

【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 19 年 6 月 14 日 (2007.6.14)

【公表番号】特表 2002-542298 (P2002-542298A)

【公表日】平成 14 年 12 月 10 日 (2002.12.10)

【出願番号】特願 2000-613460 (P2000-613460)

【国際特許分類】

**A 6 1 K 38/55 (2006.01)**

**A 6 1 K 9/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 7/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

【F I】

A 6 1 K 37/64

A 6 1 K 9/00

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 4 月 17 日 (2007.4.17)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 キット製品であって、

(a) 低分子量トロンビン阻害物質またはその薬学的に許容しうる誘導体を、薬学的に許容しうるアジュバント、希釈剤または担体との混合物で含む医薬製剤；および

(b) 低分子量トロンビン阻害物質のプロドラッグまたはそのプロドラッグの薬学的に許容しうる誘導体を、薬学的に許容しうるアジュバント、希釈剤または担体との混合物で含む医薬製剤

を含み、成分 (a) および (b) がそれぞれ、もう一方と一緒にの投与に適する形で与えられているキット製品。

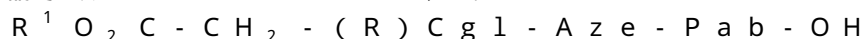
【請求項 2】 成分 (b) のプロドラッグが、成分 (a) のトロンビン阻害物質のプロドラッグである請求項 1 に記載のキット製品。

【請求項 3】 成分 (a) および (b) が、トロンビンの阻害が必要とされるまたは望まれる状態の治療において逐次的、別々のおよび / または同時の使用に適している請求項 1 または請求項 2 に記載のキット製品。

【請求項 4】 状態が深静脈血栓症である請求項 3 に記載のキット製品。

【請求項 5】 トロンビン阻害物質がメラガトランである請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載のキット製品。

【請求項 6】 プロドラッグが、式



(式中、 $R^1$  は、直鎖または分岐状  $C_{1-6}$  アルキルであり、OH 基は、Pab 中のアミノ水素の一つに取って代わる)

を有する請求項 5 に記載のキット製品。

【請求項 7】  $R^1$  が、メチル、エチルまたはプロピルである請求項 6 に記載のキット製品。

【請求項 8】  $R^1$  が、エチルである請求項 7 に記載のキット製品。

【請求項 9】 トロンビン阻害物質またはその誘導体を含む製剤が非経口製剤であり、そのプロドラッグまたはその誘導体を含む製剤が経口製剤である請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載のキット製品。

【請求項 10】 請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載のキット製品を製造する方法であって、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の成分 (a) を、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の成分 (b) と連結させ、それによって該二つの成分を互いに一緒に投与するの適当にさせることを含む方法。

【請求項 11】 低分子量トロンビン阻害物質（またはその薬学的に許容しうる誘導体）および低分子量トロンビン阻害物質のプロドラッグ（またはそのプロドラッグの薬学的に許容しうる誘導体）を、薬学的に許容しうるアジュバント、希釈剤または担体との混合物で含む医薬製剤。

【請求項 12】 プロドラッグが、式  

$$R^1 O_2 C - CH_2 - (R) Cgl - Aze - Pab - OH$$
（式中、 $R^1$  は、直鎖または分岐状  $C_{1-6}$  アルキルであり、OH 基は、Pab 中のアミノ水素の一つに取って代わる）  
を有する、請求項 11 に記載の医薬製剤。

【請求項 13】  $R^1$  が、メチル、エチルまたはプロピルである、請求項 12 に記載の医薬製剤。

【請求項 14】  $R^1$  がエチルである、請求項 13 に記載の医薬製剤。

【請求項 15】 トロンビンの阻害が必要とされるまたは望まれる状態の治療または予防用の、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載のキット製品、または請求項 11 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の医薬製剤。

【請求項 16】 キット製品の成分 (a) が、キット製品の成分 (b) の投与の開始前に投与される、請求項 15 に記載のキット製品。

【請求項 17】 状態が深静脈血栓症である、請求項 15 または請求項 16 に記載のキット製品または医薬製剤。

【請求項 18】 血栓症が外科手術によって生じる、請求項 17 に記載のキット製品または医薬製剤。

【請求項 19】 外科手術が、胃腸外科手術または整形外科手術である、請求項 18 に記載のキット製品または医薬製剤。

【請求項 20】 キット製品の成分 (a) が、外科手術の前および / または後に非経口投与され、キット製品の成分 (b) がその外科手術後に経口投与される、請求項 18 または請求項 19 に記載のキット製品。