

【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3区分

【発行日】平成26年4月10日(2014.4.10)

【公表番号】特表2013-520561(P2013-520561A)

【公表日】平成25年6月6日(2013.6.6)

【年通号数】公開・登録公報2013-028

【出願番号】特願2012-555152(P2012-555152)

【国際特許分類】

C 08 F 126/02 (2006.01)  
C 08 F 20/52 (2006.01)  
C 08 G 73/04 (2006.01)  
A 61 K 31/785 (2006.01)  
A 61 P 3/06 (2006.01)  
A 61 P 3/10 (2006.01)  
A 61 P 1/04 (2006.01)  
A 61 K 31/40 (2006.01)  
A 61 K 31/4418 (2006.01)  
A 61 K 31/404 (2006.01)  
A 61 K 31/366 (2006.01)  
A 61 K 31/47 (2006.01)  
A 61 K 31/505 (2006.01)  
A 61 K 31/22 (2006.01)  
A 61 K 31/195 (2006.01)  
A 61 K 31/192 (2006.01)  
A 61 K 31/216 (2006.01)  
A 61 K 9/48 (2006.01)  
C 08 F 220/60 (2006.01)

【F I】

C 08 F 126/02  
C 08 F 20/52  
C 08 G 73/04  
A 61 K 31/785  
A 61 P 3/06  
A 61 P 3/10  
A 61 P 1/04  
A 61 K 31/40  
A 61 K 31/4418  
A 61 K 31/404  
A 61 K 31/366  
A 61 K 31/47  
A 61 K 31/505  
A 61 K 31/22  
A 61 K 31/195  
A 61 K 31/192  
A 61 K 31/216  
A 61 K 9/48  
C 08 F 220/60

【手続補正書】

【提出日】平成26年2月20日(2014.2.20)

【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

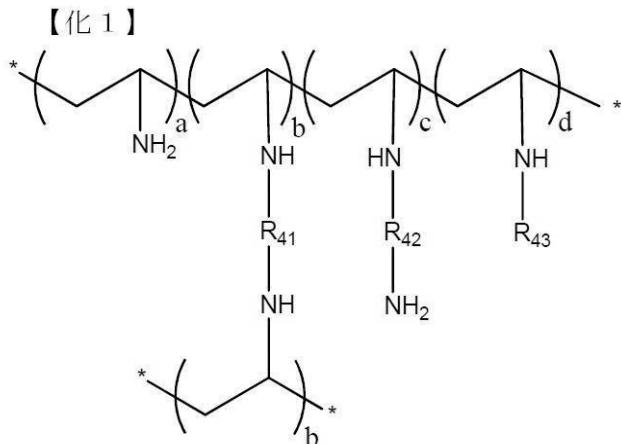
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

モノマーを含む重合混合物の反応生成物を含む架橋アミンポリマーであって、前記ポリマーが式1：

【化1-2】



(1)

の一般構造を有し、式中、

R<sub>41</sub>はC<sub>5</sub>～C<sub>12</sub>アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の-CH<sub>2</sub>-基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっているC<sub>5</sub>～C<sub>12</sub>アルキレンであり；

R<sub>42</sub>はC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の-CH<sub>2</sub>-基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっているC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキレンであり；

R<sub>43</sub>はC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキル、アラルキル、またはアルキル基の1つ以上の-CH<sub>2</sub>-基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっているC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキルであり；

以下：

(i) aが30～95モルパーセントであり、bが1～20モルパーセントであり、かつcが1～65モルパーセントであり、dが0モルパーセントであるか、またはcが0モルパーセントであり、dが1～25モルパーセントである。

(ii) aが15～80モルパーセントであり、bが1～20モルパーセントであり、cが1～65モルパーセントであり、dが1～25モルパーセントである、あるいは、

(iii) aが35～85モルパーセントであり、bが5～15モルパーセントであり、cが5～30モルパーセントであり、dが5～20モルパーセントである、

のいずれかである、

架橋アミンポリマー。

【請求項2】

aが15～80モルパーセントであり、bが1～20モルパーセントであり、cが1～65モルパーセントであり、dが1～25モルパーセントである、請求項1に記載のポリマー。

【請求項3】

aが15～75モルパーセントであり、bが1～15モルパーセントであり、cが5～

60モルパーセントであり、dが10～20モルパーセントである、請求項1に記載のポリマー。

【請求項4】

aが35～85モルパーセントであり、bが5～15モルパーセントであり、cが5～30モルパーセントであり、dが5～20モルパーセントである、請求項1に記載のポリマー。

【請求項5】

aが30～95モルパーセントであり、bが1～20モルパーセントであり、かつcが1～65モルパーセントであり、dが0モルパーセントであるか、またはcが0モルパーセントであり、dが1～25モルパーセントである、請求項1に記載のポリマー。

【請求項6】

aが35～90モルパーセントであり、bが1～15モルパーセントであり、cが1～65モルパーセントであり、dが0モルパーセントである、請求項1に記載のポリマー。

【請求項7】

aが70～95モルパーセントであり、bが1～20モルパーセントであり、cが0モルパーセントであり、dが1～25モルパーセントである、請求項1に記載のポリマー。

【請求項8】

膨潤率が約0.3～約30g水/gポリマーである、請求項1～7のいずれか1項に記載のポリマー。

【請求項9】

膨潤率が約2～約5g水/gポリマーである、請求項8に記載のポリマー。

【請求項10】

ガラス転移温度が室温より高い、請求項1～9のいずれか1項に記載のポリマー。

【請求項11】

自由流動性粉末である、請求項1～10のいずれか1項に記載のポリマー。

【請求項12】

胆汁酸に対するin vitro結合親和性が、アッセイAを用いた測定で少なくとも0.66mmol/gであるか、または胆汁酸に対するin vitro結合能が、アッセイBを用いた測定で少なくとも約2.5mmol/gである、請求項1～11のいずれか1項に記載のポリマー。

【請求項13】

請求項1～12のいずれか1項に記載のポリマーと、薬学的に許容される添加剤とを含む医薬組成物。

【請求項14】

動物対象の血清LDLコレステロールを低下させるための、請求項1～12のいずれか1項に記載のアミンポリマー、または請求項13に記載の医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0018】

以降において、他の目的および特徴を一部明らかにし、また一部指摘する。

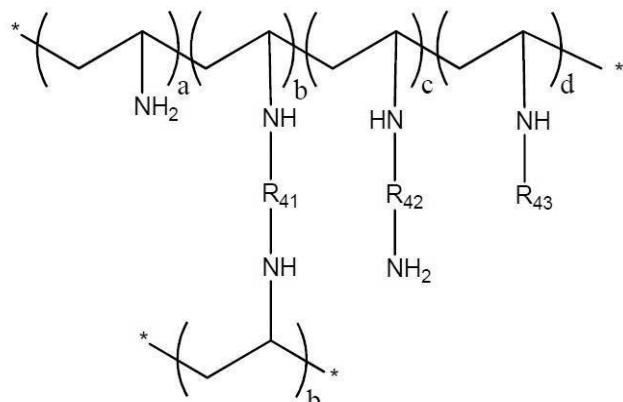
一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目1)

モノマーを含む重合混合物の反応生成物を含む架橋アミンポリマーであって、前記ポリマーが式1：

## 【化1-2】

## 【化1】



(1)

の一般構造を有し、式中、R<sub>41</sub> は C<sub>5</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>5</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレンであり；R<sub>42</sub> は C<sub>3</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>3</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレンであり；R<sub>43</sub> は C<sub>3</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキル、アラルキル、またはアルキル基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>3</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキルであり；b は、重合混合物に添加されたモノマーの割合に基づく 1.5 ~ 25 モルパーセントであり；a、c および d はそれぞれ独立して、重合混合物に添加されたモノマーの割合に基づく 0 ~ 97 モルパーセントである、架橋アミンポリマー。(項目2)a が 15 ~ 80 モルパーセントであり、b が 1 ~ 20 モルパーセントであり、c が 1 ~ 65 モルパーセントであり、d が 1 ~ 25 モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。(項目3)a が 15 ~ 75 モルパーセントであり、b が 1 ~ 15 モルパーセントであり、c が 5 ~ 60 モルパーセントであり、d が 10 ~ 20 モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。(項目4)a が 35 ~ 85 モルパーセントであり、b が 5 ~ 15 モルパーセントであり、c が 5 ~ 30 モルパーセントであり、d が 5 ~ 20 モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。(項目5)a が 30 ~ 95 モルパーセントであり、b が 1 ~ 20 モルパーセントであり、かつ c が 1 ~ 65 モルパーセントであり、d が 0 モルパーセントであるか、または c が 0 モルパーセントであり、d が 1 ~ 25 モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。(項目6)a が 35 ~ 90 モルパーセントであり、b が 1 ~ 15 モルパーセントであり、c が 1 ~ 65 モルパーセントであり、d が 0 モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。(項目7)

aが70～95モルパーセントであり、bが1～20モルパーセントであり、cが0モルパーセントであり、dが1～25モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。

