

【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2年12月17日(2020.12.17)

【公表番号】特表2019-533713(P2019-533713A)

【公表日】令和1年11月21日(2019.11.21)

【年通号数】公開・登録公報2019-047

【出願番号】特願2019-524887(P2019-524887)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/19 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
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 P 7/02 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 31/416 (2006.01)
A 6 1 K 31/44 (2006.01)
A 6 1 K 31/5575 (2006.01)
A 6 1 K 31/5578 (2006.01)
A 6 1 K 31/519 (2006.01)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)
C 0 7 D 333/34 (2006.01)
C 0 7 D 405/04 (2006.01)
C 0 7 D 213/70 (2006.01)
C 0 7 D 239/52 (2006.01)
C 0 7 D 487/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/19
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 7/02
A 6 1 K 31/506
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/416
A 6 1 K 31/44
A 6 1 K 31/5575
A 6 1 K 31/5578
A 6 1 K 31/519
C 0 7 D 471/04 1 0 6 C
C 0 7 D 333/34
C 0 7 D 405/04
C 0 7 D 213/70
C 0 7 D 239/52
C 0 7 D 487/04 1 4 2

【手続補正書】

【提出日】令和2年11月6日(2020.11.6)

【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

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

ヒトの肺動脈高血圧症(PAH)あるいは慢性血栓塞栓性肺高血圧症(CTEPH)を処置する方法において、プロスタノイド、あるいは可溶性グアニル酸シクラーゼ(sGC)刺激剤の1つ以上と組み合わせて使用するための、ラリンパグ、またはその薬学的に許容可能な塩、水和物、あるいは溶媒和物を含む組成物。

【請求項2】

プロスタノイドと組み合わされる、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

プロスタノイドと組み合わされ、ここで、前記プロスタノイドは、トレプロスチニル、イロプロスト、ベラプロスト、シカプロスト、およびエポプロステノールから選択される、請求項2に記載の組成物。

【請求項4】

プロスタノイドと組み合わされ、ここで、前記プロスタノイドは合成プロスタサイクリンアナログである、請求項2に記載の組成物。

【請求項5】

プロスタノイドと組み合わされ、ここで、前記プロスタノイドはトレプロスチニルあるいはイロプロストである、請求項2に記載の組成物。

【請求項6】

プロスタノイドと組み合わされ、ここで、前記プロスタノイドはトレプロスチニルであり、前記方法は、ラリンパグとトレプロスチニルの同時投与を含む、請求項2に記載の組成物。

【請求項7】

毎日投与されるトレプロスチニルの量は、0.1mg、0.125mg、0.2mg、0.25mg、0.3mg、0.35mg、0.4mg、0.45mg、0.5mg、0.6mg、0.65mg、0.7mg、0.75mg、0.8mg、0.85mg、0.9mg、0.95mg、1mg、0.25mg、0.5mg、1.75mg、2mg、2.25mg、2.5mg、2.75mg、3mg、3.25mg、3.5mg、3.75mg、4mg、4.25mg、4.5mg、4.75mg、および5mgから選択される、請求項5または6に記載の組成物。

【請求項8】

可溶性グアニル酸シクラーゼ(sGC)刺激剤と組み合わされ、請求項1に記載の組成物。

【請求項9】

可溶性グアニル酸シクラーゼ(sGC)刺激剤と組み合わされ、ここで、前記可溶性グアニル酸シクラーゼ(sGC)刺激剤は、リオシグアト、ベルシグアト、アタシグアト、ネロシグアト、リフィシゴート、I W - 1 7 0 1、I W - 1 9 7 3、I W P - 0 5 1、I W P - 1 2 1、I W P - 4 2 7、I W P - 9 5 3、B A Y - 6 0 - 2 7 7 0、A - 3 4 4 9 0 5、A - 3 5 0 6 1 9、A - 7 7 8 9 3 5、B I - 6 8 4 0 6 7、B I - 7 0 3 7 0 4、B A Y - 4 1 - 2 2 7 2、およびB A Y - 4 1 - 8 5 4 3からなる群から選択される、請求項8に記載の組成物。

【請求項10】

可溶性グアニル酸シクラーゼ(sGC)刺激剤と組み合わされ、ここで、前記可溶性グアニル酸シクラーゼ(sGC)刺激剤はリオシグアトである、請求項8に記載の組成物。

【請求項 1 1】

可溶性グアニル酸シクラーゼ (s G C) 刺激剤と組み合わされ、ここで、前記方法は、ラリンパグとリオシグアトの同時投与を含む、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

毎日投与されるリオシグアトの量は、0 . 5 、 1 、 1 . 5 、 2 、または 2 . 5 m g から選択される、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 3】

リオシグアトは、1日1回、1日2回、あるいは1日3回投与される、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

リオシグアトが滴定される、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

前記方法は、特発性の P A H ; 家族性の P A H ; 膜原血管病、先天性心疾患、門脈圧亢進症、H I V 感染症、薬物または毒素の摂取、遺伝性出血性毛細管拡張症、脾臓摘出、肺静脈閉塞性疾患 (P V O D) 、または肺毛細管血管腫症 (P C H) に関連する P A H ; 静脈または毛細管の関与が大きい P A H ; あるいは、慢性血栓塞栓性肺高血圧症 (C T E P H) を処置するための方法である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 1 6】

