【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和6年11月28日(2024.11.28)

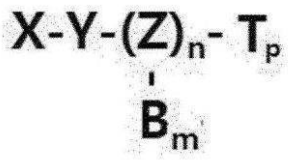
【国際公開番号】WO2022/114908
【公表番号】特表2023-551480(P2023-551480A)
【公表日】令和5年12月8日(2023.12.8)
【年通号数】公開公報(特許)2023-231
【出願番号】特願2023-532339(P2023-532339)
【国際特許分類】
A61K 47/54(2017.01)
A61K 38/26(2006.01)
A61K 38/22(2006.01)
A61K 38/28(2006.01)
A61K 38/29(2006.01)
A61K 38/23(2006.01)
A61K 38/21(2006.01)
A61K 38/18(2006.01)
A61K 38/44(2006.01)
A61K 38/49(2006.01)
A61K 38/19(2006.01)
A61P 3/10(2006.01)
A61P 5/18(2006.01)
A61P 37/02(2006.01)
A61P 7/06(2006.01)
A61P 19/10(2006.01)
A61P 43/00(2006.01)
A61P 31/00(2006.01)
A61P 7/02(2006.01)
A61P 7/04(2006.01)
A61P 25/00(2006.01)
A61K 31/4045(2006.01)
A61K 38/12(2006.01)
A61K 38/36(2006.01)
A61K 38/37(2006.01)
A61K 31/198(2006.01)
A61K 39/395(2006.01)
A61K 39/00(2006.01)
A61K 31/7032(2006.01)
A61K 31/727(2006.01)
A61K 47/28(2006.01)
A61K 47/10(2017.01)
A61K 47/12(2006.01)
A61K 47/02(2006.01)
A61K 47/26(2006.01)
A61K 47/14(2017.01)
A61K 47/22(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ４７/５４　　ＺＮＡ
Ａ６１Ｋ３８/２６

Ａ６１Ｋ　３８／２２
Ａ６１Ｋ　３８／２８
Ａ６１Ｋ　３８／２９
Ａ６１Ｋ　３８／２３
Ａ６１Ｋ　３８／２１
Ａ６１Ｋ　３８／１８
Ａ６１Ｋ　３８／４４
Ａ６１Ｋ　３８／４９
Ａ６１Ｋ　３８／１９
Ａ６１Ｐ　　３／１０
Ａ６１Ｐ　　５／１８
Ａ６１Ｐ　３７／０２
Ａ６１Ｐ　　７／０６
Ａ６１Ｐ　１９／１０
Ａ６１Ｐ　４３／００　１１１
Ａ６１Ｐ　４３／００　１１７
Ａ６１Ｐ　３１／００
Ａ６１Ｐ　　７／０２
Ａ６１Ｐ　　７／０４
Ａ６１Ｐ　２５／００
Ａ６１Ｋ　３１／４０４５
Ａ６１Ｋ　３８／１２
Ａ６１Ｋ　３８／３６
Ａ６１Ｋ　３８／３７
Ａ６１Ｋ　３１／１９８
Ａ６１Ｋ　３９／３９５　　Ｎ
Ａ６１Ｋ　３９／００　　Ｇ
Ａ６１Ｋ　３９／３９５　　Ｙ
Ａ６１Ｋ　３１／７０３２
Ａ６１Ｋ　３１／７２７
Ａ６１Ｋ　４７／２８
Ａ６１Ｋ　４７／１０
Ａ６１Ｋ　４７／１２
Ａ６１Ｋ　４７／０２
Ａ６１Ｋ　４７／２６
Ａ６１Ｋ　４７／１４
Ａ６１Ｋ　４７／２２

【誤訳訂正書】
【提出日】令和６年１１月２０日(２０２４.１１.２０)
【誤訳訂正１】
【訂正対象書類名】特許請求の範囲
【訂正対象項目名】全文
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体、及び
（ｉｉ）賦形剤

を含む、経口医薬製剤。
【請求項２】
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記生理活性物質が、
グルカゴン（グルガコン）、ＧＬＰ－１（グルカゴン様ペプチド－１）、ＧＬＰ－２（グルカゴン様ペプチド－２）、ＧＩＰ（グルコース依存性インスリン分泌刺激ポリペプチド）、エキセンジン－４、インスリン、副甲状腺ホルモン、インターフェロン、エリスロポエチン、カルシトニン、アミリン、セロトニン、リツキシマブ、トラスツズマブ、ウリカーゼ、組織プラスミノゲン活性化因子、サイモグロビン、ワクチン、ヘパリンまたはヘパリン類似体、アンチトロンビンＩＩＩ、フィルグラスチム、酢酸プラムリンチド、エキセナチド、エプチフィバチド、アンチベニン、ＩｇＧ、ＩｇＭ、ＨＧＨ、サイロキシン、第ＶＩＩ及び第ＶＩＩＩ血液凝固因子、治療剤として作用する糖脂質、ならびにその誘導体
を含む群から選択される、請求項１に記載の経口医薬製剤。
【請求項３】
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記生理活性物質が、
配列番号１～１４及び配列番号１８～４２で表されるアミノ酸配列からなるポリペプチド、ならびにその誘導体
を含む群から選択される１つである、請求項１に記載の経口医薬製剤。
【請求項４】
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記生理活性物質が、
配列番号１５及び１６で表されるアミノ酸配列からなるポリペプチドもしくはその誘導体、または配列番号１７及び１６で表されるアミノ酸配列からなるポリペプチドもしくはその誘導体
である、請求項１に記載の経口医薬製剤。
【請求項５】
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記ビオチン部分が、以下の一般式Ａ：
【化１８】

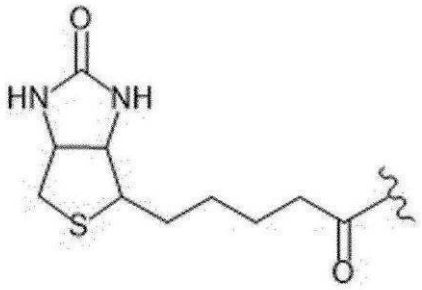
［式Ａ］



〔上記一般式Ａ中、
Ｘは、生理活性物質に結合することができる官能基であり、
Ｙはスペーサーであり、
Ｚは結合単位であり、
Ｂは、以下の化学式Ａ－１；

【化１９】

［化学式Ａ－１］



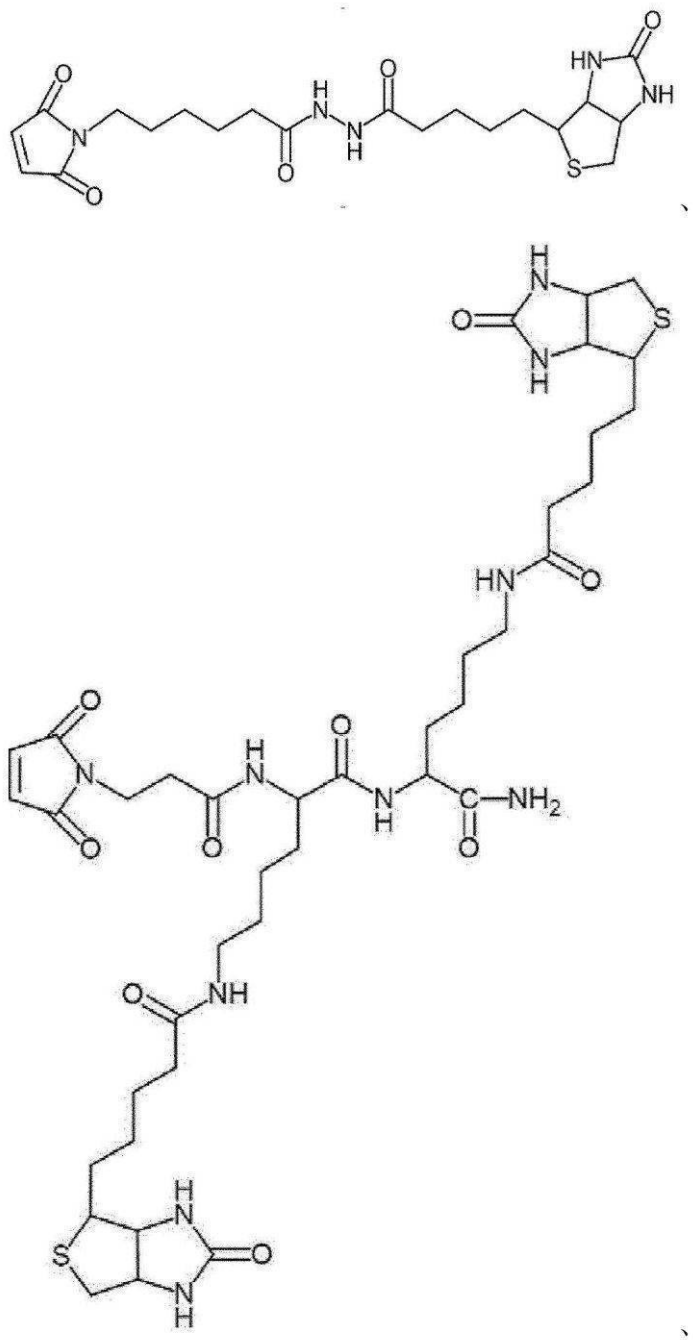
で表され、
Ｚは、化学式Ａ－１の
【化２０】



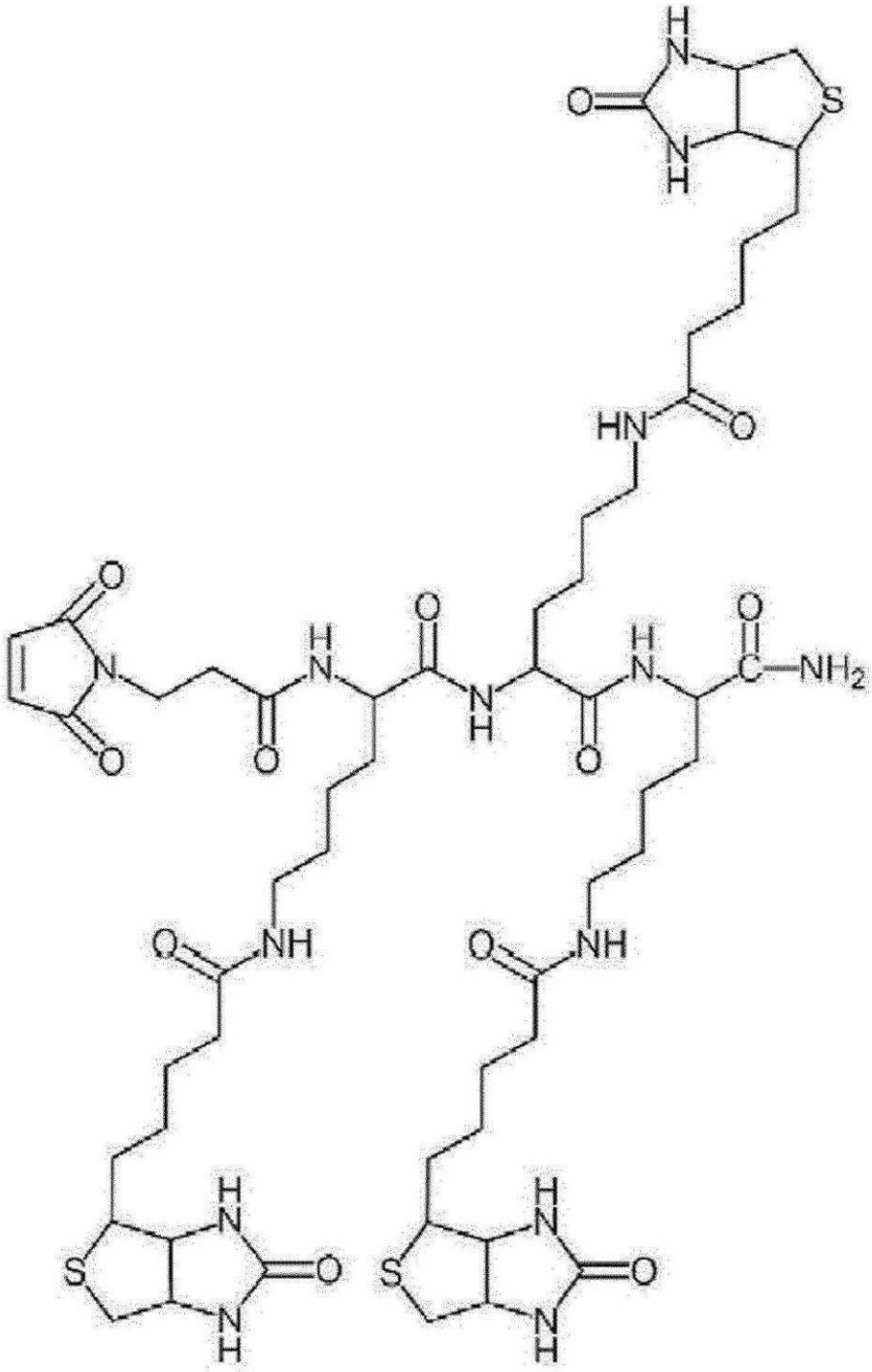
に連結されており、
Ｔは末端基であり、
ｍは１～１０の整数であり、
ｎは０または１～１０の整数であり、ｎ＝０である場合にはＹはＢまたはＴに直接結合しており、
ｐは０または１の整数である〕
で表される、請求項１に記載の経口医薬製剤。
【請求項６】
Ｘが、
マレイミド、スクシンイミド、Ｎ－ヒドロキシスクシンイミド、コハク酸スクシンイミジル、グルタル酸スクシンイミジル、スクシンイミジル　メチルエステル、スクシンイミジル　ペンチルエステル、炭酸スクシンイミジル、炭酸ｐ－ニトロフェニル、アルデヒド、アミン、チオール、オキシアミン、ヨードアセトアミド、アミノオキシル、ヒドラジド、ヒドロキシ、プロピオネート、ピリジル、アルキルハライド、ビニルスルホン、カルボキシル、ヒドラジド、ハロゲンアセトアミド、C_{2-5}アルキニル、C_{6-20}アリールジスルフィド、C_{5-20}ヘテロアリールジスルフィド、イソシアネート、チオエステル、イミノエステル、及びその誘導体
を含む群から選択される、請求項５に記載の経口医薬製剤。
【請求項７】
Ｙが、
存在していないか、あるいは
置換もしくは非置換直鎖状もしくは分岐状C_{1-50}アルキレン、置換もしくは非置換直鎖状もしくは分岐状C_{1-50}ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換C_{6-50}アリーレン、または置換もしくは非置換C_{6-50}ヘテロアリーレンであり、
置換されている場合には、＝Ｏ、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、－ＳＨ、＝ＮＨ及び－NH_2を含む群から選択される少なくとも１つを含む、
請求項５に記載の経口医薬製剤。
【請求項８】
Ｙが、繰り返し単位として－Ｃ（Ｏ）－（OCH_2CH_2）$_u$－ＮＨ－を含み、ｕが１～２０の整数である、請求項５に記載の経口医薬製剤。
【請求項９】
Ｙが、成分としてグルタミン酸、グルタミン、グリシン、イソロイシンまたはリジンを

