

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-526778 (P2004-526778A)

【公表日】平成 16 年 9 月 2 日 (2004.9.2)

【年通号数】公開・登録公報 2004-034

【出願番号】特願 2002-582955 (P2002-582955)

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 31/785

A 6 1 K 31/015

A 6 1 K 31/355

A 6 1 K 31/375

A 6 1 K 31/4415

A 6 1 K 31/616

A 6 1 K 31/714

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 39/00

【F I】

A 6 1 K 31/785

A 6 1 K 31/015

A 6 1 K 31/355

A 6 1 K 31/375

A 6 1 K 31/4415

A 6 1 K 31/616

A 6 1 K 31/714

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 39/00

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 3 月 31 日 (2005.3.31)

【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】

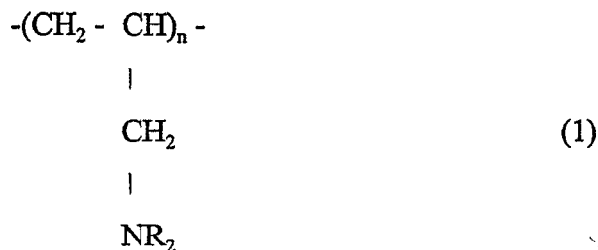
少なくとも 1 つの脂肪族アミンポリマーの塩を含んでなる、X 症候群の処置または X 症候群の症状の開始の障害が必要な患者において X 症候群を処置または X 症候群の症状の開始を障害するための医薬組成物。

【請求項 2】

脂肪族アミンポリマーがアルキル化されかつ架橋されたポリマー、またはそのコポリマーであって、該ポリマー塩が

( a )

## 【化 1】



と

## 【化 2】



式中、 $n$  は正の整数であり、各  $R$  は独立して、 $H$  または  $C_1 \sim C_8$  アルキル基であるから本質的に群より選択される繰り返し単位を有する 1 つ以上のポリマー、またはその塩およびコポリマー；

(b) 少なくとも 1 つの脂肪族アルキル化剤；ならびに

(c) 架橋剤

の反応産物を含んでなる、請求項 1 記載の 医薬組成物。

## 【請求項 3】

ポリマー塩が固定陽電荷ならびに  $Cl^-$ 、 $Br^-$ 、 $CH_3OSO_3^-$ 、 $H_2SO_4^-$ 、 $SO_4^{2-}$ 、 $HCO_3^-$ 、および  $CO_3^{2-}$  からなる群より選択される少なくとも 1 つの対イオンを含む、請求項 1 または 2 記載の 医薬組成物。

## 【請求項 4】

ポリマーが多官能性架橋剤により架橋されている、請求項 1 ～ 3 いずれか記載の 医薬組成物。

## 【請求項 5】

架橋剤がモノマーと架橋剤の混合重量を基準として約 0.5 重量% ～ 約 25 重量% の量で存在する、請求項 2 ～ 4 いずれか記載の 医薬組成物。

## 【請求項 6】

架橋剤がモノマーと架橋剤の混合重量を基準として約 2.5 重量% ～ 約 20 重量% の量で存在する、請求項 2 ～ 4 いずれか記載の 医薬組成物。

## 【請求項 7】

架橋剤がエピクロロヒドリンを含んでなる請求項 2 ～ 6 いずれか記載の 医薬組成物。

## 【請求項 8】

アルキル化剤が式  $RX$

式中、 $R$  は  $C_1 \sim C_{20}$  アルキル基、 $C_1 \sim C_{20}$  ヒドロキシアルキル基、 $C_1 \sim C_{20}$  アルキルアンモニウム基、または  $C_1 \sim C_{20}$  アルキルアミド基であり、 $X$  は 1 つ以上の求電子性脱離基である

を有する請求項 2 ～ 7 いずれか記載の 医薬組成物。

## 【請求項 9】

アルキル化剤が  $C_1 \sim C_{20}$  アルキルハロゲン化物を含んでなる請求項 2 ～ 8 いずれか記載の 医薬組成物。

## 【請求項 10】

前記アルキル化剤が  $C_1 \sim C_{20}$  アルキルハロゲン化物アンモニウム塩を含んでなる請求項 2 ~ 10 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記アルキルハロゲン化物アンモニウム塩が  $C_4 \sim C_{12}$  ハロアルキルトリメチルアンモニウム塩である請求項 10 記載の医薬組成物。

