

【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2013-520563(P2013-520563A)

【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2012-555155(P2012-555155)

【国際特許分類】

C 08 G 73/02 (2006.01)

A 61 K 31/785 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 K 31/40 (2006.01)

A 61 K 31/4418 (2006.01)

A 61 K 31/366 (2006.01)

A 61 K 31/47 (2006.01)

A 61 K 31/22 (2006.01)

A 61 K 31/505 (2006.01)

A 61 K 31/194 (2006.01)

A 61 K 31/192 (2006.01)

A 61 K 31/216 (2006.01)

A 61 K 31/397 (2006.01)

A 61 K 31/155 (2006.01)

A 61 K 31/517 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 K 31/64 (2006.01)

A 61 K 31/403 (2006.01)

A 61 K 38/00 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 17/04 (2006.01)

A 61 P 1/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 08 G 73/02

A 61 K 31/785

A 61 K 45/00

A 61 K 31/40

A 61 K 31/4418

A 61 K 31/366

A 61 K 31/47

A 61 K 31/22

A 61 K 31/505

A 61 K 31/194

A 61 K 31/192

A 61 K 31/216

A 61 K 31/397

A 61 K 31/155

A 6 1 K 31/517
 A 6 1 K 31/427
 A 6 1 K 31/64
 A 6 1 K 31/403
 A 6 1 K 37/02
 A 6 1 P 3/06
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 43/00 1 2 1

【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】

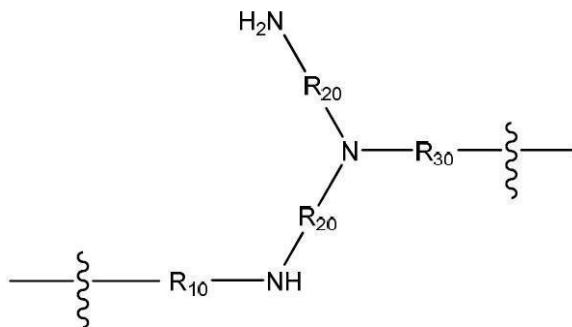
【請求項 1】

6つ、7つまたは8つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと架橋モノマーとの反応生成物を含むアミンポリマーであって、

前記ポリマーの単位が、式 1

【化 1 - 2】

【化 1】



(1)

の構造を有し、式中、

R_{10} は、架橋モノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_{16}$ アルキレン、 $-NH-C(NH)-NH-$ 、 $-NH-C(NH_2^+)-NH-$ 、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、またはアルキレン基の1つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_{50}$ アルキレンであり；

R_{30} は、アミンモノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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、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 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレンであり；

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_6$ アルキレンであり；

R_{10} または R_{30} のうちの少なくとも1つは、算出 $\log P$ ($\text{clog } P$) が4より

大きい疎水基である、
アミンポリマー。

【請求項 2】

R_{10} は、架橋モノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_{16}$ アルキレン、 $-NH-C(NH)-NH-$ 、 $-NH-C(NH_2^+)-NH-$ 、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、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_{50}$ アルキレンであり；

R_{30} は、アミンモノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_6$ アルキレンであり；

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_6$ アルキレンであり；

R_{10} は、算出 $\log P$ ($\log P$) が 4 より大きい疎水基である、

請求項 1 に記載のアミンポリマー。

【請求項 3】

R_{10} は、架橋モノマーに由来し、かつ $C_8 \sim C_{16}$ 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 $C_8 \sim C_{50}$ アルキレンであり；

R_{30} は、アミンモノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレンであり；

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_6$ アルキレンである、

請求項 1 に記載のアミンポリマー。

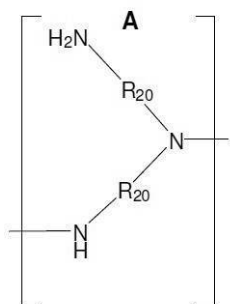
【請求項 4】

脂肪族セグメントにより隔てられた正電荷の結合点を有するポリマーの単位を含むアミンポリマーであって、

前記正電荷の結合点が、 17.3 meq/g よりも大きい電荷密度と、式 A の構造

【化 5 - 2】

【化 5】



とを有し、式中、

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_3 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_3 \sim C_8$ アルキレンであり；

少なくとも 1 つの脂肪族セグメントが正電荷の各結合点と結合し、各脂肪族セグメントの算出 $\log P$ ($\log P$) が 4 より大きい、

アミンポリマー。

【請求項 5】

前記少なくとも 1 つの脂肪族セグメントが、 $C_8 \sim C_{16}$ 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 $C_8 \sim C_{50}$ アルキレン

である、請求項 4 に記載のアミンポリマー。

【請求項 6】

前記正電荷の結合点がそれぞれ、算出 $\log P$ ($c \log P$) が 4 より大きい脂肪族セグメントを含まない、請求項 4 または 5 に記載のアミンポリマー。

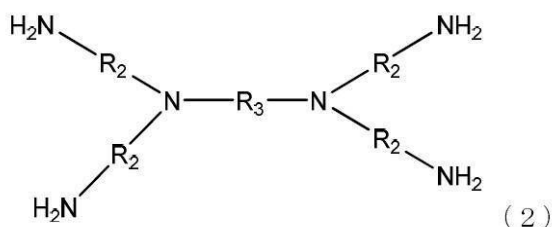
【請求項 7】

アミンモノマーと架橋モノマーとの重合により生じた反復単位を含むアミンポリマーであって、

前記アミンモノマーが、構造

【化 7 - 2】

【化 7】



を有する式 2 のアミンであり、式中、

R_2 はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基が少なくとも 1 つのアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり、かつ R_3 は、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり；

前記架橋モノマーが、グアニジン、グアニジウム塩、式 $X - R_1 - X$ を有する化合物またはそれらの組合せであり、式中、

X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は、 $C_8 \sim C_{16}$ 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 $C_5 \sim C_{50}$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_5 \sim C_{50}$ アルキレンである、

アミンポリマー。

【請求項 8】

R_2 はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり；かつ R_3 は、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレンであり；

前記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、オキシアルキル、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 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 1 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 3 - メチル - 1 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 4 - メチル - 1 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 1 - オキシ - m - アリール C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - (アルキルチオ) - 1 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - (アリール) - 1 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - カルボキシ - 1 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - グアニジノ - 1 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - ($m - 1$) - ヒドロキシ - 1 - オキシ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - ヒドロキシ - 1 - オキシ C_m アルキ

ル、2 - (保護アミノ) - m - メルカプト - 1 - オキソ C_m アルキル、m - (アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (アルキルヘテロシクロ) C_m アルキル、m - アミノ - 2 - (保護アミノ) - 1, m - ジオキソ C_m アルキル、m - (x - アミノ C_x アルキル) ヘテロシクロ C_m アルキル、(m - 1) - アミノ - m - (ヘテロシクロ) - 1 - オキソ C_m アルキル、m - (アリールアルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - (アルキルチオ) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - アミノ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - アミノ - x - オキソ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - カルボキシ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (ヘテロシクロアルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - ヒドロキシ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - ((x - 1) - ヒドロキシ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - メルカプト C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - トリアルキルアンモニオ C_x アルキル) ヘテロシクロ C_m アルキル、m - (x - (2 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - (3 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - (4 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、式 4

【化 1 2 - 2】

【化 1 2】

*— R_{46} — R_{47} — R_{48} (4)

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_{46} は $C_6 \sim C_{16}$ アルキレンであり、 R_{47} は 1, y - ビス (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) C_y アルキレンであり、 R_{48} 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、かつ z は 1 ~ 16 の整数である、