(項目8)

aが35～90モルパーセントであり、bが1～15モルパーセントであり、cが1～65モルパーセントであり、dが0モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。

(項目9)

aが70～95モルパーセントであり、bが1～20モルパーセントであり、cが0モルパーセントであり、dが1～25モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。

(項目10)

aが80～99モルパーセントであり、bが1～20モルパーセントであり、cおよびdが0モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。

(項目11)

aが85～99モルパーセントであり、bが1～15モルパーセントであり、cおよびdが0モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。

(項目12)

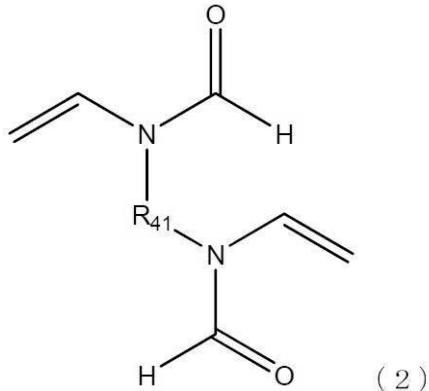
aが85～99モルパーセントであり、bが1～15モルパーセントであり、cおよびdが0モルパーセントである、項目1に記載のポリマー。

(項目13)

式2:

【化2-2】

【化2】



のモノマーを含む重合混合物の反応生成物を含む架橋アミンポリマーであって、式中、

R<sub>41</sub>はC<sub>8</sub>～C<sub>12</sub>アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の-C<sub>n</sub>H<sub>2n-1</sub>-基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシク

口官能基に置き換わっているC<sub>8</sub>～C<sub>12</sub>アルキレンである、

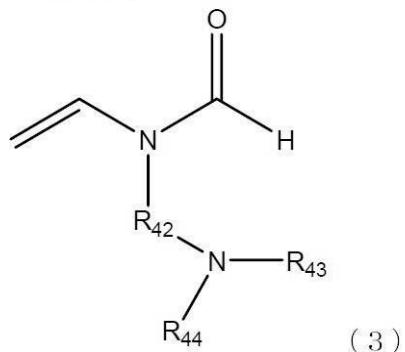
架橋アミンポリマー。

(項目14)

式3:

【化 3 - 2】

【化 3】



のモノマーを含む重合混合物の反応生成物を含む架橋アミンポリマーであって、式中、

$R_{4-2}$  は  $C_3 \sim C_{1-2}$  アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている  $C_3 \sim C_{1-2}$  アルキレンであり；

R<sub>4</sub>は水素または保護基であり；

R<sub>4,4</sub>は保護基である、

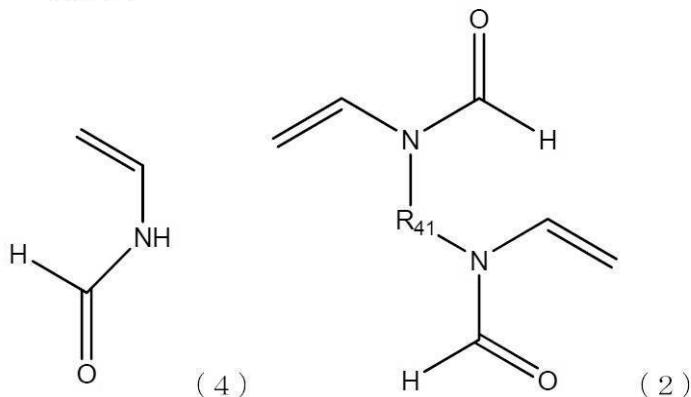
#### 架橋アミンポリマー。

( 項目 15 )

式4のモノマーと、重合混合物に添加された全モノマーに対し1~25モルパーセントの式2のモノマーとを含む重合混合物の反応生成物を含む架橋アミンポリマーであって、前記モノマーが式：

【化 4 - 2】

【化4】



を有し、式中、

$R_{4-1}$  は  $C_5 \sim C_{12}$  アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている  $C_5 \sim C_{12}$  アルキレンである、

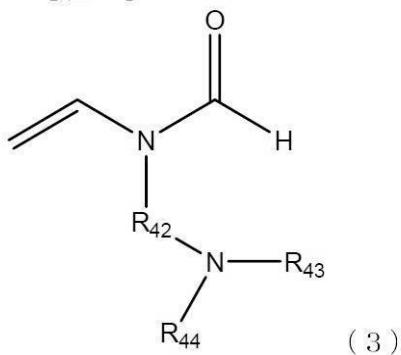
架橋アミンポリマー。

( 項目 1 6 )

前記重合混合物が 1 ~ 6.5 モルパーセントの式 3 :

【化5-2】

【化5】

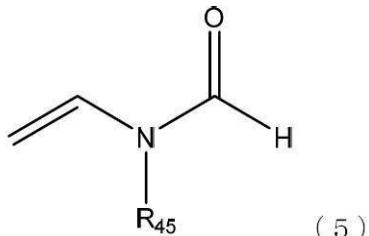
のモノマーをさらに含み、式中、R<sub>42</sub>はC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の-C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>-基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっているC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキレンであり；R<sub>43</sub>は水素または保護基であり；R<sub>44</sub>は保護基である、項目15に記載のポリマー。

(項目17)

前記重合混合物が1～25モルパーセントの式5：

【化6-2】

【化6】

のモノマーをさらに含み、式中、R<sub>45</sub>はC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキル、アラルキル、またはアルキル基の1つ以上の-C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>-基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっているC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキルである、項目15または16のいずれかに記載のポリマー。

(項目18)

前記重合混合物が、15～80モルパーセントのモノマー4、1～20モルパーセントのモノマー2、0～65モルパーセントのモノマー3、0～25モルパーセントのモノマー5を含む、項目15～17のいずれか1項に記載のポリマー。

(項目19)

前記重合混合物が、15～80モルパーセントのモノマー4、1～20モルパーセントのモノマー2、1～65モルパーセントのモノマー3、1～25モルパーセントのモノマー5を含む、項目17に記載のポリマー。

(項目20)

前記重合混合物が、15～75モルパーセントのモノマー4、1～15モルパーセントのモノマー2、5～60モルパーセントのモノマー3、10～20モルパーセントのモノマー5を含む、項目17に記載のポリマー。

(項目21)

前記重合混合物が、15～75モルパーセントのモノマー4、1～15モルパーセントのモノマー2、5～60モルパーセントのモノマー3、10～20モルパーセントのモノマー5を含む、項目17に記載のポリマー。

(項目22)

前記重合混合物が、30～95モルパーセントのモノマー4、1～20モルパーセントのモノマー2、および1～65モルパーセントのモノマー3と0モルパーセントのモノマー5または0モルパーセントのモノマー3と1～25モルパーセントのモノマー5のいずれかを含む、項目16または17に記載のポリマー。

(項目23)

前記重合混合物が、35～90モルパーセントのモノマー4、1～15モルパーセントのモノマー2、1～65モルパーセントのモノマー3を含む、項目16に記載のポリマー。

(項目24)

前記重合混合物が、70～95モルパーセントのモノマー4、1～20モルパーセントのモノマー2、1～25モルパーセントのモノマー5を含む、項目17に記載のポリマー。

(項目25)

前記重合混合物が、35～90モルパーセントのモノマー4、1～15モルパーセントのモノマー2、1～65モルパーセントのモノマー3を含む、項目16に記載のポリマー。

(項目26)

前記重合混合物が、70～95モルパーセントのモノマー4、1～20モルパーセントのモノマー2、1～25モルパーセントのモノマー5を含む、項目17に記載のポリマー。

(項目27)

前記重合混合物が、80～99モルパーセントのモノマー4、1～20モルパーセントのモノマー2を含む、項目15に記載のポリマー。

(項目28)

前記重合混合物が、85～99モルパーセントのモノマー4と、1～15モルパーセントのモノマー2とを含む、項目15に記載のポリマー。

(項目29)

前記重合混合物が、85～99モルパーセントのモノマー4と、1～15モルパーセントのモノマー2とを含む、項目15に記載のポリマー。

(項目30)