ラリンパグ、またはその薬学的に許容可能な塩、水和物、あるいは溶媒和物は、0 . 0 1 m g 、 0 . 0 2 m g 、 0 . 0 2 5 m g 、 0 . 0 3 m g 、 0 . 0 4 m g 、 0 . 0 5 m g 、 0 . 0 6 m g 、 0 . 0 6 5 m g 、 0 . 0 7 m g 、 0 . 0 7 5 m g 、 0 . 0 8 m g 、 0 . 0 9 m g 、 0 . 1 m g 、 0 . 1 2 m g 、 0 . 1 5 m g 、 0 . 1 6 m g 、 0 . 2 m g 、 0 . 2 5 m g 、 0 . 3 m g 、 0 . 3 5 m g 、 0 . 4 m g 、 0 . 4 5 m g 、 0 . 5 m g 、 0 . 5 5 m g 、 0 . 6 m g 、 0 . 6 5 m g 、 0 . 7 m g 、 0 . 7 5 m g 、 0 . 8 m g 、 0 . 8 5 m g 、 0 . 9 m g 、 0 . 9 5 m g 、 あるいは 1 . 0 m g のラリンパグに相当する 1 日量で投与される、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 1 7】

ラリンパグ、またはその薬学的に許容可能な塩、水和物、あるいは溶媒和物は、1日1回投与される、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 1 8】

ラリンパグ、またはその薬学的に許容可能な塩、水和物、あるいは溶媒和物は、1日2回投与される、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 1 9】

ラリンパグ、またはその薬学的に許容可能な塩、水和物、あるいは溶媒和物は、滴定される、請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 2 0】

ヒトの肺動脈高血圧症 (P A H) を処置する方法において、トレプロスチニルと組み合させて使用するための、ラリンパグを含む組成物。

【請求項 2 1】

毎日投与されるトレプロスチニルの量は、0 . 1 m g 、 0 . 1 2 5 m g 、 0 . 2 m g 、 0 . 2 5 m g 、 0 . 3 m g 、 0 . 3 5 m g 、 0 . 4 m g 、 0 . 4 5 m g 、 0 . 5 m g 、 0 . 6 m g 、 0 . 6 5 m g 、 0 . 7 m g 、 0 . 7 5 m g 、 0 . 8 m g 、 0 . 8 5 m g 、 0 . 9 m g 、 0 . 9 5 m g 、 1 m g 、 0 . 2 5 m g 、 0 . 5 m g 、 1 . 7 5 m g 、 2 m g 、 2 . 2 5 m g 、 2 . 5 m g 、 2 . 7 5 m g 、 3 m g 、 3 . 2 5 m g 、 3 . 5 m g 、 3 . 7 5 m g 、 4 m g 、 4 . 2 5 m g 、 4 . 5 m g 、 4 . 7 5 m g 、 および 5 m g から選択される、請求項 2 0 に記載の組成物。

【請求項 2 2】

毎日投与されるラリンパグの量は、約 0 . 0 1 m g 、 0 . 0 2 m g 、 0 . 0 2 5 m g 、 0 . 0 3 m g 、 0 . 0 4 m g 、 0 . 0 5 m g 、 0 . 0 6 m g 、 0 . 0 6 5 m g 、 0 . 0 7 m g 、 0 . 0 7 5 m g 、 0 . 0 8 m g 、 0 . 0 9 m g 、 0 . 1 m g 、 0 . 1 2 m g 、 0 .

1.5 mg、0.16 mg、0.2 mg、0.25 mg、0.3 mg、0.35 mg、0.4 mg、0.45 mg、0.5 mg、0.55 mg、0.6 mg、0.65 mg、0.7 mg、0.75 mg、0.8 mg、0.85 mg、0.9 mg、0.95 mg、および1.0 mgから選択される、請求項20または21に記載の組成物。

【請求項23】

P A Hは、

特発性のP A H；

家族性のP A H；

膠原血管病、先天性心疾患、門脈圧亢進症、H I V感染症、薬物または毒素の摂取、遺伝性出血性毛細管拡張症、脾臓摘出、肺静脈閉塞性疾患（P V O D）、または肺毛細管血管腫症（P C H）に関連するP A H；および、

静脈または毛細管の関与が大きいP A H

から選択される、請求項20～22のいずれか1つに記載の組成物。

【請求項24】

ヒトの肺動脈高血圧症（P A H）を処置する方法において、リオシグアトと組み合わせて使用するための、ラリンパグを含む組成物。

【請求項25】

毎日投与されるリオシグアトの量は、約0.25 mg、0.5 mg、0.75 mg、1 mg、1.25 mg、1.5 mg、1.75 mg、2 mg、2.25 mg、2.5 mg、2.75 mg、3 mg、3.25 mg、3.5 mg、3.75 mg、4 mg、4.25 mg、4.5 mg、4.75 mg、および5 mgから選択される、請求項24に記載の組成物。

【請求項26】

毎日投与されるラリンパグの量は、約0.01 mg、0.02 mg、0.025 mg、0.03 mg、0.04 mg、0.05 mg、0.06 mg、0.065 mg、0.07 mg、0.075 mg、0.08 mg、0.09 mg、0.1 mg、0.12 mg、0.15 mg、0.16 mg、0.2 mg、0.25 mg、0.3 mg、0.35 mg、0.4 mg、0.45 mg、0.5 mg、0.55 mg、0.6 mg、0.65 mg、0.7 mg、0.75 mg、0.8 mg、0.85 mg、0.9 mg、0.95 mg、および1.0 mgから選択される、請求項24または25に記載の組成物。

【請求項27】

P A Hは、

特発性のP A H；

家族性のP A H；

膠原血管病、先天性心疾患、門脈圧亢進症、H I V感染症、薬物または毒素の摂取、遺伝性出血性毛細管拡張症、脾臓摘出、肺静脈閉塞性疾患（P V O D）、または肺毛細管血管腫症（P C H）に関連するP A H；および、

静脈または毛細管の関与が大きいP A H；

から選択される、請求項24～26のいずれか1つに記載の組成物。