含む、請求項５に記載の経口医薬製剤。
【請求項１０】
Ｚが、各々独立して選択され得る以下：
Ａ）Ｘと一緒に、またはＸとは別個に、アミノ酸またはその誘導体を形成している；
Ｂ）置換または非置換直鎖状または分岐状Ｃ$_{1-50}$ヘテロアルキレン（ｈｅｔｅｒｏａｌｋｙｅｎｅ）であり、
置換されている場合には、＝Ｏ、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ$_2$、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、－ＳＨ、＝ＮＨ及び－ＮＨ$_2$を含む群から選択される少なくとも１つを含む、
のいずれか１つである、請求項５に記載の経口医薬製剤。
【請求項１１】
Ｔが、
アミン、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-8}$アルケニル、ハロ、ヒドロキシ、チオール、スルホン酸、カルボキシル、フェニル、ベンジル、アルデヒド、アジド、シアネート、イソシアネート、チオシアネート、イソチオシアネート、ニトリル及びホスホン酸
を含む群から選択される、請求項５に記載の経口医薬製剤。
【請求項１２】
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記ビオチン部分が、

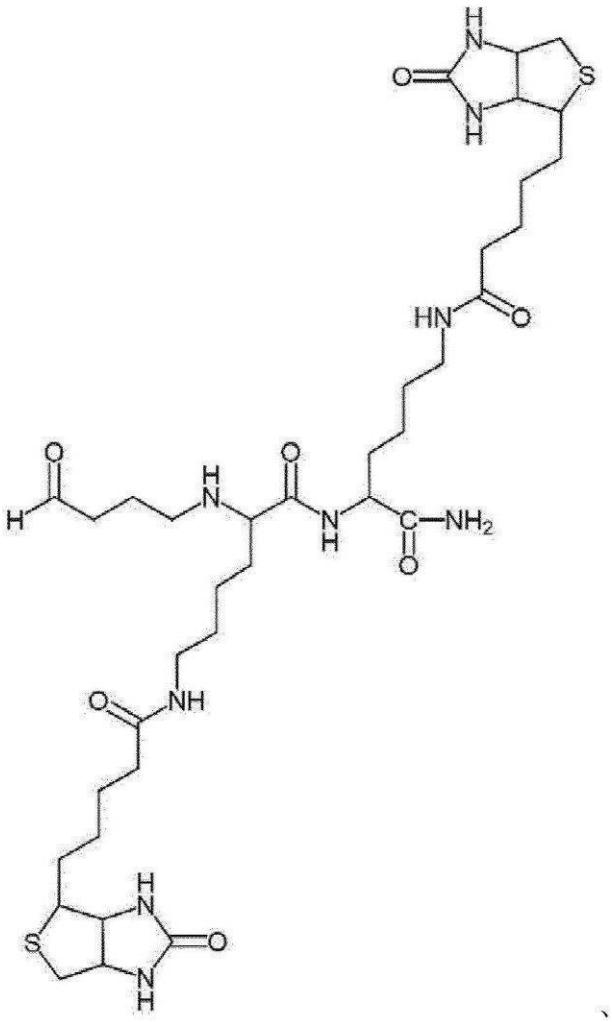
【化２１－１】



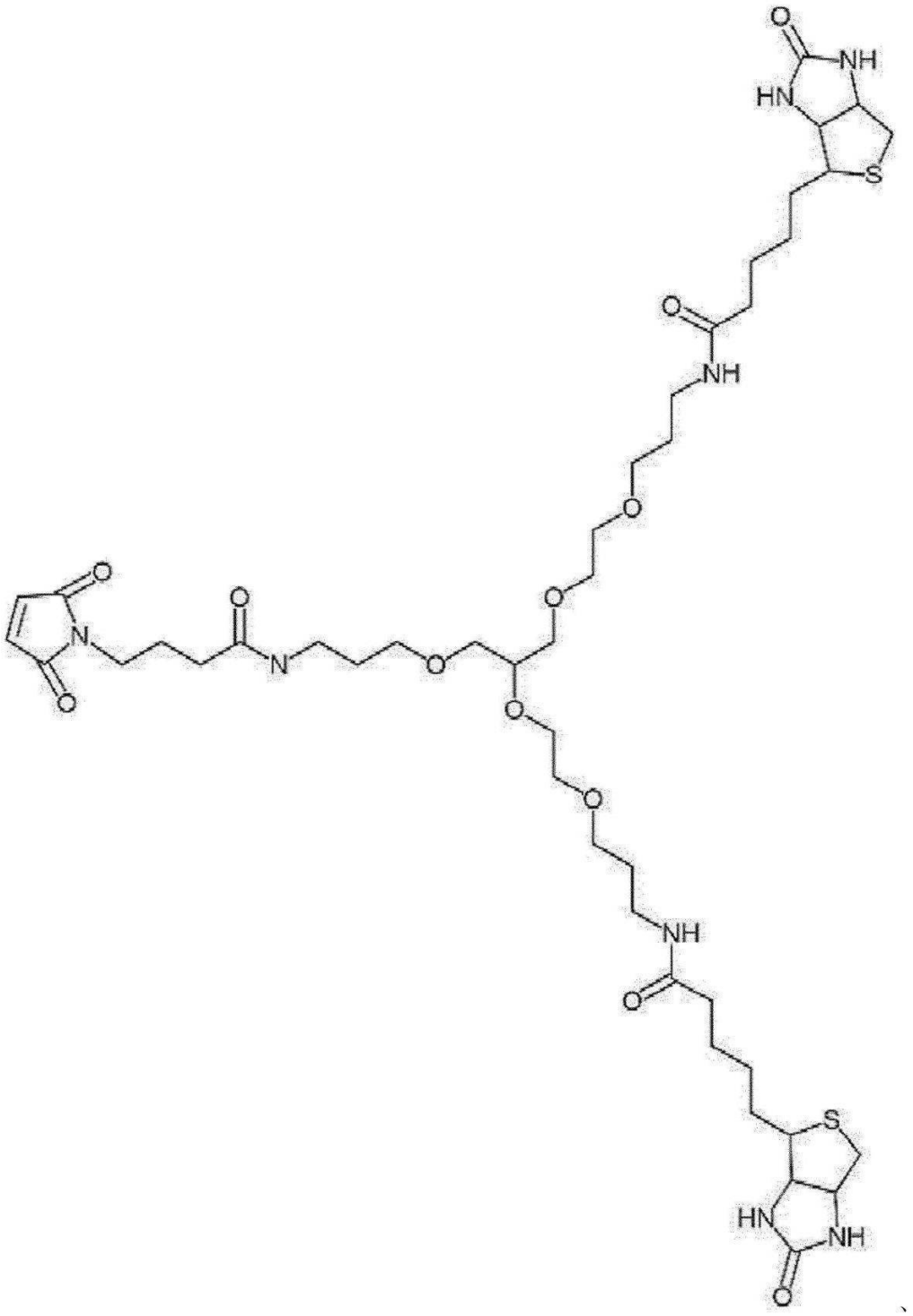