請求項 7 に記載のアミンポリマー。

【請求項 9】

R_{10} が、アルキレン基の 1 つ以上の - CH_2 - 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_6$ アルキレンである、請求項 1 に記載のアミンポリマー。

【請求項 10】

R_{10} が - CH_2 - $CH(OH)$ - CH_2 - である、請求項 9 に記載のアミンポリマー。

【請求項 11】

R_{30} がデシレンまたはドデシレンである、請求項 10 に記載のアミンポリマー。

【請求項 12】

胆汁酸に対する結合親和性が、*in vitro* アッセイ A を用いた測定で少なくとも約 0.46 mmol / g であるか、または胆汁酸に対する結合能が、アッセイ B を用いた測定で少なくとも約 2.22 mmol / g である、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーと、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】

動物対象の上昇した血清 LDL コレステロールを処置するための、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】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0023】

他の目的および特徴は、以下で一部が明らかになり、一部が指摘されるであろう。

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)

6つ、7つまたは8つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと2つまたは3つの可能な反応部位を有する架橋モノマーとの重合により生じた反復単位を含むアミンポリマーであって、前記アミンモノマーと前記架橋モノマーのモル比が1:3～約1:1.1の範囲にあり、胆汁酸に対する前記アミンポリマーの結合親和性が、*in vitro*アッセイAを用いた測定で少なくとも0.46 mmol/gであるアミンポリマー。

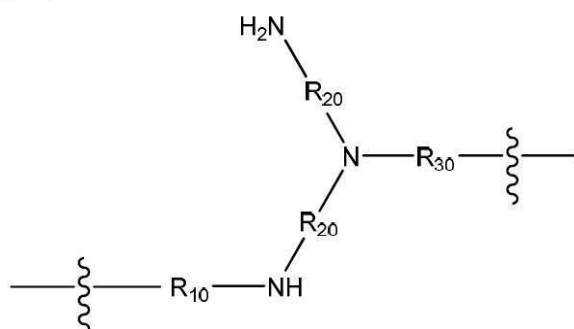
(項目2)

6つ、7つまたは8つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと架橋モノマーとの反応生成物を含むアミンポリマーであって、

前記ポリマーの単位が、式1

【化1-2】

【化1】



(1)

の構造を有し、式中、

R_{10} は、架橋モノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_{16}$ アルキレン、 $-NH-C(NH)-NH-$ 、 $-NH-C(NH_2^+)-NH-$ 、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、またはアルキレン基の1つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_{50}$ アルキレンであり；

R_{30} は、アミンモノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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、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 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレンであり；

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_6$ アルキレンであり；

R_{10} または R_{30} のうちの少なくとも1つは、算出 $\log P$ ($\log P$) が4より大きい疎水基である、

アミンポリマー。

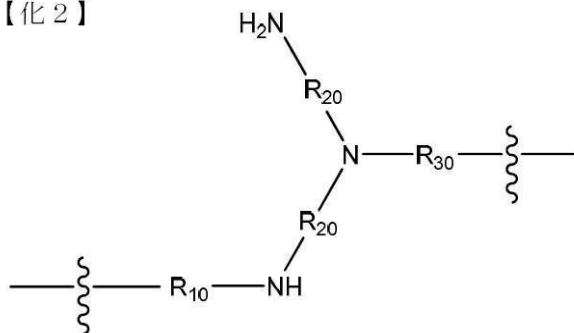
(項目3)

6つ、7つまたは8つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと架橋モノマーとの反応生成物を含むアミンポリマーであって、

前記ポリマーの単位が、式1

【化 2 - 2】

【化 2】



(1)

の構造を有し、式中、

R_{10} は、架橋モノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_{16}$ アルキレン、 $-NH-C(NH)-NH-$ 、 $-NH-C(NH_2^+)-NH-$ 、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、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_{50}$ アルキレンであり；

R_{30} は、アミンモノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_6$ アルキレンであり；

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_6$ アルキレンであり；

R_{10} は、算出 $\log P$ ($\log P$) が 4 より大きい疎水基である、アミンポリマー。

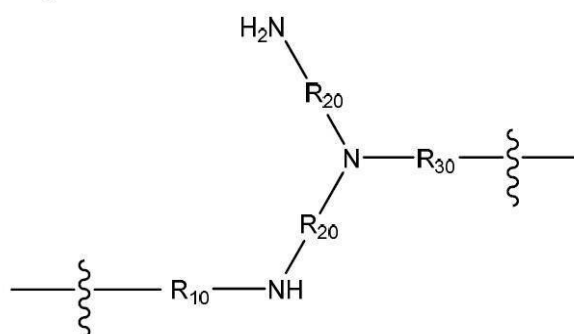
(項目 4)

6 つ、7 つまたは 8 つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと架橋モノマーとの反応生成物を含むアミンポリマーであって、

前記ポリマーの単位が、式 1

【化 3 - 2】

【化 3】



(1)

の構造を有し、式中、

R_{10} は、架橋モノマーに由来し、かつ $C_8 \sim C_{16}$ 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 $C_8 \sim C_{50}$ アルキレンであり；

R_{30} は、アミンモノマーに由来し、かつ $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレンであり；

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の

- CH_2 - 基がアミド官能基に置き換わっている $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキレンである、
アミンポリマー。

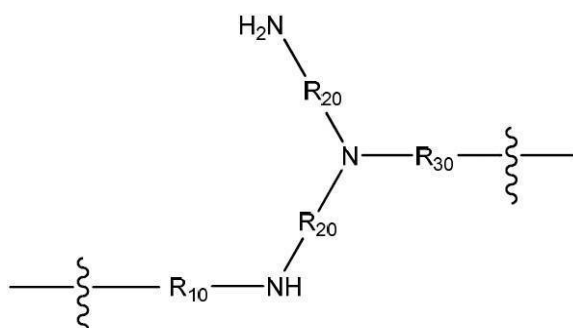
(項目5)

6つ、7つまたは8つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと架橋モノマーとの反応生成物を含むアミンポリマーであって、

前記ポリマーの単位が、式1

【化4-2】

【化4】



(1)

の構造を有し、式中、

R_{10} は、架橋モノマーに由来し、かつ $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の $-\text{CH}_2-$ 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 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の $-\text{CH}_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキレンであり；

R_{30} は、アミンモノマーに由来し、かつ $\text{C}_8 \sim \text{C}_{16}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、またはアルキレン基の1つ以上の $-\text{CH}_2-$ 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 $\text{C}_8 \sim \text{C}_{16}$ アルキレンであり；

R_{20} はそれぞれ独立して、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の $-\text{CH}_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキレンである、
アミンポリマー。

(項目6)

前記ポリマーが、1:1～約1:5の範囲の算出比で第一級アミン原子と第二級アミン原子とを含む、項目2～5のいずれか1項に記載のアミンポリマー。

(項目7)

前記アミンモノマーと前記架橋モノマーのモル比が1:3～約1:1.1の範囲にある、項目2～6のいずれか1項に記載のアミンポリマー。

(項目8)

胆汁酸に対する結合親和性が、*in vitro* アッセイAを用いた測定で少なくとも0.46 mmol/gである、項目2～7のいずれか1項に記載のアミンポリマー。

(項目9)

6つ、7つまたは8つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと2つまたは3つの可能な反応部位を有する架橋モノマーとの反応生成物を含むアミンポリマーであって、

