

【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20年11月27日(2008.11.27)

【公表番号】特表2008-517921(P2008-517921A)
 【公表日】平成20年5月29日(2008.5.29)
 【年通号数】公開・登録公報2008-021
 【出願番号】特願2007-538049(P2007-538049)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/427 (2006.01)
 A 6 1 K 31/155 (2006.01)
 A 6 1 K 45/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 A 6 1 K 31/40 (2006.01)
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)
 A 6 1 K 31/472 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 3/00 (2006.01)
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)
 A 6 1 K 9/24 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/427
 A 6 1 K 31/155
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/40
 A 6 1 K 31/426
 A 6 1 K 31/472
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 K 9/24

【手続補正書】

【提出日】平成20年10月8日(2008.10.8)

【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】

同時、個別または連続使用される、

i) ジベプチジルベプチダーゼ - I V (D P P - I V) 阻害剤、

ii) チアゾリジンジオン(グリタゾン)、非グリタゾン型 P P A R アゴニスト、P P A R アゴニストまたは二重 P P A R / P P A R アゴニストから選択される1種の P

P A R 抗糖尿病薬、および

iii) メトホルミン、

または上記化合物いずれかの医薬上許容される塩および所望により少なくとも1種の医薬上許容される担体を含む組合わせ剤。

【請求項2】

固定した組合わせ剤の形態である、請求項1記載の組合わせ剤。

【請求項3】

D P P - I V 阻害剤、P P A R 抗糖尿病薬およびメトホルミンが、慣用的即時放出型である、請求項2記載の固定した組合わせ剤。

【請求項4】

i) D P P - I V 阻害剤およびP P A R 抗糖尿病薬が慣用的即時放出型であり、そして
ii) メトホルミンが持続放出型である、

請求項2記載の固定した組合わせ剤。

【請求項5】

P P A R 抗糖尿病薬が、化合物L、ピオグリタゾン、塩酸ピオグリタゾン、トログリタゾンまたはロシグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、または上記化合物いずれかの医薬上許容される塩から選択される、請求項1～4のいずれか1項記載の組合わせ剤。

【請求項6】

D D P - I V 阻害剤が、1 - { 2 - [(5 - シアノピリジン - 2 - イル) アミノ] エチルアミノ } アセチル - 2 (S) - シアノ - ピロリジン二塩酸塩 (D P P 7 2 8)、特にその二塩酸塩、(S) - 1 - [(3 - ヒドロキシ - 1 - アダマンチル) アミノ] アセチル - 2 - シアノ - ピロリジン (L A F 2 3 7)、L - トレオ - イソロイシルチアゾリジン (プロバイオドラッグによる化合物コード : 明細書記載の P 3 2 / 9 8)、M K - 0 4 3 1、3 - (アミノメチル) - 2 - イソブチル - 1 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 2 - ジヒドロ - 6 - イソキノリンカルボキサミドおよび 2 - { [3 - (アミノメチル) - 2 - イソブチル - 4 - フェニル - 1 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロ - 6 - イソキノリル] オキシ } アセトアミドおよび所望により何らかの医薬的塩類から選択される、請求項1～5のいずれか1項記載の組合わせ剤。

【請求項7】

D D P - I V 阻害剤が、(S) - 1 - [(3 - ヒドロキシ - 1 - アダマンチル) アミノ] アセチル - 2 - シアノ - ピロリジン (L A F 2 3 7) であり、P P A R 抗糖尿病薬が、化合物L、ピオグリタゾンまたはロシグリタゾン、または上記化合物いずれかの医薬上許容される塩から選択される、請求項1～4のいずれか1項記載の組合わせ剤。

【請求項8】

ジペプチジルペプチダーゼ - I V が介在する状態の予防、進行遅延または処置を目的とする医薬の製造についての

i) メトホルミンまたはその塩、および

ii) ピオグリタゾンまたはロシグリタゾンまたは何らかの医薬的塩類

と組合わせた、L A F 2 3 7 またはその医薬的塩の使用。

【請求項9】

D P P - I V が介在する状態の処置方法であって、処置を必要とする温血動物に

i) メトホルミンまたはその塩、および

ii) ピオグリタゾンまたはロシグリタゾンまたは何らかの医薬的塩類

と組合わせて、併用で治療有効量のL A F 2 3 7 またはその医薬的塩を投与することを含む方法。

【請求項10】

ジペプチジルペプチダーゼ - I V が介在する状態が、糖尿病、2型真性糖尿病、耐糖能異常 (I G T) 状態、空腹時高血糖状態、代謝性アシドーシス、ケトーシス、関節炎、肥満およびオステオポロシスから選択される、請求項8記載の使用または請求項9記載の方法。