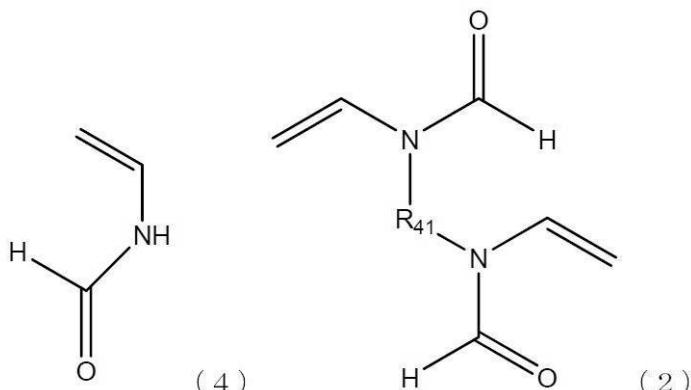
前記保護基が独立して-C(=O)OR<sub>4,9</sub>、-C(=O)R<sub>5,0</sub>であるか、またはR<sub>4,3</sub>とR<sub>4,4</sub>が、結合している窒素原子とともにスクシンイミドもしくはフタルイミド環を形成し、式中、R<sub>4,9</sub>はアルキルまたはアリールであり、R<sub>5,0</sub>はアミノ、水素、アルキルまたはハロアルキルである、項目14、16、18、22、23および25のいずれか1項に記載のポリマー。

(項目31)

式4のモノマーと式2のモノマー：

【化 7 - 2】

【化7】



とを食む重合混食物の反応生成物を食む架橋アミンポリマーであって、式中、

$R_{4-1}$  は  $C_3 \sim C_{16}$  アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている  $C_3 \sim C_{16}$  アルキレンであり；

架橋アミンポリマーの窒素原子の一部が、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、ヘテロシクロ、ヘテロシクロアルキル、(トリアルキルアンモニオ)アルキル、2-(保護アミノ)-m-(ヘテロシクロ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-3-メチル-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-4-メチル-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-1-オキソ-m-アリールC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-(アルキルチオ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-(アリール)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-カルボキシ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-グアニジノ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-(m-1)-ヒドロキシ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-メルカプト-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アルキルヘテロシクロ)C<sub>m</sub>アルキル、m-アミノ-2-(保護アミノ)-1,m-ジオキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アミノC<sub>x</sub>アルキル)ヘテロシクロC<sub>m</sub>アルキル、(m-1)-アミノ-m-(ヘテロシクロ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アリールアルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-アミノC<sub>x</sub>アルキル)-m-(アリールアルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-アミノC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-カルボキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(ヘテロシクロアルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-ヒドロキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-((x-1)-ヒドロキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-メルカプトC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-トリアルキルアンモニオC<sub>x</sub>アルキル)ヘテロシクロC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(2-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(3-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(4-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、式6:

【化 8 - 2】

〔化 8 〕

$$* \text{---} R_{46} \text{---} R_{47} \text{---} R_{48} \quad (6)$$

の配位子またはそれらの組合せから選択される配位子で置換されており、式中、

$R_{4-6}$  は  $C_6 \sim C_{16}$  アルキレンであり、 $R_{4-7}$  は 1, y - ピス (1-メチルピペリジン - 4 - イル)  $C_y$  アルキレンであり、 $R_{4-8}$  は  $C_6 \sim C_{16}$  アルキルであり、m は 3 ~ 12 の整数であり、x は 1 ~ 12 の整数であり、y は 1 ~ 14 の整数であり、z は 1 ~ 16 の整数である。

## 架橋アミンポリマー。

( 項目 3 2 )

前記ポリマーが、前記重合混合物と加水分解剤との反応生成物である、項目1～31のいずれか1項に記載のポリマー。

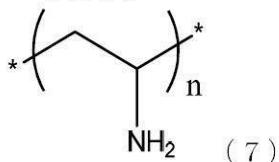
(項目33)

ビニルアミン反復単位と架橋剤との反応により生じた反復単位を含む架橋アミンポリマーであって、

## 前記ビニルアミン反復単位が式：

【化 9 - 2】

【化 9】



を有し、

前記架橋剤が  $X - R_1 - X$  またはエピハロヒドリンであり、式中、

$R_1$  は  $C_3 \sim C_{16}$  アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている  $C_3 \sim C_{16}$  アルキレンであり、X はそれぞれ独立して脱離基であり、

ソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - メルカプト C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - トリアルキルアンモニオ C<sub>x</sub> アルキル) ヘテロシクロ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - (2 - (アルコキシ) ベンズアミド) C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - (3 - (アルコキシ) ベンズアミド) C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - (4 - (アルコキシ) ベンズアミド) C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、式 6 :

【化 10 - 2】

【化 10】

\*—R<sub>46</sub>—R<sub>47</sub>—R<sub>48</sub> (6)

の配位子またはそれらの組合せから選択される配位子で置換されており、式中、

R<sub>46</sub> は C<sub>6</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキレンであり、R<sub>47</sub> は 1, y - ビス (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) C<sub>y</sub> アルキレンであり、R<sub>48</sub> は C<sub>6</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキルであり、m は 3 ~ 12 の整数であり、x は 1 ~ 12 の整数であり、y は 1 ~ 14 の整数であり、z は 1 ~ 6 の整数である、

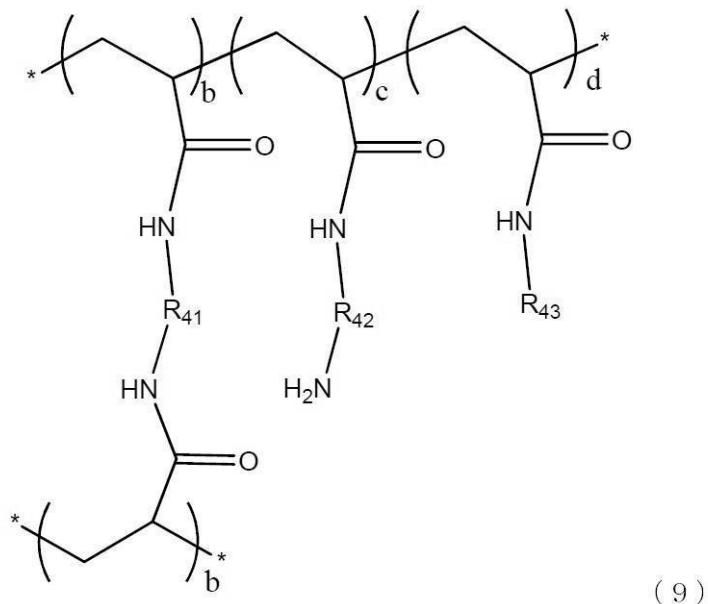
架橋アミンポリマー。

(項目 34)

モノマーを含む重合混合物の反応生成物を含む架橋アクリルアミドポリマーであって、前記ポリマーが式 9 :

【化 11 - 2】

【化 11】



(9)

の一般構造を有し、式中、

R<sub>41</sub> は C<sub>5</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の - CH<sub>2</sub> - 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>5</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレンであり；

R<sub>42</sub> は C<sub>3</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の - CH<sub>2</sub> - 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>3</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレンであり；

R<sub>43</sub> は C<sub>3</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキル、アラルキル、またはアルキル基の 1 つ以上の - CH<sub>2</sub> - 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>3</sub> ~ C<sub>20</sub> アルキルであり；

b は、重合混合物に添加されたモノマーの割合に基づく 1 ~ 25 モルパーセントであり

c および d はそれぞれ独立して、重合混合物に添加されたモノマーの割合に基づく 0 ~ 99 モルパーセントである、架橋アクリルアミドポリマー。

(項目 35)

b が 1 ~ 25 モルパーセントであり、c が 50 ~ 99 モルパーセントであり、d が 0 ~ 30 モルパーセントである、項目 34 に記載のポリマー。

(項目 36)

b が 1 ~ 15 モルパーセントであり、c が 60 ~ 98 モルパーセントであり、d が 1 ~ 25 モルパーセントである、項目 34 に記載のポリマー。

(項目 37)

b が 1 ~ 10 モルパーセントであり、c が 70 ~ 98 モルパーセントであり、d が 1 ~ 20 モルパーセントである、項目 34 に記載のポリマー。

(項目 38)

b が 1 ~ 20 モルパーセントであり、c が 80 ~ 99 モルパーセントであり、d が 0 モルパーセントである、項目 34 に記載のポリマー。

(項目 39)

b が 1 ~ 15 モルパーセントであり、c が 85 ~ 99 モルパーセントであり、d が 0 モルパーセントである、項目 34 に記載のポリマー。

(項目 40)