前記ポリマーが水に不溶性であり、

前記アミン第二級窒素原子の少なくとも一部が架橋ポリマー網目構造の一部であり、

前記架橋モノマーが式 $\text{X} - \text{R}_1 - \text{X}$ を有する化合物であり、式中、 X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は、 $\text{C}_8 \sim \text{C}_{16}$ アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の $-\text{CH}_2-$ 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 $\text{C}_8 \sim \text{C}_{50}$ アルキレンであり、かつ前記架

橋モノマーの算出 $\log P$ ($\log P$) が 4 より大きい、
アミンポリマー。

(項目 10)

6 つ、7 つまたは 8 つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと 2 つまたは 3 つの可能な反応部位を有する架橋モノマーとの反応生成物を含むアミンポリマーであって、

前記ポリマーが水に不溶性であり、

前記アミン第二級窒素原子の少なくとも一部が架橋ポリマー網目構造の一部であり、

前記アミンモノマーが、 $C_8 \sim C_{16}$ アルキレン、アリーレン、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 $C_8 \sim C_{50}$ アルキレンである少なくとも 1 つのセグメントを有し、かつ前記アミンモノマーの前記少なくとも 1 つのセグメントの算出 $\log P$ ($\log P$) が 4 より大きく、

前記架橋モノマーが式 $X - R_1 - X$ を有する化合物であり、式中、 X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は $C_2 \sim C_6$ 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 $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_6$ アルキレンである、

アミンポリマー。

(項目 11)

前記架橋モノマーが $X - R_1 - X$ であり、式中、 X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は、 $C_8 \sim C_{16}$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヘテロシクロ官能基に置き換わっている $C_8 \sim C_{50}$ アルキレンである、項目 9 に記載のポリマー。

(項目 12)

前記架橋モノマーが $X - R_1 - X$ であり、式中、 X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は、アルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヘテロシクロ官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_6$ アルキレンである、項目 10 に記載のポリマー。

(項目 13)

6 つ、7 つまたは 8 つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと 2 つまたは 3 つの可能な反応部位を有する架橋モノマーとの重合により生じた反復単位を含むアミンポリマーであって、

前記アミンモノマーと前記架橋モノマーのモル比が 1 : 3 ~ 約 1 : 1 . 1 の範囲にあり、

前記ポリマーが、アッセイ B を用いた測定で 0 . 3 mmol / g ポリマー未満の量でリン酸塩と *in vitro* で結合し、

前記ポリマーが、アッセイ B を用いた測定で約 3 mmol / g ポリマーよりも大きい *in vitro* で胆汁酸と結合する、

アミンポリマー。

(項目 14)

脂肪族セグメントにより隔てられた正電荷の結合点を有するポリマーの単位を含むアミンポリマーであって、

前記正電荷の結合点が、少なくとも 19 . 0 meq / g の電荷密度と少なくとも 200 . 0 g / mol の分子量とを有し、

少なくとも 1 つの脂肪族セグメントが正電荷の各結合点と結合し、

前記少なくとも 1 つの脂肪族セグメントの算出 $\log P$ ($\log P$) が 4 より大きく、

前記正電荷の結合点がそれぞれ、算出 $\log P$ ($\log P$) が 4 より大きい脂肪族セグメントを含まない、

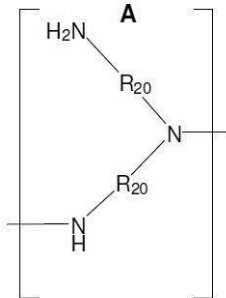
アミンポリマー。

(項目 1 5)

脂肪族セグメントにより隔てられた正電荷の結合点を有するポリマーの単位を含むアミンポリマーであって、

前記正電荷の結合点が、 17.3 meq/g よりも大きい電荷密度と、式 A の構造【化 5 - 2】

【化 5】



とを有し、式中、

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_3 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_3 \sim C_8$ アルキレンであり；

少なくとも 1 つの脂肪族セグメントが正電荷の各結合点と結合し、各脂肪族セグメントの算出 $\log P$ (cLogP) が 4 より大きい、

アミンポリマー。

(項目 1 6)

前記少なくとも 1 つの脂肪族セグメントが、 $C_8 \sim C_{16}$ 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 $C_8 \sim C_{50}$ アルキレンである、項目 1 4 または 1 5 に記載のアミンポリマー。

(項目 1 7)

前記ポリマーが、アッセイ B を用いた測定で 0.3 mmol/g ポリマー未満の量でリン酸塩と *in vitro* で結合し、かつ前記ポリマーが、アッセイ B を用いた測定で約 3 mmol/g ポリマーよりも大きい *in vitro* 能で胆汁酸と結合する、項目 1 4 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 1 8)

前記ポリマーが、アッセイ B を用いた測定で 0.2 mmol/g ポリマー未満の量でリン酸塩と *in vitro* で結合する、項目 1 7 に記載のアミンポリマー。

(項目 1 9)

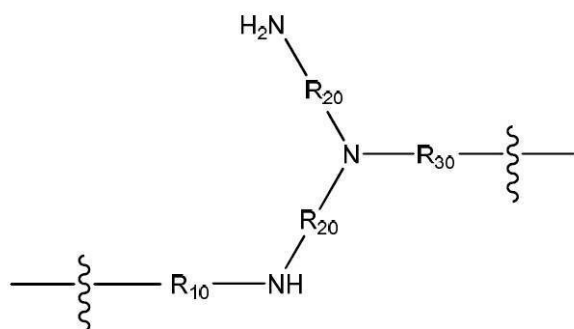
前記正電荷の結合点がそれぞれ、算出 $\log P$ (cLogP) が 4 より大きい脂肪族セグメントを含まない、項目 1 5 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 2 0)

式 1

【化 6 - 2】

【化 6】



(1)

の構造を有するポリマーの単位を含むアミンポリマーであって、式中、

R_{10} は、 $C_2 \sim C_{16}$ アルキレン、アリーレン、 $-NH-C(NH)-NH-$ 、 $-NH-C(NH_2^+)-NH-$ 、ジメチルピフェニル、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、シクロアルキル、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、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_{50}$ アルキレンであり；

R_{30} は、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレンであり；かつ

R_{20} はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり；

前記ポリマーが、アッセイ B を用いた測定で 0.3 mmol/g ポリマー未満の量でリン酸塩と *in vitro* で結合し；かつ

前記ポリマーが、アッセイ B を用いた測定で約 3 mmol/g ポリマーよりも大きい *in vitro* 能で胆汁酸と結合する、

アミンポリマー。

(項目 21)

前記アミンポリマーが、6 つ、7 つまたは 8 つの可能な反応部位を有するアミンモノマーと架橋モノマーとの反応生成物を含み、 R_{10} が架橋モノマーに由来し、 R_{30} がアミンモノマーに由来する、項目 20 に記載のアミンポリマー。

(項目 22)

前記アミンポリマーが、アッセイ B を用いた測定で 0.2 mmol/g ポリマー未満の量でリン酸塩と *in vitro* で結合する、項目 20 に記載のアミンポリマー。

(項目 23)

前記算出 Log P が 4.5 より大きい、項目 1 ~ 22 のいずれかに記載のアミンポリマー。

(項目 24)

前記算出 Log P が 5 より大きい、項目 1 ~ 22 のいずれかに記載のアミンポリマー。

(項目 25)

前記算出 Log P が 5.5 より大きい、項目 1 ~ 22 のいずれかに記載のアミンポリマー。

(項目 26)

前記算出 Log P が 6 より大きい、項目 1 ~ 22 のいずれかに記載のアミンポリマー。

(項目 27)

