

【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27年10月8日(2015.10.8)

【公開番号】特開2015-44875(P2015-44875A)

【公開日】平成27年3月12日(2015.3.12)

【年通号数】公開・登録公報2015-016

【出願番号】特願2014-248337(P2014-248337)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 K 31/155 (2006.01)
A 6 1 K 31/517 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/4453 (2006.01)
A 6 1 K 31/7034 (2006.01)
A 6 1 K 31/133 (2006.01)
A 6 1 K 31/445 (2006.01)
A 6 1 K 31/64 (2006.01)
A 6 1 K 31/198 (2006.01)
A 6 1 K 31/427 (2006.01)
A 6 1 K 31/426 (2006.01)
A 6 1 K 31/40 (2006.01)
A 6 1 K 31/4985 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/522 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
A 6 1 K 31/403 (2006.01)
A 6 1 K 31/4375 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 K 31/69 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 27/12 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/02 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 P 19/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/04 (2006.01)
A 6 1 P 9/06 (2006.01)
A 6 1 P 3/06 (2006.01)
A 6 1 P 1/18 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)
 A 6 1 P 9/08 (2006.01)
 A 6 1 K 38/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 K 31/155
 A 6 1 K 31/517
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/4453
 A 6 1 K 31/7034
 A 6 1 K 31/133
 A 6 1 K 31/445
 A 6 1 K 31/64
 A 6 1 K 31/198
 A 6 1 K 31/427
 A 6 1 K 31/426
 A 6 1 K 31/40
 A 6 1 K 31/4985
 A 6 1 P 43/00 1 2 3
 A 6 1 K 31/522
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/403
 A 6 1 K 31/4375
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/69
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 27/12
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 19/00
 A 6 1 P 9/10 1 0 1
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 9/06
 A 6 1 P 3/06
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 31/00
 A 6 1 P 9/08
 A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成27年8月20日(2015.8.20)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0251

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0251】

例6：350mgの活性物質を含有するカプセル剤

組成物：

(1) 活性物質	350.0mg
(2) 乾燥トウモロコシデンブ	46.0mg
(3) マンニトール	30.0mg
(4) ステアリン酸マグネシウム	4.0mg
	430.0mg

調製：

(1)を(3)で粉末化する。激しく混合しながら、この粉碎物を(2)および(4)の混合物に加える。この粉末混合物をカプセル充填機内でサイズ0の硬質ゼラチンカプセルに充填する。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕(a) DPP-4阻害剤と、任意で、

(b) ビグアニド、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
-グルコシダーゼ阻害剤およびGLP-1類縁体からなる群G3から選択される第2の抗糖尿病薬と、任意で、

(c) ビグアニド、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
-グルコシダーゼ阻害剤およびGLP-1類縁体からなる群G3から選択される、(b)と異なる第3の抗糖尿病薬、

を含む医薬組成物または医薬的に許容されるその塩。

〔2〕(a) DPP-4阻害剤と、任意で、

(b) ビグアニド(特にメトホルミン)、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
-グルコシダーゼ阻害剤およびGLP-1類縁体からなる群G3から選択される第2の抗糖尿病薬と、任意で、

(c) メトホルミン、スルホニル尿素、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、レバグリニド、
ナテグリニド、アカルボース、ボグリボース、ミグリトールおよびGLP-1類縁体からなる群から選択される、(b)と異なる第3の抗糖尿病薬、

を含む、前記〔1〕に記載の医薬組成物または医薬的に許容されるその塩。

〔3〕(a) DPP-4阻害剤と、任意で、

(b) メトホルミン、スルホニル尿素、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、レバグリニド、
ナテグリニド、アカルボース、ボグリボース、ミグリトールおよびGLP-1類縁体からなる群から選択される第2の抗糖尿病薬と、任意で、

(c) ビグアニド(特にメトホルミン)、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
-グルコシダーゼ阻害剤およびGLP-1類縁体からなる群G3から選択される、(b)と異なる第3の抗糖尿病薬、

を含む、前記〔1〕に記載の医薬組成物または医薬的に許容されるその塩。

〔4〕(a) DPP-4阻害剤と、任意で、

(b) メトホルミン、スルホニル尿素およびピオグリタゾンからなる群から選択される第2の抗糖尿病薬と、任意で、

(c) メトホルミン、スルホニル尿素、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、レバグリニド、
ナテグリニド、アカルボース、ボグリボース、ミグリトールおよびGLP-1類縁体からなる群から選択される、(b)と異なる第3の抗糖尿病薬、