【化２１－２】



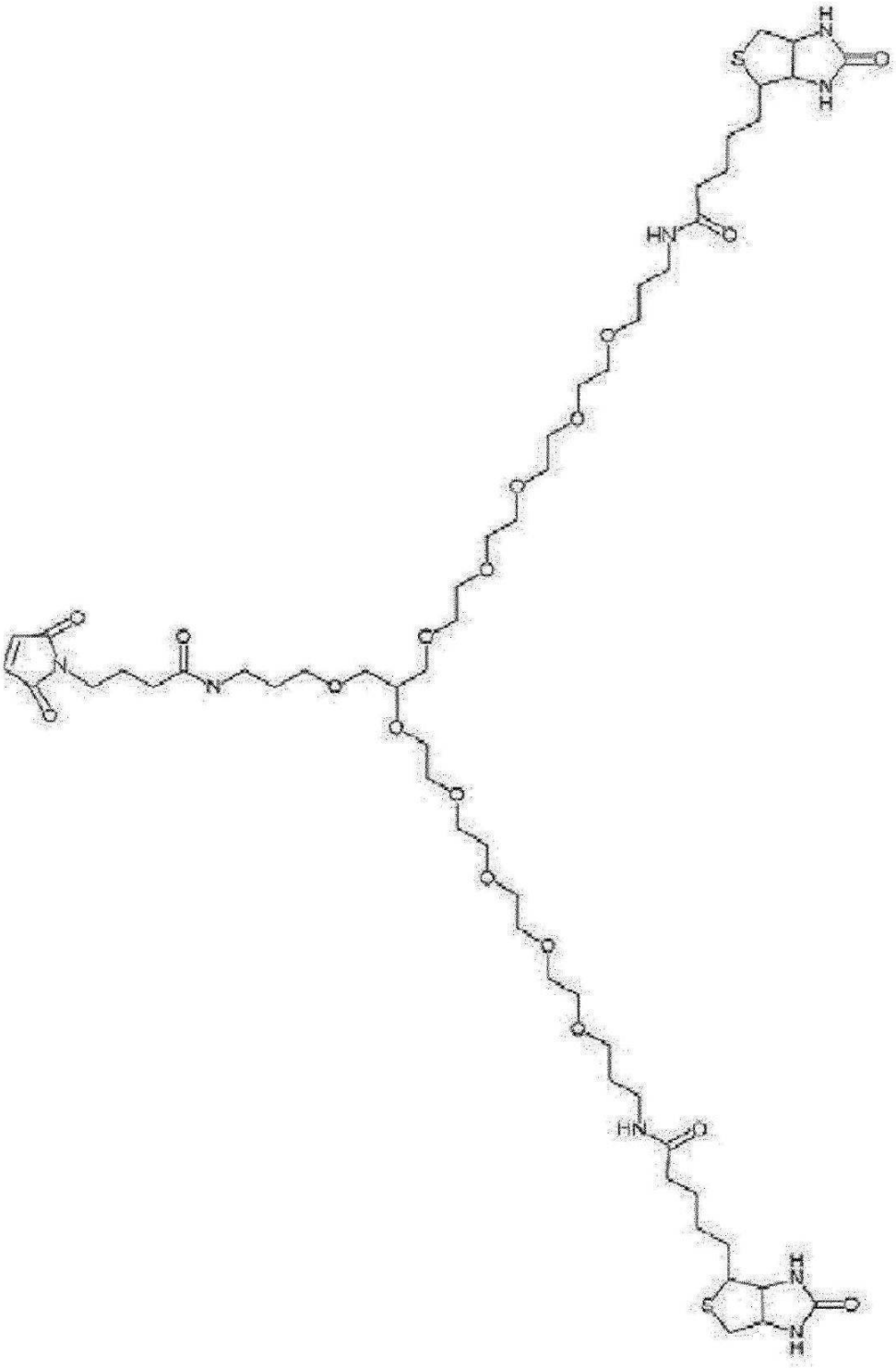
【化２１－３】



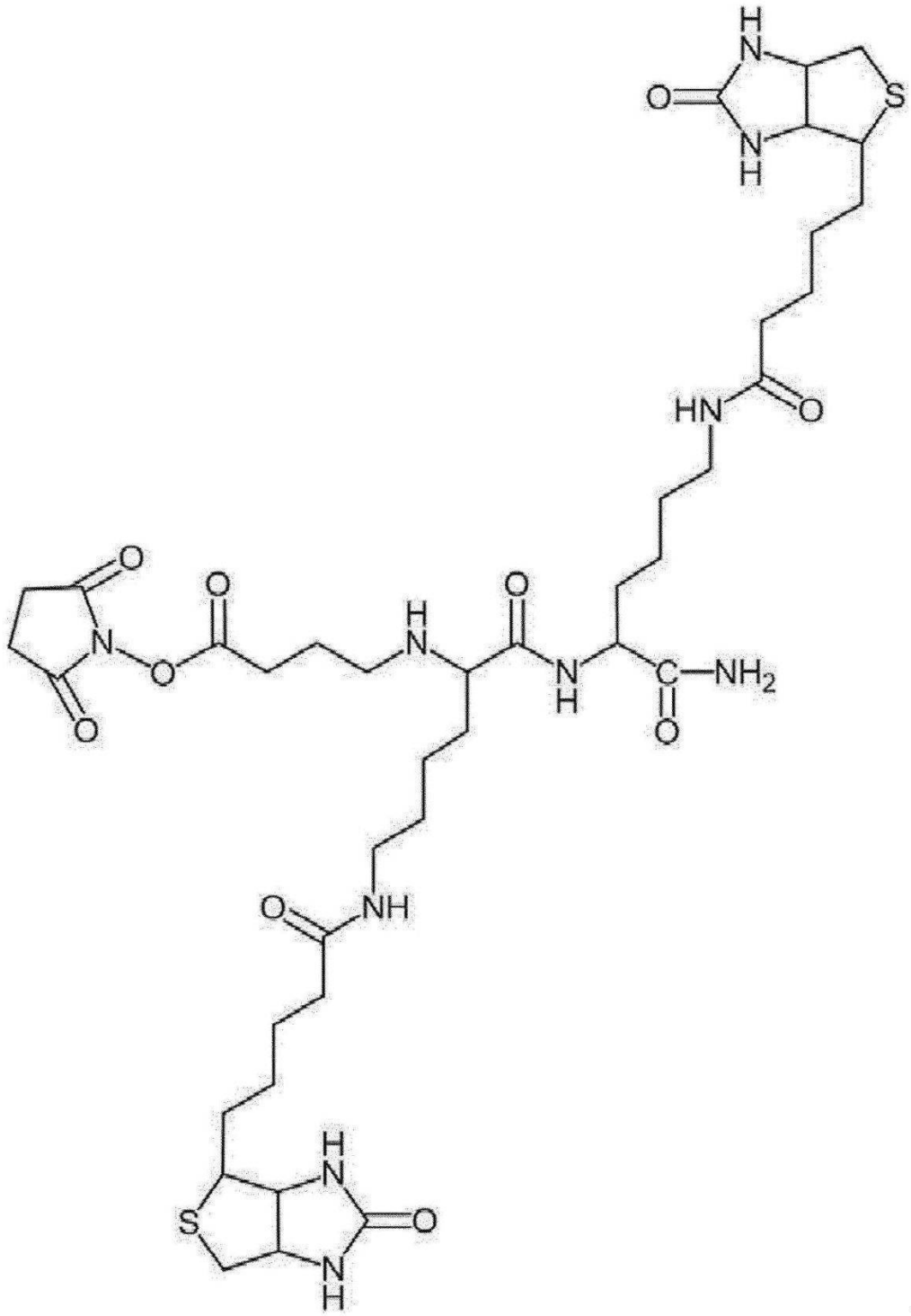
【化２１－４】



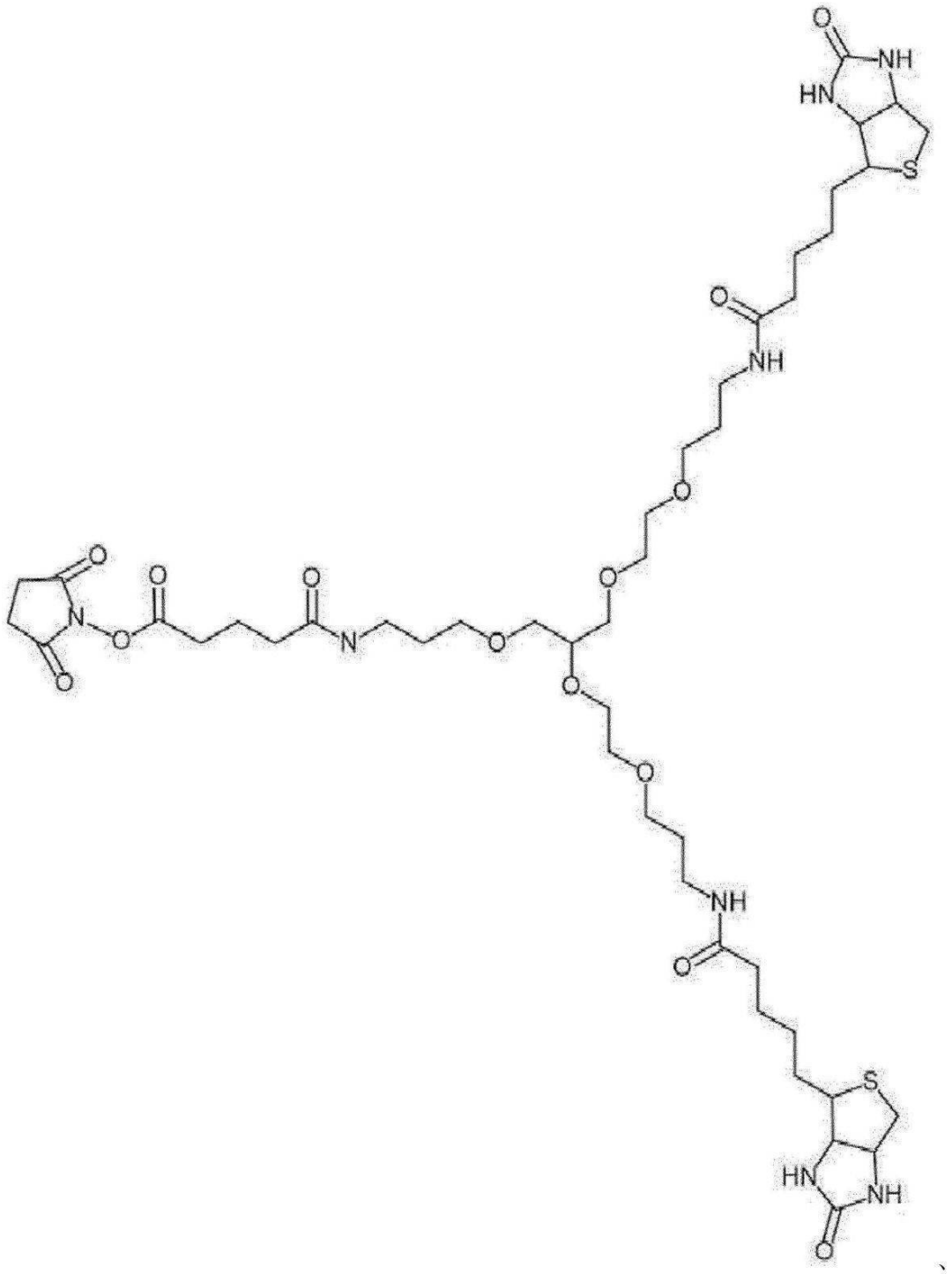
【化２１－５】



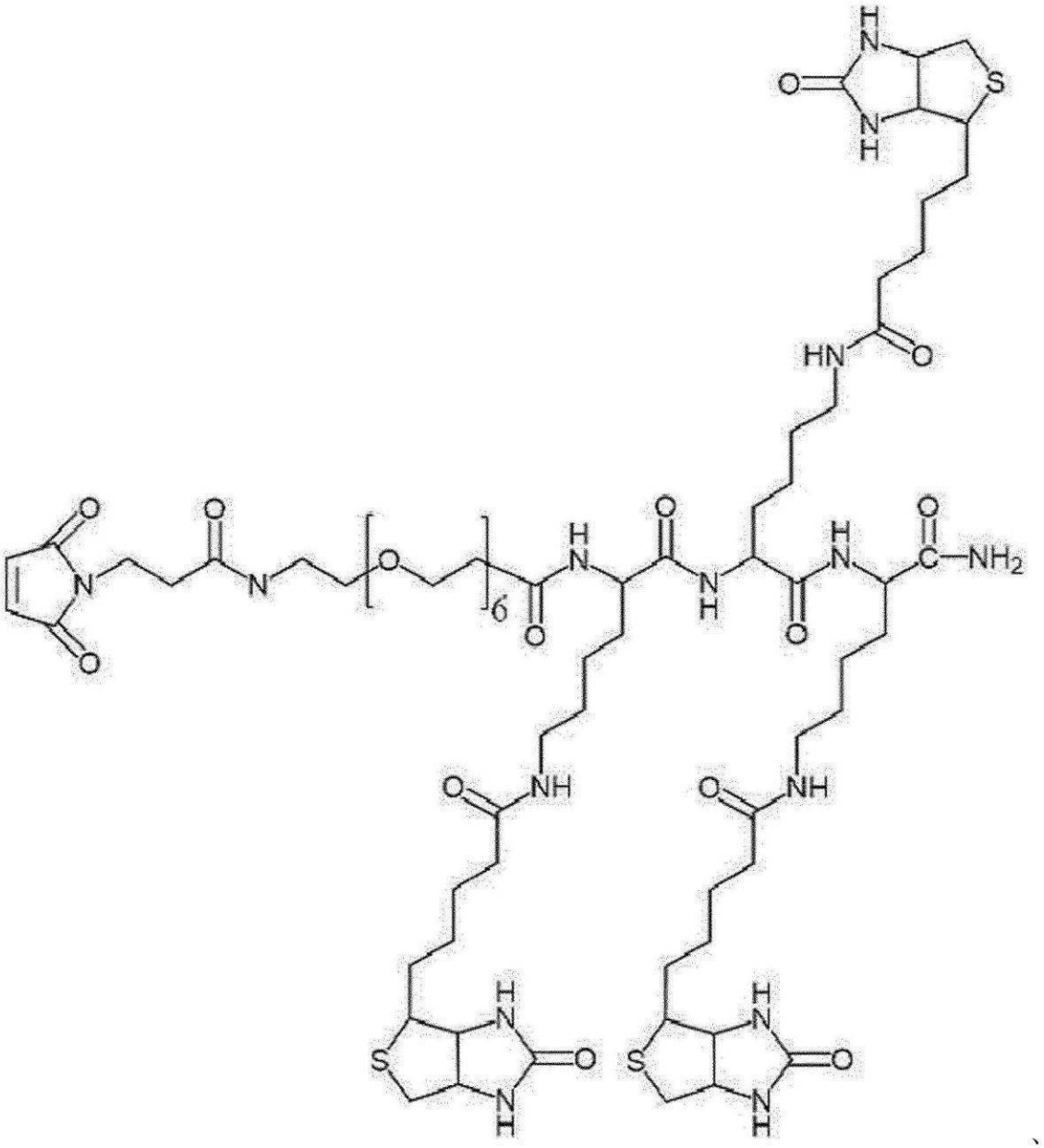
【化２１－６】



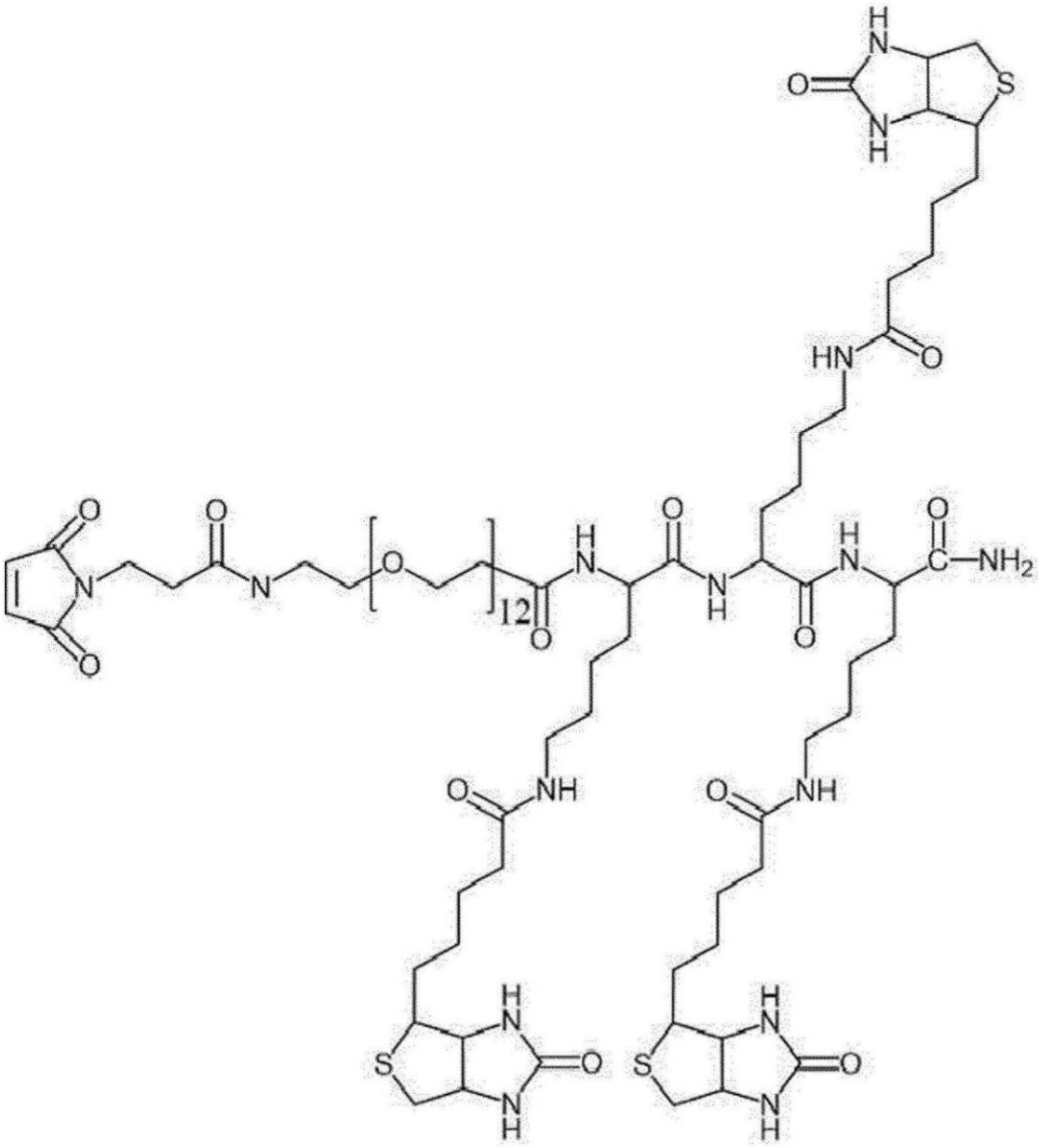
【化２１－７】



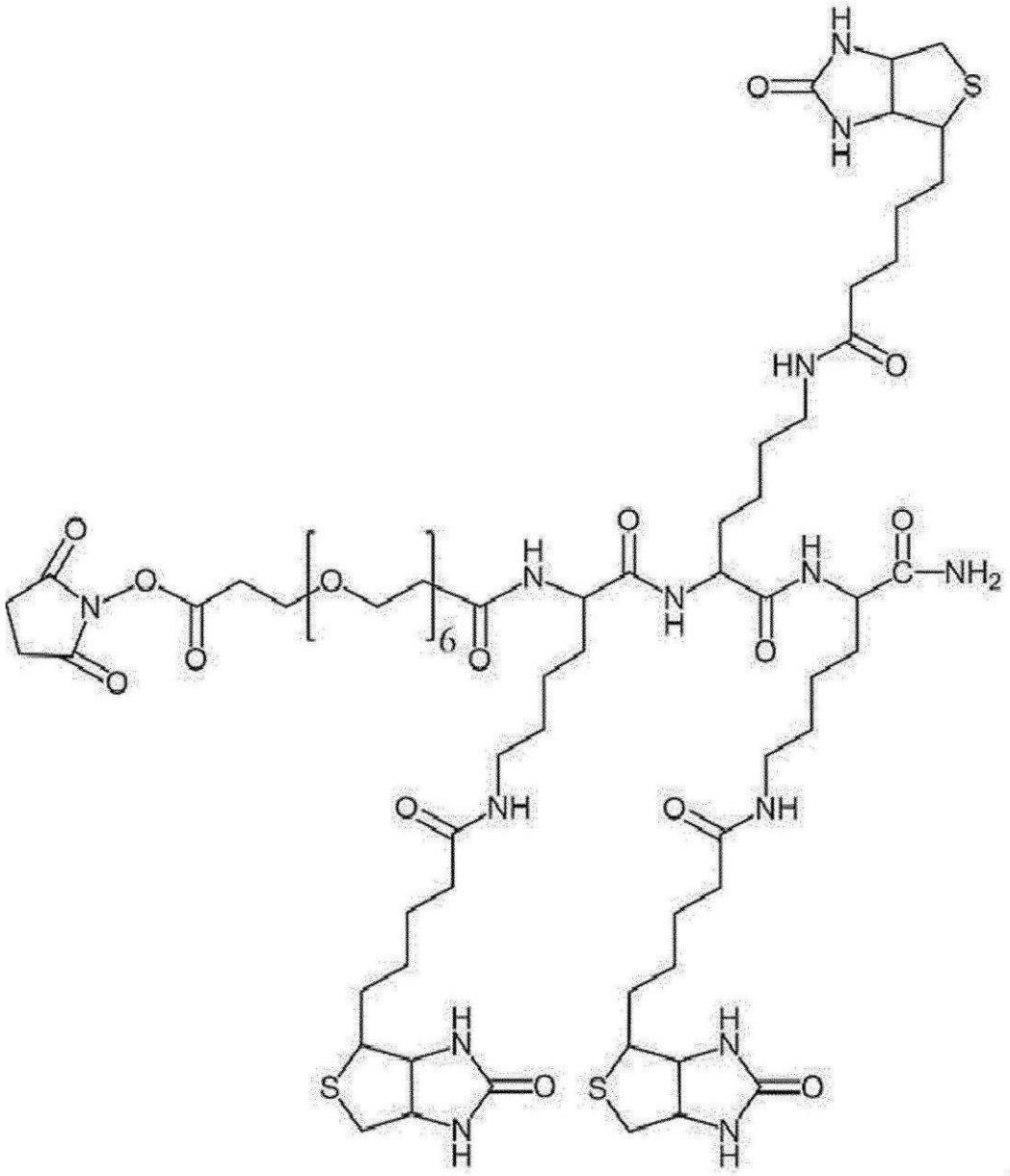
【化２１－８】



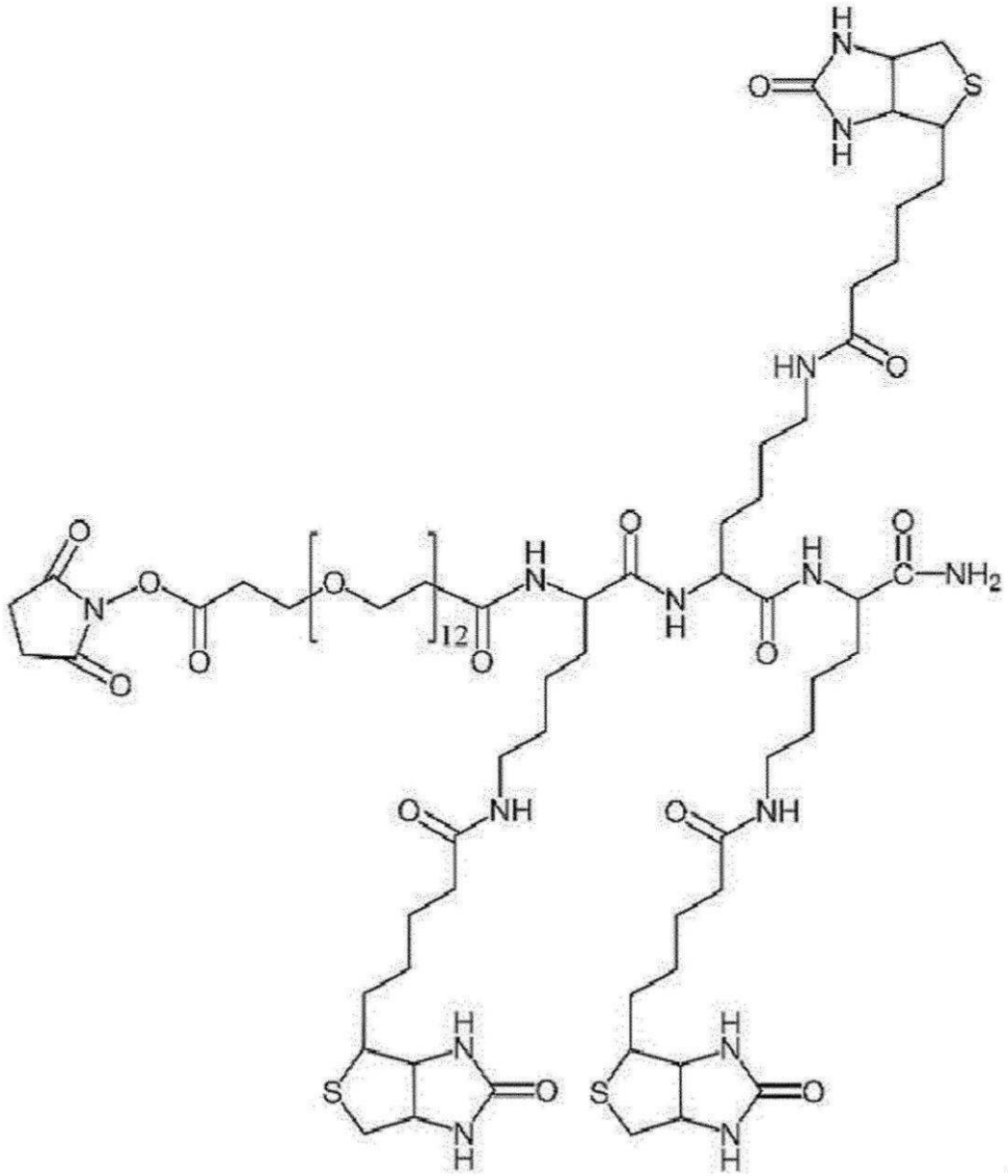
【化２１－９】



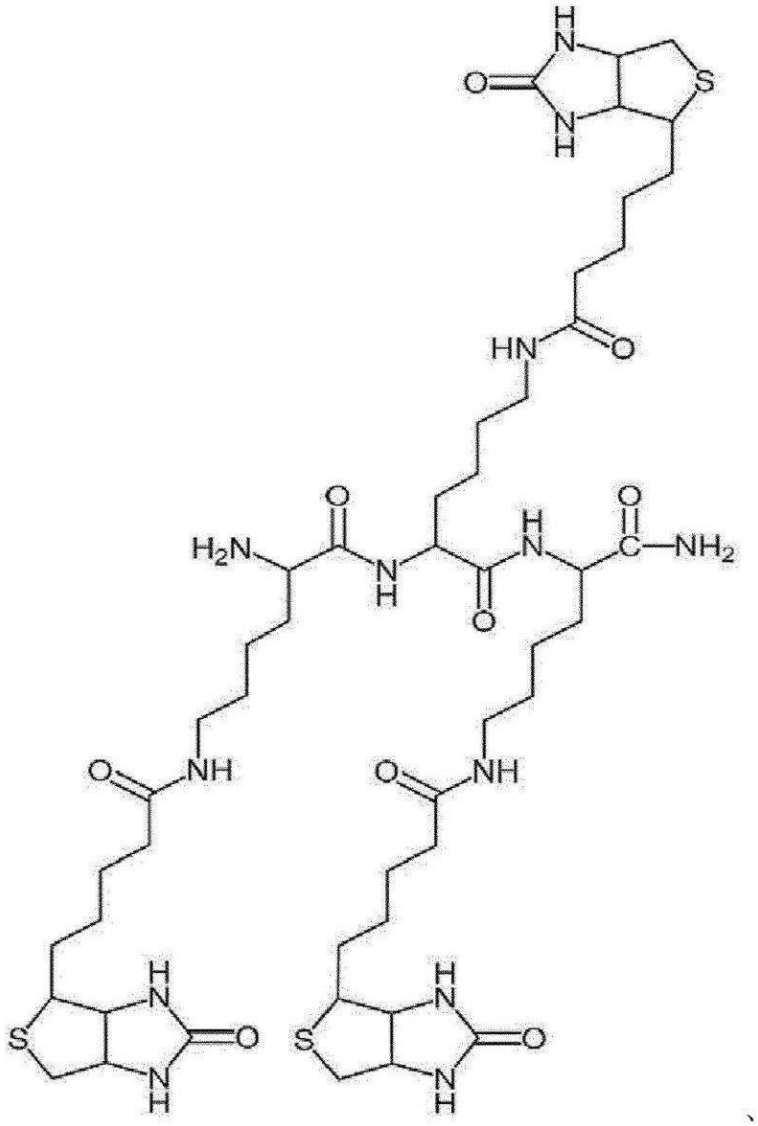
【化２１－１０】



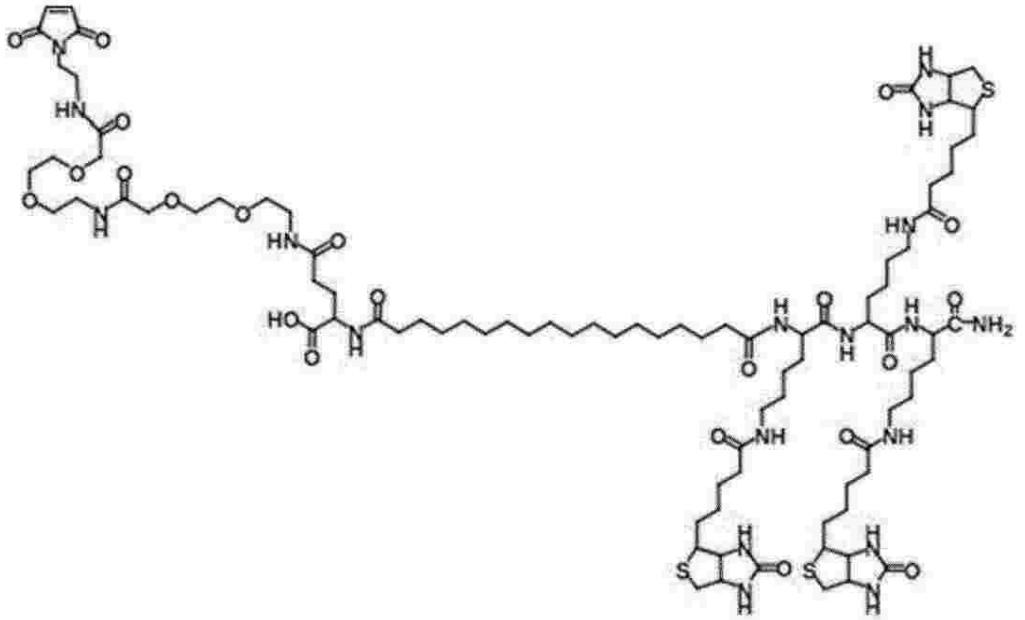
【化２１－１１】

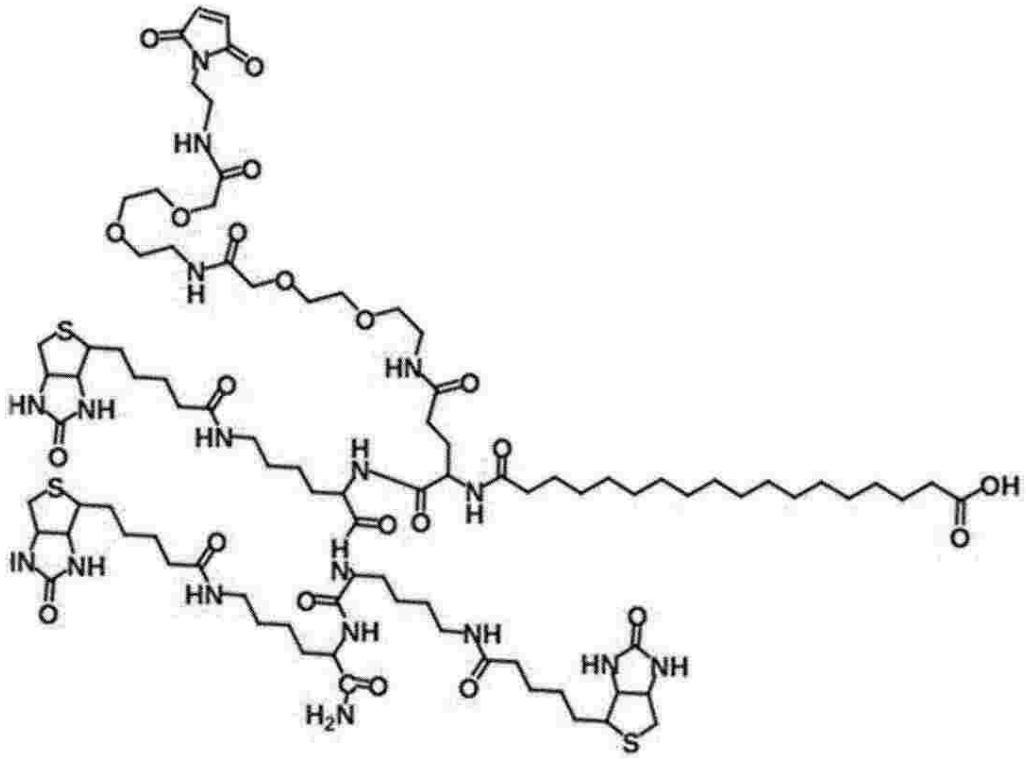


【化２１－１２】

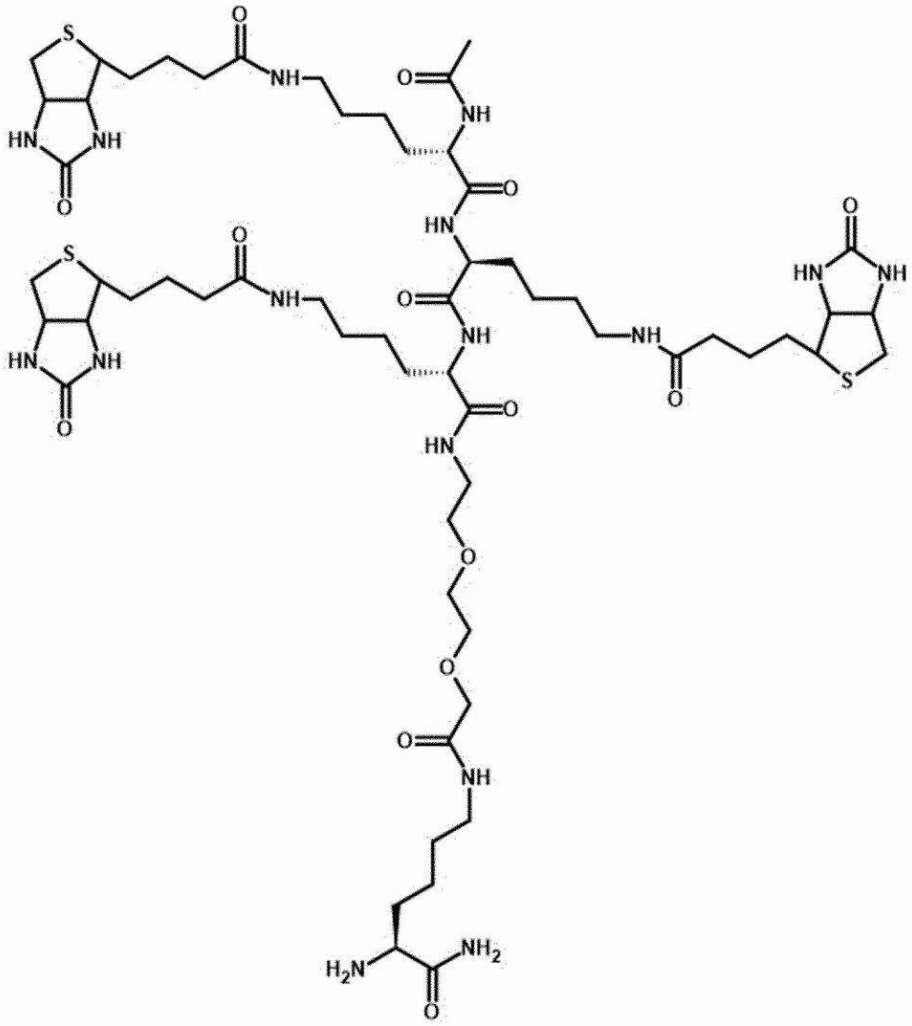


【化２１－１３】

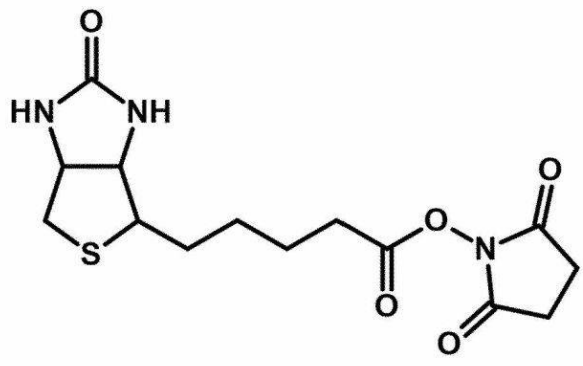




【化２１－１４】



、及び



を含む群から選択される、請求項１に記載の経口医薬製剤。