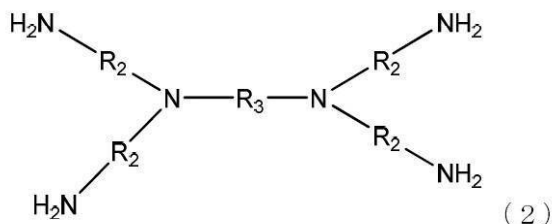
アミンモノマーと架橋モノマーとの重合により生じた反復単位を含むアミンポリマーで

あって、

前記アミンモノマーが、構造

【化 7 - 2】

【化 7】



を有する式 2 のアミンであり、式中、

R_2 はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基が少なくとも 1 つのアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり、かつ R_3 は、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり、

前記架橋モノマーが、グアニジン、グアニジウム塩、式 $X - R_1 - X$ を有する化合物またはそれらの組合せであり、式中、

X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は、 $C_8 \sim C_{16}$ 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 $C_5 \sim C_{50}$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_5 \sim C_{50}$ アルキレンである、

アミンポリマー。

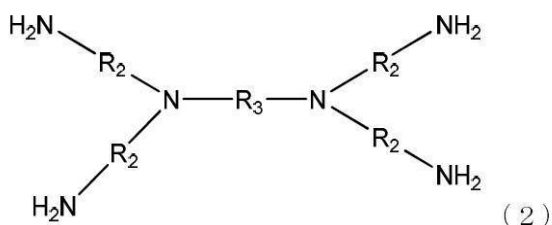
(項目 2 8)

項目 1 ～ 2 6 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーであって、

前記アミンモノマーが、構造

【化 8 - 2】

【化 8】



を有する式 2 のアミンであり、式中、

R_2 はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり、かつ R_3 は、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_8$ アルキレンである、

、

アミンポリマー。

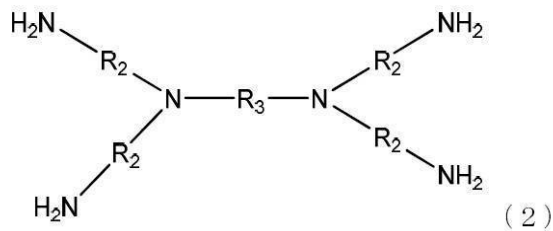
(項目 2 9)

項目 1 ～ 2 6 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーであって、

前記アミンモノマーが、構造

【化 9 - 2】

【化 9】



を有する式 2 のアミンであり、式中、

R_2 はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり、かつ R_3 は、 $C_8 \sim C_{16}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_8 \sim C_{16}$ アルキレンであり；

前記架橋モノマーが、式 $X - R_1 - X$ を有する化合物であり、式中、

X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は、 $C_2 \sim C_6$ 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 $C_2 \sim C_6$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_6$ アルキレンである、

アミンポリマー。

(項目 30)

前記架橋モノマーが、グアニジン、グアニジウム塩、式 $X - R_1 - X$ を有する化合物またはそれらの組合せであり、式中、 X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は、 $C_8 \sim C_{16}$ アルキレン、ジメチルピフェニル、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基が 1 つもしくは 2 つのフェニル、ピペリジニウムもしくはイミダゾリウム官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_{50}$ アルキレンである、項目 28 に記載のアミンポリマー。

(項目 31)

アルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基が 1 つまたは 2 つのフェニル、ピペリジニウムまたはイミダゾリウム官能基に置き換わっている前記 $C_2 \sim C_{50}$ アルキレンが、 p -キシレン、1, 3-ビス(m -ハロ C_m アルキル) - 1H-イミダゾール - 3-イウム、4, 4'-(C_x アルカン - 1, x -ジイル)ビス(1-(m -ハロ C_m アルキル) - 1-メチルピペリジニウム)または 1-(q -ハロ C_q alkyl) - 3-(m -(3-(p -halo C_p alkyl) - 1H-イミダゾール - 3-イウム - 1-イル) C_m アルキル) - 1H-イミダゾール - 3-イウムであり、式中、 m は 2 ~ 14 の整数であり、 p は 2 ~ 14 の整数であり、 q は 2 ~ 14 の整数であり、 x は 2 ~ 8 の整数である、項目 30 に記載のアミンポリマー。

(項目 32)

項目 28 に記載のアミンポリマーであって、

前記架橋モノマーがグアニジン、式 $X - R_1 - X$ を有する化合物(式中、 R_1 は $C_8 \sim C_{16}$ アルキレン)またはそれらの組合せであり、

前記アミンポリマーがコモノマーを含み、

前記コモノマーが C_m アルカン - 1, m -ジイルジアミン、アルキレンジシクロアルカンアミン、(m -アミノ C_m アルキル)ヘテロシクロ、3-(m -アミノ C_m アルキル) - 1H-イミダゾール - 3-イウムまたはそれらの組合せであり、

式中、 m が 2 ~ 16 の整数であり、かつ X がそれぞれ独立して脱離基である、

アミンポリマー。

(項目 3 3)

項目 2 9 に記載のアミンポリマーであって、

前記架橋モノマーが式 $X - R_1 - X$ を有する化合物 (式中、 R_1 は $C_2 \sim C_6$ アルキレンである) であり、

前記アミンポリマーがモノマーを含み、

前記モノマーが C_m アルカン - 1, m - ジイルジアミン、アルキレンジシクロアルカンアミン、(m - アミノ C_m アルキル) ヘテロシクロ、3 - (m - アミノ C_m アルキル) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムまたはそれらの組合せであり、

式中、 m が 2 ~ 16 の整数であり、かつ X がそれぞれ独立して脱離基である、

アミンポリマー。

(項目 3 4)

R_3 がオクチレン、デシレン、ウンデシレンまたはドデシレンである、項目 2 9 に記載のアミンポリマー。

(項目 3 5)

前記ポリマーがモノマーを含み、前記モノマーがヘキサン - 1, 6 - ジイルジアミン、ヘプタン - 1, 7 - ジイルアミン、オクタン - 1, 8 - ジイルジアミン、ノナン - 1, 9 - ジイルアミン、デカン - 1, 10 - ジイルジアミン、ウンデカン - 1, 11 - ジイルアミン、ドデカン - 1, 12 - ジイルジアミン、4, 4' - メチレンジシクロヘキサンアミン、3 - (3 - アミノプロピル) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムまたはそれらの組合せである、項目 2 9 に記載のアミンポリマー。

(項目 3 6)

R_3 がエチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン、オクチレン、デシレン、ウンデシレン、ドデシレン、3, 3' - (1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1, 3 - ジイル) ジプロピル、1, 4 - フェニレンジメチル、1, 6 - ジオキソヘキサン - 1, 6 - ジイル、1, 4 - ジオキソブタン - 1, 4 - ジイルまたは 2, 6 - ジホルミルピリジンである、項目 2 8 に記載のアミンポリマー。

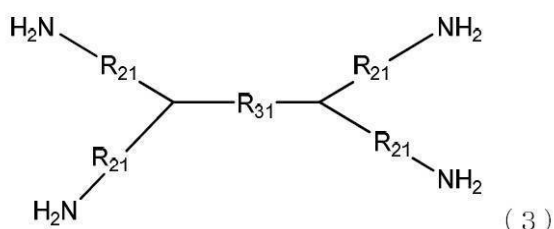
(項目 3 7)

項目 1 に記載のアミンポリマーであって、

前記アミンモノマーが、構造

【化 10 - 2】

【化 10】



を有する式 3 のアミンであり、式中、

R_{21} はそれぞれ独立して、アルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基が少なくとも 1 つの硫黄原子に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり、かつ R_{31} は、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレンであり、

