

【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11月12日(2020.11.12)

【公表番号】特表2019-530711(P2019-530711A)

【公表日】令和1年10月24日(2019.10.24)

【年通号数】公開・登録公報2019-043

【出願番号】特願2019-519652(P2019-519652)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月1日(2020.10.1)

【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】

認知症の処置を必要とする対象において認知症を処置するための方法において用いるための、アピリモド又は薬学的に許容できるその塩を含む医薬組成物であって、当該方法が、当該対象の細胞においてアミロイド前駆体タンパク質(APP)がプロセシングされてアミロイドベータ(ab)ペプチドになるのを阻害するのに有効な量の当該医薬組成物を当該対象に投与することを含む、前記組成物。

【請求項2】

前記細胞が神経細胞である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

経口剤形である、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記方法が、さらに、少なくとも1種類の追加薬剤を前記対象に投与することを含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

少なくとも1種類の追加薬剤が療法薬である、請求項4に記載の組成物。

【請求項6】

前記療法薬がコリンエステラーゼ阻害薬である、請求項5に記載の組成物。

【請求項7】

前記方法が、少なくとも1種類の追加薬剤を、アピリモド又は薬学的に許容できるその塩と同じ剤形で投与することを含む、請求項4～6のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項8】

前記方法が、少なくとも1種類の追加薬剤を、アピリモド又は薬学的に許容できるその塩と異なる剤形で投与することを含む、請求項4～6のいずれか1項に記載の組成物。

**【請求項 9】**

剤形が経口剤形である、請求項 7 または 8 に記載の組成物。

**【請求項 10】**

認知症がアルツハイマー病である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

**【請求項 11】**

前記方法が患者においてアルツハイマー病の少なくとも 1 つの症状を軽減するのに有効であるか、あるいは患者においてアルツハイマー病の進行を遅延させるのに有効である、請求項 10 に記載の組成物。

**【請求項 12】**

アピリモドが 2 - [ 2 - ピリジン - 2 - イル ) - エトキシ ] - 4 - N ' - ( 3 - メチル - ベンジリデン ) - ヒドラジノ ] - 6 - ( モルホリン - 4 - イル ) - ピリミジン ( IUPAC 名 : ( E ) - 4 - ( 6 - ( 2 - ( 3 - メチルベンジリデン ) ヒドラジニル ) - 2 - ( 2 - ピリジン - 2 - イル ) エトキシ ) ピリミジン - 4 - イル ) モルホリン ) である、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

**【請求項 13】**

インビトロで、細胞においてアミロイド前駆体タンパク質 ( APP ) がプロセシングされてアミロイドベータ ( Ab ) ペプチドになるのを阻害するための方法であって、その細胞を APP がプロセシングされて Ab ペプチドになるのを阻害するのに有効な量のアピリモド又は薬学的に許容できるその塩と接触させることを含む方法。

**【請求項 14】**

認知症を治療する方法において用いるための、アピリモド又は薬学的に許容できるその塩を含む医薬組成物であって、当該方法が、細胞においてアミロイド前駆体タンパク質 ( APP ) がプロセシングされてアミロイドベータ ( Ab ) ペプチドになるのを、 APP がプロセシングされて Ab ペプチドになるのを阻害するのに有効な量の当該アピリモド又は塩と当該細胞を接触させることによって、インビボで阻害することを含む、前記組成物。

**【請求項 15】**

前記細胞が組織の一部である、請求項 13 に記載の方法又は請求項 14 に記載の組成物。

**【請求項 16】**

前記組織が神経組織である、請求項 15 に記載の方法又は組成物。

**【請求項 17】**

アピリモドが 2 - [ 2 - ピリジン - 2 - イル ) - エトキシ ] - 4 - N ' - ( 3 - メチル - ベンジリデン ) - ヒドラジノ ] - 6 - ( モルホリン - 4 - イル ) - ピリミジン ( IUPAC 名 : ( E ) - 4 - ( 6 - ( 2 - ( 3 - メチルベンジリデン ) ヒドラジニル ) - 2 - ( 2 - ピリジン - 2 - イル ) エトキシ ) ピリミジン - 4 - イル ) モルホリン ) である、請求項 13、15 及び 16 のいずれか 1 項に記載の方法、又は請求項 14 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の組成物。

