

【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 1 部門第 1 区分

【発行日】令和 1 年 7 月 11 日 (2019.7.11)

【公表番号】特表 2018-522581 (P2018-522581A)

【公表日】平成 30 年 8 月 16 日 (2018.8.16)

【年通号数】公開・登録公報 2018-031

【出願番号】特願 2018-516634 (P2018-516634)

【国際特許分類】

C 1 2 Q 1/6883 (2018.01)

C 1 2 Q 1/6851 (2018.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

G 0 1 N 33/50 (2006.01)

G 0 1 N 33/68 (2006.01)

【 F I 】

C 1 2 Q 1/6883 Z N A Z

C 1 2 Q 1/6851 Z

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 33/00

A 6 1 P 31/16

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 K 31/4245

G 0 1 N 33/15 Z

G 0 1 N 33/50 Z

G 0 1 N 33/68

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 6 月 7 日 (2019.6.7)

【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】

LSD1 阻害剤での処置に対する対象の応答をモニタリングする方法であって、前記対象から得た試料中の、S100A9であるバイオマーカーのレベルを決定するステップを含み、対照中の前記バイオマーカーのレベルと比較して前記試料中の前記バイオマーカーのレベルの減少が、前記LSD1阻害剤での前記処置に対する応答を示し、前記対象がCNS疾患を有する、方法。

【請求項 2】

前記対象が、アルツハイマー病を有する、請求項1に記載の方法。

【請求項 3】

前記LSD1阻害剤が、2-(ヘテロ)アリールシクロプロルアミノ化合物である、請求項1又は2に記載の方法。

【請求項 4】

前記LSD1阻害剤が、国際公開第2010/043721号パンフレット、国際公開第2010/084160号パンフレット、国際公開第2011/035941号パンフレット、国際公開第2011/042217号パンフレット、国際公開第2011/131697号パンフレット、国際公開第2012/013727号パンフレット、国際公開第2012/013728号パンフレット、国際公開第2012/045883号パンフレット、国際公開第2013/057320号パンフレット、国際公開第2013/057322号パンフレット、国際公開第2012/135113号パンフレット、国際公開第2013/022047号パンフレット、国際公開第2014/058071号パンフレット、国際公開第2010/143582号パンフレット、米国特許出願公開第2010-0324147号明細書、国際公開第2011/131576号パンフレット、国際公開第2014/084298号パンフレット、国際公開第2014/086790号パンフレット、国際公開第2014/164867号パンフレット、国際公開第2015/021128号パンフレット、国際公開第2014/194280号パンフレット、国際公開第2015/123465号パンフレット、国際公開第2015/123437号パンフレット、国際公開第2015/123424号パンフレット、国際公開第2015/123408号パンフレット、国際公開第2015/156417号パンフレット、または国際公開第2015/181380号パンフレットにおいて開示されている化合物である、請求項1又は2に記載の方法。

【請求項 5】

前記LSD1阻害剤が、(-)-5-(((trans)-2-(4-(ベンジルオキシ)フェニル)シクロプロピル)アミノ)メチル)-1,3,4-オキサジアゾール-2-アミンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物である、請求項1又は2に記載の方法。

【請求項 6】

患者が、LSD1阻害剤での処置に対して応答する可能性が高いかどうかを判定する方法であって、前記LSD1阻害剤での処置前の前記患者から得た試料中の、S100A9および/またはS100A8であるバイオマーカーのレベルを決定するステップを含み、前記試料中の前記バイオマーカーのレベルが対照と比較して上昇している場合、前記LSD1阻害剤には前記患者に対する治療効果がある可能性がより高く、前記対象がCNS疾患を有する、方法。

【請求項 7】

前記対象が、アルツハイマー病を有する、請求項6に記載の方法。

【請求項 8】

前記バイオマーカーが、S100A9である、請求項6又は7に記載の方法。

【請求項 9】

前記 L S D 1 阻害剤が、2 - (ヘテロ)アリールシクロプロロールアミノ化合物である、請求項 6 から 8 のいずれかに記載の方法。

【請求項 10】

前記 L S D 1 阻害剤が、(-) 5 - (((t r a n s) - 2 - (4 - (ベンジルオキシ)フェニル)シクロプロピル)アミノ)メチル) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - アミンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物である、請求項 6 から 8 のいずれかに記載の方法。

