

【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23年6月23日(2011.6.23)

【公表番号】特表2010-526104(P2010-526104A)

【公表日】平成22年7月29日(2010.7.29)

【年通号数】公開・登録公報2010-030

【出願番号】特願2010-506700(P2010-506700)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/422

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成23年4月28日(2011.4.28)

【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】

それを必要とする患者において血小板凝集を阻害する又は血栓症を治療若しくは予防するための医薬組成物であって、該患者において治療的に有効な血漿濃度を達成するのに十分な量の抗血栓剤を含み、前記治療的に有効な血漿濃度は、

(a)哺乳類から得られる血液サンプルを、該血液サンプルにおいて血小板凝集を誘発するのに十分な量の生理的血小板アゴニストと接触させること、及び血小板凝集の第1量を計測すること;並びに

(b)続いて、該血液サンプルをある血漿濃度の抗血栓剤と接触させること、及び該血液サンプル中の血小板凝集の第2量を計測すること

を含む方法によって決定され、ここで、該血小板凝集の第2量が、該血小板凝集の第1量より少なくとも25%低い場合、該抗血栓剤の血漿濃度が、治療的に有効な血漿濃度である、前記医薬組成物。

【請求項2】

前記生理的血小板アゴニストがコラーゲンである、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記生理的血小板アゴニストと前記血液サンプルを接触させる前に、該血液サンプルの凝固を阻止することをさらに含む、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記抗血栓剤が、トロンボキサン受容体アンタゴニストである、請求項1記載の医薬組

成物。

【請求項 5】

前記トロンボキサン受容体アンタゴニストが、イフェトロバンである、請求項4記載の医薬組成物。

【請求項 6】

血小板の凝集をインビトロで阻害する方法であって、100nM超の濃度のイフェトロバンと血小板をインビトロで接触させることを含む、前記方法。

【請求項 7】

それを必要とする患者において血栓症を治療又は予防するための医薬組成物であって、100nM超の血漿濃度を少なくとも24時間達成するのに十分な量のイフェトロバンを含む、前記医薬組成物。

【請求項 8】

前記イフェトロバンの量が、1から10mg/kg/日である、請求項7記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記量が、350nM以上の血漿濃度を少なくとも12時間達成するのに十分である、請求項7記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記量が、350nM以上の血漿濃度を少なくとも24時間達成するのに十分である、請求項7記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記イフェトロバンの量が、6から10mg/kg/日である、請求項10記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記量が、250nM以上の血漿濃度を少なくとも24時間達成するのに十分である、請求項7記載の医薬組成物。

【請求項 13】

哺乳類の血小板の凝集を阻害するための抗血栓剤の有効濃度を決定する方法であって、(a)哺乳類から得られた血液サンプルを、該血液サンプルにおける血小板凝集を誘発するのに十分な量の生理的血小板アゴニストと接触させること、及び血小板凝集の第1量を計測すること;並びに

(b)続いて、該血液サンプルを、ある血漿濃度の抗血栓剤と接触させること、及び該血液サンプルにおける血小板凝集の第2量を計測することを含み、ここで、該血小板凝集の第2量が、該血小板凝集の第1量より少なくとも25%低い場合、該血漿濃度が、哺乳類の血小板の凝集を阻害するための抗血栓剤の有効濃度である、前記方法。

【請求項 14】

前記生理的血小板アゴニストが、コラーゲン、エピネフリン、及びADPからなる群から選択される、請求項13記載の方法。

【請求項 15】

前記血液サンプルを前記生理的血小板アゴニストと接触させる前に、該血液サンプルの凝固を阻止することをさらに含む、請求項13記載の方法。

【請求項 16】

前記抗血栓剤が、トロンボキサン受容体アンタゴニストである、請求項13記載の方法。

【請求項 17】

前記トロンボキサン受容体アンタゴニストが、イフェトロバンである、請求項16記載の方法。

【請求項 18】

それを必要とする患者において血栓症を治療又は予防するための医薬組成物であって、該患者において少なくとも350nMの恒常的な血漿濃度をしばらくの間達成するのに十分な量のイフェトロバンを含む、前記医薬組成物。

【請求項 19】

前記量が、350nMから1000nMの範囲の恒常的な血漿濃度をしばらくの間達成するのに十

分である、請求項18記載の医薬組成物。

【請求項 20】

それを必要とする患者において血栓症を治療又は予防するための医薬組成物であって、該患者においてC<sub>max</sub>が1500から2500ng/mLの範囲である血漿濃度を達成するのに十分な量のイフェトロバンを含む、前記医薬組成物。

【請求項 21】

それを必要とする患者において血栓症を治療又は予防するための医薬組成物であって、該患者において平均トラフ濃度が約154ng/mLである総血漿濃度を達成するのに十分な量のイフェトロバンを含む、前記医薬組成物。

【請求項 22】

それを必要とする患者において血栓症を治療又は予防するための医薬組成物であって、該患者においてトラフ濃度に対するピークの比が15以下である総血漿濃度を達成するのに十分な量のイフェトロバンを含む、前記医薬組成物。