

【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 12 月 10 日 (2015.12.10)

【公表番号】特表 2015-500840 (P2015-500840A)

【公表日】平成 27 年 1 月 8 日 (2015.1.8)

【年通号数】公開・登録公報 2015-002

【出願番号】特願 2014-547627 (P2014-547627)

【国際特許分類】

A 6 1 K 35/16 (2015.01)

A 6 1 K 31/685 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/688 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 35/16

A 6 1 K 31/685

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 K 31/688

A 6 1 K 47/28

【手続補正書】

【提出日】平成 27 年 10 月 21 日 (2015.10.21)

【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】

ヒトにおいて疾患、障害又は状態を予防的又は治療的に処置するための医薬を製造するための、固定投薬量アポリタンパク質製剤の使用であって、ここで固定投薬量アポリタンパク質製剤は、60～140kgの体重範囲内であるヒトへの投与の際に治療的に有効であり、そして該製剤のアポリタンパク質成分への曝露における患者間変動性が、体重調整した投与計画を用いて観察されるか又は体重調整した投与計画に関連するであろう患者間変動性と比較して、相対的な減少を示すように決定される、上記使用。

【請求項 2】

疾患、障害又は状態が、心血管疾患、高コレステロール血症又は低コレステロール血症を含む、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

疾患、障害又は状態が急性冠症候群 (ACS)、アテローム性動脈硬化症、不安定狭心症、及び心筋梗塞を含む、請求項 2 に記載の使用。

【請求項 4】

アポリタンパク質への曝露の患者間変動性が、体重調整した投与計画を用いて観察されるか又は体重調整した投与計画に関連する患者間変動性の 90%未満である、請求項 7 に記載の使用。

【請求項 5】

固定投薬量が、アポリタンパク質 0.1～15g；1～10g；2～9g；3～8g

； 4 ～ 7 g ； 及び 5 ～ 6 g から選択される範囲内の量のアポリボタンパク質を含む、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 6】

固定投薬量がアポリボタンパク質を 0 . 2 5 g 、 0 . 5 g 、 1 g 、 1 . 7 g 、 2 g 、 3 . 4 g 、 4 g 、 5 . 1 g 、 6 g 、 6 . 8 g 又は 8 g 含む、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 7】

アポリボタンパク質が A p o - A 1 又はそのフラグメントである、請求項 1 ～ 6 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 8】

アポリボタンパク質製剤が再構成高密度アポリボタンパク質 (r H D L) 製剤である、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 9】

r H D L 製剤が、アポリボタンパク質、 1 つ又はそれ以上の脂質、及び場合により界面活性剤を含む、請求項 8 に記載の使用。

【請求項 1 0】

アポリボタンパク質が血漿から精製された A p o A - I であり、脂質がホスファチジルコリンであり、そして r H D L 製剤がコール酸ナトリウム界面活性剤をさらに含む、請求項 9 に記載の使用。

【請求項 1 1】

アポリボタンパク質と脂質との間の比が 1 : 4 0 ～ 1 : 7 5 (m o l : m o l) であり、そしてコール酸ナトリウムが 0 . 5 ～ 0 . 9 g / L の濃度で存在する、請求項 1 0 に記載の使用。

【請求項 1 2】

アポリボタンパク質が組換え A p o A - I であり、そして 1 つ又はそれ以上の脂質がスフィンゴミエリンとホスファチジルグリセロールとの混合物である、請求項 9 に記載の使用。

【請求項 1 3】

アポリボタンパク質と脂質との間の比が 1 : 8 0 と 1 : 1 2 0 (m o l : m o l) との間であり、そしてスフィンゴミエリン及びホスファチジルグリセロールが 9 0 : 1 0 ～ 9 9 : 1 (質量 : 質量) の比で存在する、請求項 1 2 に記載の使用。

【請求項 1 4】

6 0 ～ 1 4 0 k g の体重範囲内であるヒトへの投与の際に治療的に有効であり、そして該製剤のアポリボタンパク質成分への曝露における患者間変動性が、体重調整した投与計画を用いて観察されるか又は体重調整した投与計画に関連するであろう患者間変動性と比較して、相対的な減少を示すように決定される、固定投薬量でアポリボタンパク質製剤を製造する工程を含む、アポリボタンパク質又はそのフラグメントを含む固定投薬量アポリボタンパク質製剤を製造する方法。

【請求項 1 5】

請求項 1 4 に記載の方法に従って製造された固定投薬量アポリボタンパク質製剤。

【請求項 1 6】

変動性が、体重調整した投与計画を用いて観察されるか又は体重調整した投与計画に関連する変動性の 9 0 % 未満である、請求項 1 5 に記載の固定投薬量アポリボタンパク質製剤。