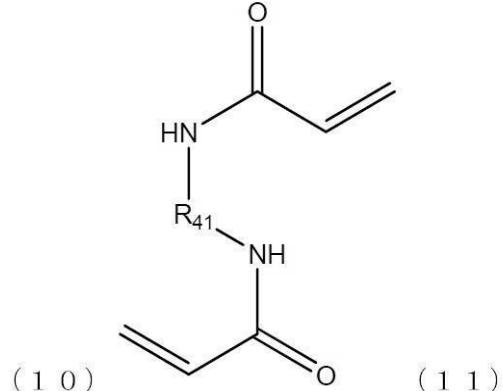
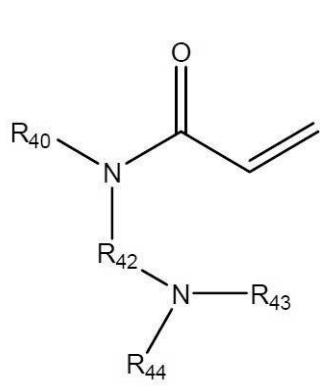
b が 1 ~ 10 モルパーセントであり、c が 90 ~ 99 モルパーセントであり、d が 0 モルパーセントである、項目 34 に記載のポリマー。

(項目 41)

式 10 のモノマーと、重合混合物に添加された全モノマーに対し 1 ~ 25 モルパーセントの式 11 のモノマーとを含む重合混合物の反応生成物を含む架橋アクリルアミドポリマーであって、前記モノマーが式 :

【化 12 - 2】

【化 12】



を有し、式中、

R<sub>40</sub> は水素または -R<sub>42</sub>N R<sub>43</sub>R<sub>44</sub> であり；

R<sub>41</sub> は C<sub>5</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>5</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレンであり；

R<sub>42</sub> は C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレンであり；

R<sub>43</sub> は水素または保護基であり；

R<sub>44</sub> は保護基である、

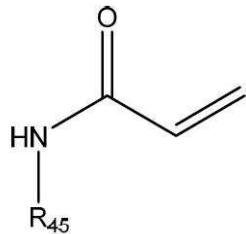
架橋アクリルアミドポリマー。

(項目42)

前記重合混合物が5～30モルパーセントの式12：

【化13-2】

【化13】



のモノマーをさらに含み、式中、

R<sub>45</sub>はC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキル、アラルキル、またはアルキル基の1つ以上の-C<sub>n</sub>H<sub>2n-1</sub>基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっているC<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>アルキルである、項目41に記載のポリマー。

(項目43)

前記重合混合物が、50～99モルパーセントのモノマー10、1～25モルパーセントのモノマー11、0～30モルパーセントのモノマー12を含む、項目41または42に記載のポリマー。

(項目44)

前記重合混合物が、60～98モルパーセントのモノマー10、1～15モルパーセントのモノマー11、1～25モルパーセントのモノマー12を含む、項目42に記載のポリマー。

(項目45)

前記重合混合物が、70～98モルパーセントのモノマー10、1～10モルパーセントのモノマー11、1～20モルパーセントのモノマー12を含む、項目42に記載のポリマー。

(項目46)

前記重合混合物が、80～99モルパーセントのモノマー10、1～20モルパーセントのモノマー11、0モルパーセントのモノマー12を含む、項目41に記載のポリマー。

(項目47)

前記重合混合物が、85～99モルパーセントのモノマー10、1～15モルパーセントのモノマー11、0モルパーセントのモノマー12を含む、項目41に記載のポリマー。

(項目48)

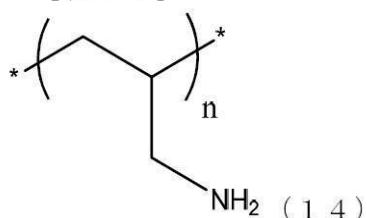
前記重合混合物が、90～99モルパーセントのモノマー10、1～10モルパーセントのモノマー11、0モルパーセントのモノマー12を含む、項目41に記載のポリマー。

(項目49)

ポリアリルアミンの反復単位と、架橋剤と前記ポリアリルアミンとの反応により生じた-R<sub>50</sub>-の架橋単位とを含む架橋アミンポリマーであって、式14の前記ポリアリルアミンが式：

【化 1 4 - 2】

【化 1 4】



を有し、式中、

$n$  は整数であり；

$R_{5-0}$  は、アルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、エーテル、エステル、シクロアルキルもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている C<sub>8</sub> ~ C<sub>5-0</sub> アルキレンである。

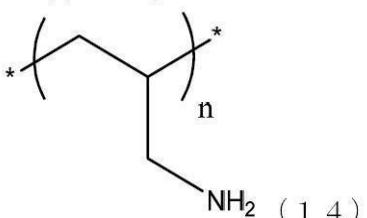
## 架橋アミンポリマー。

(項目50)

アリルアミン反復単位と架橋剤との反応により生じた反復単位を含む架橋アミンポリマーであって、前記アリルアミン反復単位が式：

【化 1 5 - 2】

〔化 1 5 〕



を有し、式中、 $n$  は整数であり、

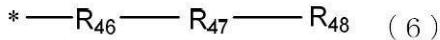
架橋剤が  $X - R_1 - X$  またはエピハロヒドリンであり、式中、

$R_1$  は独立して  $C_2 \sim C_{50}$  アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の -CH<sub>2</sub>- 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている  $C_2 \sim C_{50}$  アルキレンであり、X はそれぞれ独立して脱離基であり。

C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - アミノ C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - アミノ - x - オキソ C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - カルボキシ C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( ヘテロシクロアルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - ヒドロキシ C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( ( x - 1 ) - ヒドロキシ C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - メルカプト C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - トリアルキルアンモニオ C<sub>x</sub> アルキル ) ヘテロシクロ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - ( 2 - ( アルコキシ ) ベンズアミド ) C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - ( 3 - ( アルコキシ ) ベンズアミド ) C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( x - ( 4 - ( アルコキシ ) ベンズアミド ) C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、式 6 :

【化 1 6 - 2】

【化 1 6】



の配位子またはそれらの組合せから選択される配位子で置換されており、式中、

$R_{4-6}$  は  $C_6 \sim C_{16}$  アルキレンであり、 $R_{4-7}$  は 1, y - ピス (1-メチルピペリジン-4-イル)  $C_y$  アルキレンであり、 $R_{4-8}$  は  $C_6 \sim C_{16}$  アルキルであり、m は 3 ~ 12 の整数であり、x は 1 ~ 12 の整数であり、y は 1 ~ 14 の整数であり、z は 1 ~ 16 の整数である。

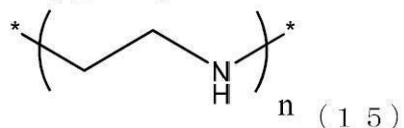
## 架橋アミンポリマー。

(項目51)

ポリエチレンイミンと架橋剤との反復単位を含む架橋アミンポリマーであって、前記ポリエチレンイミンが式：

【化 1 7 - 2】

【化 1 7】



を有し、式中、 $n$  は整数であり、

架橋剤が  $X - R_1 - X$  またはエピハロヒドリンであり、式中、

$R_1$  は独立して  $C_2 \sim C_{5,0}$  アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の  $-CH_2-$  基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロシクロ官能基に置き換わっている  $C_2 \sim C_{5,0}$  アルキレンであり、 $X$  はそれぞれ独立して脱離基であり、

架橋アミンポリマーの窒素原子の一部が、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、ヘテロシクロ、ヘテロシクロアルキル、(トリアルキルアンモニオ)アルキル、2-(保護アミノ)-m-(ヘテロシクロ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-3-メチル-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-4-メチル-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-1-オキソ-m-アリールC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-(アルキルチオ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-(アリール)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-カルボキシ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-グアニジノ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-(m-1)-ヒドロキシ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-ヒドロキシ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-メルカプト-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル

ル、m-(アルキルヘテロシクロ)C<sub>m</sub>アルキル、m-アミノ-2-(保護アミノ)-1  
 -オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-アミノ-2-(保護アミノ)-1, m-ジオキソC<sub>m</sub>アルキ  
 ル、m-(x-アミノC<sub>x</sub>アルキル)ヘテロシクロC<sub>m</sub>アルキル、(m-1)-アミノ-  
 m-(ヘテロシクロ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アリールアルキルアミノ)-m  
 -オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(アルキルチオ)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソ  
 C<sub>m</sub>アルキル、m-(x-アミノC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-  
 (x-アミノ-x-オキソC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-  
 カルボキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(ヘテロシクロアルキ  
 ルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-ヒドロキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m  
 -オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-1)-ヒドロキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソ  
 C<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(1-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソ  
 C<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(3-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソ  
 C<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(4-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-  
 m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、式6:

【化18-2】

【化18】

\*—R<sub>46</sub>—R<sub>47</sub>—R<sub>48</sub> (6)

の配位子またはそれらの組合せから選択される配位子で置換されており、式中、

R<sub>46</sub>はC<sub>6</sub>~C<sub>16</sub>アルキレンであり、R<sub>47</sub>は1,y-ビス(1-メチルピペリジ  
 ン-4-イル)C<sub>y</sub>アルキレンであり、R<sub>48</sub>はC<sub>6</sub>~C<sub>16</sub>アルキルであり、mは3~  
 12の整数であり、xは1~12の整数であり、yは1~14の整数であり、zは1~1  
 6の整数である、

架橋アミンポリマー。

(項目52)

分岐ポリエチレンイミンと架橋剤との反応生成物を含む架橋アミンポリマーであって、  
 前記架橋剤がX-R<sub>1</sub>-Xであり、式中、

R<sub>1</sub>は独立してC<sub>8</sub>~C<sub>50</sub>アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の-C H<sub>2</sub>-  
 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテ  
 ロシクロ官能基に置き換わっているC<sub>8</sub>~C<sub>50</sub>アルキレンであり、Xはそれぞれ独立し  
 て脱離基である、

架橋アミンポリマー。

(項目53)

分岐ポリエチレンイミンと架橋剤との反応生成物を含む架橋アミンポリマーであって、  
 前記分岐ポリエチレンイミンの分子量が250~50,000の間であり、

前記架橋剤がX-R<sub>1</sub>-Xであり、式中、

R<sub>1</sub>は独立してC<sub>8</sub>~C<sub>50</sub>アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の-C H<sub>2</sub>-  
 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテ  
 ロシクロ官能基に置き換わっているC<sub>8</sub>~C<sub>50</sub>アルキレンであり、Xはそれぞれ独立し  
 て脱離基である、

架橋アミンポリマー。

(項目54)

前記架橋剤が、3.5より大きい算出L o g Pを有しあつX-R<sub>1</sub>-Xであり、式中、

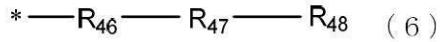
R<sub>1</sub>は独立してC<sub>8</sub>~C<sub>50</sub>アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の-C H<sub>2</sub>-  
 基がアミド、カルボニル、エーテル、エステル、シクロアルキルもしくはヘテロシクロ官  
 能基に置き換わっているC<sub>8</sub>~C<sub>50</sub>アルキレンであり、Xはそれぞれ独立して脱離基で  
 ある、

項目 5 2 または 5 3 に記載のポリマー。(項目 5 5 )

R<sub>1</sub> が C<sub>1~0</sub> ~ C<sub>1~4</sub> アルキレンである、項目 5 2 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 5 6 )

前記架橋アミンポリマーの窒素原子の一部が、アルキル、アミノアルキル、アリール、アリールアルキル、オキソアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、グアニジノ、ヘテロシクロ、ヘテロシクロアルキル、(トリアルキルアンモニオ)アルキル、2-(保護アミノ)-m-(ヘテロシクロ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-3-メチル-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-1-オキソ-m-アリールC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-(アルキルチオ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-(アリール)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-カルボキシ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-グアニジノ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-(m-1)-ヒドロキシ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-ヒドロキシ-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、2-(保護アミノ)-m-メルカプト-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アルキルアルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アルキルヘテロシクロ)C<sub>m</sub>アルキル、m-アミノ-2-(保護アミノ)-1,m-ジオキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-アミノC<sub>x</sub>アルキル)ヘテロシクロC<sub>m</sub>アルキル、(m-1)-アミノ-m-(ヘテロシクロ)-1-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(アリールアルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(アルキルチオ)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-アミノC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-カルボキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-ヒドロキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-1)-ヒドロキシC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-メルカプトC<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-トリアルキルアンモニオC<sub>x</sub>アルキル)ヘテロシクロC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(2-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(3-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、m-(x-(4-(アルコキシ)ベンズアミド)C<sub>x</sub>アルキルアミノ)-m-オキソC<sub>m</sub>アルキル、式 6 :

【化 1 9 - 2】【化 1 9】

の配位子またはそれらの組合せから選択される配位子で置換されており、式中、

R<sub>4~6</sub> は C<sub>6</sub> ~ C<sub>1~6</sub> アルキレンであり、R<sub>4~7</sub> は 1, y - ビス(1-メチルピベリジン-4-イル)C<sub>y</sub> アルキレンであり、R<sub>4~8</sub> は C<sub>6</sub> ~ C<sub>1~6</sub> アルキルであり、m は 3 ~ 12 の整数であり、x は 1 ~ 12 の整数であり、y は 1 ~ 14 の整数であり、z は 1 ~ 16 の整数である、

項目 1 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 5 7 )

前記配位子の分子量が約 1600 ダルトン未満である、項目 5 6 に記載のポリマー。

(項目 5 8 )

前記配位子の分子量が約 800 ダルトン未満である、項目 5 7 に記載のポリマー。

(項目 5 9 )

前記配位子が、ナフタレン-2-イルアルキルもしくはナフタレン-1-イルアルキル

から選択されるアリールアルキル；m - ( 1 - メチルピロリジニウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキル、m - ( 2 - ( 1 H - インドール - 3 - イル ) エチルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ( 2 - メチルチアゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>m</sub> アルキル、m - ( ベンゾ [ d ] チアゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>m</sub> アルキル、m - ( ピリジニウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキル、m - ( テトラヒドロ - 1 H - チオフェニウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキル、z - ( 1 , 2 - ジアルキル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>z</sub> アルキル、m - ( 2 , 3 - ジアルキル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキル、z - ( 1 - アルキル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>z</sub> アルキル、m - ( 3 - アルキル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルもしくはz - ( チアゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>z</sub> アルキルから選択されるヘテロシクロアルキル；2 - ( 保護アミノ ) - m - ( 1 H - インドール - 3 - イル ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキルもしくは2 - ( 保護アミノ ) - m - ( 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキルから選択される2 - ( 保護アミノ ) - m - ( ヘテロシクロ ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル；2 - ( 保護アミノ ) - m - ( ヒドロキシフェニル ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル；m - ( 3 - アルキル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキル、m - ( 1 - アルキル - 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルもしくはm - ( 3 - アルキル - 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルから選択されるm - ( アルキルヘテロシクロ ) C<sub>m</sub> アルキル；m - ( 3 - ( x - アミノ C<sub>x</sub> アルキル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルもしくはm - ( 1 - ( x - アミノ C<sub>x</sub> アルキル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルから選択されるm - ( x - アミノ C<sub>x</sub> アルキル ) ヘテロシクロ C<sub>m</sub> アルキル；( m - 1 ) - アミノ - m - ( 1 H - インドール - 2 - イル ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル；m - ( ヒドロキシフェナルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキルもしくはm - ( フェナルキルアミノ ) - m - オキソ - C<sub>m</sub> アルキルから選択されるm - ( アリールアルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル；m - ( 1 - ( x - ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>x</sub> アルキル、m - ( 1 - ( x - ( 3 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>x</sub> アルキル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>m</sub> アルキル、m - ( 3 - ( x - ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>x</sub> アルキル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルもしくはm - ( 3 - ( x - ( 3 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>x</sub> アルキル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルから選択されるm - ( x - ( ヘテロシクロ ) C<sub>x</sub> アルキル ) ヘテロシクロ C<sub>m</sub> アルキル；m - ( x - ( 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) C<sub>x</sub> アルキルアミノ ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル；またはm - ( 3 - ( x - トリアルキルアンモニオ ) C<sub>x</sub> アルキル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルもしくはm - ( 1 - ( x - トリアルキルアンモニオ ) C<sub>x</sub> アルキル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) C<sub>m</sub> アルキルから選択されるm - ( x - トリアルキルアンモニオ C<sub>x</sub> アルキル ) ヘテロシクロ C<sub>m</sub> アルキルであり、式中、mは3~12の整数であり、xは1~12の整数であり、zは1~16の整数である、項目31、33、50、51または56のいずれか1項に記載のポリマー。

( 項目60 )