【請求項１３】

前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、

前記脂肪酸部分が、以下の一般式Ｂ：

［一般式Ｂ］

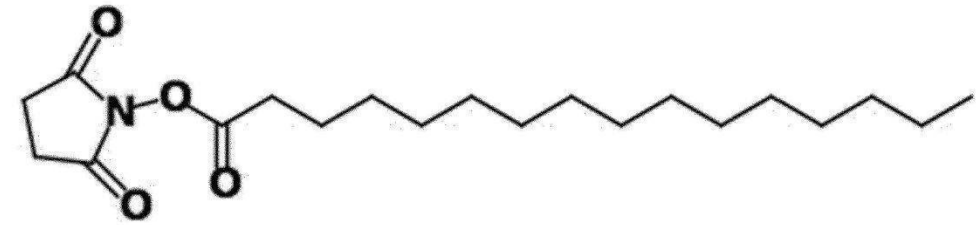
Ｘ’－Ｙ’－Ｗ

〔上記式中、

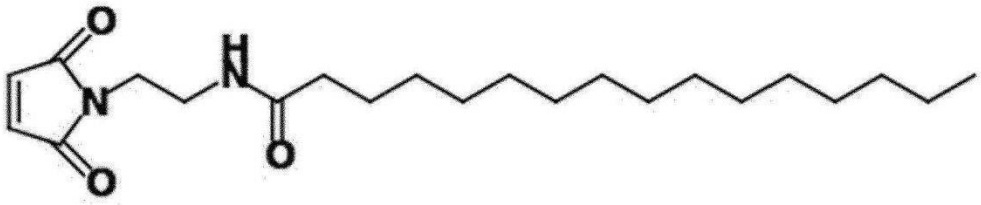
Ｘ’は、前記生理活性物質に結合することができる官能基であり、

Ｙ’はスペーサーであり、
Ｗは脂肪酸である〕
で表される、請求項１に記載の経口医薬製剤。
【請求項１４】
Ｘ’が、
マレイミド、スクシンイミド、Ｎ－ヒドロキシスクシンイミド、コハク酸スクシンイミジル、グルタル酸スクシンイミジル、スクシンイミジル　メチルエステル、スクシンイミジル　ペンチルエステル、炭酸スクシンイミジル、炭酸ｐ－ニトロフェニル、アルデヒド、アミン、チオール、オキシアミン、ヨードアセトアミド、アミノオキシル、ヒドラジド、ヒドロキシ、プロピオネート、ピリジル、アルキルハライド、ビニルスルホン、カルボキシル、ヒドラジド、ハロゲンアセトアミド、C_{2-5}アルキニル、C_{6-20}アリールジスルフィド、C_{5-20}ヘテロアリールジスルフィド、イソシアネート、チオエステル、イミノエステル、テトラフルオロフェニルエステル、炭酸ニトロフェニル、ニトロフェニル、及びその誘導体
を含む群から選択される、請求項１３に記載の生理活性物質結合体。
【請求項１５】
Ｙ’が直接結合であるか、あるいは
Ｙの構造が、
置換もしくは非置換C_{1-50}直鎖状アルキレン、置換もしくは非置換C_{1-50}非直鎖状アルキレン、置換もしくは非置換C_{1-50}直鎖状ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換C_{1-50}非直鎖状ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換C_{1-50}アリーレン、置換もしくは非置換C_{1-50}ヘテロアリーレン、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ－または－ＮＯＲ－
を含む群の少なくとも１つを含み、Ｒが、水素、または非置換C_{1-50}アルキル、置換もしくは非置換C_{1-50}アリール、またはエチレングリコール繰り返し単位（－（CH_2CH_2O）$_n$－、式中、ｎは、少なくとも１であるが２０を上回らない整数である）である、
請求項１３に記載の生理活性物質結合体。
【請求項１６】
Ｙ’が、繰り返し単位として－Ｃ（Ｏ）－（OCH_2CH_2）$_u$－ＮＨ－を含み、ｕが１～２０の整数である、請求項１３に記載の生理活性物質結合体。
【請求項１７】
Ｙ’が、成分としてグルタミン酸、グルタミン、グリシン、イソロイシンまたはリジンを含む、請求項１３に記載の生理活性物質結合体。
【請求項１８】
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記脂肪酸部分が、

