

【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28年12月8日 (2016.12.8)

【公表番号】特表2015-535263(P2015-535263A)

【公表日】平成27年12月10日 (2015.12.10)

【年通号数】公開・登録公報2015-077

【出願番号】特願2015-539998(P2015-539998)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/19 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/22

A 6 1 K 9/19

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/24

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 9/10

【手続補正書】

【提出日】平成28年10月20日 (2016.10.20)

【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】

アポリポタンパク質、脂質、及び凍結乾燥安定剤を含む再構成された高密度リポタンパク質 (r H D L) 製剤であって、ここでアポリポタンパク質と脂質との間の比は約 1 : 20 ~ 約 1 : 120 (mol : mol) であり、凍結乾燥安定剤は r H D L 製剤の約 1.0 % から 6.0 % 未満 (質量 / 質量) の濃度で存在するスクロースを含み、そして凍結乾燥安定剤は r H D L 製剤の約 1.0 % から 6.0 % 未満 (質量 / 質量) の総濃度で存在する、上記 r H D L 製剤。

【請求項 2】

アポリポタンパク質と凍結乾燥安定剤との間の比が約 1 : 1 ~ 約 1 : 3 (質量 : 質量) である、請求項 1 に記載の r H D L 製剤。

【請求項 3】

凍結乾燥安定剤が約 4.0 ~ 5.5 % (質量 / 質量) の濃度で存在する、請求項 1 又は 2 に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 4】

製剤が界面活性剤をさらに含む、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 5】

界面活性剤がコール酸ナトリウムを含む、請求項 4 に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 6】

アポリポタンパク質と脂質との間の比が約 1 : 2 0 ~ 約 1 : 1 0 0 ( m o l : m o l ) である、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 7】

アポリポタンパク質の濃度が約 5 ~ 約 5 0 m g / m l である、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 8】

アポリポタンパク質がアポリポタンパク質 A - I ( アポ A - I ) を含む、請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 9】

アポ A - I が、血漿から精製されるアポ A - I 及び組み換えアポ A - I からなる群から選択される、請求項 8 に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 10】

アポ A - I が、野生型又は M i l l a n o アポ A - I 配列を含む、請求項 9 に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 11】

脂質が、少なくとも 1 つの荷電した、もしくは無荷電のリン脂質又はそれらの混合物を含む、請求項 1～10 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 12】

脂質が、ホスファチジルコリンを含む、請求項 11 に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 13】

アポリポタンパク質が血漿から精製されたアポ A - I であり、脂質がホスファチジルコリンであり、凍結乾燥安定剤がスクロースであり、かつ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 1～12 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 14】

アポリポタンパク質と脂質の間の比が、1 : 4 5 ~ 1 : 6 5 ( m o l : m o l ) であり；凍結乾燥安定剤が 4 . 6 ~ 4 . 8 % ( 質量 / 質量 ) の濃度で存在し；かつコール酸ナトリウムが 0 . 5 ~ 1 . 5 m g / m l の濃度で存在する、請求項 13 に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 15】

製剤が 6 ~ 8 の範囲の p H を有する、請求項 1～14 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 16】

製剤が凍結乾燥されている、請求項 1～15 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤。

## 【請求項 17】

アポリポタンパク質、脂質、及びスクロースを含む凍結乾燥安定剤を組み合わせる工程を含む、r H D L 製剤の製造方法であって、アポリポタンパク質と脂質との間の比は 1 : 2 0 ~ 1 : 1 2 0 ( m o l : m o l ) であり、スクロースは製剤の約 1 . 0 % から 6 . 0 % 未満 ( 質量 / 質量 ) の濃度で存在し、そして凍結乾燥安定剤は r H D L 製剤の約 1 . 0 % から 6 . 0 % 未満 ( 質量 / 質量 ) の総濃度で存在する、上記方法。

## 【請求項 18】

それを必要としているヒトにおける、心血管疾患、高コレステロール血症及び低コレステロール血症からなる群から選択される、疾患、障害又は状態を処置するための方法であって、前記ヒトに請求項 1～16 のいずれか 1 項に記載の r H D L 製剤を投与することを含む、上記方法。

## 【請求項 19】

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、狭心症及び心筋梗塞からなる群から選択される、請求項１８に記載の方法。

【請求項２０】

製剤が、非経口投与に適している、請求項１～１６のいずれか１項に記載のｒＨＤＬ製剤。

【請求項２１】

製剤が、静脈内投与に適している、請求項１～１６のいずれか１項に記載のｒＨＤＬ製剤。

【請求項２２】

アポリポタンパク質と凍結乾燥安定剤との間の比が約１：１～約１：２．４（質量：質量）である、請求項１又は２に記載のｒＨＤＬ製剤。

【請求項２３】

アポリポタンパク質と凍結乾燥安定剤との間の比が約１：１から１：２（質量：質量）未満である、請求項２１に記載のｒＨＤＬ製剤。

【請求項２４】

凍結乾燥安定剤が４．３～５．３％（質量／質量）の濃度で存在する、請求項１～３のいずれか１項に記載のｒＨＤＬ製剤。

【請求項２５】

凍結乾燥安定剤が４．６～４．８％（質量／質量）の濃度で存在する、請求項２３に記載のｒＨＤＬ製剤。