

【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27年8月27日(2015.8.27)

【公開番号】特開2013-23499(P2013-23499A)

【公開日】平成25年2月4日(2013.2.4)

【年通号数】公開・登録公報2013-006

【出願番号】特願2012-154328(P2012-154328)

【国際特許分類】

A 6 1 K	39/395	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/4418	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
A 6 1 K	31/366	(2006.01)
A 6 1 K	31/47	(2006.01)
A 6 1 K	31/22	(2006.01)
A 6 1 K	31/505	(2006.01)
C 0 7 K	16/40	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	39/395	D
A 6 1 K	39/395	N
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 K	31/40	
A 6 1 K	31/4418	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/366	
A 6 1 K	31/47	
A 6 1 K	31/22	
A 6 1 K	31/505	
C 0 7 K	16/40	Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成27年7月8日(2015.7.8)

【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】

上昇した血中低密度リポタンパク質コレステロール(LDL-C)レベルによって特徴づけられる障害の処置において使用するための前駆タンパク質転換酵素サブチリシンケシン9型(PCSCK9)拮抗抗体であって、PCSCK9拮抗抗体が、少なくとも3mg/kg、4mg/kg、5mg/kg、または6mg/kgの初回用量として投与され、初回用量とほぼ同じまたはそれ未満の量の複数の後続用量で投与され、初回用量ならびに第1の後続用量および追加の後続用量が、互いに少なくとも4週間の時間間隔である抗体。

**【請求項 2】**

上昇した血中低密度リポタンパク質コレステロール（LDL-C）レベルによって特徴づけられる障害の処置において使用するための前駆タンパク質転換酵素サブチリシンケキシン9型（PCSK9）拮抗抗体であって、PCSK9拮抗抗体が、少なくとも200mgまたは300mgの初回用量として投与され、初回用量とほぼ同じまたはそれ未満の量の複数の後続用量で投与され、初回用量ならびに第1の後続用量および追加の後続用量が、互いに少なくとも4週間の時間間隔である抗体。

**【請求項 3】**

上昇した血中低密度リポタンパク質コレステロール（LDL-C）レベルによって特徴づけられる障害の処置において使用するための前駆タンパク質転換酵素サブチリシンケキシン9型（PCSK9）拮抗抗体であって、PCSK9拮抗抗体が、少なくとも50mg、75mg、100mg、140mgまたは150mgの初回用量として投与され、初回用量とほぼ同じまたはそれ未満の量の複数の後続用量で投与され、初回用量ならびに第1の後続用量および追加の後続用量が、互いに少なくとも2週間の時間間隔である抗体。

**【請求項 4】**

スタチンがPCSK9拮抗抗体の初回用量の前に投与されている、請求項1から3のいずれか一項に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 5】**

1日用量のスタチンを投与する、請求項4に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 6】**

安定用量のスタチンが、PCSK9抗体の初回用量の前に、少なくとも2、3、4、5または6週間の間、投与されている、請求項4または5に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 7】**

スタチンが、アトルバスタチン、セリバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチン、またはその任意の薬学的に許容できる塩もしくは立体異性体である、請求項4から6のいずれか一項に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 8】**

スタチンの1日用量が、40mgのアトルバスタチン、80mgのアトルバスタチン、20mgのロスバスタチン、40mgのロスバスタチン、40mgのシンバスタチン、および80mgのシンバスタチンからなる群から選択される、請求項5に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 9】**

障害が、高コレステロール血症、異常脂質血症、高脂血症、アテローム性動脈硬化症、心血管疾患、または急性冠症候群（ACS）である、請求項1から8のいずれか一項に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 10】**

抗体が、配列番号11に示すアミノ酸配列を有する重鎖可変領域からの3個のCDRおよび配列番号12に示すアミノ酸配列を有する軽鎖可変領域からの3個のCDRを含む、請求項1から9のいずれか一項に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 11】**

抗体がL1L3である、請求項10に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 12】**

抗体を皮下または静脈内投与する、請求項1から11のいずれか一項に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 13】**

抗体を1ヶ月に1回または2回投与する、請求項1から12のいずれか一項に記載のPCSK9拮抗抗体。

**【請求項 14】**

請求項1から13に記載のいずれか一項に記載のPCSK9拮抗抗体を含む医薬組成物

。【請求項 15】

初回用量の P C S K 9 拮抗抗体の投与前に 7 0 m g / d L 以上の空腹時総コレステロールレベルを有する患者を治療するための、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

初回用量の P C S K 9 拮抗抗体の投与前に 1 3 0 m g / d L 以上の空腹時 L D L コレステロールレベルを有する患者を治療するための、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

容器と、P C S K 9 拮抗抗体を含む容器内の組成物と、少なくとも 3 m g / k g 、 6 m g / k g 、 5 0 m g 、 7 5 m g 、 1 0 0 m g 、 1 4 0 m g 、 1 5 0 m g 、 2 0 0 m g 、または 3 0 0 m g の P C S K 9 拮抗抗体の初回用量、および初回用量と同量またはそれ未満である少なくとも 1 つの後続用量を投与する指示を含有する添付文書とを含み、初回用量および後続用量の投与が少なくとも 2 週間または 4 週間の時間間隔である製品。

【請求項 18】

添付文書が、P C S K 9 拮抗抗体をスタチンで処置されている個体に投与するための指示を含む、請求項 17 に記載の製品。

【請求項 19】

スタチンが、アトルバスタチン、セリバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチン、またはその任意の薬学的に許容できる塩もしくは立体異性体である、請求項 18 に記載の製品。

【請求項 20】

指示が、静脈内または皮下注射によって初回用量を投与し、静脈内または皮下注射によって少なくとも 1 つの後続用量を投与するためのものである、請求項 17 から 19 のいずれか一項に記載の製品。

【請求項 21】

複数の後続用量を投与する、請求項 17 から 20 のいずれか一項に記載の製品。

【請求項 22】

組成物が上昇した血中低密度リポタンパク質コレステロールレベルによって特徴づけられる状態を処置するために使用できることを示す、容器上に存在するまたはそれに付随するラベルをさらに含む、請求項 17 から 21 のいずれか一項に記載の製品。

【請求項 23】

ラベルが、組成物を高コレステロール血症、アテローム生成的異常脂質血症、高脂血症、アテローム性動脈硬化症、心血管疾患、または急性冠症候群（A C S）の処置に使用できることを示す、請求項 17 から 22 のいずれか一項に記載の製品。

【請求項 24】

抗体が L 1 L 3 である、請求項 17 から 23 のいずれか一項に記載の製品。