【請求項 11】

患者における C N S 疾患を処置する方法における使用のための L S D 1 阻害剤を含有する医薬組成物であって、前記方法が、(i) L S D 1 阻害剤を含有する医薬組成物での処置前の前記患者から得た試料中の、S 1 0 0 A 9 および / または S 1 0 0 A 8 であるバイオマーカーのレベルを決定するステップ、ならびに (i i) 前記試料中の前記バイオマーカーのレベルが対照と比較して上昇している場合、前記患者に前記 L S D 1 阻害剤を含む医薬組成物を投与するステップを含む、医薬組成物。

【請求項 12】

前記バイオマーカーが、S 1 0 0 A 9 である、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記 L S D 1 阻害剤が、2 - (ヘテロ)アリールシクロプロロールアミノ化合物である、請求項 11 または 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記 L S D 1 阻害剤が、国際公開第 2 0 1 0 / 0 4 3 7 2 1 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 0 / 0 8 4 1 6 0 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 1 / 0 3 5 9 4 1 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 1 / 0 4 2 2 1 7 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 1 / 1 3 1 6 9 7 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 2 / 0 1 3 7 2 7 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 2 / 0 1 3 7 2 8 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 2 / 0 4 5 8 8 3 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 3 / 0 5 7 3 2 0 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 3 / 0 5 7 3 2 2 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 2 / 1 3 5 1 1 3 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 3 / 0 2 2 0 4 7 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 4 / 0 5 8 0 7 1 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 0 / 1 4 3 5 8 2 号パンフレット、米国特許出願公開第 2 0 1 0 - 0 3 2 4 1 4 7 号明細書、国際公開第 2 0 1 1 / 1 3 1 5 7 6 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 4 / 0 8 4 2 9 8 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 4 / 0 8 6 7 9 0 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 4 / 1 6 4 8 6 7 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 5 / 0 2 1 1 2 8 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 4 / 1 9 4 2 8 0 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 5 / 1 2 3 4 6 5 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 5 / 1 2 3 4 3 7 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 5 / 1 2 3 4 2 4 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 5 / 1 2 3 4 0 8 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 5 / 1 5 6 4 1 7 号パンフレット、または国際公開第 2 0 1 5 / 1 8 1 3 8 0 号パンフレットにおいて開示されている化合物である、請求項 11 又は 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記 L S D 1 阻害剤が、(-) 5 - (((t r a n s) - 2 - (4 - (ベンジルオキシ)フェニル)シクロプロピル)アミノ)メチル) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - アミンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物である、請求項 11 から 13 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記疾患が、アルツハイマー病である、請求項 11 から 15 のいずれかに記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 8 6 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 8 6 3 】

本発明を特定の実施形態に関連して説明したが、当然のことながら、さらなる修飾が可能であり、本出願は、本発明の原理に一般に従う本発明のあらゆる変形形態、使用または適応形態を包含することを意図したものであり、そのような変形形態、使用または適応形態には、本発明が属する技術分野内で公知のまたは通例の実施に含まれるような、ならびに上文にて述べたおよび添付の特許請求の範囲における下記の通りの本質的特徴に対して適用することができるような、本開示からの逸脱が含まれる。本発明は次の態様も含む。

(1) L S D 1 阻害剤での処置に対する対象の応答をモニタリングする方法であって、前記対象から得た試料中の、 S 1 0 0 A 9 および / または S 1 0 0 A 8 であるバイオマーカーのレベルを決定するステップを含み、対照中の前記バイオマーカーのレベルと比較して前記 試料中の前記バイオマーカーのレベルの減少が、前記 L S D 1 阻害剤での前記処置に対する応答を示す、方法。

