

【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以上のリバーゼ阻害剤と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、多機能性コ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】 多機能性コモノマーが、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】 多機能性コモノマーが、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、ペンタエリトリト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】リバーゼ阻害剤が、リップスタチン(lipstatin)、テトラヒドロリップスタチン(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(エチレンイミン)、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。

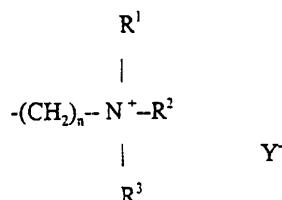
【請求項20】疎水性領域が、約12個の炭素のアルキル基である請求項16記載の肥満治療薬。

【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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>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、

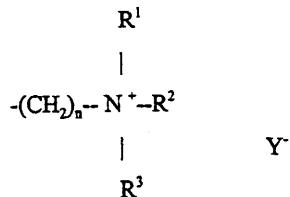
nは、3以上の値を有する整数であり、

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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>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、

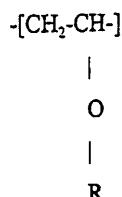
nは、3以上の値を有する整数であり、

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、リバ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以上のリバーゼ阻害剤と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】 脂肪便がリバ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以上のリバーゼ阻害剤と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。