

【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10月4日(2018.10.4)

【公開番号】特開2018-131450(P2018-131450A)

【公開日】平成30年8月23日(2018.8.23)

【年通号数】公開・登録公報2018-032

【出願番号】特願2018-83792(P2018-83792)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/522 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/155 (2006.01)

A 6 1 K 31/64 (2006.01)

A 6 1 K 31/4353 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/522

A 6 1 K 31/5025

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/155

A 6 1 K 31/64

A 6 1 K 31/4353

A 6 1 P 3/10

【手続補正書】

【提出日】平成30年7月18日(2018.7.18)

【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】

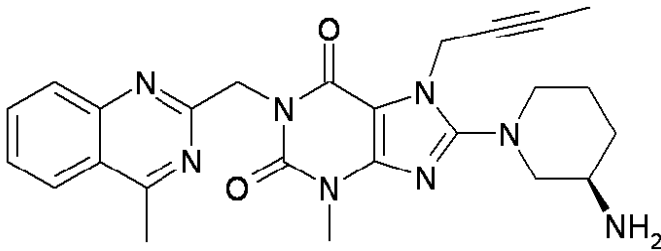
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

メトホルミン、スルホニル尿素、チアゾリジンジオン、グリニド、アルファ - グルコシダーゼブロッカー、G L P - 1 又は G L P - 1 類似体、及びインスリン又はインスリン類似体から選ばれた一種以上の通常の経口又は非経口抗糖尿病薬を用いた治療にもかかわらず不十分な血糖調節の患者の代謝性疾患の治療及び / 又は予防のための、下記式の D P P - 4 阻害剤又はその医薬上許される塩を含む医薬組成物であって、

前記医薬組成物は、1 日 1 回の経口投与用であり且つ 5 m g の前記 D P P - 4 阻害剤を含むか、或いは

前記医薬組成物は、1 日 2 回の経口投与用であり且つ 2 . 5 m g の前記 D P P - 4 阻害剤を含む、前記医薬組成物。



【請求項 2】

メトホルミン、スルホニル尿素、チアゾリジンジオン、グリニド及びアルファ - グルコシダーゼブロッカーから選ばれた一種以上の経口抗糖尿病薬を用いた治療にもかかわらず不十分な血糖調節の患者の代謝性疾患の治療及び / 又は予防のための請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3】

スルホニル尿素薬を用いた治療にもかかわらず不十分な血糖調節の患者の代謝性疾患の治療及び / 又は予防のための請求項 1 又は 2 記載の医薬組成物。

【請求項 4】

スルホニル尿素薬単独による治療にもかかわらず不十分な血糖調節の患者の代謝性疾患の治療及び / 又は予防のための請求項 1 又は 2 記載の医薬組成物。

【請求項 5】

スルホニル尿素薬及びメトホルミンを用いた組み合わせ治療にもかかわらず不十分な血糖調節の患者の代謝性疾患の治療及び / 又は予防のための請求項 1 又は 2 記載の医薬組成物。

【請求項 6】

スルホニル尿素二次無効を有する 2 型糖尿病患者の血糖調節を得るため、及び / 又は維持するため請求項 1 から 5 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記 D P P - 4 阻害剤が前記通常的一种以上の抗糖尿病薬と組み合わせて使用される、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記 D P P - 4 阻害剤が前記スルホニル尿素と組み合わせて使用され、且つ任意に一種以上のその他の治療薬と組み合わせて使用されてもよい、請求項 1 から 7 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記 D P P - 4 阻害剤が前記スルホニル尿素の代替として使用され、且つ任意に一種以上のその他の治療薬と組み合わせて使用されてもよい、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記スルホニル尿素がグリベンクラミド、グリピジド及びグリメピリドから選ばれる、請求項 1 から 9 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記 D P P - 4 阻害剤が、メトホルミンを用いて又は用いないで、前記スルホニル尿素を用いた追加又は初期組み合わせ療法に使用される、請求項 1 から 8 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記患者で H b A 1 c、F P G 及び / 又は P P G を改善し、グルコース変動幅を減少し、及び / 又はインスリン分泌を改善するために用いられる、請求項 1 から 11 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 13】

第一又は第二選択スルホニル尿素治療の適応を有する患者における、糖尿病を治療するため又は H b A 1 c を低下させるため又はインスリン分泌を改善するために用いられる、

請求項 1 から 12 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 14】

スルホニル尿素 + メトホルミン又はスルホニル尿素 + チアゾリジンジオン又はスルホニル尿素 + インスリンからなる群から選択される二重スルホニル尿素組み合わせ治療の適応を有する患者の糖尿病の治療に用いられる、請求項 1 から 12 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 15】

メトホルミン、スルホニル尿素及びチアゾリジンジオン、或いはメトホルミン、スルホニル尿素及びインスリン、或いはスルホニル尿素、チアゾリジンジオン及びインスリンの三重の組み合わせ治療の適応を有する患者の糖尿病の治療に用いられる、請求項 1 から 12 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 16】

インスリン治療の適応を有する患者の糖尿病の治療に用いられる、請求項 1 から 12 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記患者が、スルホニル尿素薬による治療にもかかわらず 7.5 ~ 11 % 又は 7.0 ~ 10 % 又は 7.5 ~ 10 % の不適な HbA1c 値に悩まされている、請求項 1 から 16 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記患者における、低血糖及び / 又は体重増加から選択されるスルホニル尿素抗糖尿病治療と関連する副作用のリスクを予防又は軽減するために用いられる、請求項 1 から 17 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記患者における、スルホニル尿素二次無効による糖尿病の進行を予防又は遅延させるために用いられる、請求項 1 から 18 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 20】

