

【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、T<sub>1</sub> 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 T<sub>1</sub> 強調  
病変の数を減少させること、または

前記患者の E D S S 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】

2 0 m g の G A の連日皮下投与または 4 0 m g の G A 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 G A 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 - c o - グリコール酸）（P L G A）、ポリ（乳酸）（P L A）、ポリ（グ  
リコール酸）（P G A）、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】

2 0 % ～ 3 0 % 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 G A 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 : 1 0 0 で  
ある、または

前記 G A 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 : 2 5 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 1 0】

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 8 0 % が常時攪拌下 3 7 にて P B S 中で 2 2 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 2 0 % が常時攪拌下 3 7 にて P B S 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 1 1】

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 G A 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 2 0 m  
g 用量の G A 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 4 0 m g 用量の G A の 3 回の皮下注射から、2 ～ 6 週間毎の 4 0 m g 用量の G A 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  
G A 治療の耐容性を増大させる、デポ製剤。

【請求項 1 2】

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（R R M S）に罹患しているヒト患者にお  
いて R R M S 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 1 3】

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（E D S S）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（EDSS）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 1 4】

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、1 2 週間の確定された能力障害進行（CDP）、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 1 5】

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 2 m L 当たり 4 0 m g の G A をもたらす、

キット。

【請求項 1 6】

再発寛解型多発性硬化症（RRMS）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、RRMS の進行を抑えるもしくは遅延させる方法、または RRMS 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。