

【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30年3月1日(2018.3.1)

【公開番号】特開2017-160212(P2017-160212A)

【公開日】平成29年9月14日(2017.9.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-035

【出願番号】特願2017-74526(P2017-74526)

【国際特許分類】

|         |         |           |
|---------|---------|-----------|
| A 6 1 K | 45/00   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 45/06   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 38/22   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 38/28   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/351  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/40   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/403  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4365 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4409 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4439 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/517  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/616  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/64   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/155  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/195  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/10    | (2006.01) |
| A 6 1 P | 5/50    | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00   | (2006.01) |

【F I】

|         |         |       |
|---------|---------|-------|
| A 6 1 K | 45/00   |       |
| A 6 1 K | 45/06   |       |
| A 6 1 K | 38/22   |       |
| A 6 1 K | 38/28   |       |
| A 6 1 K | 31/351  |       |
| A 6 1 K | 31/40   |       |
| A 6 1 K | 31/403  |       |
| A 6 1 K | 31/4365 |       |
| A 6 1 K | 31/4409 |       |
| A 6 1 K | 31/4439 |       |
| A 6 1 K | 31/517  |       |
| A 6 1 K | 31/616  |       |
| A 6 1 K | 31/64   |       |
| A 6 1 K | 31/155  |       |
| A 6 1 K | 31/195  |       |
| A 6 1 P | 3/10    |       |
| A 6 1 P | 5/50    |       |
| A 6 1 P | 43/00   | 1 1 1 |
| A 6 1 P | 43/00   | 1 2 1 |

【手続補正書】

【提出日】平成29年12月27日(2017.12.27)

## 【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

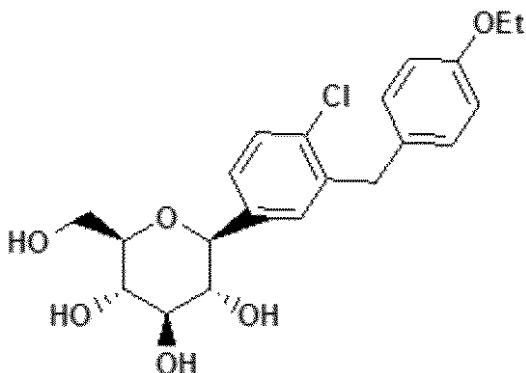
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

極度のインスリン抵抗性の哺乳類の患者に式：

【化1】



またはそのプロピレングリコール溶媒和物のSGLT2阻害剤を投与することを特徴とする治療剤であって、

極度のインスリン抵抗性が、50単位/日のインスリンに加え、一つもしくはそれ以上のメトホルミン、ピオグリタゾン、およびロシグリタゾンによる治療を受けているにもかかわらず、血糖コントロール(HbA<sub>1c</sub> < 7%)が不適切であると定義される剤。

【請求項2】

該患者が1つもしくはそれ以上のメトホルミン、グリブリド、グリピジド、エクセナチド、サクサグリプチン、シタグリプチン、ビルダグリプチン、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、およびインスリンと組み合わせて、SGLT2阻害剤により治療される、請求項1に記載の剤。

【請求項3】

該SGLT2阻害剤が1日当たり0.5から350mgの範囲の量で投与される、請求項1に記載の剤。

【請求項4】

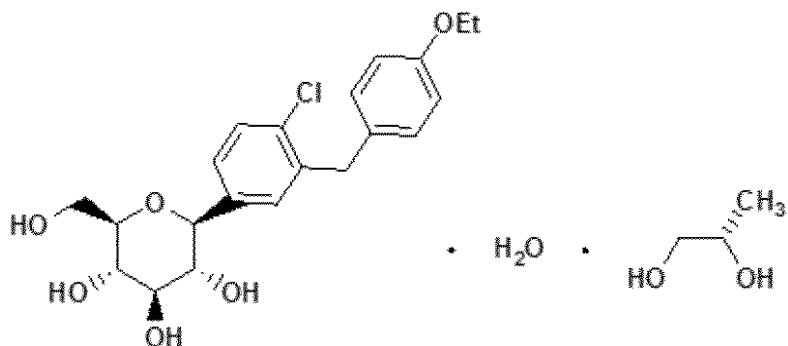
該患者が

- a) インスリン；または
- b) インスリンおよびメトホルミン；または
- c) インスリンおよびピオグリタゾンもしくはロシグリタゾン；または
- d) インスリンおよびメトホルミンおよびピオグリタゾンもしくはロシグリタゾンと組み合わせて、SGLT2阻害剤により治療される、請求項2に記載の剤。

【請求項5】

該SGLT2阻害剤が、(S)-プロピレングリコール溶媒和物として以下の構造：

## 【化2】



を有する、請求項1に記載の剤。

## 【請求項6】

該SGLT2阻害剤がダパグリフロジンまたはダパグリフロジン-PGSであって、(a)ダパグリフロジンまたはダパグリフロジン-PGSが、1日当たり0.5から200mgの投与量において、医師の処方または米医薬品便覧(PDR)に記載の投与量のインスリンと組み合わせて投与されるか；

(b)ダパグリフロジンまたはダパグリフロジン-PGSが、1日当たり0.5から200mgの投与量において、医師の処方またはPDRに記載の投与量のインスリンおよび1日当たり500から2000mgの投与量のメトホルミンと組み合わせて投与されるか；(c)ダパグリフロジンまたはダパグリフロジン-PGSが、1日当たり0.5から200mgの投与量において、医師の処方またはPDRに記載の投与量のインスリン、1日当たり0.5から75mgの投与量のピオグリタゾン、または1日当たり0.5から25mgの投与量のロシグリタゾンと組み合わせて投与されるか；あるいは

