

【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9月17日(2020.9.17)

【公表番号】特表2019-530648(P2019-530648A)

【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2019-508893(P2019-508893)

【国際特許分類】

A 6 1 K	38/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/66	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2017.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	38/16
A 6 1 P	25/00
A 6 1 K	9/10
A 6 1 K	9/66
A 6 1 K	47/34
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/10
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	47/38

【手続補正書】

【提出日】令和2年8月6日(2020.8.6)

【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】

40mg用量の酢酸グラチラマー(GA)を含み、2~6週間毎の単回筋肉内注射のレジメンに適しており、再発寛解型多発性硬化症(RRMS)に罹患しているヒト患者または最初の臨床症状を発現したことがありかつ臨床的に明白な多発性硬化症を発症するリスクが高いと判定されるヒト患者においてRRMSの少なくとも1つの症状を軽減するのに使用するための、デボ製剤であって、前記症状が前記患者の再発の頻度、脳MRIの増強病変の数または新たな病変画像の数、および総合障害度評価尺度(EDSS)スコアからなる群より選択される、デボ製剤。

【請求項2】

4週間毎に1回の投与に適している、請求項1に記載のデボ製剤。

【請求項3】

症状を軽減することが、

前記再発の頻度を低下させること、

脳における増強病変の数もしくは体積または新たな病変の数を減少させること、
前記患者において、脳萎縮を減少させること、G d 増強病変の数もしくは体積を減少させること、T₁ 強調増強病変の数もしくは体積を減少させること、または新たなT₁ 強調病変の数を減少させること、または

前記患者のEDSSスコアを減少させること、
を含む、請求項1または2に記載のデポ製剤。

【請求項4】

20mgのGAの連日皮下投与または40mgのGAの週3回の皮下注射と少なくとも同程度に効果的に前記症状を軽減する、請求項1～3のいずれか1項に記載のデポ製剤。

【請求項5】

前記患者が前記レジメンの開始前にGA療法を受けたことがある、請求項1または4に記載のデポ製剤。

【請求項6】

ポリ(乳酸-co-グリコール酸)(PLGA)、ポリ(乳酸)(PLA)、ポリ(グリコール酸)(PGA)、およびその任意の組合せからなる群より選択される薬学的に許容される生分解性担体をさらに含む、請求項1～5のいずれか1項に記載のデポ製剤。

【請求項7】

水中油中水型(w/o/w)二重乳化工程によって調製される微粒子の形態である、請求項1～6のいずれか1項に記載のデポ製剤。

【請求項8】

20%～30%の固体を含む、請求項1～7のいずれか1項に記載のデポ製剤。

【請求項9】

前記GAと前記薬学的に許容される生分解性担体の間の重量比が1：1～1：100である、または

前記GAと前記薬学的に許容される生分解性担体の間の重量比が1：5～1：25である、

請求項6～8のいずれか1項に記載のデポ製剤。

【請求項10】

実質的に同じ用量のグラチラマーの即放製剤と比較して対象においてグラチラマーの長時間の放出または長時間の作用をもたらす、

前記グラチラマーの約80%が常時攪拌下37にてPBS中で22日以内に前記デポ製剤から放出される、または

前記グラチラマーの約20%が常時攪拌下37にてPBS中で5日以内に前記デポ製剤から放出される、

請求項1～9のいずれか1項に記載のデポ製剤。

【請求項11】

40mg用量の酢酸グラチラマー(GA)を含み、2～6週間毎の単回筋肉内注射のレジメンに適しており、再発寛解型多発性硬化症に罹患しているヒト患者においてGA治療の耐容性を増大させるのに使用するための、デポ製剤であって、皮下注射の頻度を20mg用量のGAの連日皮下注射または各注射間に少なくとも1日を有して7日の期間にわたる40mg用量のGAの3回の皮下注射から、2～6週間毎の40mg用量のGAのデポ製剤の単回筋肉内注射の治療上有効なレジメンに減らすことによって、前記患者においてGA治療の耐容性を増大させる、デポ製剤。

【請求項12】

40mg用量の酢酸グラチラマー(GA)を含み、2～6週間毎の単回筋肉内注射のレジメンに適しており、再発寛解型多発性硬化症(RRMS)に罹患しているヒト患者においてRRMSの進行を抑えるまたは遅延させるのに使用するための、デポ製剤。

【請求項13】

前記レジメンが前記患者の(a)再発の頻度、(b)増強病変の数もしくは体積、(c)新たな病変の数、または(d)総合障害度評価尺度(EDSS)スコアを改善するのに

十分である、または

前記レジメンが前記患者の再発の頻度、増強病変の数もしくは体積、新たな病変の数、および総合障害度評価尺度（E D S S）スコアを改善するのに十分である、

請求項1 2に記載のデボ製剤。

【請求項14】

4 0 m g 用量の酢酸グラチラマー（G A）を含み、2～6週間毎の単回筋肉内注射のレジメンに適しており、再発寛解型多発性硬化症に罹患しているヒト患者において疾患活動性を抑えるのに使用するための、デボ製剤であって、前記レジメンが前記患者において再発、12週間の確定された能力障害進行（C D P）、新たな病変形成および既存の病変の増強を抑えるのに十分である、デボ製剤。

【請求項15】

ポリ（乳酸 - c o - グリコール酸）（P L G A）と封入されるG Aを含む第一の容器と、注射用の薬学的に許容される賦形剤を含む第二の別個の容器とを含み、

4 0 m g のG Aと注射用の水（W F I）とを含む、または

前記第一の容器と前記第二の容器の内容物を混合することが希釈剤2m L当たり4 0 m gのG Aをもたらす、

キット。

【請求項16】

再発寛解型多発性硬化症（R R M S）の少なくとも1つの症状を軽減する方法、G A治療の耐容性を増大させる方法、R R M Sの進行を抑えるもしくは遅延させる方法、またはR R M Sの活動性を抑えるのに使用するための、請求項1 5に記載のキット。