前記配位子が、2 - ( 保護アミノ ) - m - ( ヘテロシクロ ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - アミノ - 2 - ( 保護アミノ ) - 1 , m - ジオキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - アミノ - 2 - ( 保護アミノ ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - ( 保護アミノ ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - ( 保護アミノ ) - m - ( ヒドロキシフェニル ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - ( 保護アミノ ) - 1 - オキソ - m - フェニル C<sub>m</sub> アルキル、2 - ( 保護アミノ ) - m - ( 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - ( 保護アミノ ) - m - カルボキシ - 1

- オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - (保護アミノ) - 3 - メチル - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - (保護アミノ) - 4 - メチル - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - (保護アミノ) - m - メルカプト - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - (保護アミノ) - (m - 1) - ヒドロキシ - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - (保護アミノ) - m - ヒドロキシ - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、2 - (保護アミノ) - m - グアニジノ - 1 - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - (アルキルチオ) C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (ヒドロキシフェナルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - オキソ - m - (フェナルキルアミノ) C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - (1H - イミダゾール - 4 - イル) C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - カルボキシ C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - メルカプト C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - ((x - 1) - ヒドロキシ C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - ヒドロキシ C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキル、m - (x - アミノ C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキルまたは m - (x - アミノ - x - オキソ C<sub>x</sub> アルキルアミノ) - m - オキソ C<sub>m</sub> アルキルであり

式中、m は 3 ~ 12 の整数であり、x は 1 ~ 12 の整数である。

項目 31、33、50、51 または 56 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 61)

前記配位子が式 6 であり、R<sub>4-6</sub> が C<sub>8</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキレンであり、R<sub>4-7</sub> が 1, y - ビス(1 - メチルピペリジン - 4 - イル) C<sub>y</sub> アルキレンであり、R<sub>4-8</sub> が C<sub>8</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキルであり、y が 1 ~ 6 の整数である、項目 31、33、50、51 または 56 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 62)

前記配位子が、2 - (tert - プトキシカルボニルアミノ) - 3 - (1H - インドール - 3 - イル) - 1 - オキソプロピル、5 - (2 - (4 - (ノニルオキシ) ベンズアミド) エチルアミノ) - 5 - オキソベンチル、(4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾリル、10 - (ピリジニウム - 1 - イル) デシル、2 - (1H - インドール - 3 - イル) エチル、5 - (2 - (1H - インドール - 3 - イル) - 1 - オキソプロピル、3 - (1, 2 - ジメチル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル) プロピル、10 - (1, 2 - ジメチル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル) デシル、10 - (1 - メチル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル) デシル、3 - (チアゾール - 3 - イウム - 3 - イル) プロピル、3 - アミノプロピル、3 - シクロヘキシリルプロピル、3 - フェニルプロピル、3 - (トリメチルアンモニオ) プロピル、3 - (1 - メチルピロリジニウム - 1 - イル) プロピル、3 - (2 - メチルチアゾール - 3 - イウム - 3 - イル) プロピル、3 - (ベンゾ [d] チアゾール - 3 - イウム - 3 - イル) プロピル、3 - (テトラヒドロ - 1H - チオフェニウム - 1 - イル) プロピル、3 - (3 - メチル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) プロピル、3 - (チアゾール - 3 - イウム - 1 - イル) プロピル、3 - (3 - (3 - アミノプロピル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) プロピル、3 - (1 - (3 - アミノプロピル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル) プロピル、3 - (3 - (3 - (5 - トリメチルアンモニオ) ベンチル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) プロピル、3 - (1 - (5 - トリメチルアンモニオ) ベンチル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル) プロピル、3 - (1 - (3 - デシル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) プロピル、3 - (3 - (9 - (3 - メチル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) ノニル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) プロピル、3 - (1 - (9 - (1 - メチル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル) ノニル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) プロピル、3 - (1 - (9 - (3 - メチル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) ノニル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル) プロピル、3 - (3 - (9 - (1 -

メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) ノニル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) プロピル、 4 - ( 3 - デシル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) ブチル、 10 - ( 1 - デシル - 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) デシル、 10 - ( 3 - デシル - 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) デシル、 3 - ( 1 , 2 - ジメチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) プロピル、 3 - ( 2 , 3 - ジメチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) プロピル、 10 - ( 2 , 3 - ジメチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) デシル、 10 - ( 1 , 2 - ジメチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) デシル、 10 - ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) デシル、 10 - ( 3 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) デシル、 10 - ( 1 - ブチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル ) デシル、 10 - ( 3 - ブチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル ) デシル、 10 - ( ピリジニウム - 1 - イル ) デシル、 10 - ( 1 - メチルピロリジニウム - 1 - イル ) デシル、 ナフタレン - 2 - イルメチル、 ナフタレン - 1 - イルメチル、 4 - アミノ - 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 1 , 4 - ジオキソブチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 1 - オキソエチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 4 - ( メチルチオ ) - 1 - オキソブチル、 5 - ( 3 - ( メチルチオ ) プロピルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 3 - ( 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 - オキソプロピル、 5 - ( 4 - ヒドロキシフェネチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 1 - オキソ - 3 - フェニルプロピル、 5 - オキソ - 5 - ( フェネチルアミノ ) ベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 3 - ( 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) エチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 3 - カルボキシ - 1 - オキソプロピル、 5 - ( 2 - カルボキシエチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 3 - メチル - 1 - オキソブチル、 5 - ( イソブチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 ( 3 R ) - 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 3 - メチル - 1 - オキソベンチル、 ( R ) - 5 - ( 2 - メチルブチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 3 - メルカプト - 1 - オキソプロピル、 5 - ( 2 - メルカプトエチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 ( 3 R ) - 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オキソブチル、 ( R ) - 5 - ( 2 - ヒドロキシプロピルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 6 - アミノ - 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 1 - オキソヘキシル、 5 - ( 5 - アミノベンチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 5 - アミノ - 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 1 , 5 - ジオキソベンチル、 5 - ( 4 - アミノ - 4 - オキソブチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 5 - グアニジノ - 1 - オキソベンチル、 5 - ( 4 - グアニジノブチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オキソプロピル、 5 - ( 2 - ヒドロキシエチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 4 - メチル - 1 - オキソベンチル、 5 - ( イソペンチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 4 - カルボキシ - 1 - オキソブチル、 5 - ( 3 - カルボキシプロピルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 2 - ( tert - ブトキシカルボニルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 5 - ( エチルアミノ ) - 5 - オキソベンチル、 式 6 :

【化 20 - 2】

【化 20】

\* — R<sub>46</sub> — R<sub>47</sub> — R<sub>48</sub> ( 6 )

の配位子またはそれらの組合せであり、式中、

R<sub>4-6</sub> はデシレンであり、R<sub>4-7</sub> は 1, 3 - ビス(1-メチルピペリジン-4-イル)プロパンであり、R<sub>4-8</sub> はデシルである。

項目 3 1、 3 3、 5 0、 5 1 または 5 6 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

( 項目 6 3 )

前記配位子が、2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)-3-(1H-インドール-3-イル)-1-オキソプロピル、5-(2-(4-(ノニルオキシ)ベンズアミド)エチルアミノ)-5-オキソペンチル、(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾリル、10-(ピリジニウム-1-イル)デシル、2-(1H-インドール-3-イル)エチルアミノ)-5-オキソペンチル、2-アミノ-3-(1H-インドール-2-イル)-1-オキソプロピル、3-(1,2-ジメチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、10-(1,2-ジメチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)デシル、10-(1-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)デシル、3-(チアゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、3-アミノプロピル、3-シクロヘキシリプロピル、3-フェニルプロピル、3-(トリメチルアンモニオ)プロピル、3-(1-メチルピロリジニウム-1-イル)プロピル、3-(ベンゾ[d]チアゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、3-(テトラヒドロ-1H-チオフェニウム-1-イル)プロピル、3-(3-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)プロピル、3-(ベニゾ[d]チアゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、3-(3-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、3-(1-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、3-(3-(3-アミノプロピル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)プロピル、3-(1-(3-アミノプロピル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、3-(3-(5-トリメチルアンモニオ)ベンチル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)プロピル、3-(3-デシル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)プロピル、3-(1-デシル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)ノニル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)プロピル、3-(1-(9-(3-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)ノニル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)プロピル、3-(3-(9-(3-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)ノニル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、3-(1-(9-(3-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)ノニル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)ノニル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)ノニル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)ノニル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)プロピル、4-(3-デシル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)ブチル、4-(1-デシル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)ブチル、10-(1-デシル-2-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)デシル、10-(3-デシル-2-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)デシル、3-(1,2-ジメチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)プロピル、3-(2,3-ジメチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)プロピル、10-(2,3-ジメチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)デシル、4-(1-デシル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)ブチル、10-(1-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)デシル、10-(1-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル)デシル、10-(3-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)デシル、10-(1-ブチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)デシル、10-(3-ブチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル)デシル、10-(ピリジニウム-1-イル)デシル、10-(1-メチルピロリジニウム-1-イル)デシル、ナフタレン-2-イルメチル、ナフタレン-1-イルメチル、式6：