前記患者がメトホルミンに対する非寛容性又は禁忌のためにメトホルミン治療に適さず、又は減少された用量のメトホルミン治療を要する患者、腎臓障害のある患者、及び / 又は老人の患者である、請求項 1 から 19 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 21】

ピオグリタゾン又はメトホルミンとの組み合わせにおける使用のための請求項 1 から 20 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記 DPP-4 阻害剤が、1 - [ (4 - メチル - キナゾリン - 2 - イル) メチル ] - 3 - メチル - 7 - (2 - ブチン - 1 - イル) - 8 - (3 - (R) - アミノ - ピペリジン - 1 - イル) - キサンチンである、請求項 1 から 21 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記患者が、メトホルミン、スルホニル尿素、ピオグリタゾン又は (基礎) インスリンを用いた単一治療にもかかわらず不十分な血糖調節を有する患者であるか、或いは

前記患者が、メトホルミン / ピオグリタゾン、メトホルミン / スルホニル尿素、メトホルミン / (基礎) インスリン、スルホニル尿素 / ピオグリタゾン、スルホニル尿素 / (基礎) インスリン、又はピオグリタゾン / (基礎) インスリンの組み合わせを用いた二重の組み合わせ治療にもかかわらず不十分な血糖調節を有する患者である、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 24】

メトホルミン、スルホニル尿素、チアゾリジンジオン、グリニド、アルファ - グルコシダーゼブロッカー、GLP-1 及び GLP-1 類似体、並びにインスリン及びインスリン類似体から選択される 1 種の抗高血糖薬を用いた治療にもかかわらず不十分な血糖調節を有する患者における 2 型糖尿病を治療するための、1 - [ (4 - メチル - キナゾリン - 2 - イル) メチル ] - 3 - メチル - 7 - (2 - ブチン - 1 - イル) - 8 - (3 - (R) - ア

ミノ - ピペリジン - 1 - イル) - キサンチンを含む医薬組成物であって、

前記医薬組成物は、前記抗高血糖薬と組み合わせての 1 日 1 回の経口投与用であり且つ 5 m g の 1 - [ ( 4 - メチル - キナゾリン - 2 - イル)メチル] - 3 - メチル - 7 - ( 2 - ブチン - 1 - イル) - 8 - ( 3 - ( R ) - アミノ - ピペリジン - 1 - イル) - キサンチンを含むか、或いは

前記医薬組成物は、前記抗高血糖薬と組み合わせての 1 日 2 回の経口投与用であり且つ 2 . 5 m g の 1 - [ ( 4 - メチル - キナゾリン - 2 - イル)メチル] - 3 - メチル - 7 - ( 2 - ブチン - 1 - イル) - 8 - ( 3 - ( R ) - アミノ - ピペリジン - 1 - イル) - キサンチンを含む、前記医薬組成物。

【請求項 2 5】

メトホルミン、スルホニル尿素、チアゾリジンジオン、グリニド、アルファ - グルコシダーゼブロッカー、G L P - 1 及び G L P - 1 類似体、並びにインスリン及びインスリン類似体から選択される 2 種の抗高血糖薬を用いた治療にもかかわらず不十分な血糖調節を有する患者における 2 型糖尿病を治療するための、1 - [ ( 4 - メチル - キナゾリン - 2 - イル)メチル] - 3 - メチル - 7 - ( 2 - ブチン - 1 - イル) - 8 - ( 3 - ( R ) - アミノ - ピペリジン - 1 - イル) - キサンチンを含む医薬組成物であって、

前記医薬組成物は、前記抗高血糖薬と組み合わせての 1 日 1 回の経口投与用であり且つ 5 m g の 1 - [ ( 4 - メチル - キナゾリン - 2 - イル)メチル] - 3 - メチル - 7 - ( 2 - ブチン - 1 - イル) - 8 - ( 3 - ( R ) - アミノ - ピペリジン - 1 - イル) - キサンチンを含むか、或いは

前記医薬組成物は、前記抗高血糖薬と組み合わせての 1 日 2 回の経口投与用であり且つ 2 . 5 m g の 1 - [ ( 4 - メチル - キナゾリン - 2 - イル)メチル] - 3 - メチル - 7 - ( 2 - ブチン - 1 - イル) - 8 - ( 3 - ( R ) - アミノ - ピペリジン - 1 - イル) - キサンチンを含む、前記医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記 D P P - 4 阻害剤の投与された経口用量の 1 0 % 未満又は 7 % 以下が腎臓を介して排泄される、糖尿病患者の経口治療のための、請求項 1 から 2 5 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

前記 D P P - 4 阻害剤が、主として胆汁を介して未変化で排泄される、請求項 2 6 記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

前記 D P P - 4 阻害剤の投与された経口用量の 8 0 % より多く、又は 9 0 % 以上が親薬物として未変化で排泄される、請求項 2 6 又は 2 7 記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

前記 D P P - 4 阻害剤の主代謝産物が薬理学上不活性である、請求項 2 6 から 2 8 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。