

【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】平成30年3月22日 (2018.3.22)

【公表番号】特表2017-511793(P2017-511793A)

【公表日】平成29年4月27日 (2017.4.27)

【年通号数】公開・登録公報2017-017

【出願番号】特願2016-550529(P2016-550529)

【国際特許分類】

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/473 (2006.01)

A 6 1 K 31/4375 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/4453 (2006.01)

A 6 1 K 31/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 K 31/405 (2006.01)

A 6 1 K 31/565 (2006.01)

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/455 (2006.01)

A 6 1 K 31/451 (2006.01)

A 6 1 K 31/13 (2006.01)

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

A 6 1 K 31/275 (2006.01)

A 6 1 K 31/135 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 K 31/136 (2006.01)

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 K 31/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/185 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

C 0 7 K 16/18 (2006.01)

C 0 7 K 16/46 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 39/395 Z N A N

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 37/43

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/473
 A 6 1 K 31/4375
 A 6 1 K 31/40
 A 6 1 K 31/4453
 A 6 1 K 31/46
 A 6 1 K 31/428
 A 6 1 K 31/48
 A 6 1 K 31/381
 A 6 1 K 31/4045
 A 6 1 K 31/4745
 A 6 1 K 31/405
 A 6 1 K 31/565
 A 6 1 K 31/573
 A 6 1 K 31/519
 A 6 1 K 31/455
 A 6 1 K 31/451
 A 6 1 K 31/13
 A 6 1 K 31/27
 A 6 1 K 31/138
 A 6 1 K 31/275
 A 6 1 K 31/135
 A 6 1 K 31/137
 A 6 1 K 31/136
 A 6 1 K 31/198
 A 6 1 K 31/12
 A 6 1 K 31/185
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 25/28
 C 0 7 K 16/18
 C 0 7 K 16/46

【手続補正書】

【提出日】平成30年2月5日(2018.2.5)

【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】

(a) 初期または軽度から中程度のアルツハイマー病 (A D) と診断された患者において、機能能力または認知能力の低下を減少させる；または

(b) 初期または軽度から中程度のアルツハイマー病 (A D) と診断された患者において、臨床的低下を緩徐にさせる；または

(c) 患者において、初期または軽度 A D を治療する；または

(d) 初期または軽度から中程度 A D と診断された患者において、(i) アミロイド関連画像異常 - 浮腫 (A R I A - E) 及び (i i) アミロイド関連画像異常 - 出血 (A R I A - H) から選択される有害事象のリスクを増大することなく、初期または軽度から中程度 A D を治療する

ことに使用するための医薬であって、

アミロイド (1 ~ 4 2) (配列番号 1) の残基 1 3 及び 2 4 内で結合するヒト化モノクローナル抗アミロイドベータ (A) 抗体を含む、医薬。

【請求項 2】

前記患者が、A p o E 4 陽性である、請求項 1 に記載の医薬。

【請求項 3】

前記抗体が、アミロイド のオリゴマー形態、フィブリル形態及び単量体形態を結合することができる、請求項 1 または 2 に記載の医薬。

【請求項 4】

前記抗体が、I g G 4 抗体である、請求項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の医薬。

【請求項 5】

前記抗体が、6 つの超可変領域 (H V R) を含み：

(i) H V R - H 1 は配列番号 2 であり；

(i i) H V R - H 2 は配列番号 3 であり；

(i i i) H V R - H 3 は配列番号 4 であり；

(i v) H V R - L 1 は配列番号 6 であり；

(v) H V R - L 2 は配列番号 7 であり；及び

(v i) H V R - L 3 は配列番号 8 である、請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の医薬

。

【請求項 6】

前記抗体が、配列番号 5 のアミノ酸配列を有する重鎖、及び配列番号 9 のアミノ酸配列を有する軽鎖を含む、請求項 5 に記載の医薬。

【請求項 7】

前記抗体が、クレネズマブ (c r e n e z u m a b) である、請求項 6 に記載の医薬。

【請求項 8】

認知能力の低下が、1 2 項目アルツハイマー病評価スケール - 認知 (A D A S - C o g 1 2)試験、1 3 項目アルツハイマー病評価スケール - 認知 (A D A S - C o g 1 3)試験、または1 4 項目アルツハイマー病評価スケール - 認知 (A D A S - C o g 1 4)試験を用いて、前記医薬の投与前及び投与後の前記患者のスコアを判定することによって評価され、場合によって、A D A S - C o g によって測定されるとき、認知低下の減少は、プラセボに対して、少なくとも 3 0 %、少なくとも 3 5 %、少なくとも 4 0 %、または少なくとも 4 5 %である、請求項 1 (a)、1 (b)、1 (c) 及び 2 から 7 のいずれか 1 項に記載の医薬。

【請求項 9】

前記患者が、治療開始前、少なくとも 2 0、2 0 ~ 3 0、2 0 ~ 2 6、2 4 ~ 3 0、2 1 ~ 2 6、2 2 ~ 2 6、2 2 ~ 2 8、2 3 ~ 2 6、2 4 ~ 2 6 または 2 5 ~ 2 6 の M M S E スコアを有する、請求項 1 (a)、1 (b)、1 (c) 及び 2 から 8 のいずれか 1 項に記載の医薬。

