

【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せられる、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せられ、ここで、前記プロスタノイドは、トレプロスチニル、イロprost、ベラprost、シカprost、およびエボprostエ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せられ、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せられ、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prost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せられ、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)刺激剤と組み合わせられ、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)刺激剤と組み合わせられ、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、IW-1701、IW-1973、IWP-051、IWP-121、IWP-427、IWP-953、BAY-60-2770、A-344905、A-350619、A-778935、BI-684067、BI-703704、BAY-41-2272、およびBAY-41-8543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)刺激剤と組み合わせられ、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) 刺激剤と組み合わせられ、ここで、前記方法は、
ラリンバ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 ; 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 ; 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】

ラリンバグ、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 のラリンバグに相当する 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】

ラリンバグ、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】

ラリンバグ、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】

ラリンバグ、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
わせて使用するのための、ラリンバグを含む組成物。

【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バグの量は、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】

PAH は、

特発性の PAH；

家族性の PAH；

膠原血管病、先天性心疾患、門脈圧亢進症、HIV 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（PVOD）、または肺毛細管血管腫症（PCH）に関連する PAH；および、

静脈または毛細管の関与が大きい PAH

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（PAH）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、ラリンバグを含む組成物。

【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バグの量は、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】

PAH は、

特発性の PAH；

家族性の PAH；

膠原血管病、先天性心疾患、門脈圧亢進症、HIV 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（PVOD）、または肺毛細管血管腫症（PCH）に関連する PAH；および、

静脈または毛細管の関与が大きい PAH；

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。