

【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 4 月 9 日 (2020.4.9)

【公表番号】特表 2019-507165 (P2019-507165A)
 【公表日】平成 31 年 3 月 14 日 (2019.3.14)
 【年通号数】公開・登録公報 2019-010
 【出願番号】特願 2018-545843 (P2018-545843)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 9/10

【手続補正書】
 【提出日】令和 2 年 2 月 26 日 (2020.2.26)

【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】

イマチニブを含有する、脳卒中の処置用の医薬組成物であって、650 mg / 日以上の用量で少なくとも 3 日間連続して、好ましくは少なくとも 4 日間連続して、最も好ましくは少なくとも 5 日間連続して患者に投与されることを特徴とする、医薬組成物。

【請求項 2】

700 mg / 日以上の用量で、好ましくは 750 mg / 日以上の用量で、より好ましくは 800 mg / 日以上の用量で患者に投与される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

血栓摘出に先立って、血栓摘出と同時に、または血栓摘出に続いて患者に投与される、請求項 1 および 2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

血栓溶解に先立って、血栓溶解と同時に、または血栓溶解に続いて患者に投与される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

血栓摘出および血栓溶解を受けている患者または受けた患者に投与される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

【請求項 6】

前記血栓溶解が、アルテプラゼ、レテプラゼおよびテネクテプラゼから選ばれる組織プラスミノゲン活性化因子 (t P A) を投与することを含む、請求項 4 および 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

1 日目における 1000 mg / 日以上の開始用量、および、その後の日における 650 mg / 日 ~ 1000 mg / 日の幅での用量で患者に投与される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

経口投与または静脈内投与によって投与される、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

【請求項 9】

前記開始用量の少なくとも一部が静脈内投与され、かつ、残りの用量が経口投与される、請求項 7 に記載の使用のためのイマチニブ。

【請求項 10】

イマチニブの開始用量が前記処置の少なくとも 1 日目の期間中において静脈内投与され、これに対して、残る処置の期間中におけるイマチニブが経口投与される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

【請求項 11】

イマチニブを静脈内投与のための好適な溶液において、例えば、0.8% ~ 1.0% の NaCl 溶液（例えば、500 ml の 0.9% NaCl 溶液など）において 800 mg ~ 1200 mg の範囲での用量で、好ましくは 800 mg ~ 1000 mg の範囲での用量で含む、静脈内投与のための医薬組成物。

【請求項 12】

別個の容器において 800 mg の用量で供給されるイマチニブと、1 つまたは複数は容器において、例えば、50 ml、100 ml、250 ml、500 ml または 1000 ml の容積を有する、好ましくは 500 ml の容積を有する、軟質バッグなどにおいて供給される静脈内投与のために好適な溶液とを含む部品キット。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0040

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0040】

イマチニブは静脈内投与されることが現時点では好ましく、しかし、イマチニブは錠剤形態で利用可能であるので、イマチニブの開始用量が処置の少なくとも 1 日目の期間中において静脈内投与され、これに対して、残る処置の期間中におけるイマチニブが経口投与されることが意図される。したがって、なおさらに別の実施形態が、1000 mg のイマチニブが 500 ml の 0.9% NaCl に存在する溶液と、n 個の 400 mg イマチニブ錠剤（n は 2 ~ 4 の間での整数である）とを含む部品キットである。

他の記載と重複するが、本発明を以下に示す。

【発明 1】

脳卒中の処置における使用のためのイマチニブであって、650 mg / 日以上用量で少なくとも 3 日間連続して、好ましくは少なくとも 4 日間連続して、最も好ましくは少なくとも 5 日間連続して患者に投与されることを特徴とする、イマチニブ。

【発明 2】

700 mg / 日以上用量で、好ましくは 750 mg / 日以上用量で、より好ましくは 800 mg / 日以上用量で患者に投与される、発明 1 に記載の使用のためのイマチニブ。

【発明 3】

血栓摘出に先立って、血栓摘出と同時に、または血栓摘出に続いて患者に投与される、発明 1 および 2 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

【発明 4】

血栓溶解に先立って、血栓溶解と同時に、または血栓溶解に続いて患者に投与される、発明 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

【発明 5】

血栓摘出および血栓溶解を受けている患者または受けた患者に投与される、発明 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

【発明 6】

前記血栓溶解が、アルテプラゼ、レテプラゼおよびテネクテプラゼから選ばれる組織プラスミノゲン活性化因子（tPA）を投与することを含む、発明 4 および 5 のい

いずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

[発明 7]

患者が急性虚血性脳卒中または出血性脳卒中に見舞われているかどうか明らかにされる前に、前記患者に投与される、脳卒中の処置における使用のためのイマチニブ。

[発明 8]

1 日目における 1 0 0 0 m g / 日以上を開始用量、および、その後の日における 6 5 0 m g / 日 ~ 1 0 0 0 m g / 日の幅での用量で患者に投与される、発明 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

[発明 9]

経口投与または静脈内投与によって投与される、発明 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

[発明 1 0]

前記開始用量の少なくとも一部が静脈内投与され、かつ、残りの用量が経口投与される、発明 8 に記載の使用のためのイマチニブ。

[発明 1 1]

イマチニブの開始用量が前記処置の少なくとも 1 日目の期間中において静脈内投与され、これに対して、残る処置の期間中におけるイマチニブが経口投与される、発明 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の使用のためのイマチニブ。

[発明 1 2]

脳卒中を処置するための方法であって、イマチニブが 6 5 0 m g / 日以上で少なくとも 3 日間連続して、好ましくは少なくとも 4 日間連続して、最も好ましくは少なくとも 5 日間連続して患者に投与される、方法。

[発明 1 3]

イマチニブが、7 0 0 m g / 日以上で、好ましくは 7 5 0 m g / 日以上で、より好ましくは 8 0 0 m g / 日以上で患者に投与される、発明 1 2 に記載の方法。

[発明 1 4]

イマチニブが、血栓摘出に先立って、血栓摘出と同時に、または血栓摘出に続いて患者に投与される、発明 1 2 および 1 3 のいずれか一項に記載の方法。

[発明 1 5]

イマチニブが、血栓溶解に先立って、血栓溶解と同時に、または血栓溶解に続いて患者に投与される、発明 1 2 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の方法。

[発明 1 6]

イマチニブが、血栓摘出および血栓溶解を受けている患者または受けた患者に投与される、発明 1 4 および 1 5 のいずれか一項に記載の方法。

[発明 1 7]

前記血栓溶解が、アルテプラゼ、レテプラゼおよびテネクテプラゼから選ばれる組織プラスミノゲン活性化因子 (t P A) を投与することを含む、発明 1 2 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の方法。

[発明 1 8]

脳卒中を処置するための方法であって、イマチニブが、患者が急性虚血性脳卒中または出血性脳卒中に見舞われているかどうか明らかにされる前に前記患者に投与される、方法。

[発明 1 9]

前記イマチニブが、1 日目における 1 0 0 0 m g / 日以上を開始用量、および、その後の日における 6 5 0 m g / 日 ~ 約 1 0 0 0 m g / 日の幅での用量で患者に投与される、発明 1 2 ~ 1 8 のいずれか一項に記載の方法。

[発明 2 0]

イマチニブが経口投与または静脈内投与によって投与される、発明 1 9 に記載の方法。

[発明 2 1]

イマチニブの開始用量が前記処置の少なくとも１日目の期間中において静脈内投与され、これに対して、残る処置の期間中におけるイマチニブが経口投与される、発明１２～１８のいずれか一項に記載の方法。

[発明 ２ ２]

前記開始用量の少なくとも一部が静脈内投与され、かつ、残りの用量が経口投与される、発明 １ ９ に記載の方法。

[発明 ２ ３]

イマチニブを静脈内投与のための好適な溶液において、例えば、０．８％～１．０％の NaCl 溶液（例えば、５００ｍｌの０．９％NaCl 溶液など）において４００ｍｇ～１２００ｍｇの範囲での用量で、好ましくは８００ｍｇ～１０００ｍｇの範囲での用量で含む、静脈内投与のための医薬組成物。

[発明 ２ ４]

別個の容器において４００ｍｇまたは８００ｍｇの用量で供給されるイマチニブと、１つまたは複数は容器において、例えば、５０ｍｌ、１００ｍｌ、２５０ｍｌ、５００ｍｌまたは１０００ｍｌの容積を有する、好ましくは５００ｍｌの容積を有する、軟質バッグなどにおいて供給される静脈内投与のために好適な溶液とを含む部品キット。