



(19)  
**Bundesrepublik Deutschland**  
**Deutsches Patent- und Markenamt**

(10) **DE 03 758 361 T1 2007.10.11**

(12)

## Veröffentlichung der Patentansprüche

der europäischen Patentanmeldung mit der  
 (97) Veröffentlichungsnummer: **1 567 193**  
 in deutscher Übersetzung (Art. II § 2 Abs. 1 IntPatÜG)  
 (86) PCT-Aktenzeichen: **PCT/GB03/04597**  
 (96) Europäisches Aktenzeichen: **03 758 361.4**  
 (87) PCT-Veröffentlichungs-Nr.: **WO 2004/037292**  
 (86) PCT-Anmeldetag: **24.10.2003**  
 (87) Veröffentlichungstag  
 der PCT-Anmeldung: **06.05.2004**  
 (97) Veröffentlichungstag  
 der europäischen Anmeldung: **31.08.2005**  
 (46) Veröffentlichungstag der Patentansprüche  
 in deutscher Übersetzung: **11.10.2007**

(51) Int Cl.<sup>8</sup>: **A61K 47/10 (2006.01)**  
**A61K 47/22 (2006.01)**  
**A61K 47/02 (2006.01)**  
**A61K 31/765 (2006.01)**

(30) Unionspriorität:  
**0224909 25.10.2002 GB**

(74) Vertreter:  
**derzeit kein Vertreter bestellt**

(71) Anmelder:  
**Norgine Europe BV, Amsterdam, NL**

(72) Erfinder:  
**Barras, Norman, Mid Glamorgan, GB; Cox, Ian David, Mid Glamorgan CF82 8SJ, GB**

**Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen**

(54) Bezeichnung: **DARMREINIGUNGSMITTEL ZUSAMMENSETZUNG**

(57) Hauptanspruch: Eine trockene Zusammensetzung zum Vermischen mit Wasser, wobei die trockene Zusammensetzung die folgenden Komponenten pro Liter herzustellen wässriger Lösung enthält:

- a) 80 bis 350 g Polyethylenglycol,
  - b) 3 bis 20 g Ascorbinsäure, eines Salzes oder mehrerer Salze von Ascorbinsäure oder einer Mischung aus Ascorbinsäure und einem oder mehreren Salzen von Ascorbinsäure,
  - c) 1 bis 15 g eines Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfats oder einer Mischung aus Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfaten und
  - d) gegebenenfalls ein oder mehrere Elektrolyte, ausgewählt aus Natriumchlorid, Kaliumchlorid und Natriumhydrogencarbonat,
- wobei die Komponenten der Zusammensetzung derart ausgewählt sind, dass 1 Liter einer hergestellten wässrigen Lösung eine Osmolarität innerhalb des Bereichs von 300 bis 700 mOsmol/kg besitzt.

**Patentansprüche**

1. Eine trockene Zusammensetzung zum Vermischen mit Wasser, wobei die trockene Zusammensetzung die folgenden Komponenten pro Liter herzustellender wässriger Lösung enthält:

- a) 80 bis 350 g Polyethylenglycol,
  - b) 3 bis 20 g Ascorbinsäure, eines Salzes oder mehrerer Salze von Ascorbinsäure oder einer Mischung aus Ascorbinsäure und einem oder mehreren Salzen von Ascorbinsäure,
  - c) 1 bis 15 g eines Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfats oder einer Mischung aus Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfaten und
  - d) gegebenenfalls ein oder mehrere Elektrolyte, ausgewählt aus Natriumchlorid, Kaliumchlorid und Natriumhydrogencarbonat,
- wobei die Komponenten der Zusammensetzung derart ausgewählt sind, dass 1 Liter einer hergestellten wässrigen Lösung eine Osmolarität innerhalb des Bereichs von 300 bis 700 mOsmol/kg besitzt.

2. Eine wie in Anspruch 1 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei eine in 1 Liter Wasser hergestellte wässrige Lösung eine Osmolarität von 330 mOsmol/kg oder höher besitzt.

3. Eine wie in Anspruch 1 oder Anspruch 2 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei eine in 1 Liter Wasser hergestellte wässrige Lösung eine Osmolarität im Bereich von 550 mOsmol/kg oder niedriger besitzt.

4. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 3 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei das Polyethylenglycol ein mittleres Molekulargewicht von 2000 Dalton oder höher besitzt.

5. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 4 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei das Polyethylenglycol ein mittleres Molekulargewicht von 4500 oder niedriger besitzt.

6. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 5 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei das Polyethylenglycol ein mittleres Molekulargewicht von 3350 oder 4000 besitzt.

7. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 6 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend 90 g oder mehr Polyethylenglycol pro Liter.

8. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 7 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend 150 g oder weniger Polyethylenglycol pro Liter.

9. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 8 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend 100 g Polyethylenglycol pro Liter.

10. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 9 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend das Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfat oder die Mischung aus Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfaten in einer Menge von 3 g oder mehr pro Liter.

11. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 10 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend das Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfat oder die Mischung aus Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfaten in einer Menge von 9 g oder weniger pro Liter.

12. Eine wie in Anspruch 10 oder 11 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend das Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfat oder die Mischung aus Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfaten in einer Menge von 7,5 g pro Liter.

13. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 12 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei das Alkalimetall oder Erdalkalimetall Magnesium ist.

14. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 12 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei das Alkalimetall oder Erdalkalimetall Natrium ist.

15. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 14 beanspruchte trockene Zusammensetzung, die Natriumchlorid enthält.

16. Eine wie in Anspruch 15 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend Natriumchlorid in einer Menge von 2 g oder mehr pro Liter.

17. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 16 beanspruchte trockene Zusammensetzung, die Kaliumchlorid enthält.

18. Eine wie in Anspruch 17 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend Kaliumchlorid in einer Menge von 0,5 g oder mehr pro Liter.

19. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 18 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend Ascorbinsäure oder ein Salz davon in einer Menge von 5 g oder mehr pro Liter.

20. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 19 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend Ascorbinsäure oder ein Salz davon in einer Menge von 10 g oder weniger pro Liter.

21. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 20 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend Ascorbinsäure und ein Salz davon.

22. Eine wie in Anspruch 21 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend Ascorbinsäure und ein Salz davon in einem Gewichtsverhältnis in-

nerhalb des Bereichs von 1:9 bis 9:1.

23. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 22 beanspruchte trockene Zusammensetzung, enthaltend Natriumascorbat.

24. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 23 beanspruchte trockene Zusammensetzung, ferner enthaltend einen Aromastoff.

25. Eine wie in Anspruch 24 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei der Aromastoff Zitrone ist.

26. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 24 beanspruchte trockene Zusammensetzung, ferner enthaltend einen Süßstoff, der kein Substrat für Bakterien im Darm ist.

27. Eine wie in Anspruch 26 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei der Süßstoff ausgewählt ist aus Aspartam, Acesulfam K, Saccharin und Citronensäure.

28. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 27 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei die Ascorbinsäure und/oder das Salz von Ascorbinsäure beschichtet sind/ist.

29. Ein Kolonreinigungspräparat, enthaltend eine wässrige Lösung einer wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 28 beanspruchten Zusammensetzung.

30. Eine Kolonreinigungspräparatpackung, umfassend die Komponenten einer wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 28 beanspruchten Zusammensetzung.

31. Ein Kolonreinigungszusammensetzungskit, umfassend die Komponenten einer wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 28 beanspruchten Zusammensetzung, enthaltend wenigstens zwei Teile, wobei die Ascorbinsäure und/oder die Salze davon in einem ersten Teil verpackt ist/sind und die anderen Komponenten in einem zweiten Teil verpackt sind.

32. Ein Verfahren zur Reinigung des Kolons eines Säugers, umfassend die orale Verabreichung einer Reinigungsflüssigkeit an den Säuger, die, pro Liter, die folgenden Komponenten enthält:

- a) 80 bis 150 g Polyethylenglycol,
- b) 3 bis 20 g Ascorbinsäure, eines Salzes oder mehrerer Salze von Ascorbinsäure oder einer Mischung aus Ascorbinsäure und einem oder mehreren Salzen von Ascorbinsäure,
- c) 1 bis 15 g eines Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfats oder einer Mischung aus Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfaten und
- d) gegebenenfalls ein oder mehrere Elektrolyte, ausgewählt aus Natriumchlorid, Kaliumchlorid und Natri-

umhydrogencarbonat, wobei die Komponenten derart ausgewählt sind, dass die Reinigungsflüssigkeit eine Osmolarität innerhalb des Bereichs von 300 bis 700 mOsmol/kg besitzt, das Volumen an verabreichter Flüssigkeit 1,5 bis 3 Liter für einen erwachsenen Menschen und anteilig für einen Säuger anders als einen erwachsenen Menschen beträgt.