(2) 前記対象が、 C N S 疾患を有する、上記 (1) に記載の方法。

(3) 前記対象が、アルツハイマー病を有する、上記 (1) に記載の方法。

(4) 前記対象が、多発性硬化症を有する、上記 (1) に記載の方法。

(5) 前記バイオマーカーが、 S 1 0 0 A 9 である、上記 (1) から (4) のいずれかに記載の方法。

(6) 前記 L S D 1 阻害剤が、 2 - (ヘテロ) アリールシクロプロロールアミノ化合物である、上記 (1) から (5) のいずれかに記載の方法。

(7) 前記 L S D 1 阻害剤が、国際公開第 2 0 1 0 / 0 4 3 7 2 1 号パンフレット、国際公開 第 2 0 1 0 / 0 8 4 1 6 0 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 1 / 0 3 5 9 4 1 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 1 / 0 4 2 2 1 7 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 1 / 1 3 1 6 9 7 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 2 / 0 1 3 7 2 7 号パンフレット、国際公開 第 2 0 1 2 / 0 1 3 7 2 8 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 2 / 0 4 5 8 8 3 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 3 / 0 5 7 3 2 0 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 3 / 0 5 7 3 2 2 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 2 / 1 3 5 1 1 3 号パンフレット、国際公開第 2 0 1 3 / 0 2 2 0 4 7 号パンフレットまたは国際公開第 2 0 1 4 / 0 5 8 0 7 1 号パンフレットにおいて開示されている化合物である、上記 (1) から (5) のいずれかに記載の方法。

(8) 前記 L S D 1 阻害剤が、 (-) 5 - ((((t r a n s) - 2 - (4 - (ベンジルオキシ) フェニル) シクロプロピル) アミノ) メチル) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - アミンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物である、上記 (1) から (5) のいずれかに記載の方法。

(9) 患者が、 L S D 1 阻害剤での処置に対して応答する可能性が高いかどうかを判定する方法であって、前記 L S D 1 阻害剤での処置前の前記患者から得た試料中の、 S 1 0 0 A 9 および / または S 1 0 0 A 8 であるバイオマーカーのレベルを決定するステップを含み、前記試料中の前記バイオマーカーのレベルが対照と比較して上昇している場合、前記 L S D 1 阻害剤には前記患者に対する治療効果がある可能性がより高い、方法。

(1 0) 前記対象が、 C N S 疾患を有する、上記 (9) に記載の方法。

(1 1) 前記対象が、アルツハイマー病を有する、上記 (9) に記載の方法。

(1 2) 対象が、多発性硬化症を有する、上記 (9) に記載の方法。

(1 3) 前記バイオマーカーが、 S 1 0 0 A 9 である、上記 (9) から (1 2) のいずれかに記載の方法。

(1 4) 前記 L S D 1 阻害剤が、 2 - (ヘテロ) アリールシクロプロロールアミノ化合物である、上記 (9) から (1 3) のいずれかに記載の方法。

(1 5) 前記 L S D 1 阻害剤が、 (-) 5 - ((((t r a n s) - 2 - (4 - (ベンジルオキシ) フェニル) シクロプロピル) アミノ) メチル) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - アミンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物である、上記 (9) から (1 3) のいずれかに記載の方法。

- (1 6) 患者における C N S 疾患、自己免疫疾患、感染症または感染症に起因する疾患 (好ましくは、細菌感染症、真菌感染症、原虫感染症、インフルエンザ感染症、または前記感染症のいずれかに起因する疾患)、がんおよび心血管疾患からなる群から選択される疾患を処置する方法における使用のための L S D 1 阻害剤であって、前記方法が、(i) L S D 1 阻害剤での処置前の前記患者から得た試料中の、S 1 0 0 A 9 および / または S 1 0 0 A 8 であるバイオマーカーのレベルを決定するステップ、ならびに(i i) 前記試料中の前記バイオマーカーのレベルが対照と比較して上昇している場合、前記患者に前記 L S D 1 阻害剤を投与するステップを含む、L S D 1 阻害剤。
- (1 7) 前記バイオマーカーが、S 1 0 0 A 9 である、上記(1 6)に記載の方法。
- (1 8) 前記 L S D 1 阻害剤が、2 - (ヘテロ) アリールシクロプロロールアミノ化合物である、上記(1 6)または(1 7)に記載の方法。
- (1 9) 前記 L S D 1 阻害剤が、(-) 5 - (((t r a n s) - 2 - (4 - (ベンジルオキシ) フェニル) シクロプロピル) アミノ) メチル) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - アミンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物である、上記(1 6)から(1 8)のいずれかに記載の方法。
- (2 0) 前記疾患が、C N S 疾患である、上記(1 6)から(1 9)のいずれかに記載の方法。
- (2 1) 前記疾患が、アルツハイマー病である、上記(1 6)から(1 9)のいずれかに記載の方法。
- (2 2) 前記疾患が、多発性硬化症である、上記(1 6)から(1 9)のいずれかに記載の方法。