【請求項 12】

ポリマー塩が、ポリマー、またはその塩もしくはコポリマー、および少なくとも 2 つの前記アルキル化剤；前記アルキル化剤のうち 1 つは式  $RX$ 、式中  $R$  は  $C_1 \sim C_{20}$  アルキル基であり、 $X$  は 1 つ以上の求電子性脱離基である、を有し、他の前記アルキル化剤は式  $R'X$ 、式中  $R'$  は  $C_1 \sim C_{20}$  アルキルアンモニウム基であり、 $X$  は 1 つ以上の求電子性脱離基である、を有する  
の反応産物を含んでなる、請求項 2 ~ 11 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 13】

式  $RX$  を有する前記アルキル化剤のうち 1 つがアルキルハロゲン化物であり、式  $R'X$  を有する他の前記アルキル化剤がアルキルハロゲン化物アンモニウム塩である、請求項 12 記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記アルキルハロゲン化物が  $C_4 \sim C_{20}$  アルキルハロゲン化物であり、前記アルキルハロゲン化物アンモニウム塩が  $C_4 \sim C_{18}$  アルキルハロゲン化物アンモニウム塩である、請求項 13 記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記アルキルハロゲン化物が  $C_{10}$  アルキルハロゲン化物であり、前記アルキルハロゲン化物アンモニウム塩が  $C_6$  アルキルハロゲン化物トリメチルアンモニウム塩である、請求項 13 または 14 記載の医薬組成物。

【請求項 16】

投与されるポリマー塩がポリ(アリルアミン)、ポリ(ジアリルアミン)、ポリ(ビニルアミン)およびポリ(エチレンジアミン)からなる群より選ばれる少なくとも 1 つのポリマーを含んでなる、請求項 1 ~ 15 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 17】

1 つ以上の食事と共に投与される請求項 1 ~ 16 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 18】

一日あたり約 1.5 g ~ 一日あたり約 4.5 g のポリマー塩を含む投薬で胃腸管に投与される、請求項 1 ~ 17 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 19】

一日あたり約 2.3 g ~ 一日あたり約 3.8 g のポリマー塩を含む投薬で胃腸管に投与される、請求項 1 ~ 17 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 20】

さらなる生物活性剤を含んでなるかまたは、さらなる生物活性剤と共に胃腸管に同時投与される、請求項 1 ~ 19 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 21】

HMG-CoA レダクターゼインヒビター、HMG-CoA シンターゼインヒビター、スクワレンエポキシダーゼインヒビター、およびスクワレンシンターゼインヒビターからなる群より選択されるインヒビターと共に投与される、請求項 1 ~ 20 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 22】

HMG-CoA レダクターゼインヒビターおよびアスピリン、または HMG-CoA レダクターゼインヒビターおよび遮断薬と共に胃腸管に投与される、請求項 1 ~ 20 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 23】

抗高脂血症剤または血漿 HDL 上昇剤と共に投与される、請求項 1 ~ 22 いずれか記載

の医薬組成物。

【請求項 24】

ビタミン B<sub>6</sub>、ビタミン B<sub>12</sub>、ビタミン C、ビタミン E、および カロチンからなる群より選択されるビタミンと共に胃腸管に同時投与される、請求項 1 ~ 23 いずれか記載の医薬組成物。

【請求項 25】

塩酸コレセバラムを含んでなる、X 症候群の処置または X 症候群の症状の開始の阻害が必要な患者において X 症候群を処置または X 症候群の症状の開始を阻害するための医薬組成物。

【請求項 26】

塩酸セベラマーを含んでなる、X 症候群に関連する病理学の処置または X 症候群に関連する病理学の症状の開始の阻害が必要な患者において X 症候群に関連する病理学を処置または X 症候群に関連する病理学の症状の開始を阻害するための医薬組成物。

【請求項 27】

X 症候群の処置または X 症候群の症状の開始の阻害が必要な個体において X 症候群を処置または X 症候群の症状の開始を阻害するための医薬の製造における、少なくとも 1 つの脂肪族アミンポリマーの塩の使用。

—