

【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 17 年 4 月 21 日 (2005.4.21)

【公表番号】特表 2005-500981(P2005-500981A)
 【公表日】平成 17 年 1 月 13 日 (2005.1.13)
 【年通号数】公開・登録公報 2005-002
 【出願番号】特願 2002-557409(P2002-557409)
 【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 45/00
 A 6 1 J 3/00
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 38/00
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 43/00
 // C 0 7 K 14/155

【 F I 】

A 6 1 K 45/00 Z N A
 A 6 1 J 3/00 3 1 0 Z
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 A 6 1 K 37/02
 C 0 7 K 14/155

【手続補正書】
 【提出日】平成 15 年 6 月 19 日 (2003.6.19)
 【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】

H I V 感染の処置を必要とする個体における H I V 感染を処置するための組み合わせ治療のための第 1 の薬学的組成物および第 2 の薬学的組成物を製造するための、C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩および D P - 1 7 8 ポリペプチドまたはその薬学的に受容可能な誘導体の使用であって、第 1 の薬学的組成物は、一定量の C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩を含み、ならびに第 2 の薬学的組成物は、一定量の D P - 1 7 8 ポリペプチドまたはその薬学的に受容可能な誘導体を含む、使用。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の使用であって、前記 C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩の投薬量が 2 5 m g ~ 6 0 0 m g であり、そして前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドまたはその薬学的に受容可能な誘導体の投薬量が、3 m g ~ 2 0 0 m g または前記個体におけるウイルス量を 1 1 0 g ~ 2 1 0 g 減少させるこの倍数量である、使用。

【請求項 3】

前記 C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩を含む一定量の前記第 1 の薬学的組成物が、1 投与日につき 1 回または 2 回の投与用である、請求項 1 に記載の使用。

。

【請求項 4】

前記 C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩を含む一定量の前記第 1 の薬学的組成物が、1 週間につき 1 回～3 回または 1 日おきの投与用である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 5】

前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドを含む一定量の前記第 2 の薬学的組成物が、1 週間につき 1 回～3 回または 1 日おきの投与用である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 6】

前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドを含む一定量の前記第 2 の薬学的組成物が、1 週間につき 3 回または 1 日おきの投与用である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 7】

前記 C C R 5 アンタゴニストを含む一定量の前記第 1 の薬学的組成物が、経口投与用である、請求項 1 に記載の使用。

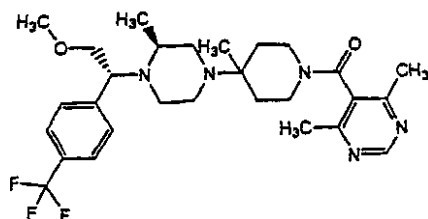
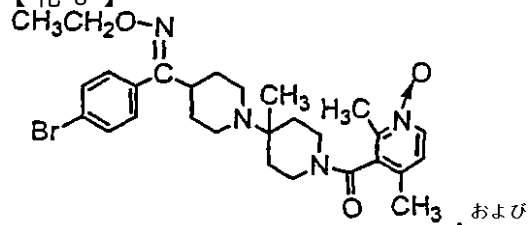
【請求項 8】

前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドを含む一定量の前記第 2 の薬学的組成物が、皮下投与用である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 9】

前記 C C R 5 アンタゴニストが、以下：

【化 8】



からなる群より選択される化合物である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 10】

前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドが、表 3 におけるアミノ酸配列からなる、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 11】

前記組み合わせ治療が、H I V の処置のために有用である 1 つ以上の抗ウイルス剤または治療剤と組み合わせる、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 12】

前記抗ウイルス剤が、ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、およびプロテアーゼ阻害剤からなる群から選択される、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 13】

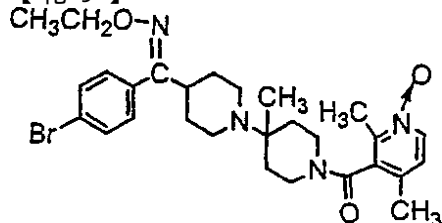
前記抗ウイルス剤が、D P - 1 0 7 ポリペプチド、ジドブジン、ラミブジン、ザルシタビン、ジダノシン、スタブジン、アバカビル、アデフォビル・ジピボキシル、ロブカビル、B C H - 1 0 6 5 2、エミトリシタピン、- L - F D 4、D A P D、ロデノシン、ネビラピン、デラビリジン、エファビレンツ、P N U - 1 4 2 7 2 1、A G - 1 5 4 9、M K C - 4 4 2、(+) - カラノリド A および (+) - カラノリド B、サキナビル、インジ

ナビル、リトナビル、ネルフィナビル、ラシナビル、DMP - 450、BMS - 2322623、ABT - 378、アンブレナビル、ヒドロキシ尿素、リバビリン、IL - 2、IL - 12、Yissum No. 11607およびAG - 1549からなる群から選択される、請求項11に記載の使用。