を含む、前記〔1〕、〔2〕または〔3〕に記載の医薬組成物または医薬的に許容されるその塩。

〔5〕(a) DPP-4阻害剤と、任意で、

(b)メトホルミンおよびピオグリタゾンからなる群から選択される第2の抗糖尿病薬と、任意で、

(c)メトホルミン、スルホニル尿素およびピオグリタゾンからなる群から選択される、(b)と異なる第3の抗糖尿病薬、

を含む、前記〔1〕から〔4〕のいずれか1項に記載の医薬組成物または医薬的に許容されるその塩。

〔6〕第2および/または第3の抗糖尿病薬が、メトホルミン、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、トログリタゾン、シグリタゾン、グリベンクラミド、トルブタミド、グリメリド、グリビジド、グリキドン、グリボルヌリド、グリブリド、グリソエピド、グリクラジド、ナテグリニド、レパグリニド、ミチグリニド、アカルボース、ボグリボース、ミグリトール、エクセナチド、リラグルチド、タスポグルチド、セマグルチド、アルビグルチドおよびリキシセナチドまたは前記治療薬のうちの1つの医薬的に許容される塩からなる群から選択される、前記〔1〕、〔2〕または〔3〕に記載の医薬組成物。

〔7〕DPP-4阻害剤が、リナグリプチン、シタグリプチン、ビルダグリプチン、アログリプチン、サクサグリプチン、カルメグリプチン、メログリプチン、ゴソグリプチン、テネリグリプチンおよびドゥトグリプチンまたは前記DPP-4阻害剤のうちの1つの医薬的に許容される塩もしくはそのプロドラッグからなる群G2から選択される、前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の医薬組成物。

〔8〕1つまたは複数の医薬的に許容される担体をさらに含む、前記〔1〕から〔7〕のいずれか1項に記載の医薬組成物。

〔9〕前記組成物が、成分の同時使用または逐次使用に適していることを特徴とする、前記〔1〕から〔8〕の1項に記載の医薬組合せ。

〔10〕成分が1つの単一の剤形内に存在する、または各成分が別個の剤形内に存在することを特徴とする、前記〔1〕から〔9〕の1項に記載の医薬組合せ。

〔11〕DPP-4阻害剤および第2の抗糖尿病薬が単一の剤形内に存在し、第3の抗糖尿病薬が、別個の剤形内に存在することを特徴とする、前記〔1〕から〔10〕のいずれか1項に記載の医薬組合せ。

〔12〕前記〔7〕に記載のDPP-4阻害剤と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、1型糖尿病、2型糖尿病、耐糖能障害、空腹時血糖障害、高血糖、摂食後の高血糖、過体重、肥満およびメタボリックシンドロームからなる群から選択される代謝障害を予防、その進行を緩和、遅延、または治療するための方法。

〔13〕前記〔7〕に記載のDPP-4阻害剤と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、血糖コントロールを改善するための、および/または、空腹時血漿グルコース、摂食後血漿グルコースおよび/またはグリコシル化ヘモグロビンHbA1cを低下させるための方法。

〔14〕前記〔7〕に記載のDPP-4阻害剤と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、耐糖能障害、空腹時血糖障害、インスリン抵抗性および/またはメタボリックシンドロームから、2型糖尿病への進行を予防、緩和、遅延、または寛解するための方法。

〔15〕前記〔7〕に記載のDPP-4阻害剤と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載

の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、糖尿病の合併症、例えば白内障、ならびに微小血管性および大血管性疾患、例えば腎症、網膜症、ニューロパシー、組織虚血、糖尿病性足病変、動脈硬化、心筋梗塞、急性冠不全症候群、不安定狭心症、安定狭心症、脳卒中、末梢性動脈閉塞性疾患、心筋症、心不全、心臓リズム障害および血管再狭窄からなる群から選択される状態または障害を予防、その進行を緩和、遅延、または治療するための方法。

〔16〕前記〔7〕に記載のDPP-4阻害剤と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、体重および/もしくは体脂肪を減少するための、体重および/もしくは体脂肪の増加を予防するための、または、体重および/もしくは体脂肪の減少を促進するための方法。

〔17〕前記〔7〕に記載のDPP-4阻害剤と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、膵細胞の変性および/もしくは膵細胞の機能の低下を予防、緩和、遅延、または治療するための、および/または、膵細胞の機能を改善および/もしくは回復もしくは保護するための、および/または、膵臓のインスリン分泌機能を回復するための方法。