【化 2 1 - 2】

【化 2 1】

の配位子またはそれらの組合せであり、式中、

R<sub>4-6</sub> はデシレンであり、R<sub>4-7</sub> は 1, 3 - ビス (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) プロパンであり、R<sub>4-8</sub> はデシルである、

項目 6 2 に記載のポリマー。

(項目 6 4)

前記保護基が独立して -C(O)OR<sub>4-9</sub>、-C(O)R<sub>5-0</sub> であるか、または R<sub>4-3</sub> と R<sub>4-4</sub> が、結合している窒素原子とともにスクシンイミドもしくはフタルイミド環を形成し、式中、R<sub>4-9</sub> はアルキルまたはアリールであり、R<sub>5-0</sub> はアミノ、水素、アルキルまたはハロアルキルである、

項目 3 1、3 3、5 0、5 1、5 6、5 9 または 6 0 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 6 5)

膨潤率が約 0.3 ~ 約 3.0 g 水 / g ポリマーである、項目 1 ~ 6 4 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 6 6)

膨潤率が約 0.5 ~ 約 1.0 g 水 / g ポリマーである、項目 6 5 に記載のポリマー。

(項目 6 7)

膨潤率が約 2 ~ 約 5 g 水 / g ポリマーである、項目 6 5 に記載のポリマー。

(項目 6 8)

ガラス転移温度が室温より高い、項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 6 9)

自由流動性粉末である、項目 1 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 7 0)

胆汁酸に対する in vitro 結合親和性が、アッセイ A を用いた測定で少なくとも 0.66 mmol / g である、項目 1 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 7 1)

胆汁酸に対する in vitro 結合能が、アッセイ B を用いた測定で少なくとも約 2.5 mmol / g である、項目 1 ~ 7 0 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 7 2)

西洋型食餌を与えた雄性ゴールデンシリアンハムスター (Golden Syria hamster) における 0.5 % の用量での測定で、in vivo 結合能がコレセベラム塩酸塩よりも少なくとも 25 % 大きい、項目 1 ~ 7 0 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 7 3)

前記 in vivo 結合能が、コレセベラム塩酸塩よりも少なくとも 50 % 大きい、項目 7 2 に記載のポリマー。

(項目 7 4)

前記 in vivo 結合能が、コレセベラム塩酸塩よりも少なくとも 75 % 大きい、項目 7 2 に記載のポリマー。

(項目 7 5)

前記 in vivo 結合能が、コレセベラム塩酸塩よりも少なくとも 100 % 大きい、項目 7 2 に記載のポリマー。

(項目 7 6)

in vitro アッセイ B を用いた測定で、結合能がコレセベラム塩酸塩よりも少なくとも 25 % 大きい、項目 1 ~ 7 0 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 7 7)

前記 in vitro 結合能が、in vitro アッセイ B を用いた測定でコレセベラム塩酸塩よりも少なくとも 50 % 大きい、項目 7 6 に記載のポリマー。

(項目 7 8)

前記 in vitro 結合能が、in vitro アッセイ B を用いた測定でコレセベ

ラム塩酸塩よりも少なくとも 75% 大きい、項目 76 に記載のポリマー。

(項目 79)

前記 *in vitro* 結合能が、*in vitro* アッセイ B を用いた測定でコレセベラム塩酸塩よりも少なくとも 100% 大きい、項目 76 に記載のポリマー。

(項目 80)

平均直径が約 50 ミクロン～約 100 ミクロンの粒子である、項目 1～79 のいずれか 1 項に記載のポリマー。

(項目 81)

前記粒子がビーズである、項目 80 に記載のポリマー。

(項目 82)

項目 1～81 のいずれか 1 項に記載のポリマーと、薬学的に許容される添加剤とを含む医薬組成物。

(項目 83)

項目 1～81 のいずれか 1 項に記載の有効量のアミンポリマー、または項目 82 に記載の医薬組成物を、それを必要とする動物対象に投与することを含む、動物対象の血清 LDL コレステロールを低下させる方法。

(項目 84)

項目 1～81 のいずれか 1 項に記載の有効量のアミンポリマー、または項目 82 に記載の医薬組成物を、それを必要とする動物対象に投与することを含む、動物対象の糖尿病を治療する方法。

(項目 85)

項目 1～81 のいずれか 1 項に記載の有効量のアミンポリマー、または項目 82 に記載の医薬組成物を、それを必要とする動物対象に投与することを含む、動物対象のアルツハイマー病、非アルコール性脂肪性肝炎、そう痒症、IBS-D または特発性胆汁酸吸收不良を治療する方法。

(項目 86)

項目 1～81 のいずれか 1 項に記載の有効量のアミンポリマー、または項目 82 に記載の医薬組成物を、それを必要とする動物対象に投与することを含む、動物対象から胆汁酸塩を除去する方法。

(項目 87)

脂質異常症を治療する薬剤を動物対象に投与することをさらに含む、項目 83～86 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 88)

脂質異常症を治療する前記薬剤が、動物対象に対するヒドロキシメチル - グルタリル - 補酵素 A (HMG - CoA) 還元酵素阻害剤、フィブラーート、コレステロール吸収阻害剤、ナイアシン (すなわち、ニコチン酸またはその誘導体)、フィトステロール、腸リバーゼ阻害剤、腸もしくは分泌ホスホリバーゼ A2 阻害剤、apo-B 100 の合成もしくは正常な活性の阻害剤、apoA の合成もしくは正常な活性のアゴニスト、またはコレステロールの吸収もしくは代謝を調節する任意の薬剤、またはそれらの組合せである、項目 87 に記載の方法。

(項目 89)

前記アミンポリマーと、脂質異常症を治療する前記薬剤またはそれらの組合せとを同時に前記動物対象に投与する、項目 87 または 88 に記載の方法。

(項目 90)

前記アミンポリマーと、脂質異常症を治療する前記薬剤またはそれらの組合せとを逐次的に前記動物対象に投与する、項目 87 または 88 に記載の方法。

(項目 91)

脂質異常症を治療する前記薬剤が HMG - CoA 還元酵素阻害剤であり、前記 HMG - CoA 還元酵素阻害剤がアトルバスタチン、セリバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチ

ンおよびそれらの組合せからなる群より選択されるスタチンを含む、項目 88～90 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 92)

脂質異常症を治療する前記薬剤がフィブラートであり、前記フィブラートがベンザフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、ゲムフィブロジル、フェノフィブラートまたはそれらの組合せを含む、項目 88～90 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 93)

脂質異常症を治療する前記薬剤がコレステロール吸収阻害剤であり、前記コレステロール吸収阻害剤がエゼチミブを含む、項目 88～90 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 94)

前記対象が重篤な胃腸管有害事象を経験しない 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 2、4、12、26、52 週間以上後に、平均血清 LDL が少なくとも 15% 低下する、項目 83～93 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 95)

前記対象が重篤な胃腸管有害事象を経験しない 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 2、4、12、26、52 週間以上後に、平均血清 LDL が少なくとも 20% 低下する、項目 94 に記載の方法。

(項目 96)

前記対象が重篤な胃腸管有害事象を経験しない 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 2、4、12、26、52 週間以上後に、平均血清 LDL が少なくとも 25% 低下する、項目 94 に記載の方法。

(項目 97)

前記対象が重篤な胃腸管有害事象を経験しない 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 2、4、12、26、52 週間以上後に、平均血清 LDL が少なくとも 30% 低下する、項目 94 に記載の方法。

(項目 98)

6.0 g / 日の 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 2、4、12、26、52 週間以上後に、平均血清 LDL が少なくとも 15% 低下する、項目 83～93 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 99)

6.0 g / 日以下の 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 2、4、12、26、52 週間以上後に、平均血清 LDL が少なくとも 20% 低下する、項目 98 に記載の方法。

(項目 100)

6.0 g / 日以下の 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 2、4、12、26、52 週間以上後に、平均血清 LDL が少なくとも 25% 低下する、項目 98 に記載の方法。

(項目 101)

6.0 g / 日以下の 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 2、4、12、26、52 週間以上後に、平均血清 LDL が少なくとも 30% 低下する、項目 98 に記載の方法。

(項目 102)