前記架橋モノマーが、グアニジン、グアニジウム塩、式 $X - R_1 - X$ を有する化合物またはそれらの組合せであり、式中、 X はそれぞれ独立して脱離基であり、 R_1 は、 $C_2 \sim C_{16}$ アルキレン、アリーレン、ジメチルピフェニル、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 $C_2 \sim C_{50}$ アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の $-CH_2-$ 基がヒドロキシで置換されている $C_2 \sim C_{50}$ アルキレンである、

アミンポリマー。

(項目38)

各 $R_{2,1}$ が m -スルフィド C_m アルキルであり、 m が1～6の整数であり、 $R_{3,1}$ が $C_3 \sim C_8$ アルキレンである、項目37に記載のアミンポリマー。

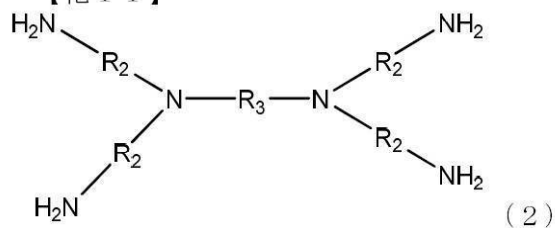
(項目39)

アミンモノマーと架橋モノマーとの重合により生じた反復単位を含むアミンポリマーであって、

式2の前記アミンモノマーが、構造

【化11-2】

【化11】



を有し、式中、

R_2 はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の1つ以上の $-CH_2-$ 基がアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり；かつ R_3 は、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレン、アリーレン、ジホルミルヘテロシクロ、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 $C_2 \sim C_{12}$ アルキレンであり；

前記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、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_m アルキル、2-(保護アミノ)-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)-3-メチル-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)-4-メチル-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)-1-オキソ- m -アリール C_m アルキル、2-(保護アミノ)- m -(アルキルチオ)-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)- m -(アリール)-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)- m -カルボキシ-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)- m -グアニジノ-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)-($m-1$)-ヒドロキシ-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)- m -ヒドロキシ-1-オキソ C_m アルキル、2-(保護アミノ)- m -メルカプト-1-オキソ C_m アルキル、 m -(アルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(アルキルヘテロシクロ) C_m アルキル、 m -アミノ-2-(保護アミノ)-1-オキソ C_m アルキル、 m -アミノ-2-(保護アミノ)-1, m -ジオキソ C_m アルキル、 m -(x -アミノ C_x アルキル)ヘテロシクロ C_m アルキル、($m-1$)-アミノ- m -(ヘテロシクロ)-1-オキソ C_m アルキル、 m -(アリールアルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(x -(アルキルチオ) C_x アルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(x -アミノ C_x アルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(x -アミノ- x -オキソ C_x アルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(x -カルボキシ C_x アルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(ヘテロシクロアルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(x -ヒドロキシ C_x アルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -($(x-1)$ -ヒドロキシ C_x アルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(x -メルカプト C_x アルキルアミ

ノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - トリアルキルアンモニオ C_x アルキル) ヘテロシクロ C_m アルキル、m - (x - (2 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキル アミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - (3 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキル アミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - (4 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキル アミノ) - m - オキソ C_m アルキル、式 4

【化 1 2 - 2】

【化 1 2】

* —R₄₆— R₄₇— R₄₈ (4)

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、R₄₆ は C₆ ~ C₁₆ アルキレンであり、R₄₇ は 1, y - ビス (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) C_y アルキレンであり、R₄₈ は C₆ ~ C₁₆ 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、かつ z は 1 ~ 16 の整数である、

アミンポリマー。

(項目 40)

項目 1 ~ 38 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーであって、

前記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_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 3 - メチル - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 4 - メチル - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 1 - オキソ - m - アリール C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - (アルキルチオ) - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - (アリール) - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - カルボキシ - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - グアニジノ - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - (m - 1) - ヒドロキシ - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - ヒドロキシ - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - メルカプト - 1 - オキソ C_m アルキル、m - (アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (アルキルヘテロシクロ) C_m アルキル、m - アミノ - 2 - (保護アミノ) - 1 - オキソ C_m アルキル、m - アミノ - 2 - (保護アミノ) - 1, m - ジオキソ C_m アルキル、m - (x - アミノ C_x アルキル) ヘテロシクロ C_m アルキル、(m - 1) - アミノ - m - (ヘテロシクロ) - 1 - オキソ C_m アルキル、m - (アリールアルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - (アルキルチオ) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - アミノ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - アミノ - x - オキソ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - カルボキシ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (ヘテロシクロアルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - ヒドロキシ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - メルカプト C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - トリアルキルアンモニオ C_x アルキル) ヘテロシクロ C_m アルキル、m - (x - (2 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - (3 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、m - (x - (4 - (アルコキシ) ベンズアミド) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、式 4

【化 1 3 - 2】

【化 1 3】

* —R₄₆— R₄₇— R₄₈ (4)

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 -ビス(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、

アミンポリマー。

(項目 41)

項目 39 または 40 に記載のアミンポリマーであって、

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_m アルキル、 m -(2-(1H-インドール-3-イル)エチルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル、 m -(2-メチルチアゾール-3-イウム-3-イル) C_m アルキル、 m -(ベンゾ[d]チアゾール-3-イウム-3-イル) C_m アルキル、 m -(ピリジニウム-1-イル) C_m アルキル、 m -(テトラヒドロ-1H-チオフェニウム-1-イル) C_m アルキル、 z -(1,2-ジアルキル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_z アルキル、 m -(2,3-ジアルキル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_m アルキル、 z -(1-アルキル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_z アルキル、 m -(3-アルキル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_m アルキルもしくは z -(チアゾール-3-イウム-3-イル) C_z 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 -(1H-インドール-3-イル)-1-オキソ C_m -アルキルもしくは2-(保護アミノ)- m -(1H-イミダゾール-4-イル)-1-オキソ C_m 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_m アルキル；2-(保護アミノ)-1-オキソ- m -フェニル C_m 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_m アルキル； m -(3-アルキル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_m アルキル、 m -(1-アルキル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_m アルキル、 m -(1-アルキル-2-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_m アルキルもしくは m -(3-アルキル-2-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_m アルキルから選択される m -(アルキルヘテロシクロ) C_m アルキル； m -(3-(x -アミノ C_x アルキル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_m アルキルもしくは m -(1-(x -アミノ C_x アルキル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_m アルキルから選択される m -(x -アミノ C_x アルキル)ヘテロシクロ C_m アルキル；(m -1)-アミノ- m -(1H-インドール-2-イル)-1-オキソ C_m アルキル； m -(ヒドロキシフェナルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキルもしくは m -(フェナルキルアミノ)- m -オキソ- C_m 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_m アルキル； m -(1-(x -(1-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_x アルキル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_m アルキル、 m -(1-(x -(3-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_x アルキル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_m アルキル、 m -(3-(x -(1-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_x アルキル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_m アルキルもしくは m -(3-(x -(3-メチル-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_x アルキル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_m アルキルから選択される m -(x -(ヘテロシクロ) C_x アルキル)ヘテロシクロ C_m アルキル； m -(x -(1H-イミダゾール-4-イル) C_x アルキルアミノ)- m -オキソ C_m アルキル；または m -(3-(x -トリアルキルアンモニオ) C_x アルキル)-1H-イミダゾール-3-イウム-1-イル) C_m アルキルもしくは m -(1-(x -トリアルキルアンモニオ) C_x アルキル)-1H-イミダゾール-3-イウム-3-イル) C_m 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_x アルキル)ヘテロシクロ C_m 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、
アミンポリマー。