〔18〕前記〔7〕に記載のDPP-4阻害剤と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、肝脂肪または異所性脂肪の異常な蓄積に起因する疾患または状態を予防、緩和、遅延、または治療するための方法。

〔19〕前記〔7〕に記載のDPP-4阻害剤と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で前記〔1〕から〔6〕のいずれか1項に記載の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、インスリン感受性を維持および/もしくは改善するための、および/または、高インスリン血症および/もしくはインスリン抵抗性を治療もしくは予防するための方法。

〔20〕それを必要とする患者において、

- 1型糖尿病、2型糖尿病、耐糖能障害、空腹時血糖障害、高血糖、摂食後の高血糖、過体重、肥満およびメタボリックシンドロームからなる群から選択される代謝障害を予防、その進行を緩和、遅延、または治療するための、または

- 血糖コントロールを改善するための、および/または、空腹時血漿グルコース、摂食後の血漿グルコースおよび/もしくはグリコシル化ヘモグロビンHbA1cを低下させるための、または

- 耐糖能障害、インスリン抵抗性および/またはメタボリックシンドロームから2型糖尿病への進行を予防、緩和、遅延、又は、寛解するための、または

- 糖尿病合併症、例えば白内障、ならびに微小血管性および大血管性疾患、例えば腎症、網膜症、ニューロパシー、学習障害および記憶障害、神経変性障害もしくは認知障害、心臓血管もしくは脳血管の疾患、組織虚血、糖尿病性足病変もしくは胃潰瘍、動脈硬化、高血圧、内皮障害、心筋梗塞、急性冠不全症候群、不安定狭心症、安定狭心症、脳卒中、末梢性動脈閉塞性疾患、心筋症、心不全、心臓リズム障害および血管再狭窄からなる群から選択される状態もしくは障害を予防、その進行を緩和、遅延、または治療するための、または

- 体重および/もしくは体脂肪を減少するための、または、体重および/もしくは体脂肪の増加を予防するための、または、体重および/もしくは体脂肪の減少を促進させるための、または

- 膵細胞の変性および/もしくは膵細胞の機能の低下を予防、緩和、遅延、または治

療するための、および/または、膵細胞の機能を改善および/もしくは回復もしくはは保護するための、および/または、膵臓のインスリン分泌機能を回復するための、または

- 肝脂肪または異所性脂肪の異常な蓄積に起因する疾患もしくはは状態を予防、緩徐、遅延、または治療するための、または

- インスリン感受性を維持および/もしくは改善するための、および/または、高インスリン血症および/もしくはインスリン抵抗性を治療もしくはは予防するための、または

- 移植術後新発症型糖尿病 (NODAT) および/または移植術後メタボリックシンドローム (PTMS) を予防、その進行を緩徐、遅延、または治療するための、または

- 微小血管性および大血管性疾患およびイベント、移植片拒絶、感染症、ならびに死亡を含めたNODATおよび/またはPTMS合併症を予防、遅延、または低下させるための、または

- 高尿酸血症および高尿酸血症状態を治療するための、

薬物製造のための、前記〔1〕から〔11〕の1項に記載の医薬組成物の使用。

〔21〕患者が、過体重、肥満、内臓肥満および腹部肥満からなる群から選択される1つまたは複数の状態であると診断されている個体である、前記〔12〕から〔19〕の1項に記載の方法または前記〔20〕に記載の使用。

〔22〕患者が、

(a) 100または110 mg/dLを超える、特に125 mg/dLを超える、空腹時血中グルコースまたは血清グルコース濃度、

(b) 140 mg/dL以上の摂食後血漿グルコース、

(c) 6.5%以上、特に7.0%以上のHbA1c値

の状態のうち1または2つ以上を示す個体である、前記〔12〕から〔19〕の1項に記載の方法または前記〔20〕に記載の使用。

〔23〕患者が、

(a) 肥満、内臓肥満および/または腹部肥満、

(b) トリグリセリド血中濃度 150 mg/dL、

(c) HDL - コレステロール血中濃度 < 40 mg/dL (女性患者) および < 50 mg/dL (男性患者)、

(d) 収縮期血圧 130 mmHg および弛緩期血圧 85 mmHg、

(e) 空腹時血中グルコース濃度 100または110 mg/dL

のうち1つ、2つ、または3つ以上の状態が存在する個体である、前記〔12〕から〔19〕の1項に記載の方法または前記〔20〕に記載の使用。

〔24〕患者が、ダイエットおよび運動にもかかわらず、または第2もしくは第3の抗糖尿病薬を用いた単剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分である、前記〔12〕から〔19〕の1項に記載の方法または前記〔20〕に記載の使用。

