

【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24年11月22日(2012.11.22)

【公表番号】特表2012-505852(P2012-505852A)

【公表日】平成24年3月8日(2012.3.8)

【年通号数】公開・登録公報2012-010

【出願番号】特願2011-531457(P2011-531457)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/28	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	37/26	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	37/02	

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月3日(2012.10.3)

【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】

第一の医薬組成物及び第二の医薬組成物を含む薬剤であって、第一の医薬組成物は少なくとも1つのインスリンを含み、そして第二の医薬組成物は少なくとも1つのGLP-1アゴニストを含み、該薬剤が、第一の医薬組成物及び第二の医薬組成物の独立した投与のために製剤化及び/又は調剤される、上記薬剤。

【請求項2】

第一の医薬組成物及び第二の医薬組成物、及び場合により少なくとも1つのさらなる医薬組成物を含む、請求項1に記載の薬剤であって、第一の医薬組成物は少なくとも1つのインスリンを含み、そして第二の医薬組成物は少なくとも1つのインスリン及び少なくとも1つのGLP-1アゴニストを含み、そして少なくとも1つのさらなる医薬組成物は少なくとも1つのインスリン及び少なくとも1つのさらなる活性化合物を含む、上記薬剤。

【請求項3】

第一の医薬組成物、第二の医薬組成物、及び使用される場合は少なくとも1つのさらなる組成物が、組成物の総質量に対する実質的に同一の質量分率で該インスリンを含む、請求項2に記載の薬剤。

【請求項4】

少なくとも1つのインスリンが、ヒトインスリン類、それらの類似体、誘導体及び代謝物から独立して選択される、請求項1~3のいずれか1項に記載の薬剤。

【請求項5】

少なくとも1つのインスリンが、 $\text{Gly}(\text{A21})-\text{Arg}(\text{B31})-\text{Arg}(\text{B32})$ ヒトインスリン、 $\text{Lys}^{\text{B}28}\text{Pro}^{\text{B}29}$ ヒトインスリン、 $\text{B28Asp}$ ヒトインスリン、及び $\text{B29Lys}(-\text{-テトラデカノイル}), \text{desB30}$ ヒトインスリンからなる群より独立して選択される、請求項1～4のいずれか1項に記載の薬剤。

#### 【請求項6】

少なくとも1つのGLP-1アゴニストが、GLP-1、その類似体及び誘導体、エキセンジン-3、その類似体及び誘導体、エキセンジン-4、その類似体及び誘導体、並びにそれらの薬理学的に許容される塩からなる群より独立して選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載の薬剤。

#### 【請求項7】

少なくとも1つのGLP-1アゴニストが、エキセンジン-4、 $\text{desPro}^{36}$ エキセンジン-4(1-39)-Lys<sub>6</sub>-NH<sub>2</sub>[AVE0010]、及びArg<sup>34</sup>, Lys<sup>26</sup>(N(-グルタミル(N-ヘキサデカノイル)))GLP-1(7-37)[リラグルチド]、並びにそれらの薬理学的に許容される塩からなる群より独立して選択される、請求項6に記載の薬剤。

#### 【請求項8】

少なくとも1つのGLP-1アゴニストが、エキセンジン-4、その類似体、誘導体、及び薬理学的に許容される塩からなる群より独立して選択される、請求項7に記載の薬剤。

#### 【請求項9】

少なくとも1つのGLP-1アゴニストが $\text{desPro}^{36}$ エキセンジン-4(1-39)-Lys<sub>6</sub>-NH<sub>2</sub>である、請求項8に記載の薬剤。

#### 【請求項10】

インスリンが、 $\text{Gly}(\text{A21})-\text{Arg}(\text{B31})-\text{Arg}(\text{B32})$ ヒトインスリンであり、そしてGLP-1アゴニストが $\text{desPro}^{36}$ エキセンジン-4(1-39)-Lys<sub>6</sub>-NH<sub>2</sub>又はその薬理学的に許容しうる塩である、請求項1～9のいずれか1項に記載の薬剤。

#### 【請求項11】

(i.) 投与しようとする少なくとも1つのインスリンの用量を選択し、そして選択した用量の少なくとも1つのインスリンが総量中に存在できるように、第一、第二、及び使用される場合は少なくとも1つのさらなる組成物の総量を決定すること、

(ii.) 投与しようとする少なくとも1つのGLP-1アゴニストの用量を選択し、そして選択した用量の少なくとも1つのGLP-1アゴニストが、第二の組成物の総量中に存在できるように第二の組成物の総量を決定すること、

(iii.) 必要に応じて、投与しようとする少なくとも1つのさらなる活性化合物の用量を選択し、そして選択した用量の少なくとも1つのさらなる活性化合物が、少なくとも1つのさらなる組成物の総量中に存在できるように少なくとも1つのさらなる組成物の総量を決定すること、

(iv.) 工程(i)による総量から、工程(ii)による第二の組成物の総量を差し引いて、そして必要に応じて工程(iii)による少なくとも1つのさらなる組成物の総量を差し引いた量に相当する投与量の第一の組成物を患者に投与すること、並びに

(v.) 工程(ii)において決定された総量の第二の組成物、及び必要に応じて、工程(iii)において決定された総量の少なくとも1つのさらなる組成物を、患者に投与すること、

を含む方法により患者を処置するための、請求項3に記載の薬剤。

#### 【請求項12】

工程(i)、(ii)及び/又は(iii)が表に基づいて行われる、請求項11に記載の薬剤。

#### 【請求項13】

糖尿病患者、特に1型若しくは2型糖尿病患者を処置するため、空腹時、食後及び/又

は吸收後の血中グルコース濃度を調節するため、耐糖能を改善するため、低血糖を予防するため、膵臓 細胞の機能の喪失を予防するため、減量のため、及び／又は体重増加を予防するための、請求項 1～12 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

【請求項 14】

請求項 1～13 のいずれか 1 項に記載の薬剤を調製する方法であって、該薬剤がインスリン及び G L P - 1 アゴニストをそれぞれ所定の量で含み得るように、そして患者の個別の要求に適合する用量で投与することができるよう製剤化及び／又は調剤することを含む、上記方法。

【請求項 15】

請求項 1～13 のいずれか 1 項に記載の薬剤を含むキット。

【請求項 16】

請求項 1～13 のいずれか 1 項に記載の薬剤又は請求項 15 に記載のキットを含むデバイスであって、別々の容器中に薬剤の医薬組成物を含み、かつ互いに独立して医薬組成物を調葉することを可能にする、デバイス。

【請求項 17】

注射用である、請求項 16 に記載のデバイス。

【請求項 18】

G l y ( A 2 1 ) - A r g ( B 3 1 ) - A r g ( B 3 2 ) ヒトインスリン、及び d e s P r o<sup>36</sup> エキセンジン - 4 ( 1 - 3 9 ) - L y s<sub>6</sub> - N H<sub>2</sub> 及び／又はその薬学的に許容しうる塩の組み合わせ物。

【請求項 19】

糖尿病患者、特に 1 型若しくは 2 型糖尿病患者を処置するため、空腹時、食後及び／又は吸收後の血中グルコース濃度を調節するため、耐糖能を改善するため、低血糖を予防するため、膵臓 細胞の機能の喪失を予防するため、減量のため、及び／又は体重増加を予防するための医薬品を調製するための、少なくとも 1 つのインスリン及び少なくとも 1 つの G L P - 1 アゴニストの使用。