【請求項 1 0】

前記抗体が、患者体重あたり 1 0 m g 抗体 / k g ~ 1 0 0 m g 抗体 / k g の投与量での患者への投与用に製剤化される、請求項 1 (a)、1 (b)、1 (c) 及び 2 から 9 のいずれか 1 項に記載の医薬。

【請求項 1 1】

前記抗体が、患者体重あたり、1 5 m g 抗体 / k g、3 0 m g 抗体 / k g、4 5 m g 抗体 / k g、5 0 m g 抗体 / k g、または 6 0 m g 抗体 / k g の投与量での患者への投与用に製剤化される、請求項 1 0 に記載の医薬。

【請求項 1 2】

前記抗体が、静脈注射用に製剤化される、請求項 1 0 に記載の医薬。

【請求項 1 3】

前記抗体が、2 週間ごと、4 週間ごと、1 ヶ月ごと、2 ヶ月ごと、または 6 ヶ月ごとの投与用に製剤化される、請求項 1 0 から 1 2 のいずれか 1 項に記載の医薬。

【請求項 14】

初期または軽度から中程度 A D と診断された患者において、有害事象の前記リスクを増大することなく、初期または軽度から中程度 A D を治療することに使用するための医薬であって、前記有害事象が A R I A - E であり、任意選択的に、

(a) 治療中に発生した A R I A - E が検出された場合、前記医薬の投与が中止され、任意により A R I A - E の治療剤が投与される；または

(b) 治療中に発生した A R I A - E が検出された場合、前記医薬の投与が中止され、任意により A R I A - E の治療剤が投与され、且つ前記 A R I A - E の解消後に、前記医薬の投与が再開され、投与が中止される前よりも少ない投与量で前記医薬が投与される；または

(c) 前記医薬による治療中に、1 つ以上の新規 A R I A - E が前記患者で検出された場合、これ以上前記医薬は投与されず、任意によりコルチコステロイドが投与される、請求項 1 (a)、1 (b)、1 (c) 及び 2 から 13 のいずれか 1 項に記載の医薬。

【請求項 15】

前記患者が、ターゲットに特異的に結合する治療薬；コリンエステラーゼ阻害剤；N M D A レセプターアンタゴニスト；モノアミン枯渇薬；メシル酸エルゴロイド；抗コリン性抗パーキンソン病剤；ドーパミン作動性抗パーキンソン剤；テトラベナンジン；抗炎症剤；ホルモン；ビタミン；ディメボリン (d i m e b o l i n)；ホモタウリン；セロトニンレセプター活性調節剤；インターフェロン及びグルココルチコイド；クレネズマブ (c r e n e z u m a b) 以外の抗 A 抗体；抗菌剤；抗ウイルス剤からなる群から選択される 1 つ以上の薬剤により同時に治療される、請求項 1 から 14 のいずれか 1 項に記載の医薬。

【請求項 16】

前記薬剤が、ガランタミン、ドネペジル、リバスティグミン及びタクリンからなる群から選択されるコリンエステラーゼ阻害剤である、請求項 15 に記載の医薬。

【請求項 17】

前記薬剤が、N M D A レセプターアンタゴニストであり、任意選択的に、メマンチンまたはその塩である、請求項 15 に記載の医薬。

【請求項 18】

前記薬剤が、ターゲットに特異的に結合する治療薬であり、前記ターゲットは、ベータセクレターゼ、タウ、プレセニリン、アミロイド前駆体タンパク質またはその部分、アミロイドベータペプチドまたはオリゴマー、またはそのフィブリル、デスレセプター 6 (D R 6)、糖化最終産物 (R A G E) レセプター、パーキン及びハンチンチンからなる群から選択される、請求項 15 に記載の医薬。

【請求項 19】

前記薬剤が、

(a) モノアミン枯渇剤であり、任意選択的にテトラベナンジンである；または

(b) プロシクリジン、ジフェンヒドラミン、トリヘキシルフェニジル、ベンズトロピン、ピペリデン及びトリヘキシルフェニジルからなる群から選択される抗コリン性抗パーキンソン剤である；または

(c) エンタカポン、セレギリン、プラミペキソール、プロモクリブチン、ロチゴチン、セレギリン、ロピニロール、ラサギリン、アボモルヒネ、カルビドパ、レボドパ、ペルゴリド、トルカポン及びアマンタジンからなる群から選択される、ドーパミン作動性抗パーキンソン剤である；または

(d) 非ステロイド性抗炎症薬及びインドメタシンからなる群から選択される抗炎症剤である；または

(e) エストロゲン、プロゲステロン及びロイプロリドからなる群から選択されるホルモンである；または

(f) 葉酸塩及びニコチンアミドからなる群から選択されるビタミンである；または

(g) ホモタウリンであり、これらは、3 - アミノプロパンスルホン酸または 3 A P S

である；または

(h) キサリプロデンである；または

(i) クレネズマブ (crenezumab) 以外の抗 A 抗体であり、任意選択的に
ソラネズマブ (solanezumab)、バピノイズマブ (bapineuzumab)、
アデュカヌマブ (aducanumab)、及びガントネルマブ (gantener
umab) からなる群から選択される、

請求項 15 に記載の医薬。