〔25〕患者が、ダイエットおよび運動にもかかわらず、または第2および第3の抗糖尿病薬を用いた2剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分である、前記〔12〕から〔19〕の1項に記載の方法または前記〔20〕に記載の使用。

〔26〕患者が、ダイエットおよび運動にもかかわらず、またはDPP-4阻害剤または第2もしくは第3の抗糖尿病薬のいずれかを用いた単剤療法にもかかわらず、または第2および第3の抗糖尿病薬を用いた2剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分である、前記〔12〕から〔19〕の1項に記載の2剤併用方法または前記〔20〕に記載の2剤併用使用。

〔27〕患者が、ダイエットおよび運動にもかかわらず、またはDPP-4阻害剤、第2もしくは第3の抗糖尿病薬のいずれかを用いた単剤療法にもかかわらず、またはDPP-4阻害剤、第2および第3の抗糖尿病薬の群から選択される2つの薬剤を用いた併用療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分である、前記〔12〕から〔19〕の1項に記載の3剤併用方法または前記〔20〕に記載の3剤併用使用。

〔28〕DPP-4阻害剤がリナグリプチンである、前記〔1〕から〔27〕のいずれか1項に記載の医薬組成物、組合せ、方法または使用。

【手続補正 2】【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】それを必要とする患者において、

- 2 型糖尿病を治療するための、または
 - 血糖コントロールを改善するための、および / または、空腹時血漿グルコース、摂食後の血漿グルコースおよび / もしくはグリコシル化ヘモグロビン H b A 1 c を低下させるための、または

- 糖尿病合併症、例えば白内障、ならびに微小血管性および大血管性疾患、例えば腎症、網膜症、ニューロパシー、学習障害および記憶障害、神経変性障害もしくは認知障害、心臓血管もしくは脳血管の疾患、組織虚血、糖尿病性足病変もしくは潰瘍、動脈硬化、高血圧、内皮障害、心筋梗塞、急性冠不全症候群、不安定狭心症、安定狭心症、脳卒中、末梢性動脈閉塞性疾患、心筋症、心不全、心臓リズム障害および血管再狭窄からなる群から選択される状態もしくは障害を予防、その進行を緩徐、遅延、または治療するための、または

- 体重および / もしくは体脂肪を減少するための、または、体重および / もしくは体脂肪の増加を予防するための、または、体重および / もしくは体脂肪の減少を促進させるための、または

- 膵細胞の変性および / もしくは膵細胞の機能の低下を予防、緩徐、遅延、または治療するための、および / または、膵細胞の機能を改善および / もしくは回復もしくは保護するための、および / または、膵臓のインスリン分泌機能を回復するための、または

- 肝脂肪または異所性脂肪の異常な蓄積に起因する疾患もしくは状態を予防、緩徐、遅延、または治療するための、または

- インスリン感受性を維持および / もしくは改善するための、および / または、高インスリン血症および / もしくはインスリン抵抗性を治療もしくは予防するための、

(a) リナグリプチン、または医薬的に許容されるその塩である DPP - 4 阻害剤を含む医薬組成物であって、

(b) ビグアニド、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、 - グルコシダーゼ阻害剤および GLP - 1 類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される第 2 の抗糖尿病薬と組み合わせて投与され、

(c) ビグアニド、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、 - グルコシダーゼ阻害剤および GLP - 1 類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される、(b) と異なる第 3 の抗糖尿病薬と組み合わせて投与されてもよく、

前記第 2 の抗糖尿病薬と、存在する場合には前記第 3 の抗糖尿病薬とのいずれかは、スルホニル尿素であり、

前記患者は、前記第 2 又は第 3 の抗糖尿病薬を用いた単剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分な患者であるか、または

前記患者は、第 2 および第 3 の抗糖尿病薬を用いた 2 剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分な患者であり、