33. Ein wie in Anspruch 32 beanspruchtes Verfahren, wobei die Zusammensetzung innerhalb von 1 bis 4 Stunden verabreicht wird.

34. Ein wie in Anspruch 32 oder Anspruch 33 beanspruchtes Verfahren, wobei das Kolon vor der Durchführung eines diagnostischen Verfahrens, eines therapeutischen Verfahrens oder eines chirurgischen Eingriffs am Kolon, Rektum oder Anus oder anderswo im Abdomen gereinigt wird.

35. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 32 bis 34 beanspruchtes Verfahren, wobei die bei dem Verfahren verwendete Reinigungsflüssigkeit die Merkmale der in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 29 beschriebenen Zusammensetzungen besitzt.

36. Eine trockene Zusammensetzung zum Vermischen mit Wasser, wobei die trockene Zusammensetzung die folgenden Komponenten pro Liter herzustellender wässriger Lösung enthält:

- a) 30 bis 350 g Polyethylenglycol,
- b) 3 bis 20 g Ascorbinsäure und eines Salzes oder mehrerer Salze von Ascorbinsäure und
- c) gegebenenfalls ein oder mehrere Elektrolyte, ausgewählt aus Natriumchlorid, Kaliumchlorid, Natriumhydrogencarbonat und den Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfaten.

37. Eine wie in Anspruch 36 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei das Salz von Ascorbinsäure ein Alkalimetall- oder Erdalkalimetallascorbat ist.

38. Eine wie in Anspruch 36 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei das Salz von Ascorbinsäure Natriumascorbat ist.

39. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 36 bis 38 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei die Ascorbinsäure und das Salz davon in einem Gewichtsverhältnis innerhalb des Bereichs von 1:9 bis 9:1 vorliegen.

40. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 36 bis 39 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei die Ascorbinsäure und das Salz davon in einem Gewichtsverhältnis innerhalb des Bereichs von 4:6 bis 6:4 vorliegen.

41. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 36 bis

40 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei die Zusammensetzung die in den Ansprüchen 4 bis 28 beschriebenen zusätzlichen Merkmale umfasst.

42. Eine wie in irgendeinem der Ansprüche 36 bis 41 beanspruchte trockene Zusammensetzung, wobei die Zusammensetzung Natriumsulfat enthält.

43. Ein Kolonreinigungspräparat, enthaltend eine wässrige Lösung einer wie in irgendeinem der Ansprüche 36 bis 42 beanspruchten Zusammensetzung.

44. Eine Kolonreinigungspräparatpackung, umfassend die Komponenten einer wie in irgendeinem der Ansprüche 36 bis 42 beanspruchten Zusammensetzung.

45. Ein Kolonreinigungszusammensetzungskit, umfassend die Komponenten einer wie in irgendeinem der Ansprüche 36 bis 42 beanspruchten Zusammensetzung, enthaltend wenigstens zwei Teile, wobei die Ascorbinsäure und das Salz davon in einem ersten Teil verpackt sind und die anderen Komponenten in einem zweiten Teil verpackt sind.

46. Ein Verfahren zur Reinigung des Kolons eines Säugers, umfassend die orale Verabreichung eines Präparats an den Säuger, das, pro Liter, die folgenden Komponenten enthält:

- a) 30 bis 350 g Polyethylenglycol,
  - b) 3 bis 20 g einer Mischung aus Ascorbinsäure und einem Salz von Ascorbinsäure und
  - c) gegebenenfalls ein oder mehrere Elektrolyte, ausgewählt aus Natriumchlorid, Kaliumchlorid, Natriumhydrogencarbonat und den Alkalimetall- oder Erdalkalimetallsulfaten,
- wobei das Volumen an verabreichter Zusammensetzung 1,5 bis 4 Liter für einen erwachsenen Menschen und anteilig für einen Säuger anders als einen erwachsenen Menschen beträgt.

