

【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 18 年 2 月 23 日 (2006.2.23)

【公表番号】特表 2002-500183 (P2002-500183A)

【公表日】平成 14 年 1 月 8 日 (2002.1.8)

【出願番号】特願 2000-527238 (P2000-527238)

【国際特許分類】

**A 6 1 K 31/785 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/78 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/04 (2006.01)**

【F I】

A 6 1 K 31/785

A 6 1 K 31/78

A 6 1 P 3/04

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 12 月 28 日 (2005.12.28)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 1 以上のリパーゼ阻害剤と 1 以上の脂肪結合性ポリマーとを組み合わせたことを特徴とする肥満治療薬。

【請求項 2】 脂肪結合性ポリマーが、ポリアルキルアクリレート、ポリアクリルアミド、ポリアルキルメタクリレート、ポリメタクリルアミド、ポリ - N - アルキルアクリルアミド、ポリ - N - アルキルメタクリルアミド、それらの置換誘導体及びそれらのコポリマーからなる群より選ばれる請求項 1 記載の肥満治療薬。

【請求項 3】 脂肪結合性ポリマーが、ポリ(ジメチルアミノプロピルアクリルアミド)、ポリ(トリメチルアンモニウムエチルアクリレート)、ポリ(トリメチルアンモニウムエチルメタクリレート)、ポリ(トリメチルアンモニウムプロピルアクリルアミド)、ポリ(ドデシルアクリレート)、ポリ(オクタデシルアクリレート)、ポリ(オクタデシルメタクリレート)又はそれらのコポリマーである請求項 2 記載の肥満治療薬。

【請求項 4】 ポリマーが、多機能性モノマーによって架橋されている請求項 2 記載の肥満治療薬。

【請求項 5】 多機能性モノマーが、ジアクリレート、トリアクリレート、テトラアクリレート、ジメタクリレート、ジアクリルアミド、ジメタクリルアミド、ジアリルアクリルアミド及びポリビニルアレーンからなる群より選ばれる請求項 4 記載の肥満治療薬。

【請求項 6】 多機能性モノマーが、エチレングリコールジアクリレート、プロピレングリコールジアクリレート、ブチレングリコールジアクリレート、エチレングリコールジメタクリレート、ブチレングリコールジメタクリレート、メチレンビス(メタクリルアミド)、エチレンビス(アクリルアミド)、エチレンビス(メタクリルアミド)、エチリデンビス(アクリルアミド)、エチリデンビス(メタクリルアミド)、ビスフェノール A ジメタクリレート、ビスフェノール A ジアクリレート、ペンタエリトリールテトラアクリレート、トリメチロールプロパントリアクリレート及びジビニルベンゼンからなる群より選ばれる請求項 5 記載の肥満治療薬。

【請求項 7】 架橋剤の量が、架橋剤とモノマーを合わせた重量に基づいて、約 0 .

5 ～ 約 25 重量パーセントの間である請求項 4 記載の肥満治療薬。

【請求項 8】 リパーゼ阻害剤が、リプスタティン (lipstatin)、テトラヒドロリプスタティン (tetrahydrolipstatin) 又はそれらの組み合わせから選ばれる請求項 1 記載の肥満治療薬。

【請求項 9】 脂肪結合性ポリマーが、合成アミンポリマーである請求項 1 記載の肥満治療薬。

【請求項 10】 アミンポリマーが、ポリ(アリルアミン)、ポリ(エチレンジアミン)、ポリ(ビニルアミン)、ポリ(ジアリルアミン)及びポリ(ジアリルメチルアミン)からなる群より選ばれる請求項 9 記載の肥満治療薬。

【請求項 11】 アミンポリマーが、モノマーと架橋剤とを合わせた重量に基づいて約 0.5 重量% ～ 25 重量%の量で存在する多機能性架橋剤によって架橋されている請求項 10 記載の肥満治療薬。