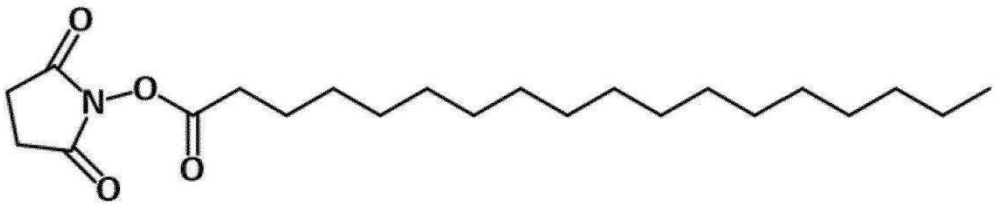
【化２２－１】



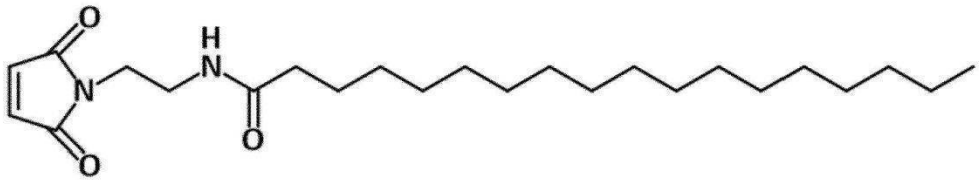
、



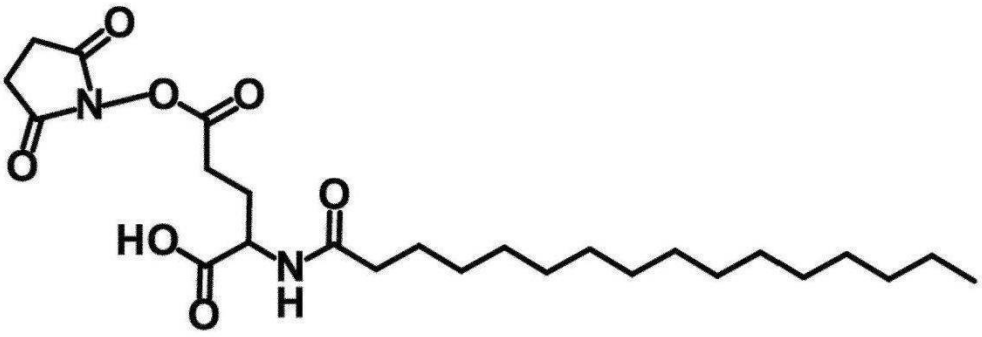
、



、

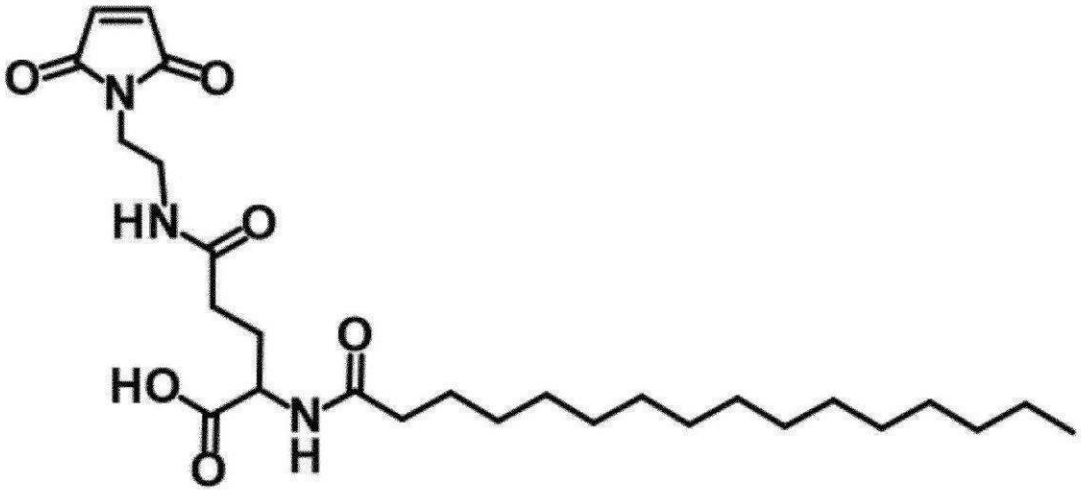


、

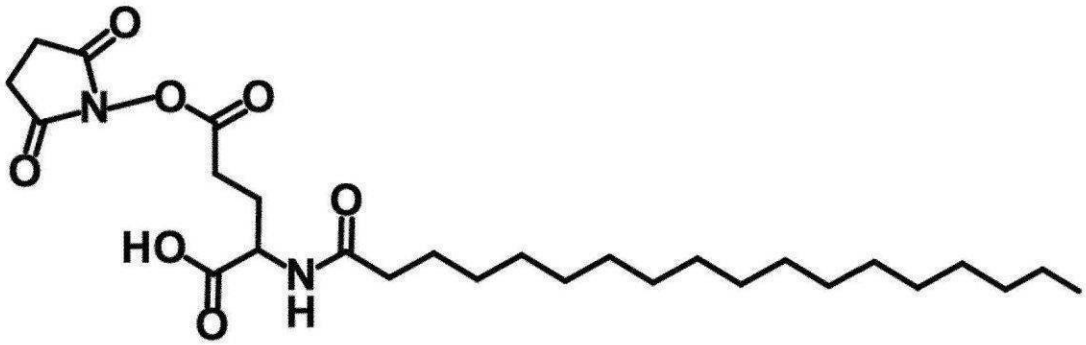


、

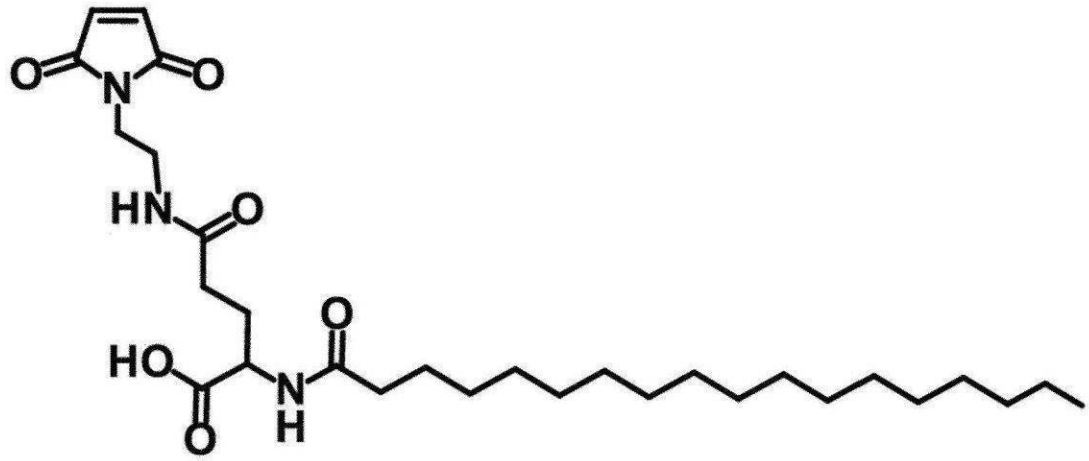
【化２２－２】



、

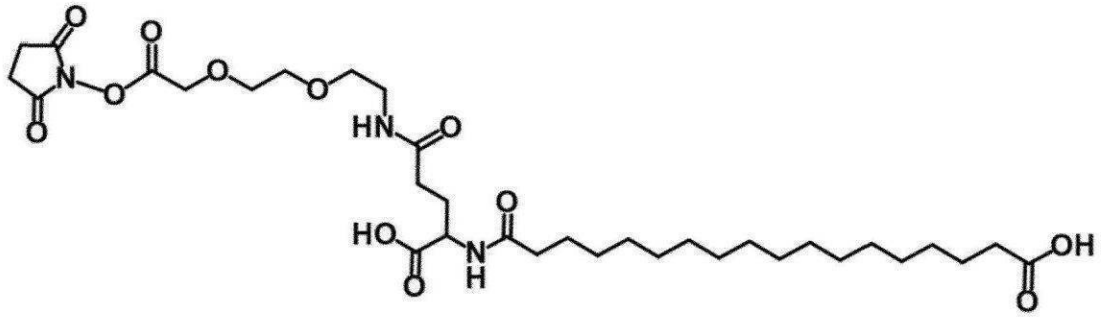


、

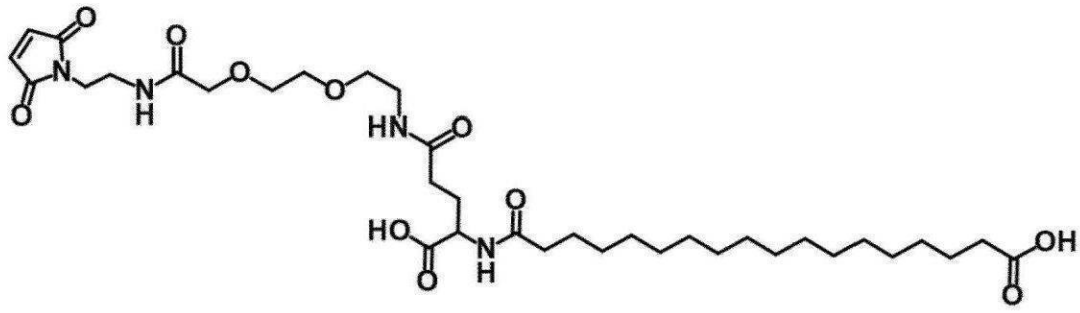


、

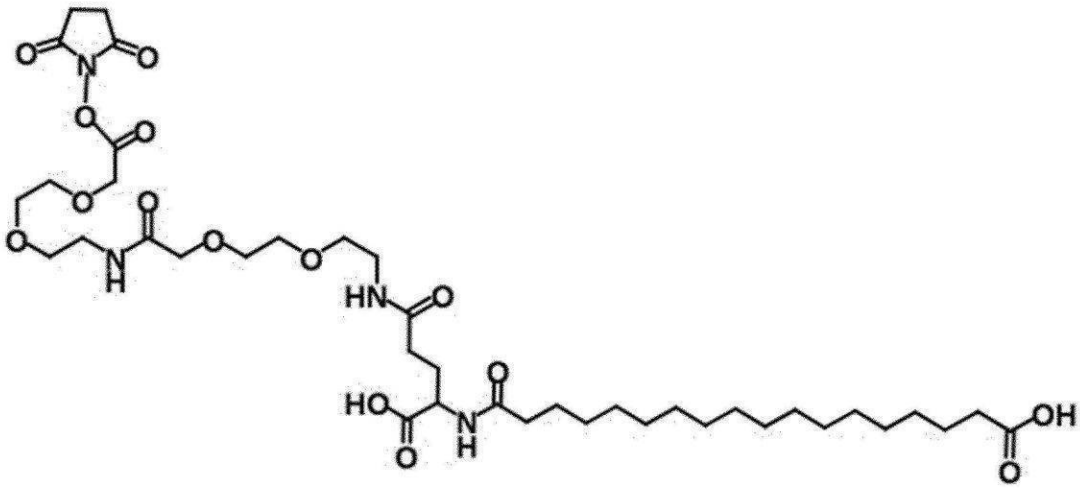
【化２２－３】



、

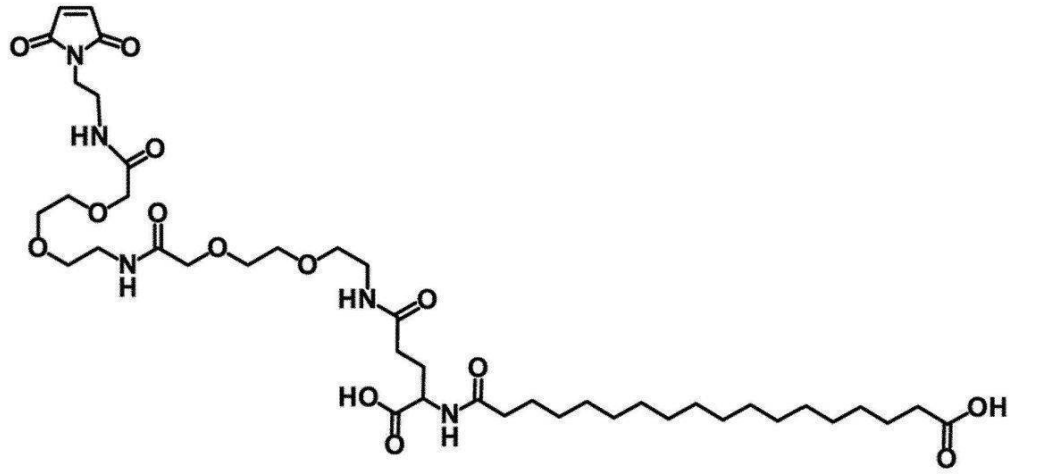


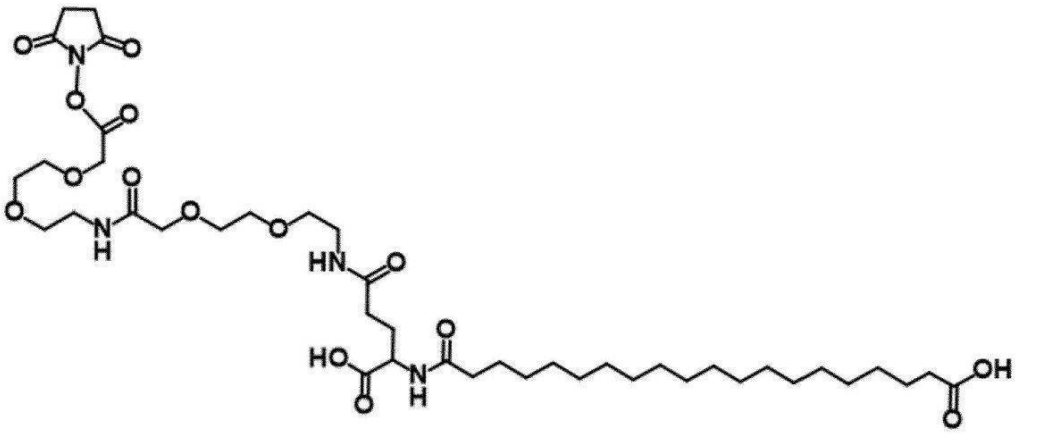
、

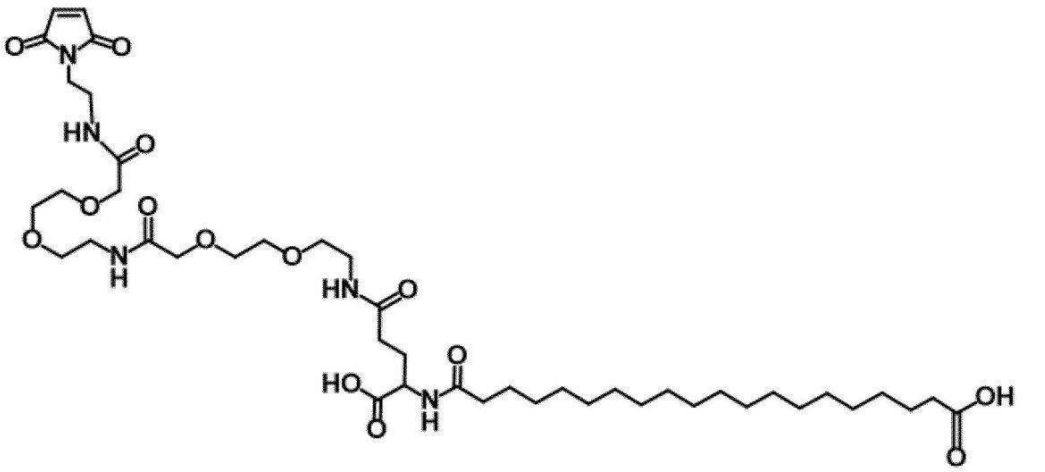


、

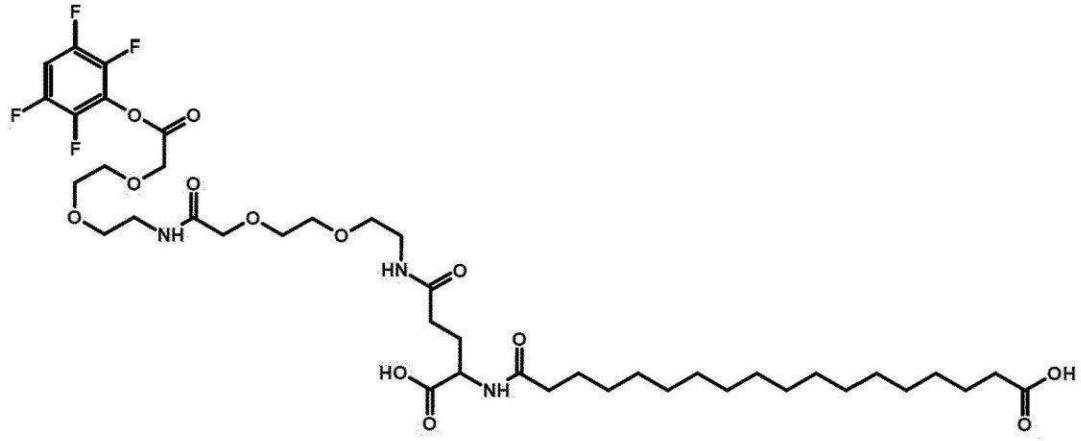
【化２２－４】


、

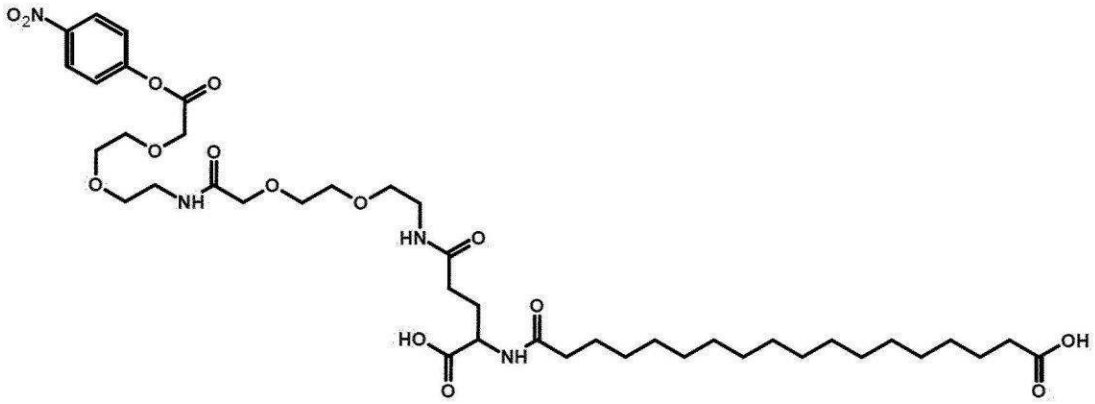

、


、

【化２２－５】



、及び



を含む群から選択される前記経口医薬製剤である、請求項１に記載の経口医薬製剤。

【請求項１９】

前記賦形剤が、胆汁酸、その誘導体、またはその薬学的に許容される塩を含む、請求項１に記載の経口医薬製剤。

【請求項２０】

前記胆汁酸が、

グリココール酸、グリコケノデオキシコール酸、タウロケノデオキシコール酸、タウロコール酸、デオキシコール酸、コール酸、ケノデオキシコール酸、ウルソデオキシコール酸及びリトコール酸

を含む群から選択される少なくとも１つである、請求項１９に記載の経口医薬製剤。

【請求項２１】

前記胆汁酸が、

ケノデオキシコール酸、デオキシコール酸、コール酸、グリココール酸、タウロコール酸及びウルソジオキシコール酸

を含む群から選択される１つである、請求項１９に記載の経口医薬製剤。

【請求項２２】

前記賦形剤が、

アルファ－トコフェロール、リンゴ酸、フマル酸、アスコルビン酸、ブチル化ヒドロキシアニソール、ブチル化ヒドロキシトルエン、リン酸ナトリウム、リン酸カルシウム、リン酸カリウム、ガラクトース、グルコース、マルトース、没食子酸、没食子酸プロピル、及びその薬学的に許容される塩

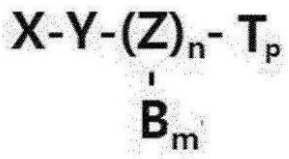
を含む群から選択される少なくとも１つをさらに含む、請求項１９に記載の経口医薬製剤。

【請求項２３】

前記賦形剤が、没食子酸プロピル、またはその薬学的に許容される塩をさらに含む、請求項１９に記載の経口医薬製剤。
【請求項２４】
（ｉ）前記ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した前記生理活性物質と（ｉｉ）前記賦形剤との重量比が１：０．０１～１０００である、請求項１に記載の経口医薬製剤。
【請求項２５】
（ｉ）前記ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した前記生理活性物質と（ｉｉ）前記賦形剤との重量比が１：０．１～５００である、請求項１に記載の経口医薬製剤。