【請求項14】

HIV感染の処置を必要とする個体におけるHIV感染を処置するための組み合わせ治療のための、経口投与用の第1の薬学的組成物および皮下投与用の第2の薬学的組成物を製造するための、構造式

【化9】



のCCR5アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩、およびT - 20の使用であって、

該第1の薬学的組成物は、一定量の該CCR5アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩を含み、そして該第2の薬学的組成物は、該T - 20を含み、そして

該CCR5アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩の経口投薬量は、1日につき1回～2回で、25～400mg/日であり、そして該T - 20の皮下投薬量は、1週につき1回、2回、3回または4回か、1日おきに1回で、3mg～200mgまたは前記個体におけるウイルス量を減少させるその倍数量である、使用。

【請求項15】

前記組み合わせ治療が、HIVの処置において有用である1つ以上の抗ウイルス剤または治療剤と組み合わせて施与される、請求項14に記載の使用。

【請求項16】

前記抗ウイルス剤が、ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、およびプロテアーゼ阻害剤からなる群から選択される、請求項15に記載の使用。

【請求項17】

前記抗ウイルス剤が、DP - 107ポリペプチド、ジドブジン、ラミブジン、ザルシタビン、ジダノシン、スタブジン、アパカビル、アデフォビル・ジピボキシル、ロブカビル、BCH - 10652、エミトリシタピン、- L - FD4、DAPD、ロデノシン、ネビラピン、デラビリジン、エファビレンツ、PNU - 142721、AG - 1549、MKC - 442、(+)-カラノリドA および(+)-カラノリドB、サキナビル、インジナビル、リトナビル、ネルフィナビル、ラシナビル、DMP - 450、BMS - 2322623、ABT - 378、アンブレナビル、ヒドロキシ尿素、リバビリン、IL - 2、IL - 12、Yissum No. 11607およびAG - 1549からなる群から選択される、請求項15に記載の使用。

【請求項18】

HIV感染を処置するために組み合わせて使用するための単一包装薬学的組成物を含むキットであって、該キットは、1週間につき1回～3回または1日おきに投与されるべき経口投薬量25mg～600mgで、CCR5アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩を薬学的に受容可能なキャリア中に含む、薬学的組成物を第1容器中に含む、そして皮下投薬量3mg～200mgまたはウイルス量を1logまたは2log減少させるその倍数量で、DP - 178ポリペプチドまたはその薬学的に受容可能な誘導体を薬学的に受容可能なキャリア中に含む、薬学的組成物を第2容器中に含む、キット。

【請求項19】

請求項18に記載のキットであって、HIVの処置において有用である治療有効量の抗ウイルス剤または治療剤を薬学的に受容可能なキャリア中に含む1つ以上の薬学的組成物を

さらなる容器中に含む、キット。

【請求項 20】

H I V 感染の処置を必要とする個体における H I V 感染を処置するためのキットであって、該キットは、H I V 感染の処置を必要とする個体における H I V 感染を処置するための組み合わせ治療のための第 1 の薬学的組成物および第 2 の薬学的組成物を含み、該第 1 の薬学的組成物は、一定量の C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩を含み、そして該第 2 の薬学的組成物は、一定量の D P - 1 7 8 ポリペプチドまたはその薬学的に受容可能な誘導体を含む、キット。

【請求項 21】

請求項 20 に記載のキットであって、前記 C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩の投薬量が、25 mg ~ 600 mg であり、そして前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドまたはその薬学的に受容可能な誘導体の投薬量が、3 mg ~ 200 mg または前記個体におけるウイルス量を 1 l o g ~ 2 l o g 減少させるこの倍数量である、キット。

【請求項 22】

前記 C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩を含む一定量の前記第 1 の薬学的組成物が、1 投与日につき 1 回または 2 回の投与用である、請求項 20 に記載のキット。

【請求項 23】

前記 C C R 5 アンタゴニストまたはその薬学的に受容可能な塩を含む一定量の前記第 1 の薬学的組成物が、1 週間につき 1 回 ~ 3 回または 1 日おきの投与用である、請求項 20 に記載のキット。

【請求項 24】

前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドを含む一定量の前記第 2 の薬学的組成物が、1 週間につき 1 回 ~ 3 回または 1 日おきの投与用である、請求項 20 に記載のキット。

【請求項 25】

前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドを含む一定量の前記第 2 の薬学的組成物が、1 週間につき 3 回または 1 日おきの投与用である、請求項 20 に記載のキット。

