



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012146344/15, 30.10.2012

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

24.10.2007 US 60/982,368;

05.11.2007 US 60/985,620;

04.03.2008 US 61/033,740;

09.05.2008 US 61/052,127

(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,
из которой данная заявка выделена: 2010120666
21.05.2010

(43) Дата публикации заявки: 10.05.2014 Бюл. № 13

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

МАННКАЙНД КОРПОРЕЙШН (US)

(72) Автор(ы):

РИЧАРДСОН Питер (US),**БОУМЕН Роберт А. (US),****КОСТЕЛЛО Дональд (US)****(54) СПОСОБ ПРЕДОТВРАЩЕНИЯ ПОБОЧНЫХ ЭФФЕКТОВ GLP-1****(57) Формула изобретения**

1. Способ лечения гипергликемии и/или диабета у пациента, включающий стадию введения прандиально пациенту, нуждающемуся в лечении, сухой порошковой лекарственной формы для ингаляции, включающей терапевтически эффективное количество GLP-1, где указанное введение не приводит, по меньшей мере, к одному побочному эффекту, выбранному из группы, состоящей из тошноты, рвоты и повышенного потоотделения.

2. Способ по п. 1, в котором пациент является млекопитающим, страдающим сахарным диабетом 2 типа.

3. Способ по п. 1, в котором лекарственная форма GLP-1 включает от приблизительно 0,5 мг до приблизительно 3 мг GLP-1.

4. Способ по п. 1, в котором сухая порошковая лекарственная форма для ингаляции дополнительно включает ингибитор DPP-IV.

5. Способ по п. 1, в котором сухая порошковая лекарственная форма для ингаляции включает дикетопиперазин.

6. Способ по п. 5, в котором дикетопиперазин является 2,5-дикето-3,6-ди(4-Х-аминобутил)пиперазином, где Х выбран из группы, состоящей из сукцинила, глутарила, малеила и фумарила, или его фармацевтически приемлемой солью.

7. Способ по п. 1, в котором GLP-1 выбран из группы, состоящей из нативного GLP-1, метаболита GLP-1, аналога GLP-1, производного GLP-1, аналога GLP-1 пролонгированного действия, миметика GLP-1, эксцидина, пептидного аналога GLP-1

или биосинтетического аналога GLP-1, или их комбинации.

8. Способ по п. 1, дополнительно включающий введение пациенту терапевтически эффективного количества инсулина.

9. Способ по п. 8, в котором сухая порошковая лекарственная форма для ингаляции включает GLP-1 в комбинации с инсулином.

10. Способ по п. 8, в котором инсулин вводят отдельно в виде сухой порошковой лекарственной формы для ингаляции.

11. Способ по п. 1, в котором сухая порошковая лекарственная форма для ингаляции не ингибирует опорожнение желудка.

12. Набор для лечения диабета и/или гипергликемии, включающий

а) картридж с лекарственным средством, вставляемый в ингалятор сухого порошка и содержащий сухую порошковую лекарственную форму, которая включает GLP-1 и дикетопиперазин формулы 2,5-дикето-3,6-ди(4-Х-аминобутил)пиперазин, где Х выбран из группы, состоящей из сукцинила, глутарила, малеила и фумарила, или его соль, и

б) устройство для ингаляции, в которое вставляется/содержится и надежно фиксируется указанный картридж.

13. Способ снижения уровней глюкозы у пациента с диабетом 2 типа, страдающего гипергликемией, включающий стадию введения указанному пациенту, нуждающемуся в лечении, сухой порошковой ингаляционной лекарственной формы для пульмонального введения, включающей терапевтически эффективное количество GLP-1, а также дикетопиперазин или его фармацевтически приемлемую соль.

14. Способ по п. 13, в котором уровни глюкозы снижаются на от приблизительно 0,1 ммоль/л до приблизительно 3 ммоль/л в течение приблизительно четырех часов после введения указанной ингаляционной лекарственной формы указанному пациенту.

15. Способ по п. 13, в котором ингаляционную лекарственную форму вводят указанному пациенту с диабетом 2 типа прандиально, препрандиально, прандиально, постпрандиально или натошак.

16. Способ по п. 13, в котором лекарственная форма GLP-1 включает от приблизительно 0,02 мг до приблизительно 2 мг GLP-1.

17. Способ по п. 13, в котором ингаляционная сухая порошковая лекарственная форма дополнительно включает ингибитор DPP-IV.

18. Способ по п. 13, в котором ингаляционная сухая порошковая лекарственная форма включает дикетопиперазин.

19. Способ по п. 18, в котором дикетопиперазин является 2,5-дикето-3,6-ди(4-Х-аминобутил)пиперазином, где Х выбран из группы, состоящей из сукцинила, глутарила, малеила и фумарила, или его фармацевтически приемлемой солью.

20. Способ по п. 13, в котором ингаляционная сухая порошковая лекарственная форма включает GLP-1 в комбинации с инсулином.

21. Способ по п. 18, дополнительно включающий введение инсулина в виде сухой порошковой лекарственной формы для ингаляции.

22. Способ по п. 21, в котором инсулин является инсулином быстрого действия или пролонгированного действия.

23. Способ по п. 13, дополнительно включающий введение лекарственной формы, включающей аналог GLP-1 пролонгированного действия.

24. Способ по п. 13, в котором ингаляционная сухая порошковая лекарственная форма не ингибирует опорожнение желудка.

25. Набор для лечения гипергликемии у пациента с диабетом 2 типа, который включает систему пульмональной доставки лекарственного средства, включающую

а) картридж с лекарственным средством, вставляемый в ингалятор сухого порошка и содержащий сухую порошковую лекарственную форму, включающую GLP-1, а также

дикетопиперазин формулы 2,5-дикето-3,6-ди(4-Х-аминобутил)пиперазин, где Х выбран из группы, состоящей из сукцинила, глутарила, малеила и фумарила, или его соль, и

б) устройство для ингаляции, в которое вставляется и надежно фиксируется указанный картридж.

RU 2012146344 A

A 4439412102 RU