【請求項 1 1】

L A F 2 3 7 またはその医薬的塩の 5 0 m g または 1 0 0 m g の 1 日用量を、好ましくは食事と共にまたは食前に投与する、請求項 8 ~ 1 0 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 1 2】

L A F 2 3 7 またはその医薬的塩の 1 日用量 1 0 0 m g を、好ましくは食事と共にまたは食前に 1 日 1 回投与する、請求項 8 ~ 1 0 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 1 3】

L A F 2 3 7 またはその医薬的塩の 1 日用量 1 0 0 m g を、好ましくは個々の食事と共にまたは食前に、5 0 m g で 2 回の個別投与量に分割して投与する、請求項 8 ~ 1 0 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 1 4】

1 5、3 0 または 4 5 m g の 1 日用量のピオグリタゾンまたはその医薬的塩を投与する、請求項 8 ~ 1 3 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 1 5】

ピオグリタゾンまたはその医薬的塩 1 5 または 3 0 m g の 1 日用量を、好ましくは L A F 2 3 7 またはその医薬的塩と同時に、1 日 1 回投与する、請求項 8 ~ 1 3 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 1 6】

ロシグリタゾンまたはマレイン酸ロシグリタゾンまたはそのいずれかの医薬的塩 4 または 8 m g の 1 日用量を投与する、請求項 8 ~ 1 5 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 1 7】

ロシグリタゾンまたはマレイン酸ロシグリタゾンまたはそのいずれかの医薬的塩 4 または 8 m g の 1 日用量を、単回用量または 1 日 2 回の分割用量として投与する、請求項 8 ~ 1 6 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 1 8】

ロシグリタゾンまたはマレイン酸ロシグリタゾン 4 または 8 m g の 1 日用量を、好ましくは L A F 2 3 7 またはその医薬的塩と同時に投与する、請求項 8 ~ 1 7 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 1 9】

メトホルミンまたはその医薬的塩の 2 5 0、5 0 0、7 5 0、8 5 0、1 0 0 0、1 5 0 0、2 0 0 0 または 2 5 5 0 m g の 1 日用量を投与する、請求項 8 ~ 1 8 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 2 0】

メトホルミンまたはその塩 2 5 5 0 m g の 1 日用量を、好ましくは各食事と共にまたは各食前に、1 日 8 5 0 m g で 3 回の投与に分割して投与する、請求項 8 ~ 1 8 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 2 1】

メトホルミンまたはその塩 2 0 0 0 m g の 1 日用量を、好ましくは食事と共にまたは食前に、1 日 1 0 0 0 m g で 2 回の投与に分割して投与する、請求項 8 ~ 1 8 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 2 2】

メトホルミンまたはその塩 1 5 0 0 m g の 1 日用量を、好ましくは食事と共にまたは食前に、1 日に 7 5 0 m g で 2 回の投与、または 1 日に 5 0 0 m g で 3 回の投与に分割して投与する、請求項 8 ~ 1 8 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 2 3】

メトホルミンまたはその塩 1 0 0 0 m g の 1 日用量を、好ましくは食事と共にまたは食前に、1 日 1 回または 1 日 5 0 0 m g で 2 回の投与に分割して投与する、請求項 8 ~ 1 8 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 2 4】

メトホルミンまたはその塩 750 mg の 1 日用量を、好ましくは食事と共に、または食前に、1 日 1 回、または 1 日に 250 mg で 3 回の投与に分割して投与する、請求項 8 ~ 18 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 25】

メトホルミンまたはその塩 500 mg の 1 日用量を、好ましくは食事と共にまたは食前に、1 日 1 回または 1 日に 250 mg で 2 回の投与に分割して投与する、請求項 8 ~ 18 のいずれかに記載の方法または使用。

【請求項 26】

少なくとも 1 個の錠剤が、

- i) L A F 2 3 7 およびメトホルミンまたは何らかの塩、
 - ii) ピオグリタゾンおよびメトホルミンまたは何らかの塩、
 - iii) ロシグリタゾンおよびメトホルミンまたは何らかの塩、
 - iv) L A F 2 3 7 およびピオグリタゾンまたは何らかの塩、
 - v) L A F 2 3 7 およびロシグリタゾンまたは何らかの塩、
 - vi) L A F 2 3 7 およびピオグリタゾンおよびメトホルミンまたは何らかの塩、または
 - vii) L A F 2 3 7 およびロシグリタゾンおよびメトホルミンまたは何らかの塩
- を含む固定した組合わせ剤の形態で投与される、請求項 8 ~ 25 のいずれかに記載の方法または使用。