前記 DPP - 4 阻害剤と組み合わせられた場合に、例えば低血糖の発生を低減するために、減少した量のスルホニル尿素が使用される

医薬組成物。

【請求項 2】それを必要とする患者において、

- 2 型糖尿病を治療するための、または

- 血糖コントロールを改善するための、および / または、空腹時血漿グルコース、摂食後

の血漿グルコースおよび/もしくはグリコシル化ヘモグロビンHbA1cを低下させるための、または

- 糖尿病合併症、例えば白内障、ならびに微小血管性および大血管性疾患、例えば腎症、網膜症、ニューロパシー、学習障害および記憶障害、神経変性障害もしくは認知障害、心臓血管もしくは脳血管の疾患、組織虚血、糖尿病性足病変もしくは潰瘍、動脈硬化、高血圧、内皮障害、心筋梗塞、急性冠不全症候群、不安定狭心症、安定狭心症、脳卒中、末梢性動脈閉塞性疾患、心筋症、心不全、心臓リズム障害および血管再狭窄からなる群から選択される状態もしくは障害を予防、その進行を緩徐、遅延、または治療するための、または

- 体重および/もしくは体脂肪を減少するための、または、体重および/もしくは体脂肪の増加を予防するための、または、体重および/もしくは体脂肪の減少を促進させるための、または

- 膵細胞の変性および/もしくは膵細胞の機能の低下を予防、緩徐、遅延、または治療するための、および/または、膵細胞の機能を改善および/もしくは回復もしくは保護するための、および/または、膵臓のインスリン分泌機能を回復するための、または

- 肝脂肪または異所性脂肪の異常な蓄積に起因する疾患もしくは状態を予防、緩徐、遅延、または治療するための、または

- インスリン感受性を維持および/もしくは改善するための、および/または、高インスリン血症および/もしくはインスリン抵抗性を治療もしくは予防するための、

(a) リナグリプチン、または医薬的に許容されるその塩であるDPP-4阻害剤と、

(b) ビグアニド、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
- グルコシダーゼ阻害剤およびGLP-1類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群G3から選択される第2の抗糖尿病薬とを含む医薬組成物であって、

(c) ビグアニド、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
- グルコシダーゼ阻害剤およびGLP-1類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群G3から選択される、(b)と異なる第3の抗糖尿病薬と組み合わせて投与されてもよく、

前記第2の抗糖尿病薬と、存在する場合には前記第3の抗糖尿病薬とのいずれかは、スルホニル尿素であり、

前記患者は、前記第2又は第3の抗糖尿病薬を用いた単剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分な患者であるか、または

前記患者は、第2および第3の抗糖尿病薬を用いた2剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分な患者であり、

前記DPP-4阻害剤と組み合わせられた場合に、例えば低血糖の発生を低減するために、減少した量のスルホニル尿素が使用される

医薬組成物。

【請求項3】

(b) 前記第2の抗糖尿病薬が、ビグアニド(特にメトホルミン)、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
- グルコシダーゼ阻害剤およびGLP-1類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択され、

存在する場合には、(c) 前記(b)と異なる第3の抗糖尿病薬が、メトホルミン、スルホニル尿素、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、レバグリニド、ナテグリニド、アカルボース、ボグリボース、ミグリトールおよびGLP-1類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される、

請求項1又は2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

(b) 前記第2の抗糖尿病薬が、メトホルミン、スルホニル尿素、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、レバグリニド、ナテグリニド、アカルボース、ボグリボース、ミグリトールおよびGLP-1類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択され、

存在する場合には、(c) 前記(b)と異なる第3の抗糖尿病薬が、ビグアニド(特にメトホルミン)、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
- グルコシダーゼ

阻害剤およびG L P - 1類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される、

請求項1又は2に記載の医薬組成物。

【請求項5】

(b)前記第2の抗糖尿病薬が、メトホルミン、スルホニル尿素およびピオグリタゾンまたは医薬的に許容されるその塩からなる群から選択され、

存在する場合には、(c)前記(b)と異なる第3の抗糖尿病薬が、メトホルミン、スルホニル尿素、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、レパグリニド、ナテグリニド、アカルボース、ボグリボース、ミグリトールおよびG L P - 1類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される、

請求項1、2、3又は4に記載の医薬組成物。

【請求項6】

(b)前記第2の抗糖尿病薬が、メトホルミンおよびピオグリタゾンまたは医薬的に許容されるその塩からなる群から選択され、

(c)前記(b)と異なる第3の抗糖尿病薬が、メトホルミン、スルホニル尿素およびピオグリタゾンまたは医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される、