(項目 42)

項目 39 または 40 に記載のアミンポリマーであって、

前記配位子が、2 - (保護アミノ) - m - (ヘテロシクロ) - 1 - オキソ C_m アルキル、 m - アミノ - 2 - (保護アミノ) - 1, m - ジオキソ C_m アルキル、 m - アミノ - 2 - (保護アミノ) - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - (アルキルチオ) - 1 - オキソ C_m 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_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 1 - オキソ - m - フェニル C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - (1H - イミダゾール - 4 - イル) - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - カルボキシ - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 3 - メチル - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - 4 - メチル - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - メルカプト - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - (m - 1) - ヒドロキシ - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - ヒドロキシ - 1 - オキソ C_m アルキル、2 - (保護アミノ) - m - グアニジノ - 1 - オキソ C_m アルキル、 m - (x - (アルキルチオ) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、 m - (ヒドロキシフェナルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、 m - オキソ - m - (フェナルキルアミノ) C_m アルキル、 m - (x - (1H - イミダゾール - 4 - イル) C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、 m - (x - カルボキシ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、 m - (アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、 m - (x - メルカプト C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、 m - (x - 1) - ヒドロキシ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、 m - (x - ヒドロキシ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキル、 m - (x - アミノ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m アルキルまたは m - (x - アミノ - x - オキソ C_x アルキルアミノ) - m - オキソ C_m 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、

アミンポリマー。

(項目 43)

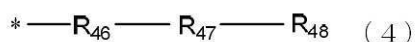
項目 39 または 40 に記載のアミンポリマーであって、

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、5 - (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 - シクロヘキシルプロピル、3 - フェニルプロピル、3 - (トリメチルアミノ)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 - (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 - トリメチルアミノ)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 - トリメチルアミノ)ベンチル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - 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 - 1

H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - イル) プロピル、3 - (3 - (9 - (3 - メチル -
 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) ノニル) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウ
 ム - 1 - イル) プロピル、3 - (1 - (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 - 3 - イル) プロピル、3
 - (1 - (9 - (3 - メチル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル) ノニル) -
 1 H - 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、4 - (1 - デシル - 1 H - 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 - 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、1
 0 - (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 - オキソペンチル、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 - オキソペンチル、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) ペンチル、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) - 1 - オキソプロピル、5 - (2 - (1 H - イミダゾール - 4
 - イル) エチルアミノ) - 5 - オキソペンチル、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 - オキソペンチル、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 - オキソペンチル、(3R) - 2 - (te
 rt - ブトキシカルボニルアミノ) - 3 - メチル - 1 - オキソペンチル、(R) - 5 - (2
 - メチルブチルアミノ) - 5 - オキソペンチル、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 - オキソペンチル、(3R) - 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 -
 オキソペンチル、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 - アミノペンチルアミノ) - 5 - オキソペンチル、5 - アミノ - 2
 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) - 1, 5 - ジオキソペンチル、5 - (4 - ア
 ミノ - 4 - オキソブチルアミノ) - 5 - オキソペンチル、2 - (tert - ブトキシカル
 ボニルアミノ) - 5 - グアニジノ - 1 - オキソペンチル、5 - (4 - グアニジノブチルア
 ミノ) - 5 - オキソペンチル、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 - オキソペンチ
 ル、2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) - 4 - メチル - 1 - オキソペンチル、
 5 - (イソペンチルアミノ) - 5 - オキソペンチル、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 - オキソペンチル、2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) - 1 - オキソプ
 ロピル、5 - (エチルアミノ) - 5 - オキソペンチル、式 4

【化 1 4 - 2】

【化 1 4】



の配位子またはそれらの組合せであり、式中、 R_{46} はデシレンであり、 R_{47} 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_{48} はデシルである、アミンポリマー。

(項目 4 4)

項目 3 9 または 4 0 に記載のアミンポリマーであって、

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 - イミダゾール、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)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 - シクロヘキシルプロピル、3 - フェニルプロピル、3 - (トリメチルアミノ)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 - (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 - トリメチルアミノ)ペンチル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - イル)プロピル、3 - (1 - (5 - トリメチルアミノ)ペンチル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 3 - 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)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 - 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)プロピル、3 - (3 - (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、4 - (3 - デシル - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - 1 - 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、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、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 - 3 - 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 4

【化 15 - 2】

【化 15】

*—R₄₆—R₄₇—R₄₈ (4)

の配位子またはそれらの組合せであり、式中、R₄₆ はデシレンであり、R₄₇ は 1, 3 - ビス(1 - メチルピペリジン - 4 - イル) プロパンであり、R₄₈ はデシルである、アミンポリマー。

(項目 45)

保護基が独立して - C(O)OR₄₉、- C(O)R₅₀ であり、式中、R₄₉ はアルキルまたはアリールであり、R₅₀ はアミノ、水素、アルキルまたはハロアルキルである、項目 39 ~ 42 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 46)

前記架橋モノマーが、グアニジン、グアニジウム塩、式 X - R₁ - X を有する化合物またはそれらの組合せであり、式中、X はそれぞれ独立して脱離基であり、R₁ は、C₂ ~ C₁₆ アルキレン、アリーレン、ジメチルビフェニル、またはアルキレン基の 1 つ以上の - CH₂ - 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 C₂ ~ C₅₀ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の - CH₂ - 基がヒドロキシで置換されている C₂ ~ C₅₀ アルキレンである、項目 39 に記載のアミンポリマー。

(項目 47)

アミンモノマーのモル数に基づく約 5 モル% ~ 約 60 モル% の配位子を含む、項目 39 ~ 46 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 48)

アミンモノマーのモル数に基づく約 5 モル% ~ 約 50 モル% の配位子を含む、項目 39 ~ 46 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 49)

アミンモノマーのモル数に基づく約 10 モル% ~ 約 30 モル% の配位子を含む、項目 39 ~ 46 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 50)

X がハロ、エポキシ、ジアジリジノまたはそれらの組合せである、項目 9 ~ 12、27 および 29 ~ 49 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 51)

R₁ が C₈ ~ C₁₄ アルキレンである、項目 29 ~ 50 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 52)

R₁ がデシレンまたはドデシレンである、項目 51 に記載のアミンポリマー。

(項目 53)

R₁ または R₁₀ が、アルキレン基の 1 つ以上の - CH₂ - 基がヒドロキシで置換されている C₂ ~ C₆ アルキレンである、項目 2、5 ~ 8、10、20 ~ 26、29、37、38、40 ~ 45 および 47 ~ 50 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 54)

R₁ または R₁₀ が - CH₂ - CH(OH) - CH₂ - である、項目 53 に記載のアミンポリマー。

(項目 55)

R₃ または R₃₀ が C₃ ~ C₁₂ アルキレンである、項目 29 ~ 54 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 56)

R₃ または R₃₀ がブチレンである、項目 55 に記載のアミンポリマー。

(項目 57)

R₃ または R₃₀ がデシレンである、項目 55 に記載のアミンポリマー。

(項目 58)

R₃ または R₃₀ がドデシレンである、項目 2、4 ~ 8、20 ~ 36 および 39 ~ 54 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 59)

R₂ または R₂₀ がそれぞれ独立して C₂ ~ C₆ アルキレンである、項目 2 ~ 8、20 ~ 36 および 39 ~ 58 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 60)

R₂ または R₂₀ がそれぞれ独立して C₂ ~ C₄ アルキレンである、項目 59 に記載のアミンポリマー。

(項目 61)

