

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和4年5月27日(2022.5.27)

【国際公開番号】WO2019/222764

【公表番号】特表2021-525704(P2021-525704A)

【公表日】令和3年9月27日(2021.9.27)

【出願番号】特願2020-563751(P2020-563751)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/27(2006.01)

10

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 P 9/12(2006.01)

A 6 1 P 11/00(2006.01)

A 6 1 K 9/08(2006.01)

A 6 1 K 47/38(2006.01)

A 6 1 K 47/02(2006.01)

A 6 1 K 9/28(2006.01)

A 6 1 K 9/48(2006.01)

A 6 1 K 47/34(2017.01)

A 6 1 K 47/10(2006.01)

20

A 6 1 K 47/14(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/27

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 11/00

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 9/28

30

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/14

【手続補正書】

【提出日】令和4年5月19日(2022.5.19)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

40

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

個体の肺高血圧症(PAH)の処置に使用するための、2 - ( ( ( 1 r , 4 r ) - 4 - ( ( ( 4 - クロロフェニル ) (フェニル)カルバモイルオキシ)メチル)シクロヘキシル)メトキシ)酢酸(化合物1)、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、または水和物の組成物であって、個体において少なくとも約2.5 ng/mLの化合物1の血漿濃度を提供するのに十分な量で個体に経口投与される組成物。

【請求項2】

50

化合物 1 の血漿濃度は、化合物 1 のピーク血漿濃度である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記個体において少なくとも約 5 ng / mL の化合物 1 のピーク血漿濃度を提供するのに十分な量で投与される、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記個体において少なくとも約 10 ng / mL の化合物 1 のピーク血漿濃度を提供するのに十分な量で投与される、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 5】

化合物 1 の前記ピーク血漿濃度は、化合物 1 のトラフ血漿濃度である、請求項 1 に記載の組成物。

10

【請求項 6】

前記個体において少なくとも約 5 ng / mL の化合物 1 のトラフ血漿濃度を達成するのに十分な量で投与される、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記化合物 1 の血漿濃度が、少なくとも、または少なくとも約 3.0、3.1、3.2、3.25、3.3、3.4、3.5、3.6、3.7、3.75、3.8、3.9、4.0、4.1、4.2、4.25、4.3、4.4、4.5、4.6、4.7、4.75、4.8、4.9、5.0、5.1、5.2、5.25、5.3、5.4、5.5、5.6、5.7、5.75、5.8、5.9、6.0、6.1、6.2、6.25、6.3、6.4、6.5、6.6、6.7、6.75、6.8、6.9、7.0、7.1、7.2、7.25、7.3、7.4、7.5、7.6、7.7、7.75、7.8、7.9、8.0、8.1、8.2、8.25、8.3、8.4、8.5、8.6、8.7、8.75、8.8、8.9、9.0、9.1、9.2、9.25、9.3、9.4、9.5、9.6、9.7、9.75、9.8、9.9、または 10 ng / mL である、請求項 1 に記載の組成物。

20

【請求項 8】

閾値血漿レベルが、約、または少なくとも約 2.5 ng / mL のピーク血漿レベル、および約、または少なくとも約 2.5 ng / mL のトラフ血漿レベルである、請求項 1 に記載の組成物。

30

【請求項 9】

閾値血漿レベルが、約、または少なくとも約 5 ng / mL のピーク血漿レベル、および約、または少なくとも約 2.5 ng / mL のトラフ血漿レベルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記組成物は、放散速度 (a)、(b)、および (c) のうち 1 つ以上の水性媒体中に化合物 1 の放散速度重量を有しており、ここで、

(a) 化合物 1 の約 15 重量% ~ 約 35 重量% が、水性媒体中で最初の 2 時間にわたり放出され；

40

(b) 化合物 1 の約 24 重量% ~ 約 59 重量% が、水性媒体中で最初の 4 時間にわたり放出され；および / または

(c) 化合物 1 の約 43 重量% ~ 約 96 重量% が、水性媒体中で最初の 8 時間にわたり放出され、

この放散速度は、0.04 ~ 0.06 M の濃度でリン酸ナトリウムを含む、37 ± 0.5 の温度で 6.3 ~ 7.3 の pH の水性媒体 400 ~ 600 mL において、80 ~ 120 rpm で USP 装置 1 (バスケット) で測定される、請求項 1 から 9 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 11】

前記組成物が第 1 の賦形剤と第 2 の賦形剤とを含み、前記第 1 の賦形剤が、20 で水

50

中に約 2 % の量で存在するときに約 2 3 0 0 m P A 秒 ~ 約 3 8 0 0 m P A 秒の粘度を有するヒドロキシプロピルメチルセルロースを含み、前記第 2 の賦形剤が、2 0 で水中に約 2 % の量で存在するときに約 7 5 m P A 秒 ~ 約 1 2 0 m P A 秒の粘度を有するヒドロキシプロピルメチルセルロースを含む、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

前記組成物が、コアおよびコーティングを含む錠剤である、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 3】

前記コアがヒドロキシプロピルメチルセルロースを含み、および前記コーティングがヒドロキシプロピルメチルセルロースを含まない、請求項 1 0 に記載の組成物。

10

【請求項 1 4】

化合物 1、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、または水和物は、化合物 1 である、請求項 1 から 1 3 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 1 5】

化合物 1 が、約、または少なくとも約 9 週間にわたり滴定される、請求項 1 から 1 4 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 1 6】

化合物 1 が約 1 6 週間にわたり滴定される、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 つに記載の組成物。

20

30

40

50