請求項1から5のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項7】

第2および/または第3の抗糖尿病薬が、メトホルミン、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン、トログリタゾン、シグリタゾン、グリベンクラミド、トルブタミド、グリメピリド、グリピジド、グリキドン、グリボルヌリド、グリブリド、グリソエピド、グリクラジド、ナテグリニド、レパグリニド、ミチグリニド、アカルボース、ボグリボース、ミグリトール、エクセナチド、リラゲルチド、タスポグルチド、セマグルチド、アルビグルチドおよびリキシセナチドまたは医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される、請求項1、2、3又は4に記載の医薬組成物。

【請求項8】

1つまたは複数の医薬的に許容される担体をさらに含む、請求項1から7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項9】

(a)、(b)、及び存在する場合には(c)のそれぞれが、同時使用または逐次使用に適している、請求項1から7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項10】

(a)、(b)、及び存在する場合には(c)のそれぞれが、1つの単一の剤形内に存在するか、または別個の剤形内に存在する、請求項1から7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項11】

D P P - 4阻害剤および第2の抗糖尿病薬が単一の剤形内に存在し、第3の抗糖尿病薬が、別個の剤形内に存在する、請求項1から7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項12】

D P P - 4阻害剤と、請求項1から7のいずれか1項に記載の第2の抗糖尿病薬と、任意で請求項1から7のいずれか1項に記載の第3の抗糖尿病薬とが、交互投与を含む併用投与により患者に投与されることを特徴とする、必要とする患者における、

- 2型糖尿病を治療するための、または
- 血糖コントロールを改善するための、および/または、空腹時血漿グルコース、摂食後血漿グルコースおよび/またはグリコシル化ヘモグロビンH b A 1 cを低下させるための、または
- 糖尿病の合併症、例えば白内障、ならびに微小血管性および大血管性疾患、例えば腎症、網膜症、ニューロパシー、組織虚血、糖尿病性足病変、動脈硬化、心筋梗塞、急性冠不全症候群、不安定狭心症、安定狭心症、脳卒中、末梢性動脈閉塞性疾患、心筋症、心不全、心臓リズム障害および血管再狭窄からなる群から選択される状態または障害を予防、そ

の進行を緩和、遅延、または治療するための、または

- 体重および/もしくは体脂肪を減少するための、体重および/もしくは体脂肪の増加を予防するための、または、体重および/もしくは体脂肪の減少を促進するための、または
 - 膵細胞の変性および/もしくは膵細胞の機能の低下を予防、緩和、遅延、または治療するための、および/または、膵細胞の機能を改善および/もしくは回復もしくは保護するための、および/または、膵臓のインスリン分泌機能を回復するための、または
 - 肝脂肪または異所性脂肪の異常な蓄積に起因する疾患または状態を予防、緩和、遅延、または治療するための、または
 - インスリン感受性を維持および/もしくは改善するための、および/または、高インスリン血症および/もしくはインスリン抵抗性を治療もしくは予防するための、
- 請求項 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

(a) リナグリプチン、または医薬的に許容されるその塩である DPP - 4 阻害剤を含む医薬組成物であって、

(b) ビグアニド、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
- グルコシダーゼ阻害剤および GLP - 1 類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される第 2 の抗糖尿病薬と組み合わせて投与されてもよく、かつ、

(c) ビグアニド、チアゾリジンジオン、スルホニル尿素、グリニド、
- グルコシダーゼ阻害剤および GLP - 1 類縁体または医薬的に許容されるその塩からなる群から選択される、(b) と異なる第 3 の抗糖尿病薬と組み合わせて投与されてもよい、

アルブミン尿を予防、その進行を緩和、その発症を遅延、または治療するための医薬組成物。

【請求項 14】

患者が、第 2 もしくは第 3 の抗糖尿病薬を用いた単剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分である、請求項 1 から 13 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

患者が、第 2 および第 3 の抗糖尿病薬を用いた 2 剤療法にもかかわらず、血糖コントロールが不十分である、請求項 1 から 13 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記第 2 の抗糖尿病薬がメトホルミン又は医薬的に許容されるその塩である、請求項 1 から 15 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記第 3 の抗糖尿病薬がスルホニル尿素又は医薬的に許容されるその塩である、請求項 1 から 16 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

(b) 前記第 2 の抗糖尿病薬がメトホルミン又は医薬的に許容されるその塩であり、(c) 前記第 3 の抗糖尿病薬がスルホニル尿素又は医薬的に許容されるその塩である、請求項 1 から 17 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

患者が 2 型糖尿病である、請求項 1 から 18 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

DPP - 4 阻害剤の 1 日投与量が 5 mg である、請求項 1 から 19 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。