R₂ または R₂₀ がそれぞれ独立してプロピレンである、項目 60 に記載のアミンポリマー。

(項目 62)

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における 0.5 % の用量での測定で、in vivo 結合能がコレセバラム塩酸塩よりも少なくとも 25 % 大きい、項目 1 ~ 61 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 63)

前記 in vivo 結合能が、コレセバラム塩酸塩よりも少なくとも 50 % 大きい、項目 62 に記載のアミンポリマー。

(項目 64)

前記 in vivo 結合能が、コレセバラム塩酸塩よりも少なくとも 75 % 大きい、項目 62 に記載のアミンポリマー。

(項目 65)

前記 in vivo 結合能が、コレセバラム塩酸塩よりも少なくとも 100 % 大きい、項目 62 に記載のアミンポリマー。

(項目 66)

胆汁酸に対する結合親和性が、in vitro アッセイ A を用いた測定で少なくとも約 0.46 mmol / g である、項目 1 ~ 65 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 67)

胆汁酸に対する結合親和性が、in vitro アッセイ A を用いた測定で少なくとも約 0.55 mmol / g である、項目 1 ~ 65 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 68)

胆汁酸に対する結合親和性が、in vitro アッセイ A を用いた測定で少なくとも約 0.60 mmol / g である、項目 1 ~ 65 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 69)

胆汁酸に対する結合親和性が、in vitro アッセイ A を用いた測定で少なくとも約 0.65 mmol / g である、項目 1 ~ 65 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 70)

in vitro アッセイ B を用いた測定で、結合能がコレセバラム塩酸塩よりも少なくとも 25 % 大きい、項目 1 ~ 69 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 71)

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バラム塩酸塩よりも少なくとも 50 % 大きい、項目 70 に記載のアミンポリマー。

(項目 72)

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バラム塩酸塩よりも少なくとも 75 % 大きい、項目 70 に記載のアミンポリマー。

(項目 73)

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バラム塩酸塩よりも少なくとも 100 % 大きい、項目 70 に記載のアミンポリマー。

(項目 74)

in vivo 測定で、糞便中に平均で少なくとも 11 % の一次胆汁酸が存在する、項目 1 ~ 73 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 75)

in vivo 測定で、糞便中に平均で少なくとも 15 % の一次胆汁酸が存在する、項目 1 ~ 73 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 76)

胆汁酸に対する結合能が、アッセイ B を用いた測定で少なくとも約 2.22 mmol / g である、項目 1 ~ 75 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 77)

項目 1 ~ 76 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーであって、37 でタウロコール酸濃度が 2.5 mM の緩衝溶液に前記ポリマーを入れた場合には、結合タウロコール酸の濃度が 1.5 mmol / g ポリマーより高く、かつ未結合タウロコール酸の濃度が 1.0 mmol / g ポリマー未満であり、37 でタウロコール酸濃度が少なくとも 10 mM の緩衝溶液に前記ポリマーを入れた場合には、結合タウロコール酸の濃度が 5.0 mmol / g ポリマーより高く、かつ未結合タウロコール酸の濃度が 4.0 mmol / g ポリマーより高いアミンポリマー。

(項目 78)

項目 1 ~ 76 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーであって、37 でグリコデオキシコール酸濃度が 1.25 mM の緩衝溶液に前記ポリマーを入れた場合には、結合グリコデオキシコール酸の濃度が 1.0 mmol / g ポリマーより高く、かつ未結合グリコデオキシコール酸の濃度が 0.1 mmol / g ポリマー未満であり、37 でグリコデオキシコール酸濃度が少なくとも 10 mM の緩衝溶液に前記ポリマーを入れた場合には、結合グリコデオキシコール酸の濃度が 6.0 mmol / g ポリマーより高く、かつ未結合グリコデオキシコール酸の濃度が 2.0 mmol / g ポリマーより高いアミンポリマー。

(項目 79)

胆汁酸捕捉剤として有用なアミンポリマーであって、2.6 mM 未満のタウロコール酸を含有する 37 の緩衝溶液中では、前記アミンポリマーがセバラムよりも多くの酸と結合し、5.0 mM を超えるタウロコール酸を含有する 37 の緩衝溶液中では、前記アミンポリマーがコレセバラムよりも多くの酸と結合するアミンポリマー。

(項目 80)

項目 1 ~ 75 のいずれか 1 項に記載の構造を有する、項目 79 に記載のアミンポリマー。

(項目 81)

前記アミンポリマーがアミンモノマーと架橋モノマーとの重合から生じ、前記アミンモノマーが N, N, N', N' - テトラキス (3 - アミノプロピル) - 1, 12 - ジアミノドデカンを含み、かつ前記架橋モノマーが 1, 3 - ジクロロプロパノールを含む、項目 80 に記載のアミンポリマー。

(項目 82)

膨潤率が約 1 ~ 約 10 である、項目 1 ~ 81 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 83)

前記膨潤率が約 2 ~ 約 6 である、項目 82 に記載のアミンポリマー。

(項目 84)

前記膨潤率が約 2 ~ 約 4 である、項目 83 に記載のアミンポリマー。

(項目 85)

前記ポリマーが、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 ~ 84 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマー。

(項目 86)

前記粒子がビーズである、項目 8 5 に記載のアミンポリマー。

(項目 8 7)

前記ビーズが実質的に球状のビーズである、項目 8 6 に記載のアミンポリマー。

(項目 8 8)

項目 1 ~ 8 7 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーと、薬学的に許容される添加剤とを含む、医薬組成物。

(項目 8 9)

動物対象の血清 L D L コレステロールを低下させる方法であって、有効量の項目 1 ~ 8 7 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーまたは項目 8 8 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方法。

(項目 9 0)

動物対象の糖尿病を治療する方法であって、有効量の項目 1 ~ 8 7 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーまたは項目 8 8 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方法。

(項目 9 1)

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、I B S - D または特発性胆汁酸吸収不良を治療する方法であって、有効量の項目 1 ~ 8 7 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーまたは項目 8 8 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方法。

(項目 9 2)

動物対象から胆汁酸塩を除去する方法であって、有効量の項目 1 ~ 8 7 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーまたは項目 8 8 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方法。

(項目 9 3)

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 8 9 ~ 9 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 9 4)

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 (H M G - C o A) 還元酵素阻害剤、フィブラート、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れらの誘導体)、フィトステロール、腸リパーゼ阻害剤、腸もしくは分泌ホスホリパーゼ A 2 阻害剤、A p o - B 1 0 0 の合成もしくはは正常な活性の阻害剤、A p o A の合成もしくは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 9 3 に記載の方法。

(項目 9 5)

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を同時に前記動物対象に投与する、項目 9 3 または 9 4 に記載の方法。

(項目 9 6)

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を逐次的に動物対象に投与する、項目 9 3 または 9 4 に記載の方法。

(項目 9 7)

脂質異常症を治療する前記薬剤が H M G - C o A 還元酵素阻害剤であり、前記 H M G - C o A 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 9 4 ~ 9 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 9 8)

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、ゲムフィブログジル、フェノフィブラートまたはそれらの組合せを含む、項目 9 4 ~ 9 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 9 9)

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 9 4 ~ 9 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 0 0)

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、1 2、2 6、5 2 週間以上後に、平均血清 L D L が少なくとも 1 5 % 減少する、項目 8 9 ~ 9 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 0 1)

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、1 2、2 6、5 2 週間以上後に、平均血清 L D L が少なくとも 2 0 % 減少する、項目 1 0 0 に記載の方法。

(項目 1 0 2)

