

【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 4 月 9 日 (2020.4.9)

【公表番号】特表 2019-507775 (P2019-507775A)

【公表日】平成 31 年 3 月 22 日 (2019.3.22)

【年通号数】公開・登録公報 2019-011

【出願番号】特願 2018-546897 (P2018-546897)

【国際特許分類】

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

C 1 2 N 15/13 (2006.01)

C 0 7 K 16/28 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/26

C 1 2 N 15/13 Z N A

C 0 7 K 16/28

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 2 月 28 日 (2020.2.28)

【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】

関節リウマチに罹患している被験体の身体機能を改善する方法における使用のための抗体を含む医薬組成物であって、ここで：

- 抗体は、配列番号 1 の配列を含む重鎖可変領域及び配列番号 2 の配列を含む軽鎖可変領域を含み、

- 抗体は、2 週ごとに 1 回約 150 mg 又は約 200 mg で被験体に皮下投与され、

- 被験体は、抗体の投与の過程でいずれの他の疾患修飾性抗リウマチ薬 (DMARD) も投与されず、かつ

- 被験体は、以前に該抗体と異なる少なくとも 1 つの DMARD を投与することにより関節リウマチを処置されたが効果がなかった、

上記医薬組成物。

【請求項 2】

被験体は、抗体の投与の少なくとも 24 週後に、健康評価質問表を用いた機能障害指数 (HAQ-DI) における少なくとも 0.22、特に少なくとも 0.30、さらに特に少なくとも 0.60 のベースライン (BL) からの変化を達成する、請求項 1 に記載の医薬

組成物。

【請求項 3】

関節リウマチに罹患している被験体の健康関連の生活の質を改善する方法における使用のための抗体を含む医薬組成物であって、ここで：

- 抗体は、配列番号 1 の配列を含む重鎖可変領域及び配列番号 2 の配列を含む軽鎖可変領域を含み、
 - 抗体は、2 週ごとに 1 回約 150 mg 又は約 200 mg で被験体に皮下投与され、
 - 被験体は、抗体の投与の過程でいずれの他の疾患修飾性抗リウマチ薬 (DMARD) も投与されず、かつ
 - 被験体は、以前に該抗体と異なる少なくとも 1 つの DMARD を投与することにより関節リウマチを処置されたが効果がなかった、
- 上記医薬組成物。

【請求項 4】

被験体は、抗体の投与の少なくとも 24 週後に、少なくとも 2.5、特に少なくとも 3、さらに特に少なくとも 8 の、Short Form - 36 身体的コンポーネントサマリー (SF - 36 PCS) のベースライン (BL) からの変化を達成する、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

被験体において関節リウマチを処置する方法における使用のための抗体を含む医薬組成物であって、ここで：

- 抗体は、配列番号 1 の配列を含む重鎖可変領域及び配列番号 2 の配列を含む軽鎖可変領域を含み、
 - 抗体は、2 週ごとに 1 回約 150 mg 又は約 200 mg で被験体に皮下投与され、
 - 被験体は、抗体の投与の過程でいずれの他の疾患修飾性抗リウマチ薬 (DMARD) も投与されず、かつ
 - 被験体は、以前に該抗体と異なる少なくとも 1 つの DMARD を投与することにより関節リウマチを処置されたが効果がなかった、
- 上記医薬組成物。

【請求項 6】

被験体は、抗体の投与の少なくとも 24 週後に、アメリカリウマチ学会コアセット疾患指標 (ACR20) における 20% 改善、特にアメリカリウマチ学会コアセット疾患指標 (ACR50) における 50% 改善、さらに特にアメリカリウマチ学会コアセット疾患指標 (ACR70) における 70% 改善を達成する、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

被験体は、抗体の投与の少なくとも 24 週後に、疾患活動性スコア 28 - 赤血球沈降速度 (DAS28 - ESR) におけるベースライン (BL) からの、少なくとも 2、特に少なくとも 2.5、さらに特に少なくとも 3 の変化を達成する、又は、被験体は、抗体の投与の少なくとも 24 週後に、DAS28 - ESR スコア 3.2 未満、特に 2.6 未満を達成する、請求項 5 又は 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物であって、以前に該抗体と異なる少なくとも 1 つの DMARD を投与することにより関節リウマチを処置されたが効果がなかった被験体は、以前にメトトレキサートを投与することにより関節リウマチを処置されたが効果がなかった被験体である、上記医薬組成物。

【請求項 9】

関節リウマチに罹患している被験体は、中程度から重度の活動性関節リウマチに罹患している被験体である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

抗体は充填済みシリンジ又は自動注射器を用いて投与される、又は、約 21 mM ヒスチジン、約 45 mM アルギニン、約 0.2% (質量/体積) ポリソルベート 20、及び約 5

%（質量／体積）スクロースを含有する約 pH 6.0 の緩衝化水溶液として投与される、請求項 1～9 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

溶液は抗体を少なくとも約 130 mg/mL 含み、特に溶液は抗体約 131.6 mg/mL を含む、又は、溶液は抗体約 175 mg/mL を含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

配列番号 1 の配列を含む重鎖可変領域及び配列番号 2 の配列を含む軽鎖可変領域を含む抗体がサリルマブである、請求項 1～11 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

被験体は 1 つ又はそれ以上の DMARD に不耐容である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

被験体は中程度から重度の活動性関節リウマチを有し、かつ 1 つ又はそれ以上の DMARD に対して不適切な応答を有していたことがある、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

DMARD がメトトレキサートである、請求項 13 又は 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

被験体は RA に起因する生活の質の低下を受けている、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

被験体は、欧州生活の質 - 5 項目法 3 レベル（EQ-5D-3L）のベースラインからの変化、関節リウマチ疾患の影響（RAID）のベースラインからの変化、関節炎のために休んだ仕事の日数、関節炎のために 50% 減少した仕事の生産性、仕事生産性の妨げになる関節炎の割合、関節炎のために休んだ家事労働の日数、関節炎のために家事労働の生産性が 50% 減少した日数、関節炎のために休んだ家族／社会的／余暇の活動の日数、関節炎のために雇った外部の援助を用いた日数、家事生産性への RA の妨げの割合、朝のこわばり VAS、個々の ACR コンポーネント - TJC 及び SJC、個々の ACR コンポーネント - 医師の全体的 VAS、参加者の全体的 VAS 及び疼痛 VAS、並びに個々の ACR コンポーネント - ESR レベルから選択される計量での平均より重度とスコア付される、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

抗体は 2 週間ごとに 1 回 150 mg で被験体に皮下投与される、請求項 1～17 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

抗体は 2 週間ごとに 1 回 200 mg で被験体に皮下投与される、請求項 1～17 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。