【請求項 1 7】

固定投薬量が、アポリボタンパク質 0 . 1 ～ 1 5 g ； 1 ～ 1 0 g ； 2 ～ 9 g ； 3 ～ 8 g ； 4 ～ 7 g ； 及び 5 ～ 6 g から選択される範囲内の量のアポリボタンパク質を含む、請求項 1 6 又は 1 7 に記載の固定投薬量アポリボタンパク質製剤。

【請求項 1 8】

固定投薬量が、アポリボタンパク質 0 . 2 5 g ； 0 . 5 g ； 1 g ； 1 . 7 g ； 2 g ； 3 . 4 g ； 4 g ； 5 . 1 g ； 6 g ； 6 . 8 g ； 及び 8 g から選択される量のアポリボタンバ

ク質を含む、請求項 17 に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 19】

ヒトにおける疾患、障害又は状態を予防的又は治療的に処置するために使用するための、固定投薬量アポリタンパク質製剤であって、ここで固定投薬量アポリタンパク質製剤は、60～140 kg の体重範囲内であるヒトへの投与の際に治療的に有効であり、そして該製剤のアポリタンパク質成分への曝露における患者間変動性が、体重調整した投与計画を用いて観察されるか又は体重調整した投与計画に関連するであろう患者間変動性と比較して、相対的な減少を示し、ここで固定投薬量が、0.1～0.5 g の範囲内の量のアポリタンパク質を含む、上記固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 20】

固定投薬量が、0.25 g 及び 0.5 g から選択される量のアポリタンパク質を含む、請求項 19 に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 21】

アポリタンパク質が Apo - A1 又はそのフラグメントである、請求項 15～20 のいずれか 1 項に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 22】

アポリタンパク質製剤が、再構成高密度リポタンパク質 (rHDL) 製剤である、請求項 15～21 のいずれか 1 項に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 23】

rHDL 製剤中に、アポリタンパク質、1 つ又はそれ以上の脂質及び場合により界面活性剤を含む、請求項 22 に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 24】

rHDL 製剤においてアポリタンパク質は血漿から精製された Apo A - I であり、脂質はホスファチジルコリンであり、そして rHDL 製剤はコール酸ナトリウム界面活性剤をさらに含む、請求項 23 に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 25】

アポリタンパク質と脂質との間の比が 1 : 40～1 : 75 (mol : mol) であり、コール酸ナトリウムが 0.5～0.9 g / L の濃度で存在する、請求項 24 に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 26】

アポリタンパク質が組換え Apo A - I であり、そして 1 つ又はそれ以上の脂質がスフィンゴミエリンとホスファチジルグリセロールとの混合物である、請求項 25 に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 27】

アポリタンパク質と脂質との間の比が 1 : 80 と 1 : 120 との間 (mol : mol) であり、そしてスフィンゴミエリン及びホスファチジルグリセロールが 90 : 10～99 : 1 (質量 : 質量) の比で存在する、請求項 26 に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤。

【請求項 28】

請求項 15～27 のいずれか 1 項に記載の固定投薬量アポリタンパク質製剤の 1 又はそれ以上の単位用量；及び 1 つ又はそれ以上の他のキット構成要素を含む、キット。

【請求項 29】

前記 1 つ又はそれ以上の他のキット構成要素は、使用のための指示書；各単位用量を収容するバイアル、コンテナ若しくは他の貯蔵容器；針、カテーテル、シリンジ、管状部材などのような 1 つ若しくはそれ以上の送達デバイス；並びに / 又はキットを安全かつ都合よく貯蔵及び / 又は輸送するために適した包装材料を含む、請求項 28 に記載のキット。

【請求項 30】

心血管疾患、高コレステロール血症又は低コレステロール血症を含む疾患、障害又は状態を治療的又は予防的に処置する際の使用のための、請求項 28 又は 29 に記載のキット。

【請求項 3 1】

疾患、障害又は状態が、急性冠症候群（A C S）、アテローム性動脈硬化症、不安定狭心症、及び心筋梗塞を含む、請求項 3 0 に記載のキット。

【請求項 3 2】

体重範囲が 6 0 ~ 1 2 0 g である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の使用、請求項 1 5 ~ 2 7 のいずれか 1 項に記載の固定投薬量製剤又は請求項 2 8 ~ 3 1 のいずれか 1 項に記載のキット。

【請求項 3 3】

体重範囲が 7 0 ~ 1 0 0 k g である、請求項 3 2 に記載の使用、固定投薬量製剤又はキット。

【請求項 3 4】

体重範囲が 8 0 ~ 9 0 k g である、請求項 3 3 に記載の使用、固定投薬量製剤又はキット。