【請求項 12】 アミンポリマーが、さらにアミン窒素部分に結合する 1 以上の疎水性の領域をさらに含む請求項 9 記載の肥満治療薬。

【請求項 13】 疎水性領域が、アミン窒素の約 1 ～ 約 60%と結合している請求項 12 記載の肥満治療薬。

【請求項 14】 疎水性領域が、アミン窒素の約 1 ～ 約 30%と結合している請求項 13 記載の肥満治療薬。

【請求項 15】 疎水性領域が、少なくとも 4 つの炭素を有する置換又は非置換、直鎖、分枝又は環状のアルキル基である請求項 12 記載の肥満治療薬。

【請求項 16】 疎水性領域が、約 4 ～ 30 個の間の炭素のアルキル基である請求項 15 記載の肥満治療薬。

【請求項 17】 疎水性領域が、約 6 個の炭素のアルキル基である請求項 16 記載の肥満治療薬。

【請求項 18】 疎水性領域が、約 8 個の炭素のアルキル基である請求項 16 記載の肥満治療薬。

【請求項 19】 疎水性領域が、約 10 個の炭素のアルキル基である請求項 16 記載の肥満治療薬。

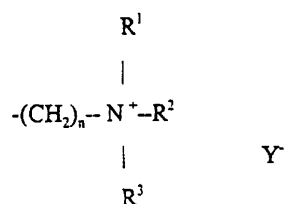
【請求項 20】 疎水性領域が、約 12 個の炭素のアルキル基である請求項 16 記載の肥満治療薬。

【請求項 21】 疎水性領域が、約 18 個の炭素のアルキル基である請求項 16 記載の肥満治療薬。

【請求項 22】 アミンポリマーが、該アミン窒素の部分に結合している 1 以上の正に帯電した領域をさらに含む請求項 9 記載の肥満治療薬。

【請求項 23】 正に帯電した領域が、下記の式：

【化 1】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $R^3$  は水素又はアルキル基を表し、各 R はそれぞれ独立して、約 1 ～ 約 24 の炭素原子の炭素原子鎖長を有する直鎖若しくは分枝の、置換若しくは非置換の、直鎖、分枝又は環状のアルキル基を表し、

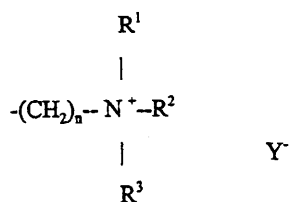
$n$  は、3 以上の値を有する整数であり、

$Y$  は、負に帯電した対イオンである)

を有する 4 級アミン含有部分を含む請求項 22 記載の肥満治療薬。

【請求項 24】 さらにアミンポリマーが、約 4 ～ 約 24 の炭素のアルキル基を含む 1 以上の疎水性領域及び、以下の式：

## 【化 2】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $R^3$  は水素又はアルキル基を表し、各  $R$  はそれぞれ独立して、約 1 ～ 約 24 の炭素原子の炭素原子鎖長を有する直鎖若しくは分枝の、置換若しくは非置換の、直鎖、分枝又は環状のアルキル基を表し、

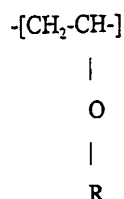
$n$  は、3 以上の値を有する整数であり、

$Y$  は、負に帯電した対イオンである)

を有する 4 級アミン含有部分を含む 1 以上の正に帯電した領域を含む請求項 9 記載の肥満治療薬。

【請求項 25】 脂肪結合性ポリマーが式：

## 【化 3】



(式中、 $R$  は疎水性領域である)

のモノマーからなる請求項 1 記載の肥満治療薬。

【請求項 26】 疎水性領域が、少なくとも約 4 個の炭素を有する、置換若しくは非置換の、直鎖、分枝又は環状のアルキル基を含む請求項 25 記載の肥満治療薬。

【請求項 27】 疎水性領域が、約 4 ～ 30 個の間の炭素のアルキル基を含む請求項 25 記載の肥満治療薬。

【請求項 28】 疎水性領域が、約 6 個の炭素のアルキル基を含む請求項 25 記載の肥満治療薬。

【請求項 29】 脂肪結合性ポリマーが、リパーゼ阻害剤で置換されている請求項 1 記載の肥満治療薬。

【請求項 30】 1 以上のリパーゼ阻害剤と 1 以上の脂肪結合性ポリマーとを組み合わせたことを特徴とする食物脂肪の吸収低減剤。

【請求項 31】 1 以上の脂肪結合性ポリマーを含むことを特徴とする脂肪便治療薬。

【請求項 32】 脂肪便がリパーゼ阻害剤の投与により生じる脂肪便である、請求項 31 記載の脂肪便治療薬。

【請求項 33】 1 以上のリパーゼ阻害剤と 1 以上の脂肪結合性ポリマーとを組み合わせたことを特徴とする高トリグリセリド血症治療薬。

【請求項 34】 1 以上の脂肪結合性ポリマーを含むことを特徴とする肥満治療薬。