**【手続補正 2】**

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0006

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0006】

[05] 複数の態様において、対象はヒト アルツハイマー病患者である。複数の態様において、本開示のアピリモド組成物で処置する必要があるヒト アルツハイマー病患者はそのアルツハイマー病が標準治療計画に対して治療抵抗性である者である。

以下に、出願時の特許請求の範囲の記載を示す。

**【請求項 1】**

認知症の処置を必要とする対象において認知症を処置するための方法であって、対象の細胞においてアミロイド前駆体タンパク質 ( APP ) がプロセシングされてアミロイドベ

ータ (A b) ペプチドになるのを阻害するのに有効な量のアピリモドを含む医薬組成物を対象に投与することを含む方法。

[請求項 2]

細胞が神経細胞である、請求項 1 に記載の方法。

[請求項 3]

医薬組成物が経口剤形である、請求項 1 に記載の方法。

[請求項 4]

さらに、少なくとも 1 種類の追加薬剤を対象に投与することを含む、請求項 1 に記載の方法。

[請求項 5]

少なくとも 1 種類の追加薬剤が療法薬である、請求項 4 に記載の方法。

[請求項 6]

療法薬がコリンエステラーゼ阻害薬である、請求項 5 に記載の方法。

[請求項 7]

少なくとも 1 種類の追加薬剤がアピリモドと同じ剤形で投与される、請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

[請求項 8]

少なくとも 1 種類の追加薬剤がアピリモドと異なる剤形で投与される、請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

[請求項 9]

剤形が経口剤形である、請求項 7 または 8 に記載の方法。

[請求項 10]

認知症がアルツハイマー病である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

[請求項 11]

その方法が患者においてアルツハイマー病の少なくとも 1 つの症状を軽減するのに有効であるか、あるいは患者においてアルツハイマー病の進行を遅延させるのに有効である、請求項 10 に記載の方法。

[請求項 12]

アピリモドが 2 - [ 2 - ピリジン - 2 - イル ) - エトキシ ] - 4 - N ' - ( 3 - メチル - ベンジリデン ) - ヒドラジノ ] - 6 - ( モルホリン - 4 - イル ) - ピリミジン ( IUPAC 名 : ( E ) - 4 - ( 6 - ( 2 - ( 3 - メチルベンジリデン ) ヒドラジニル ) - 2 - ( 2 - ピリジン - 2 - イル ) エトキシ ) ピリミジン - 4 - イル ) モルホリン ) である、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の方法。

[請求項 13]

細胞においてアミロイド前駆体タンパク質 (APP) がプロセシングされてアミロイドベータ (A b) ペプチドになるのを阻害するための方法であって、その細胞を APP がプロセシングされて A b ペプチドになるのを阻害するのに有効な量のアピリモドと接触させることを含む方法。

[請求項 14]

細胞がインビトロまたはインビボにある、請求項 13 に記載の方法。

[請求項 15]

細胞が組織の一部である、請求項 14 に記載の方法。

[請求項 16]

組織が神経組織である、請求項 15 に記載の方法。

[請求項 17]

アピリモドが 2 - [ 2 - ピリジン - 2 - イル ) - エトキシ ] - 4 - N ' - ( 3 - メチル - ベンジリデン ) - ヒドラジノ ] - 6 - ( モルホリン - 4 - イル ) - ピリミジン ( IUPAC 名 : ( E ) - 4 - ( 6 - ( 2 - ( 3 - メチルベンジリデン ) ヒドラジニル ) - 2 - ( 2 - ピリジン - 2 - イル ) エトキシ ) ピリミジン - 4 - イル ) モルホリン ) である、請求項 13 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の方法。