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、1 2、2 6、5 2 週間以上後に、平均血清 L D L が少なくとも 2 5 % 減少する、項目 1 0 0 に記載の方法。

(項目 1 0 3)

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、1 2、2 6、5 2 週間以上後に、平均血清 L D L が少なくとも 3 0 % 減少する、項目 1 0 0 に記載の方法。

(項目 1 0 4)

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、1 2、2 6、5 2 週間以上後に、平均血清 L D L が少なくとも 1 5 % 減少する、項目 8 9 ~ 9 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 0 5)

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、1 2、2 6、5 2 週間以上後に、平均血清 L D L が少なくとも 2 0 % 減少する、項目 1 0 4 に記載の方法。

(項目 1 0 6)

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、1 2、2 6、5 2 週間以上後に、平均血清 L D L が少なくとも 2 5 % 減少する、項目 1 0 4 に記載の方法。

(項目 1 0 7)

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、1 2、2 6、5 2 週間以上後に、平均血清 L D L が少なくとも 3 0 % 減少する、項目 1 0 4 に記載の方法。

(項目 1 0 8)

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 8 9 ~ 1 0 7 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 0 9)

I I 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であって、有効量の項目 1 ~ 8 7 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーまたは項目 8 8 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方法。

(項目 1 1 0)

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 8 9 ~ 1 0 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 1 1)

前記アミンポリマーと、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 1 1 0 に記載の方法。

(項目 1 1 2)

前記アミンポリマーと、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107に記載の方法。

(項目113)

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、 α -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110~112のいずれか1項に記載の方法。

(項目114)

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、プロホルミン、フェンホルミンまたはそれらの組合せである、項目113に記載の方法。

(項目115)

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113に記載の方法。

(項目116)

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、クロルプロバミド、トルブタミド、トラザミド、グリビジド、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114に記載の方法。

(項目117)

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阻害剤がアログリブチン、リナグリブチン、サクサグリブチン、シタグリブチン、ビルダグリブチンまたはそれらの組合せである、項目113に記載の方法。

(項目118)

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113に記載の方法。

(項目119)

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(Hb_{A_{1c}})が少なくとも0.5%低下する、項目109~118のいずれか1項に記載の方法。

(項目120)

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14mg/dL(0.8mmol/L)低下する、項目109~118のいずれか1項に記載の方法。

(項目121)

6.0g/日以下の用量での前記アミンポリマーによる治療の18週間後に、糖化ヘモグロビン(Hb_{A_{1c}})が少なくとも0.5%減少する、項目109~118のいずれか1項に記載の方法。

(項目122)

6.0g/日以下の用量での前記アミンポリマーによる治療の18週間後に、空腹時血糖が少なくとも14mg/dL(0.8mmol/L)低下する、項目109~118のいずれか1項に記載の方法。

(項目123)

前記動物対象がヒトである、項目89~122のいずれか1項に記載の方法。

(項目124)

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 8 9 ~ 1 2 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 2 5)

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 8 9 ~ 1 2 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 2 6)

前記アミンポリマーを 1 日に 1 回投与する、項目 8 9 ~ 1 2 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 2 7)

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 8 9 ~ 1 2 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 2 8)

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 7 5 % の胆汁酸結合能を有する、項目 8 9 ~ 1 2 7 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 2 9)

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 8 5 % の胆汁酸結合能を有する、項目 1 2 8 に記載の方法。

(項目 1 3 0)

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 9 5 % の胆汁酸結合能を有する、項目 1 2 8 に記載の方法。

(項目 1 3 1)

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 2 5 % 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 8 9 ~ 1 3 0 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 3 2)

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 8 9 ~ 1 3 1 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 3 3)

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 8 9 ~ 1 3 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 3 4)

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 1 3 3 に記載の方法。

(項目 1 3 5)

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 1 3 3 に記載の方法。

(項目 1 3 6)

前記ポリマーの沈降物降伏応力が 4 0 0 0 P a 未満である、項目 1 2 8 ~ 1 3 5 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 3 7)

前記ポリマーの沈降物降伏応力が 3 0 0 0 P a 未満である、項目 1 3 6 に記載の方法。

(項目 1 3 8)

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 6 に記載の方法。

(項目 1 3 9)

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の粘度が約 2 , 5 0 0 , 0 0 0 P a · s 未満であり、前記粘度が 0 . 0 1 秒⁻¹ のずり速度で測定される、項目 1 2 8 ~ 1 3 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 4 0)

沈降した前記粒子の塊の粘度が $2,000,000 \text{ Pa} \cdot \text{s}$ 未満である、項目 139 に記載の方法。

(項目 141)

沈降した前記粒子の塊の粘度が $1,500,000 \text{ Pa} \cdot \text{s}$ 未満である、項目 139 に記載の方法。

(項目 142)

沈降した前記粒子の塊の粘度が $1,000,000 \text{ Pa} \cdot \text{s}$ 未満である、項目 139 に記載の方法。

(項目 143)

沈降した前記粒子の塊の粘度が $500,000 \text{ Pa} \cdot \text{s}$ 未満である、項目 139 に記載の方法。

(項目 144)

乾燥形態のポリマー粒子の圧縮性指数が約 30 未満であり、前記圧縮性指数が $100 * (\text{TD} - \text{BD}) / \text{TD}$ で定義され、BD および TD がそれぞれ体積密度およびタップ密度である、項目 136 ~ 143 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 145)

前記圧縮性指数が約 25 未満である、項目 144 に記載の方法。

(項目 146)

前記圧縮性指数が約 20 未満である、項目 144 に記載の方法。

(項目 147)

前記圧縮性指数が約 15 未満である、項目 144 に記載の方法。

(項目 148)

前記圧縮性指数が約 10 未満である、項目 144 に記載の方法。

(項目 149)

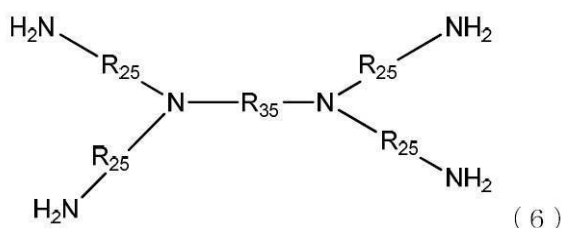
前記アミンモノマーと前記架橋モノマーとを接触させることを含む、項目 1 ~ 87 のいずれか 1 項に記載のアミンポリマーを調製するための工程。

(項目 150)

構造

【化 16 - 2】

【化 16】



を有する式 6 のアミンであって、式中、

R_{25} はそれぞれ独立して、 $C_2 \sim C_8$ アルキレン、またはアルキレン基の 1 つ以上の $-CH_2-$ 基が少なくとも 1 つのアミド官能基に置き換わっている $C_2 \sim C_8$ アルキレンであり、 R_{35} は、 $C_8 \sim C_{16}$ 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 $C_8 \sim C_{16}$ アルキレンである、アミン。

(項目 151)

R_{25} がそれぞれ独立して $C_3 \sim C_6$ アルキレンである、項目 150 に記載のアミン。

(項目 152)

各 R_{25} がプロピレンである、項目 150 に記載のアミン。

(項目 153)

R_{3 5} が C_{1 0} ~ C_{1 4} アルキレンである、項目 1 5 0 ~ 1 5 2 のいずれか 1 項に記載のアミン。

(項目 1 5 4)

R_{3 5} がデシレンである、項目 1 5 3 に記載のアミン。

(項目 1 5 5)

R_{3 5} がドデシレンである、項目 1 5 3 に記載のアミン。