【請求項２６】
前記賦形剤が、胆汁酸、またはその薬学的に許容される塩、および没食子酸プロピル、またはその薬学的に許容される塩を含み、
胆汁酸またはその薬学的に許容される塩と没食子酸プロピルまたはその薬学的に許容される塩との重量比が１：０．０１～８である、
請求項１に記載の経口医薬製剤。
【請求項２７】
前記賦形剤が、
胆汁酸、またはその薬学的に許容される塩、および没食子酸プロピル、またはその薬学的に許容される塩を含み、かつ
１～１０００ｍｇの胆汁酸またはその薬学的に許容される塩、及び
１～１０００ｍｇの没食子酸プロピルまたはその薬学的に許容される塩
を含む、
請求項１に記載の経口医薬製剤。
【誤訳訂正２】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】０２５２
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【０２５２】
［産業上の利用可能性］
本発明の経口製剤は、体内における吸収を効率的に増進し得、したがって、医薬分野において有用に使用され得る。
本発明は、例えば、以下の項目を提供する。
（項目１）
（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体、及び
（ｉｉ）賦形剤
を含む、経口医薬製剤。
（項目２）
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記生理活性物質が、
グルカゴン（グルガコン）、ＧＬＰ－１（グルカゴン様ペプチド－１）、ＧＬＰ－２（グルカゴン様ペプチド－２）、ＧＩＰ（グルコース依存性インスリン分泌刺激ポリペプチド）、エキセンジン－４、インスリン、副甲状腺ホルモン、インターフェロン、エリスロポエチン、カルシトニン、アミリン、セロトニン、リツキシマブ、トラスツズマブ、ウリカーゼ、組織プラスミノゲン活性化因子、サイモグロビン、ワクチン、ヘパリンまたはヘパリン類似体、アンチトロンビンＩＩＩ、フィルグラスチム、酢酸プラムリンチド、エキセナチド、エプチフィバチド、アンチベニン、ＩｇＧ、ＩｇＭ、ＨＧＨ、サイロキシン、第ＶＩＩ及び第ＶＩＩＩ血液凝固因子、治療剤として作用する糖脂質、ならびにその誘

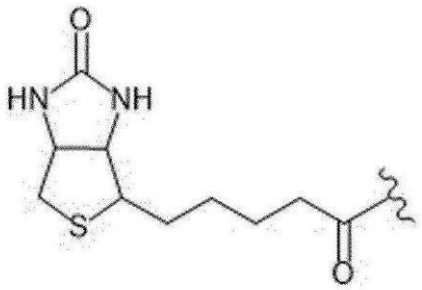
導体
を含む群から選択される、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目３）
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記生理活性物質が、
配列番号１～１４及び配列番号１８～４２で表されるアミノ酸配列からなるポリペプチド、ならびにその誘導体
を含む群から選択される１つである、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目４）
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記生理活性物質が、
配列番号１５及び１６で表されるアミノ酸配列からなるポリペプチドもしくはその誘導体、または配列番号１７及び１６で表されるアミノ酸配列からなるポリペプチドもしくはその誘導体
である、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目５）
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記ビオチン部分が、以下の一般式Ａ：
【化１８】