前記動物対象が原発性高脂血症または冠動脈心疾患を有する、項目 83～101 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 103)

項目 1～81 のいずれか 1 項に記載の有効量のアミンポリマー、または項目 82 に記載の医薬組成物を前記動物対象に投与することを含む、II 型糖尿病を有する動物対象の血糖コントロールを改善する方法。

(項目 104)

糖尿病を治療する薬剤を前記動物対象に投与することをさらに含む、項目 83～103

のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 105)

前記アミンポリマー、糖尿病を治療する前記薬剤、またはそれらの組合せを同時に前記動物対象に投与する、項目 104 に記載の方法。

(項目 106)

前記アミンポリマー、糖尿病を治療する前記薬剤、またはそれらの組合せを逐次的に前記動物対象に投与する、項目 104 に記載の方法。

(項目 107)

糖尿病を治療する前記薬剤がスルホニル尿素、ビグアニド、グリタゾン、チアゾリジンジオン、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) の活性化因子、- グルコシダーゼ阻害剤、カリウムチャネルアンタゴニスト、アルドース還元酵素阻害剤、グルカゴンアンタゴニスト、レチノイド X 受容体 (RXR) アンタゴニスト、ファルネソイド X 受容体 (FXR) アゴニスト、FXR アンタゴニスト、グルカゴン様ペプチド - 1 (GLP-1)、GLP-1 類似体、ジペプチジルペプチダーゼ IV (DPP-IV) 阻害剤、アミリン、アミリン類似体、SGLT2 阻害剤、インスリン、インスリン分泌促進物質、甲状腺ホルモン、甲状腺ホルモン類似体またはそれらの組合せである、項目 104 ~ 106 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 108)

糖尿病を治療する前記薬剤がビグアニドであり、ビグアニジンがメトホルミン、ブホルミン、フェンホルミンまたはそれらの組合せである、項目 107 に記載の方法。

(項目 109)

糖尿病を治療する前記薬剤がチアゾリジンジオンであり、前記チアゾリジンジオンがピオグリタゾン、リボグリタゾン、ロシグリタゾン、トログリタゾンまたはそれらの組合せである、項目 107 に記載の方法。

(項目 110)

糖尿病を治療する前記薬剤がスルホニル尿素であり、前記スルホニル尿素がアセトヘキサミド、クロルプロパミド、トルブタミド、トラザミド、グリピジド、グリクラジド、グリベンクラミド、グリキドン、グリクロピラミド、グリメピリドまたはそれらの組合せである、項目 107 に記載の方法。

(項目 111)

糖尿病を治療する前記薬剤が DPP-IV 阻害剤であり、前記 DPP-IV 阻害剤がアログリプチン、リナグリプチン、サクサグリプチン、シタグリプチン、ビルダグリプチンまたはそれらの組合せである、項目 107 に記載の方法。

(項目 112)

糖尿病を治療する前記薬剤が GLP-1 類似体であり、前記 GLP-1 類似体がエクセナチド、リラグルチド、アルビグルチドまたはそれらの組合せである、項目 107 に記載の方法。

(項目 113)

前記対象が重篤な胃腸管有害事象を経験しない 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 18 週間後に、糖化ヘモグロビン (HbA<sub>1c</sub>) が少なくとも 0.5% 低下する、項目 103 ~ 112 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 114)

前記対象が重篤な胃腸管有害事象を経験しない 1 日用量での前記アミンポリマーによる治療の 18 週間後に、空腹時血糖が少なくとも 14 mg/dL (0.8 mmol/L) 低下する、項目 103 ~ 112 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 115)

6.0 g / 日以下の用量での前記アミンポリマーによる治療の 18 週間に後、糖化ヘモグロビン (HbA<sub>1c</sub>) が少なくとも 0.5% 減少する、項目 103 ~ 112 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 116)

6.0 g / 日以下の用量での前記アミンポリマーによる治療の2、4、12、26、5  
2週間以上後に、空腹時血糖が少なくとも14 mg / dL (0.8 mmol / L) 低下する、項目103～112のいずれか1項に記載の方法。

(項目117)

前記動物対象がヒトである、項目103～116のいずれか1項に記載の方法。

(項目118)

1日当たり4単位用量未満の前記アミンポリマーを投与する、項目103～117のいずれか1項に記載の方法。

(項目119)

1日当たり3単位用量未満の前記アミンポリマーを投与する、項目83～118のいずれか1項に記載の方法。

(項目120)

前記アミンポリマーを1日に1回投与する、項目83～118のいずれか1項に記載の方法。

(項目121)

前記アミンポリマーをチュアブルもしくは口腔内崩壊錠、液体、粉末、小袋内に含まれる粉末、軟ゼラチンカプセルまたは硬ゼラチンカプセルの形態で投与する、項目83～120のいずれか1項に記載の方法。

(項目122)

1日1回または1日2回投与される前記ポリマーの1日量が、1日3回投与される同じポリマーの同じ1日量の少なくとも75%の胆汁酸結合能を有する、項目83～120のいずれか1項に記載の方法。

(項目123)

1日1回または1日2回投与される前記ポリマーの1日量が、1日3回投与される同じポリマーまたは同じ組成物の同じ1日量の少なくとも85%の胆汁酸結合能を有する、項目122に記載の方法。

(項目124)

1日1回または1日2回投与される前記ポリマーの1日量が、1日3回投与される同じポリマーまたは同じ組成物の同じ1日量の少なくとも95%の胆汁酸結合能を有する、請求項122に記載の方法。

(項目125)

前記ポリマーを1日1回または1日2回摂取した対象の25%未満が、軽度または中等度の胃腸管有害事象を経験する、項目83～124のいずれか1項に記載の方法。

(項目126)

1日1回または1日2回投与される前記ポリマーまたは組成物の忍容性が、1日3回投与される同じ1日量の同じポリマーまたは同じ組成物とほぼ実質的に同じである、項目83～125のいずれか1項に記載の方法。

(項目127)

前記1日量が少なくとも2グラムのポリマーである、項目122～126のいずれか1項に記載の方法。

(項目128)

前記1日量が少なくとも4グラムのポリマーである、項目127に記載の方法。

(項目129)

前記1日量が少なくとも6グラムのポリマーである、項目127に記載の方法。

(項目130)

前記ポリマーの沈降物降伏応力が4000Pa未満である、項目122～129のいずれか1項に記載の方法。

(項目131)

前記ポリマーの沈降物降伏応力が3000Pa未満である、項目130に記載の方法。

(項目132)

前記ポリマーの沈降物降伏応力が 2 5 0 0 P a 未満である、項目 1 3 0 に記載の方法。  
(項目 1 3 3 )

前記ポリマーの水和および沈降により形成されるポリマー粒子の塊が約 2 , 5 0 0 , 0 0 P a · s 未満の粘度を有し、前記粘度が 0 . 0 1 秒<sup>-1</sup> のずり速度で測定される、項目 1 2 2 ~ 1 3 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 3 4 )

前記沈降した粒子の塊が 2 , 0 0 0 , 0 0 0 P a · s 未満の粘度を有する、項目 1 3 3 に記載の方法。

(項目 1 3 5 )

前記沈降した粒子の塊が 1 , 5 0 0 , 0 0 0 P a · s 未満の粘度を有する、項目 1 3 3 に記載の方法。

(項目 1 3 6 )

前記沈降した粒子の塊が 1 , 0 0 0 , 0 0 0 P a · s 未満の粘度を有する、項目 1 3 3 に記載の方法。

(項目 1 3 7 )

前記沈降した粒子の塊が 5 0 0 , 0 0 0 P a · s 未満の粘度を有する、項目 1 3 3 に記載の方法。

(項目 1 3 8 )

乾燥形態の前記ポリマー粒子が約 3 0 未満の圧縮性指数を有し、前記圧縮性指数が 1 0 0 \* ( T D - B D ) / T D で定義され、B D および T D がそれぞれ体積密度およびタップ密度である、項目 1 3 0 ~ 1 3 7 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 3 9 )

前記圧縮性指数が約 2 5 未満である、項目 1 3 8 に記載の方法。

(項目 1 4 0 )

前記圧縮性指数が約 2 0 未満である、項目 1 3 8 に記載の方法。

(項目 1 4 1 )

前記圧縮性指数が約 1 5 未満である、項目 1 3 8 に記載の方法。

(項目 1 4 2 )

前記圧縮性指数が約 1 0 未満である、項目 1 3 8 に記載の方法。

(項目 1 4 3 )

前記モノマーを接触させて重合混合物を形成することを含む、項目 1 ~ 8 1 のいずれか 1 項に記載のポリマーを調製するための工程。