

【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26年2月20日 (2014.2.20)

【公表番号】特表2013-516455(P2013-516455A)

【公表日】平成25年5月13日 (2013.5.13)

【年通号数】公開・登録公報2013-023

【出願番号】特願2012-547586(P2012-547586)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/685	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	19/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/685	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	9/10	

【手続補正書】

【提出日】平成25年12月27日 (2013.12.27)

【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】

炎症性疾患または炎症性障害の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201、1-ヘキサデシル-2-(4'-カルボキシブチル)-グリセロール-3-ホスホコリン、またはその薬学的に許容される塩を含み、かつ該炎症性疾患または炎症性障害が乾癬、関節リウマチ、多発性硬化症、炎症性腸疾患、アテローム性動脈硬化症、頸動脈炎症、および大動脈炎症からなる群より選択される、単位剤形。

【請求項２】

乾癬の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201またはその薬学的に許容される塩を含む、単位剤形。

【請求項３】

頸動脈炎症または大動脈炎症の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201またはその薬学的に許容される塩を含む、単位剤形。

【請求項４】

アテローム性動脈硬化症の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201またはその薬学的に許容される塩を含む、単位剤形。

【請求項５】

潰瘍性大腸炎の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201またはその薬学的に許容される塩を含む、単位剤形。

【請求項６】

急性冠状動脈症候群の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201またはその薬学的に許容される塩を含む、単位剤形。

【請求項７】

狭心症の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201またはその薬学的に許容される塩を含む、単位剤形。

【請求項８】

脳卒中の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201またはその薬学的に許容される塩を含む、単位剤形。

【請求項９】

心筋虚血の治療または予防に使用するための単位剤形であって、それを必要とするヒトへ経口投与される、1mg～100mgのVB-201またはその薬学的に許容される塩を含む、単位剤形。

【請求項１０】

単位剤形が20mg、30mg、40mg、50mg、60mg、70mg、80mg、90mg、または100mgのVB-201を含む、請求項１～９のいずれか一項記載の単位剤形。

【請求項１１】

80mgのVB-201を含む、請求項10記載の単位剤形。

【請求項１２】

一日あたり1または2の単位剤形が投与される、請求項1～11のいずれか一項記載の単位剤形。

【請求項13】

VB-201またはその薬学的に許容される塩を含む単位剤形であって、14日間連続してヒトに経口投与された場合、以下からなる群より選択される1または複数の特徴を有するVB-201の血漿中薬物動態学的プロファイルを有する、単位剤形：

a) 14日目に測定される $AUC_{(0-24h)}$ が、 $3,875 \sim 8,601 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、 $8,829 \sim 16,405 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、 $11,212 \sim 29,894 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、 $19,816 \sim 41,294 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、 $30,601 \sim 64,185 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、または $68,028 \sim 111,530 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ である；

b) 14日目に測定されるVB-201の C_{max} が、 $218.17 \sim 462.45 \text{ ng/mL}$ 、 $476.21 \sim 855.39 \text{ ng/mL}$ 、 $701.14 \sim 1,850.16 \text{ ng/mL}$ 、 $1,093.41 \sim 2,549.39 \text{ ng/mL}$ 、 $1,744.10 \sim 3,345.10 \text{ ng/mL}$ 、または $3,889.90 \sim 5,750.5 \text{ ng/mL}$ である；

c) 1日目に測定される $AUC_{(0-24h)}$ が、 $916 \sim 2,546 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、 $1,812 \sim 5,176 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、 $2,751 \sim 5,621 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、 $3,162 \sim 9,656 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ 、または $4,388 \sim 7,578 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ である；および

d) 1日目に測定されるVB-201の C_{max} が、 $79.72 \sim 154.96 \text{ ng/mL}$ 、 $147.56 \sim 308.28 \text{ ng/mL}$ 、 $183.50 \sim 404.96 \text{ ng/mL}$ 、 $213.76 \sim 619.40 \text{ ng/mL}$ 、または $636.30 \sim 1211.10 \text{ ng/mL}$ である。

【請求項14】

単位剤形が80mgのVB-201を含み、14日間連続してヒトに経口投与された場合、

a) $68,028 \sim 111,530 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ の $AUC_{(0-24h)}$ 、または

b) $3,889.90 \sim 5,750.5 \text{ ng/mL}$ の C_{max}

を有し、ここで $AUC_{(0-24h)}$ またはVB-201の C_{max} は14日目に測定される、VB-201の血漿中薬物動態学的プロファイルを有する、請求項13記載の単位剤形。

【請求項15】

単位剤形が40mgのVB-201を含み、14日間連続してヒトに経口投与された場合、

a) 14日目に測定される $AUC_{(0-24h)}$ が $30,601 \sim 64,185 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ である；

b) 14日目に測定されるVB-201の C_{max} が $1,744.10 \sim 3,345.10 \text{ ng/mL}$ である；

c) 1日目に測定される $AUC_{(0-24h)}$ が $4,388 \sim 7,578 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$ である；または

d) 1日目に測定されるVB-201の C_{max} が $636.30 \sim 1211.10 \text{ ng/mL}$ である、

VB-201の血漿中薬物動態学的プロファイルを有する、請求項13記載の単位剤形。

【請求項16】

炎症性疾患または炎症性障害の治療または予防に使用するための、それを必要とするヒトへ経口投与される、請求項13～15のいずれか一項記載の単位剤形。

【請求項17】

炎症性疾患または炎症性障害が乾癬である、請求項16記載の単位剤形。

【請求項18】

炎症性疾患または炎症性障害が頸動脈炎症または大動脈炎症である、請求項16記載の単位剤形。

【請求項19】

炎症性疾患または炎症性障害が、乾癬、関節リウマチ、多発性硬化症、炎症性腸疾患、アテローム性動脈硬化症、頸動脈炎症、および大動脈炎症からなる群より選択される、請求項16記載の単位剤形。

【請求項20】

炎症性疾患または炎症性障害がアテローム性動脈硬化症である、請求項19記載の単位剤形。

【請求項21】

炎症性疾患または炎症性障害が、大腸炎、回腸炎、クローン病、慢性炎症性腸疾患、炎症性腸候群、炎症性腸疾患、セリアック病、潰瘍性大腸炎、潰瘍、皮膚潰瘍、褥瘡、胃潰瘍、消化管潰瘍、頬潰瘍、鼻咽頭潰瘍、食道潰瘍、十二指腸潰瘍、および胃腸潰瘍からなる群より選択される炎症性胃腸疾患または炎症性胃腸障害である、請求項16記載の単位剤

形。

【請求項 2 2】

炎症性胃腸疾患または炎症性胃腸障害が潰瘍性大腸炎である、請求項21記載の単位剤形

。

【請求項 2 3】

炎症性疾患または炎症性障害が、閉塞性疾患または閉塞性障害、アテローム性動脈硬化症、心弁膜症、狭窄、再狭窄、ステント内再狭窄、心筋梗塞、冠動脈疾患、急性冠状動脈症候群、うっ血性心不全、狭心症、心筋虚血、血栓症、ウェゲナー肉芽腫症、高安動脈炎、川崎症候群、抗第VIII因子自己免疫疾患または抗第VIII因子自己免疫障害、壊死性細小血管炎(necrotizing small vessel vasculitis)、顕微鏡的多発血管炎、チャージ・ストラウス症候群、ポウチイミューン(pauci-immune)型巣状壊死性糸球体腎炎(pauci-immune focal necrotizing glomerulonephritis)、半月体形成性糸球体腎炎、抗リン脂質症候群、抗体誘導性心不全、血小板減少性紫斑病、自己免疫性溶血性貧血、心臓自己免疫、シャーガス病またはシャーガス障害、および抗ヘルパーTリンパ球自己免疫からなる群より選択される炎症性心血管疾患または炎症性心血管障害である、請求項16記載の単位剤形。

【請求項 2 4】

炎症性疾患または炎症性障害が急性冠状動脈症候群である、請求項23記載の単位剤形。

【請求項 2 5】

炎症性疾患または炎症性障害が狭心症である、請求項23記載の単位剤形。

【請求項 2 6】

炎症性疾患または炎症性障害が、脳卒中、脳血管炎症、脳出血、および椎骨動脈不全からなる群より選択される炎症性脳血管疾患または炎症性脳血管障害である、請求項16記載の単位剤形。

【請求項 2 7】

炎症性脳血管疾患または炎症性脳血管障害が脳卒中である、請求項26記載の単位剤形。

【請求項 2 8】

炎症性疾患または炎症性障害が、壊疽、糖尿病血管障害、虚血性腸疾患、血栓症、糖尿病性網膜症、および糖尿病性腎症からなる群より選択される末梢血管疾患または末梢血管障害である、請求項16記載の単位剤形。

【請求項 2 9】

炎症性疾患または炎症性障害が、慢性関節リウマチ、若年性慢性関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、硬皮症、混合性結合組織病、結節性多発動脈炎、多発性筋炎、皮膚筋炎、シェーグレン症候群、ベーチェット病、多発性硬化症、自己免疫性糖尿病、橋本病、乾癬、原発性粘液水腫、悪性貧血、重症筋無力症、慢性活動性肝炎、自己免疫性溶血性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、ブドウ膜炎、脈管炎、およびヘパリン起因性血小板減少症からなる群より選択される自己免疫疾患または自己免疫障害である、請求項16記載の単位剤形。

【請求項 3 0】

単位剤形が40mgのVB-201を含む、請求項10記載の単位剤形。

【請求項 3 1】

80mg用量が2の40mg用量の投与によって達成される、請求項14記載の単位剤形。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0063

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0063】

特に定めのない限り、本明細書において使用する全ての技術用語および/または科学用語は、本発明が属する当業者に一般的に理解されるものと同じ意味を有する。本明細書に記載のものと同様のまたは等価な方法および材料を本発明の態様の実施または試験におい

て使用することができるが、例示的な方法および/または材料を以下で説明する。矛盾する場合は、定義を含む本明細書が優先される。さらに、材料、方法、および実施例は例示にしかすぎず、必ず限定することが意図されない。

[本発明1001]

1mg～100mgのVB-201および薬学的に許容される担体を含み、経口投与用に製剤化された、薬学的組成物単位剤形。

[本発明1002]

炎症性疾患または炎症性障害を治療または予防するための医用薬剤の単位剤形であって、1mg～100mgのVB-201を含み、かつ経口投与用に製剤化された単位剤形の製造におけるVB-201の使用。

[本発明1003]

単位剤形が10mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1004]

単位剤形が20mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1005]

単位剤形が30mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1006]

単位剤形が40mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1007]

単位剤形が50mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1008]

単位剤形が60mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1009]

単位剤形が70mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1010]

単位剤形が80mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1011]

単位剤形が90mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1012]

単位剤形が100mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1013]

単位剤形が10mg～30mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1014]

単位剤形が15mg～25mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1015]

単位剤形が18mg～22mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1016]

単位剤形が70mg～90mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1017]

単位剤形が75mg～85mgのVB-201を含む、本発明1001～1002のいずれかの薬学的組成物単位剤形または使用。

[本発明1018]

炎症性疾患または炎症性障害の治療または予防における使用のために、包装材料の中に入れられ、かつ該包装材料の中に、または包装材料の上に印刷により識別された、本発明1001および本発明1003～1017のいずれかの薬学的組成物単位剤形。

[本発明1019]

1日1回の使用のために識別された、本発明1018の薬学的組成物単位剤形。

[本発明1020]

一日量が薬学的組成物単位剤形の1単位または2単位からなるような使用のために識別された、本発明1018～1019のいずれかの薬学的組成物単位剤形。

[本発明1021]

一日量が薬学的組成物単位剤形の1単位からなるような使用のために識別された、本発明1020の薬学的組成物単位剤形。

[本発明1022]

食事中または食後の使用のために識別された、本発明1018～1021のいずれかの薬学的組成物単位剤形。

[本発明1023]

炎症性疾患または炎症性障害を治療または予防する方法であって、炎症性疾患または炎症性障害を治療または予防する必要がある対象に治療的有効量のVB-201を経口投与する工程であって、該治療的有効量が1mg/日～100mg/日の範囲である、工程を含む、方法。

[本発明1024]

乾癬を治療または予防する方法であって、乾癬を治療または予防する必要がある対象に治療的有効量のVB-201を経口投与する工程であって、該治療的有効量が1mg/日～100mg/日の範囲である、工程を含む、方法。

[本発明1025]

慢性関節リウマチを治療または予防する方法であって、慢性関節リウマチを治療または予防する必要がある対象に治療的有効量のVB-201を経口投与する工程であって、該治療的有効量が1mg/日～100mg/日の範囲である、工程を含む、方法。

[本発明1026]

頸動脈炎症および大動脈炎症からなる群より選択される炎症を治療または予防する方法であって、頸動脈炎症および大動脈炎症からなる群より選択される炎症を治療または予防する必要がある対象に治療的有効量のVB-201を経口投与する工程であって、該治療的有効量が1mg/日～100mg/日の範囲である、工程を含む、方法。

[本発明1027]

治療的有効量のVB-201が1日1回投与される、本発明1023～1026のいずれかの方法。

[本発明1028]

炎症性疾患または炎症性障害を治療または予防する方法であって、炎症性疾患または炎症性障害を治療または予防する必要がある対象に治療的有効量のVB-201を経口投与する工程を含み、該投与する工程が1日1回または1日2回行われる、方法。

[本発明1029]

投与する工程が1日1回行われる、本発明1028の方法。

[本発明1030]

