

【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25年8月1日(2013.8.1)

【公表番号】特表2013-501811(P2013-501811A)
 【公表日】平成25年1月17日(2013.1.17)
 【年通号数】公開・登録公報2013-003
 【出願番号】特願2012-524897(P2012-524897)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 7/04

C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成25年6月11日(2013.6.11)

【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】

低血小板数が原因の少なくとも一部である出血リスクのある対象の血小板応答を迅速に増加させるための医薬組成物であって、

1-(3-クロロ-5-{[4-(4-クロロチオフェン-2-イル)-5-(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル]カルバモイル}ピリジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸の有効量を含み、

血小板応答を14日未満で増加させ、その結果、対象の出血リスクを低下させるための医薬組成物。

【請求項2】

1-(3-クロロ-5-{[4-(4-クロロチオフェン-2-イル)-5-(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル]カルバモイル}ピリジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸の投与後約14日以内、約7日以内、約3日以内又は約24時間以内に、血小板応答を検出するように用いられる、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

対象の最初の血小板数が、 $30,000/\text{mm}^3$ 未満である又はほぼこれに等しく、血小板数がおよそ7日未満で、およそ $50,000/\text{mm}^3$ 以上まで増加する、請求項1又は2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

およそ28日目の対象の応答率が、最初の血小板数に対して、且つプラセボを投与された対象と比較して、少なくとも約10%、約25%、約50%又は約80%である、請求項1~3のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項5】

およそ7日目の対象の応答率が、最初の血小板数に対して、且つプラセボを投与された対象と比較して、少なくとも約5%、約10%、約25%、約50%、約70%、約90%又は約98%である、請求項1~4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

対象の持続的な血小板応答が、少なくとも約25%、約30%、約40%、約50%、約75%又は約77%である、請求項1~5のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

血小板応答が、少なくとも約7日間、約14日間、約28日間、約2カ月間、約3カ月間、約4カ月間、約5カ月間又は約6カ月間持続する、請求項1~6のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

血小板応答が、最初の血小板数に対して少なくとも約10%、約25%、約50%又は約90%増加する、請求項1~7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

血小板応答が、少なくとも約10,000/mm³から約400,000/mm³の間だけ増加する(正味変化又は達成される)、請求項1~8のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記有効量が周期的有効用量である、請求項1~9のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記周期的有効用量が、1日1回用量、1日2回用量、1日3回用量、隔日用量、週1回用量又は月1回用量である、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

周期的有効用量が、約1カ月間、約2カ月間、約3カ月間、約4カ月間、約5カ月間、約6カ月間又は約7カ月間投与される、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

対象が、出血を誘発し得る治療を必要としている、請求項1~12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

対象が、少なくとも治療の約1カ月以内に、少なくとも治療の約14日以内に、少なくとも治療の約7日以内に、又は少なくともほぼ治療時点で低血小板数を有する、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

治療が、外科手術、化学療法若しくは放射線治療又はこれらの組合せを含む、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

外科手術が、麻酔薬の投与、生検、硬膜外の投与、移植又は歯科的処置を含む、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

対象が血小板減少症である、請求項1~16のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

対象が、がん、肝疾患、ビタミンB12欠乏、全身性ウイルス感染、全身性細菌感染、敗血症、デング熱又は免疫異常に対する治療をさらに必要としている、請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

肝疾患が、慢性ウイルス性肝炎、非アルコール性脂肪性肝炎、アルコール性肝疾患、肝不全又は敗血症である、請求項18に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

血小板減少症が、慢性免疫性(特発性)血小板減少性紫斑病、放射線誘発性血小板減少症、化学療法誘発性血小板減少症、HIV/AIDS誘発性血小板減少症、貧血誘発性血小板減少症、血栓性血小板減少性紫斑病又は新生児同種免疫性血小板減少症である、請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

対象が、化学療法又は放射線治療が原因で血小板減少症を発症する可能性が高く、対象

の出血リスクが低下するように、1-(3-クロロ-5-{[4-(4-クロロチオフェン-2-イル)-5-(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル]カルバモイル}ピリジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸が予防的に投与される、請求項1~20のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記対象が永続的な血小板応答を有する、請求項1~21のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記対象が一過性の血小板応答を有する、請求項1~21のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記対象が血小板応答を維持する、請求項1~21のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

前記対象が以前に3ライン未満の治療を受けたことがある、請求項1~24のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記対象が、以前に三つ以上のラインの治療を受けたことがある、請求項1~24のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

前記対象に脾臓摘出歴がある、請求項1~26のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

前記対象に脾臓摘出歴がない、請求項1~26のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

前記対象がステロイド系薬物を併用している、請求項1~28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 0】

前記ステロイドがプレドニゾンである、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項 3 1】

1-(3-クロロ-5-{[4-(4-クロロチオフェン-2-イル)-5-(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル]カルバモイル}ピリジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸を投与すると、前記対象がステロイドの使用を減少させるように用いられる、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

1-(3-クロロ-5-{[4-(4-クロロチオフェン-2-イル)-5-(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル]カルバモイル}ピリジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸を投与すると、前記対象が前記ステロイドの使用を永続的に中止するように用いられる、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

1-(3-クロロ-5-{[4-(4-クロロチオフェン-2-イル)-5-(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル]カルバモイル}ピリジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸の投与を中止した後、約1週間、約2週間、約3週間又は約4週間血小板応答が持続する、請求項6に記載の医薬組成物。