47. Ein wie in Anspruch 46 beanspruchtes Verfahren, wobei das Präparat innerhalb von 1 bis 4 Stunden verabreicht wird.

48. Ein wie in Anspruch 46 oder 47 beanspruchtes Verfahren, wobei das Kolon vor der Durchführung eines diagnostischen Verfahrens, eines therapeutischen Verfahrens oder eines chirurgischen Eingriffs am Kolon, Rektum oder Anus oder anderswo im Abdomen gereinigt wird.

49. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 46 bis 48 beanspruchtes Verfahren, wobei die bei dem Verfahren verwendete Zusammensetzung wie in irgendeinem der Ansprüche 36 bis 42 beschrieben ist.

50. Die Verwendung eines PEG zur Herstellung eines Medikaments zur Reinigung des Kolons eines

Säugers gemäß einem Verabreichungsregime, umfassend die aufeinanderfolgenden Schritte:

- a) Verabreichung von 0,5 bis zu 3,0 Liter einer PEG enthaltenden Kolonreinigungslösung (Volumen  $V_{\text{PEG}}$ ) innerhalb eines Zeitraums  $t_1$  und
- b) Verabreichung von 0,3 bis zu 2,0 Liter klarer Flüssigkeit (Volumen  $V_{\text{cf}}$ ) innerhalb eines Zeitraums  $t_2$ .

51. Die wie in Anspruch 50 beanspruchte Verwendung, wobei  $t_1$  15 Minuten oder mehr beträgt.

52. Die wie in Anspruch 50 oder 51 beanspruchte Verwendung, wobei  $t_1$  2 Stunden oder weniger beträgt.

53. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 50 bis 52 beanspruchte Verwendung, wobei  $t_2$  15 Minuten oder mehr beträgt.

54. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 50 bis 53 beanspruchte Verwendung, wobei  $t_2$  2 Stunden oder weniger beträgt.

55. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 50 bis 54 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{\text{PEG}}$  500 ml oder größer ist.

56. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 50 bis 55 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{\text{PEG}}$  2000 ml oder kleiner ist.

57. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 50 bis 56 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{\text{cf}}$  300 ml oder größer ist.

58. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 50 bis 57 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{\text{cf}}$  1500 ml oder kleiner ist.

59. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 50 bis 58 beanspruchte Verwendung, wobei die PEG-Lösung eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 28 oder 36 bis 42 beschriebene Zusammensetzung enthält.

60. Ein Verfahren zur Reinigung des Kolons eines Säugers, umfassend die orale Verabreichung an den Säuger in aufeinanderfolgenden Schritten von:

- a) 0,5 bis zu 3,0 Liter einer PEG enthaltenden Reinigungslösung (Volumen  $V_{\text{PEG}}$ ) innerhalb eines Zeitraums  $t_1$  und
- b) 0,3 bis zu 2,0 Liter klarer Flüssigkeit (Volumen  $V_{\text{cf}}$ ) innerhalb eines Zeitraums  $t_2$ .

61. Ein wie in Anspruch 60 beanspruchtes Verfahren, wobei  $t_1$  15 Minuten oder mehr beträgt.

62. Ein wie in Anspruch 60 oder 61 beanspruchtes Verfahren, wobei  $t_1$  2 Stunden oder weniger beträgt.

63. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 60 bis 62 beanspruchtes Verfahren, wobei  $t_2$  15 Minuten oder mehr beträgt.

64. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 60 bis 63 beanspruchtes Verfahren, wobei  $t_2$  2 Stunden oder weniger beträgt.

65. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 60 bis 64 beanspruchtes Verfahren, wobei  $V_{\text{PEG}}$  800 ml oder größer ist.

66. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 60 bis 65 beanspruchtes Verfahren, wobei  $V_{\text{PEG}}$  2000 ml oder kleiner ist.

67. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 60 bis 66 beanspruchtes Verfahren, wobei  $V_{\text{cf}}$  400 ml oder größer ist.

68. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 60 bis 66 beanspruchtes Verfahren, wobei  $V_{\text{cf}}$  1500 ml oder kleiner ist.

69. Die Verwendung eines PEG zur Herstellung eines Medikaments zur Reinigung des Kolons eines Patienten gemäß einem Verabreichungsregime, umfassend die aufeinanderfolgenden Schritte:

- a) Verabreichung von 0,5 bis zu 3,0 Liter einer ersten, PEG enthaltenden Kolonreinigungslösung (Volumen  $V_{\text{PEG}}$ ) innerhalb eines Zeitraums  $t_1$ ,
- b) Verabreichung von 0,3 bis zu 2,0 Liter klarer Flüssigkeit (Volumen  $V_{\text{cf}}$ ) innerhalb eines Zeitraums  $t_2$  und
- c) Verabreichung von 0,5 bis zu 3,0 Liter einer zweiten, PEG enthaltenden Kolonreinigungslösung (Volumen  $V_{2\text{PEG}}$ ) innerhalb eines Zeitraums  $t_3$ .

70. Die wie in Anspruch 69 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{\text{PEG}}$ ,  $t_1$ ,  $V_{\text{Wasser}}$  und  $t_2$  wie in irgendeinem der Ansprüche 51 bis 58 beschrieben sind.

71. Die wie in Anspruch 68 oder 69 beanspruchte Verwendung, wobei  $t_3$  etwa 1 Stunde beträgt.

72. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 69 bis 71 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{2\text{PEG}}$  800 ml oder größer ist.

73. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 69 bis 72 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{2\text{PEG}}$  2000 ml oder kleiner ist.

74. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 68 bis 73 beanspruchte Verwendung, wobei das Verabreichungsregime den weiteren Schritt  
d) Verabreichung von 0,5 bis zu 2,0 Liter Wasser (Volumen  $V_{2\text{Wasser}}$ ) innerhalb eines Zeitraums  $t_4$  umfasst.

75. Die wie in Anspruch 74 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{2\text{Wasser}}$  800 ml oder größer ist.

76. Die wie in Anspruch 74 oder 75 beanspruchte Verwendung, wobei  $V_{2\text{Wasser}}$  1500 ml oder kleiner ist.

77. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 74 bis 76 beanspruchte Verwendung, wobei  $t_4$  30 Minuten oder mehr beträgt.

78. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 74 bis 77 beanspruchte Verwendung, wobei  $t_4$  3 Stunden oder weniger beträgt.

79. Die wie in irgendeinem der Ansprüche 69 bis 78 beanspruchte Verwendung, wobei die PEG-Lösung eine wie in irgendeinem der Ansprüche 1 bis 28 oder 36 bis 42 beschriebene Zusammensetzung enthält.

80. Eine Einheitsdosis einer Kolonreinigungszusammensetzung, umfassend zwei Komponenten, wobei die erste Komponente eine Zusammensetzung zur Herstellung einer ersten, PEG enthaltenden Kolonreinigungslösung ist und die zweite Komponente eine Zusammensetzung zur Herstellung einer zweiten, PEG enthaltenden Kolonreinigungslösung ist.

81. Eine wie in Anspruch 80 beanspruchte Einheitsdosis einer Kolonreinigungszusammensetzung, wobei der Kit wenigstens 1 weitere Komponente enthält, die Ascorbinsäure und/oder ein oder mehrere Salze davon enthält, getrennt von anderen Komponenten verpackt, wobei die weitere Komponente zum Vermischen mit der ersten oder zweiten Zusammensetzung zur Herstellung einer PEG enthaltenden Kolonreinigungslösung vorgesehen ist.

82. Ein Kit, umfassend eine Schachtel, eine wie in Anspruch 80 oder 81 beanspruchte Einheitsdosis einer Kolonreinigungszusammensetzung und Instruktionen für dessen Anwendung.

83. Ein wie in irgendeinem der Ansprüche 32, 33 und 46 bis 48 beanspruchtes Verfahren, wobei das Kolon bei der Behandlung einer akuten Magen-Darm-Infektion gereinigt wird.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen