

【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、650mg/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】

700mg/日以上の用量で、好ましくは750mg/日以上の用量で、より好ましくは800mg/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、アルテプラーゼ、レテプラーゼおよびテネクテプラーゼから選ばれる組織プラスミノーゲン活性化因子(tPA)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1000mg/日以上の開始用量、および、その後の日における650mg/日～1000mg/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、500mlの0.9%NaCl溶液など）において800mg～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。

**【請求項 12】**

別個の容器において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。

**【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、なおさらには別の実施形態が、1000mgのイマチニブが500mlの0.9%NaClに存在する溶液と、n個の400mg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、650mg/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、イマチニブ。

**[発明2]**

700mg/日以上の用量で、好ましくは750mg/日以上の用量で、より好ましくは800mg/日以上の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、アルテプラーゼ、レテプラーゼおよびテネクテプラーゼから選ばれる組織プラスミノーゲン活性化因子（tPA）を投与することを含む、発明4および5のい

す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が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1000mg/日以上の開始用量、および、その後の日における650mg/日～1000mg/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 10]

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 11]

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 12]

脳卒中を処置するための方法であって、イマチニブが650mg/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、方法。

[発明 13]

イマチニブが、700mg/日以上の用量で、好ましくは750mg/日以上の用量で、より好ましくは800mg/日以上の用量で患者に投与される、発明12に記載の方法。

[発明 14]

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12および13のいずれか一項に記載の方法。

[発明 15]

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12～14のいずれか一項に記載の方法。

[発明 16]

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14および15のいずれか一項に記載の方法。

[発明 17]

前記血栓溶解が、アルテプラーゼ、レテプラーゼおよびテネクテプラーゼから選ばれる組織プラスミノーゲン活性化因子(tPA)を投与することを含む、発明12～16のいずれか一項に記載の方法。

[発明 18]

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が明らかにされる前に前記患者に投与される、方法。

[発明 19]

前記イマチニブが、1日目における1000mg/日以上の開始用量、および、その後の日における650mg/日～約1000mg/日の幅での用量で患者に投与される、発明12～18のいずれか一項に記載の方法。

[発明 20]

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19に記載の方法。

[発明 21]

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22]

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19に記載の方法。

[発明23]

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24]

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。