【請求項 26】

前記 C C R 5 アンタゴニストを含む一定量の前記第 1 の薬学的組成物が、経口投与用である、請求項 20 に記載のキット。

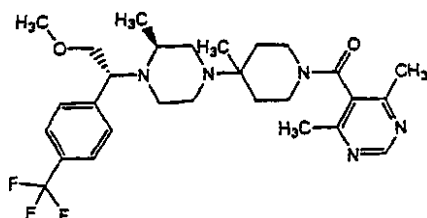
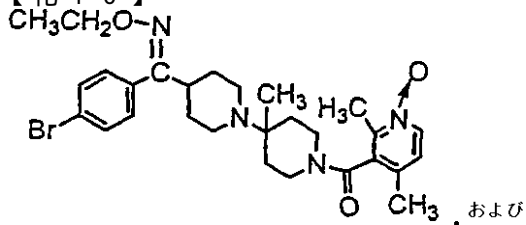
【請求項 27】

前記 D P - 1 7 8 ポリペプチドを含む一定量の前記第 2 の薬学的組成物が、皮下投与用である、請求項 20 に記載のキット。

【請求項 28】

前記 C C R 5 アンタゴニストが、以下：

【化 10】



からなる群より選択される化合物である、請求項 20 に記載のキット。

【請求項 29】

前記 DP - 178 ポリペプチドが、表 3 におけるアミノ酸配列からなる、請求項 20 に記載のキット。

【請求項 30】

前記組み合わせ治療が、HIV の処置のために有用である 1 つ以上の抗ウイルス剤または治療剤と組み合わせて施与される、請求項 20 に記載のキット。

【請求項 31】

前記抗ウイルス剤が、ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、およびプロテアーゼ阻害剤からなる群から選択される、請求項 30 に記載のキット。

【請求項 32】

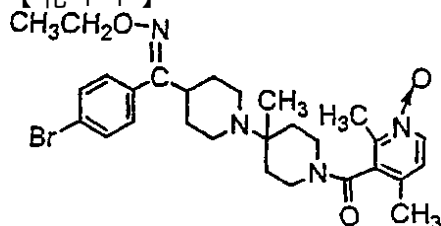
前記抗ウイルス剤が、DP - 107 ポリペプチド、ジドブジン、ラミブジン、ザルシタビン、ジダノシン、スタブジン、アバカビル、アデフォビル・ジピボキシル、ロブカビル、BCH - 10652、エミトリシタピン、- L - FD4、DAPD、ロデノシン、ネビラビン、デラビリジン、エファビレンツ、PNU - 142721、AG - 1549、MKC - 442、(+)-カラノリド A および(+)-カラノリド B、サキナビル、インジナビル、リトナビル、ネルフィナビル、ラシナビル、DMP - 450、BMS - 2322623、ABT - 378、アンブレナビル、ヒドロキシ尿素、リバビリン、IL - 2、IL - 12、Yissum No. 11607 および AG - 1549 からなる群から選択される、請求項 30 に記載のキット。

【請求項 33】

HIV 感染の処置を必要とする個体における HIV 感染を処置するための組み合わせ治療のためのキットであって、該キットは、経口投与用の第 1 の薬学的組成物および皮下投与用の第 2 の薬学的組成物を含み、

該第 1 の薬学的組成物は、一定量の構造式

【化 11】



の CCR5 アンタゴニストまたはその薬学的受容可能な塩を含み、そして該第 2 の薬学的組成物は、一定量の T - 20 を含み、そして

該 CCR5 アンタゴニストまたはその薬学的受容可能な塩の経口投薬量は、1 日につき 1 回 ~ 2 回で、25 ~ 400 mg / 日であり、そして該 T - 20 の皮下投薬量は、1 週につき 1 回、2 回、3 回、または 4 回か、または 1 日おきに 1 回で、3 ~ 200 mg または該個体におけるウイルス量を減少させるその倍数量である、キット。

【請求項 34】

前記組み合わせ治療が、HIV の処置において有用である 1 つ以上の抗ウイルス剤または治療剤と組み合わせて施与される、請求項 33 に記載のキット。

【請求項 35】

前記抗ウイルス剤が、ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、およびプロテアーゼ阻害剤からなる群から選択される、請求項 34 に記載のキット。

【請求項 36】

前記抗ウイルス剤が、DP - 107 ポリペプチド、ジドブジン、ラミブジン、ザルシタビン、ジダノシン、スタブジン、アバカビル、アデフォビル・ジピボキシル、ロブカビル、BCH - 10652、エミトリシタピン、- L - FD4、DAPD、ロデノシン、ネビ

ラピン、デラビリジン、エファビレンツ、PNU - 142721、AG - 1549、MK
C - 442、(+) - カラノリドA および(+) - カラノリドB、サキナビル、インジ
ナビル、リトナビル、ネルフィナビル、ラシナビル、DMP - 450、BMS - 2322
623、ABT - 378、アンブレナビル、ヒドロキシ尿素、リバビリン、IL - 2、I
L - 12、Yissum No. 11607およびAG - 1549からなる群から選択さ
れる、請求項34に記載のキット。