(d)ダパグリフロジンまたはダパグリフロジン-PGSが、1日当たり0.5から200mgの投与量において、医師の処方またはPDRに記載の投与量のインスリン、1日当たり500から2000mgの投与量のメトホルミン、および1日当たり0.5から75mgの投与量のピオグリタゾンもしくは1日当たり0.5から25mgの投与量のロシグリタゾンと組み合わせて投与される、

請求項4に記載の剤。

## 【請求項7】

該SGLT2阻害剤が1日当たり0.5から350mgの範囲の量で投与され、

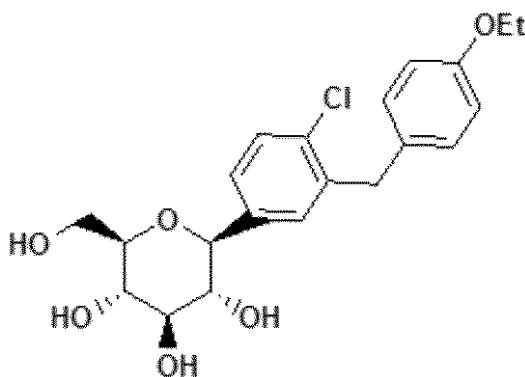
該SGLT2阻害剤が、

- a) メトホルミン；
- b) ピオグリタゾンもしくはロシグリタゾン；
- c) インスリン；
- d) メトホルミンおよびインスリン；
- e) ピオグリタゾンもしくはロシグリタゾンおよびメトホルミン；
- f) ピオグリタゾンもしくはロシグリタゾンおよびインスリン；あるいは
- g) メトホルミン、ピオグリタゾンもしくはロシグリタゾンおよびインスリンと組み合わせて用いられる、請求項1に記載の剤。

## 【請求項8】

一つもしくはそれ以上のインスリン、メトホルミン、ピオグリタゾンおよびロシグリタゾンを用いても血糖コントールを達成できない患者に対して、血糖コントロール(HbA<sub>1c</sub> < 7%)を提供するための剤であって、該患者に、式：

## 【化3】

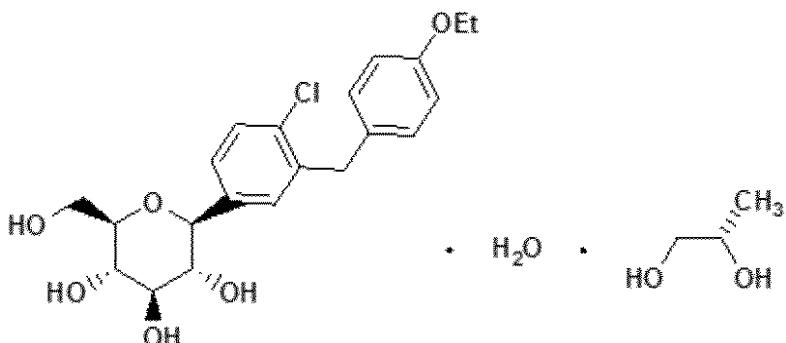


またはそのプロピレングリコール溶媒和物の S G L T 2 阻害剤を投与することを特徴とする剤。

## 【請求項 9】

該 S G L T 2 阻害剤が、以下：

## 【化4】



である、請求項 8 に記載の剤。

## 【請求項 10】

該 S G L T 2 阻害剤がダバグリフロジンまたはダバグリフロジン - P G S であって、(a) ダバグリフロジンまたはダバグリフロジン - P G S が、1日当たり 0.5 から 200 mg の投与量において、医師の処方または米医薬品便覧 (P D R) に記載の投与量のインスリンと組み合わせて投与されるか；

(b) ダバグリフロジンまたはダバグリフロジン - P G S が、1日当たり 0.5 から 200 mg の投与量において、医師の処方または P D R に記載の投与量のインスリンおよび 1 日当たり 500 から 2000 mg の投与量のメトホルミンと組み合わせて投与されるか；

(c) ダバグリフロジンまたはダバグリフロジン - P G S が、1日当たり 0.5 から 200 mg の投与量において、医師の処方または P D R に記載の投与量のインスリン、1日当たり 0.5 から 75 mg の投与量のピオグリタゾン、または 1日当たり 0.5 から 25 mg の投与量のロシグリタゾンと組み合わせて投与されるか；あるいは

(d) ダバグリフロジンまたはダバグリフロジン - P G S が、1日当たり 0.5 から 200 mg の投与量において、医師の処方または P D R に記載の投与量のインスリン、1日当たり 500 から 2000 mg の投与量のメトホルミン、および 1日当たり 0.5 から 75 mg の投与量のピオグリタゾンもしくは 1日当たり 0.5 から 25 mg の投与量のロシグリタゾンと組み合わせて投与される、

請求項 8 に記載の剤。

## 【請求項 11】

該患者が、さらに極度のインスリン抵抗性である、請求項 8 に記載の剤。

## 【請求項 12】

該患者が、50 単位 / 日のインスリン、並びに一つもしくはそれ以上のメトホルミン、ピオグリタゾン、およびロシグリタゾンでは適切な血糖コントロール (H b A<sub>1c</sub> < 7 %) を提供するために効果が無かったことを特徴とする、請求項 11 に記載の剤。

**【請求項 1 3】**

該 S G L T 2 阻害剤が 1 日当たり 0 . 5 から 3 5 0 m g の範囲の量で投与される、請求項 8 に記載の剤。