治療的有効量が1mg/日～100mg/日の範囲である、本発明1028および1029のいずれかの方法。

[本発明1031]

乾癬を治療または予防する方法であって、乾癬を治療または予防する必要がある対象に

治療の有効量のVB-201を経口投与する工程を含み、該投与する工程が1日1回または1日2回行われる、方法。

[本発明1032]

慢性関節リウマチを治療または予防する方法であって、慢性関節リウマチを治療または予防する必要のある対象に治療の有効量のVB-201を経口投与する工程を含み、該投与する工程が1日1回または1日2回行われる、方法。

[本発明1033]

頸動脈炎症および大動脈炎症からなる群より選択される炎症を治療または予防する方法であって、頸動脈炎症および大動脈炎症からなる群より選択される炎症を治療または予防する必要のある対象に治療の有効量のVB-201を経口投与する工程を含み、該投与する工程が1日1回または1日2回行われる、方法。

[本発明1034]

投与する工程が1日1回行われる、本発明1031～1033のいずれかの方法。

[本発明1035]

治療の有効量が1mg/日～100mg/日の範囲である、本発明1031～1034のいずれかの方法。

[本発明1036]

治療の有効量がVB-201 10mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1037]

治療の有効量がVB-201 20mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1038]

治療の有効量がVB-201 30mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1039]

治療の有効量がVB-201 40mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1040]

治療の有効量がVB-201 50mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1041]

治療の有効量がVB-201 60mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1042]

治療の有効量がVB-201 70mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1043]

治療の有効量がVB-201 80mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1044]

治療の有効量がVB-201 90mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1045]

治療の有効量がVB-201 100mg/日である、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1046]

治療の有効量がVB-201 10mg/日～30mg/日の範囲にある、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1047]

治療の有効量がVB-201 15mg/日～25mg/日の範囲にある、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1048]

治療の有効量がVB-201 18mg/日～22mg/日の範囲にある、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1049]

治療の有効量がVB-201 70mg/日～90mg/日の範囲にある、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1050]

治療の有効量がVB-201 75mg/日～85mg/日の範囲にある、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1051]

本発明1001および1003～1017のいずれかの薬学的組成物単位剤形の1単位または2単位を投与する工程を含む、本発明1023～1035のいずれかの方法。

[本発明1052]

薬学的組成物単位剤形の1単位を投与する工程を含む、本発明1051の方法。

[本発明1053]

治療的有効量のVB-201が食事中または食後に投与される、本発明1023～1051のいずれかの方法。

[本発明1054]

炎症性疾患または炎症性障害が内因性酸化脂質に関連している、本発明1018～1022のいずれかの薬学的組成物単位剤形、本発明1002～1016のいずれかの使用、または本発明1023および1028～1030のいずれかの方法。

[本発明1055]

炎症性疾患または炎症性障害が、特発性炎症性疾患または特発性炎症性障害、慢性炎症性疾患または慢性炎症性障害、急性炎症性疾患または急性炎症性障害、自己免疫疾患または自己免疫障害、感染性疾患または感染性障害、炎症性悪性疾患または炎症性悪性障害、炎症性移植関連疾患または炎症性移植関連障害、炎症性変性疾患または炎症性変性障害、過敏症に関連した疾患または障害、炎症性心血管疾患または炎症性心血管障害、炎症性脳血管疾患または炎症性脳血管障害、末梢血管疾患または末梢血管障害、炎症性腺疾患または炎症性腺障害、炎症性胃腸疾患または炎症性胃腸障害、炎症性皮膚疾患または炎症性皮膚障害、炎症性肝臓疾患または炎症性肝臓障害、炎症性神経学的疾患または炎症性神経学的障害、炎症性筋骨格疾患または炎症性筋骨格障害、炎症性腎臓疾患または炎症性腎臓障害、炎症性生殖疾患または炎症性生殖障害、炎症性全身疾患または炎症性全身障害、炎症性結合組織疾患または炎症性結合組織障害、炎症性腫瘍、壊死、炎症性移植片関連疾患または炎症性移植片関連障害、炎症性加齢プロセス、免疫不全疾患または免疫不全障害、増殖性疾患または増殖性障害、ならびに炎症性肺疾患または炎症性肺障害からなる群より選択される、本発明1018～1022のいずれかの薬学的組成物単位剤形、本発明1002～1016のいずれかの使用、または本発明1023および1028～1030のいずれかの方法。

[本発明1056]

疾患または障害が、乾癬、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、炎症性腸疾患、アテローム性動脈硬化症、頸動脈炎症、および大動脈炎症からなる群より選択される、本発明1055の薬学的組成物単位剤形、使用、または方法。