［式Ａ］



〔上記一般式Ａ中、
Ｘは、生理活性物質に結合することができる官能基であり、
Ｙはスペーサーであり、
Ｚは結合単位であり、
Ｂは、以下の化学式Ａ－１；
【化１９】

［化学式Ａ－１］



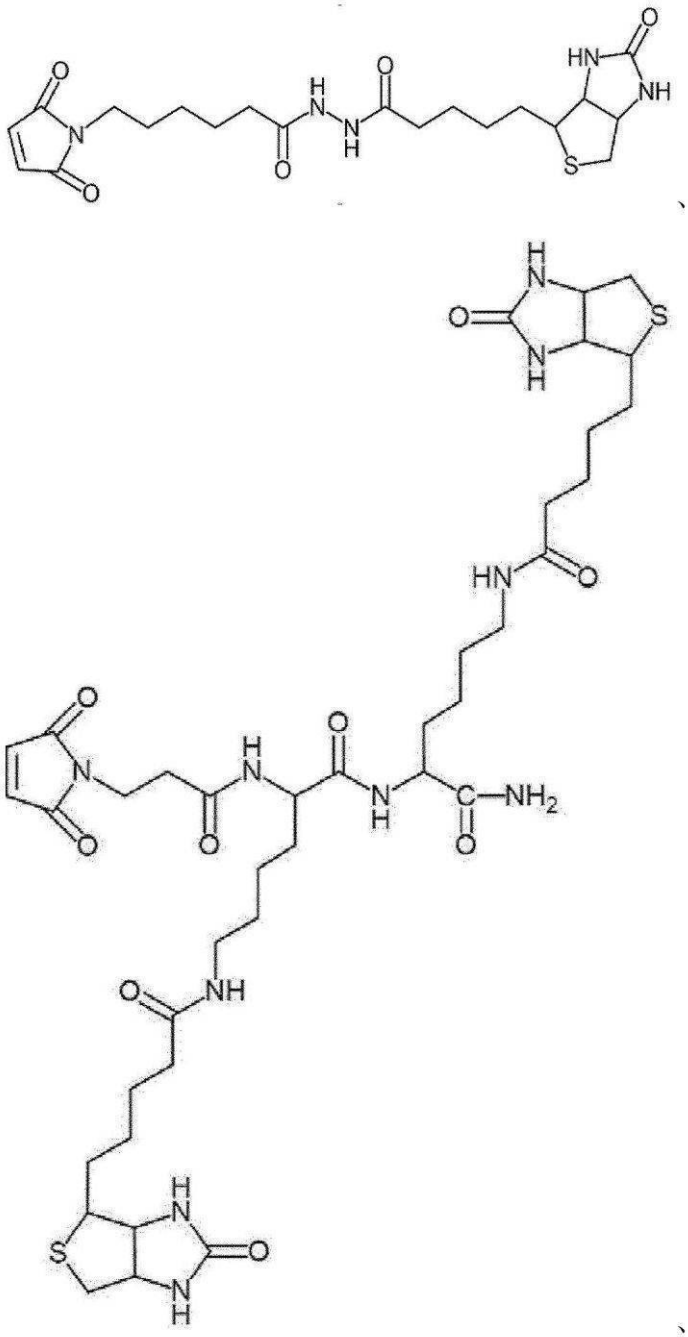
で表され、
Ｚは、化学式Ａ－１の

【化２０】

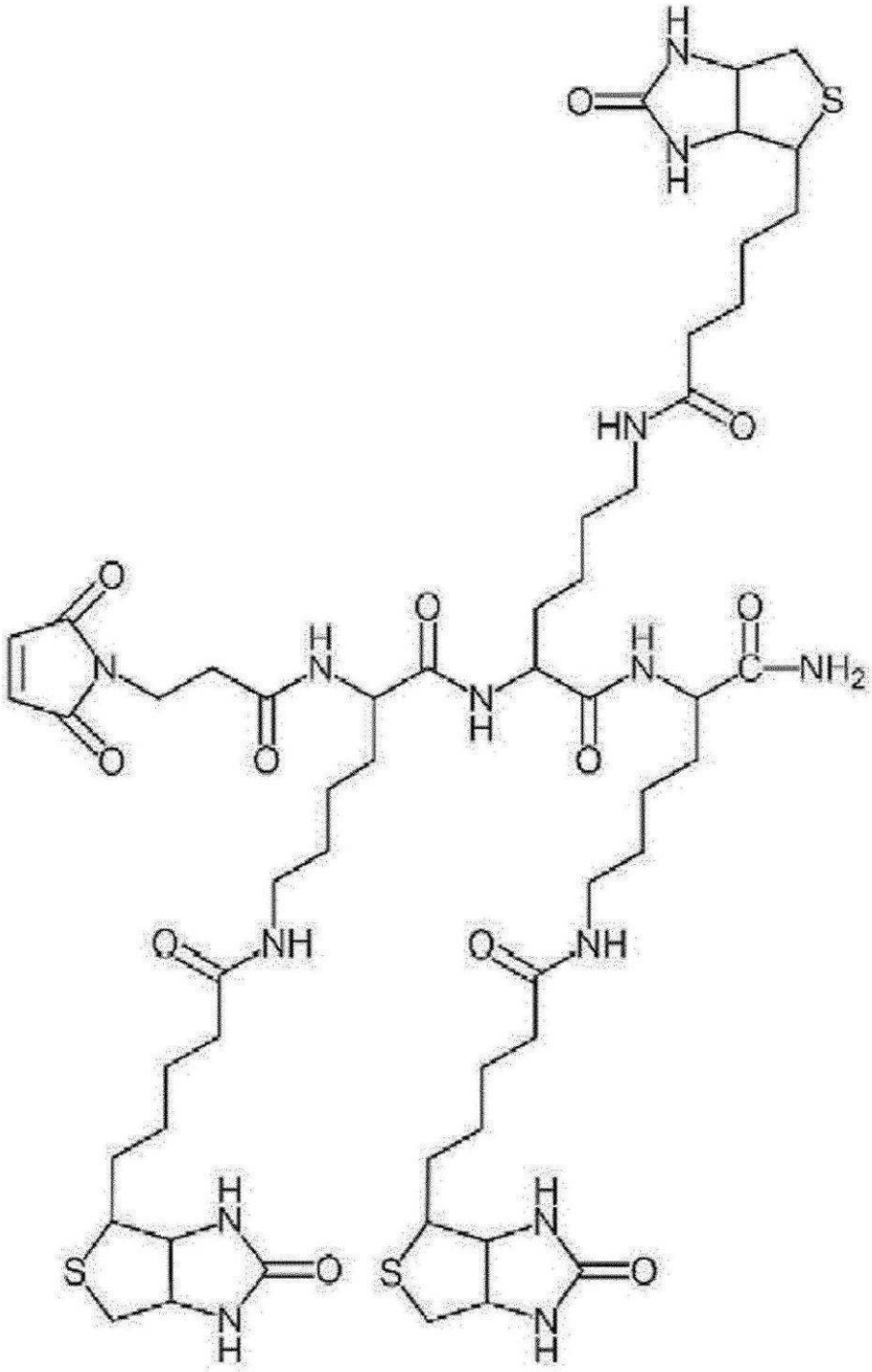


に連結されており、
Ｔは末端基であり、
ｍは１～１０の整数であり、
ｎは０または１～１０の整数であり、ｎ＝０である場合にはＹはＢまたはＴに直接結合しており、
ｐは０または１の整数である〕
で表される、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目６）
Ｘが、
マレイミド、スクシンイミド、Ｎ－ヒドロキシスクシンイミド、コハク酸スクシンイミジル、グルタル酸スクシンイミジル、スクシンイミジル　メチルエステル、スクシンイミジル　ペンチルエステル、炭酸スクシンイミジル、炭酸ｐ－ニトロフェニル、アルデヒド、アミン、チオール、オキシアミン、ヨードアセトアミド、アミノオキシル、ヒドラジド、ヒドロキシ、プロピオネート、ピリジル、アルキルハライド、ビニルスルホン、カルボキシル、ヒドラジド、ハロゲンアセトアミド、C_{2-5}アルキニル、C_{6-20}アリールジスルフィド、C_{5-20}ヘテロアリールジスルフィド、イソシアネート、チオエステル、イミノエステル、及びその誘導体
を含む群から選択される、項目５に記載の経口医薬製剤。
（項目７）
Ｙが、
存在していないか、あるいは
置換もしくは非置換直鎖状もしくは分岐状C_{1-50}アルキレン、置換もしくは非置換直鎖状もしくは分岐状C_{1-50}ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換C_{6-50}アリーレン、または置換もしくは非置換C_{6-50}ヘテロアリーレンであり、
置換されている場合には、＝Ｏ、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、－ＳＨ、＝ＮＨ及び－NH_2を含む群から選択される少なくとも１つを含む、
項目５に記載の経口医薬製剤。
（項目８）
Ｙが、繰り返し単位として－Ｃ（Ｏ）－（$OCH_2CH_2)_u$－ＮＨ－を含み、ｕが１～２０の整数である、項目５に記載の経口医薬製剤。
（項目９）
Ｙが、成分としてグルタミン酸、グルタミン、グリシン、イソロイシンまたはリジンを含む、項目５に記載の経口医薬製剤。
（項目１０）
Ｚが、各々独立して選択され得る以下：
Ａ）Ｘと一緒に、またはＸとは別個に、アミノ酸またはその誘導体を形成している；
Ｂ）置換または非置換直鎖状または分岐状C_{1-50}ヘテロアルキレン（ｈｅｔｅｒｏａｌｋｙｅｎｅ）であり、
置換されている場合には、＝Ｏ、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、－ＳＨ、＝ＮＨ及び－NH_2を含む群から選択される少なくとも１つを含む、
のいずれか１つである、項目５に記載の経口医薬製剤。
（項目１１）
Ｔが、
アミン、C_{1-8}アルキル、C_{1-8}アルケニル、ハロ、ヒドロキシ、チオール、スルホン酸、カルボキシル、フェニル、ベンジル、アルデヒド、アジド、シアネート、イソシアネート、チオシアネート、イソチオシアネート、ニトリル及びホスホン酸

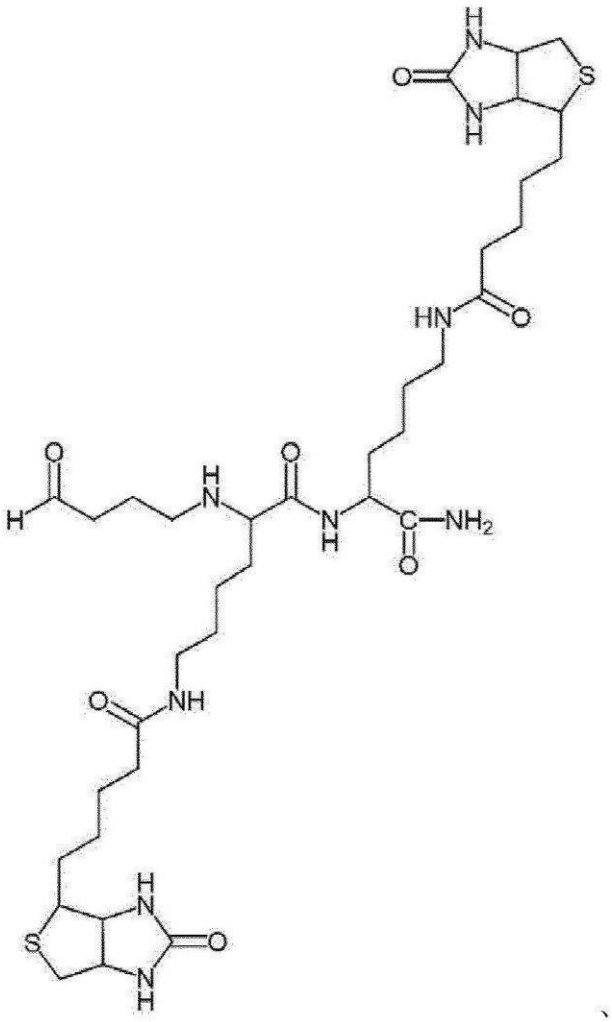
を含む群から選択される、項目５に記載の経口医薬製剤。
（項目１２）
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記ビオチン部分が、
【化２１－１】



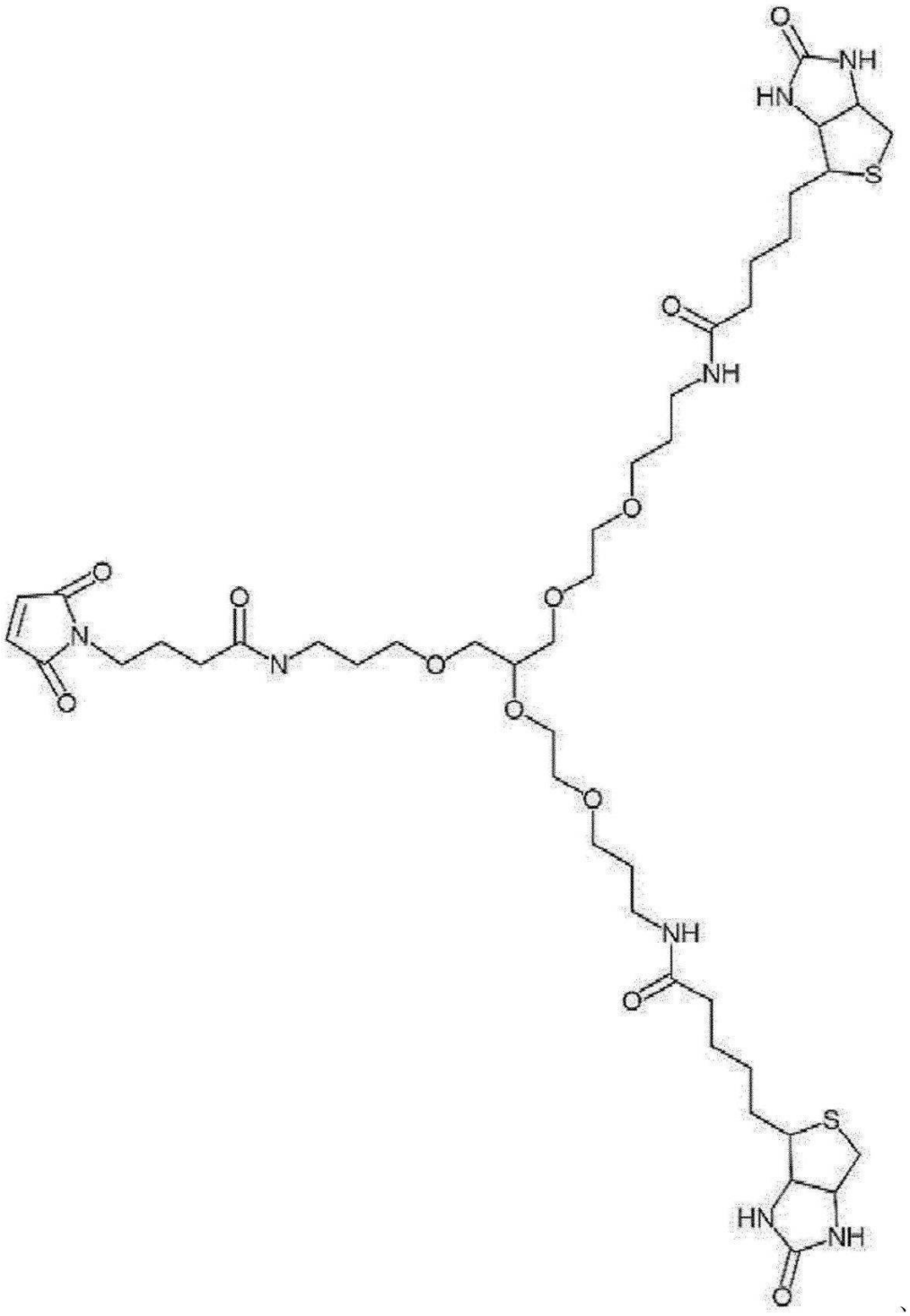
【化２１－２】



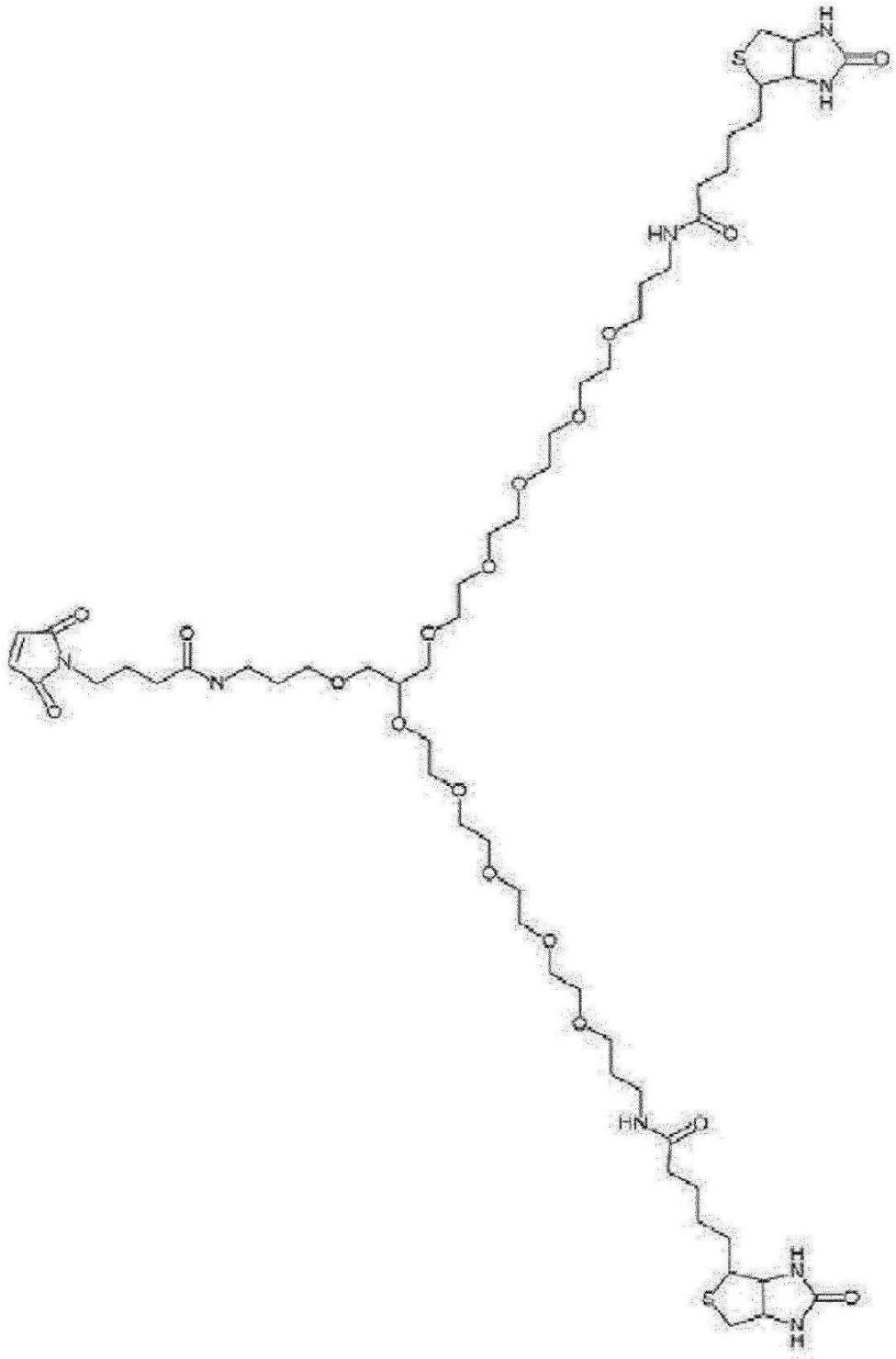
【化２１－３】



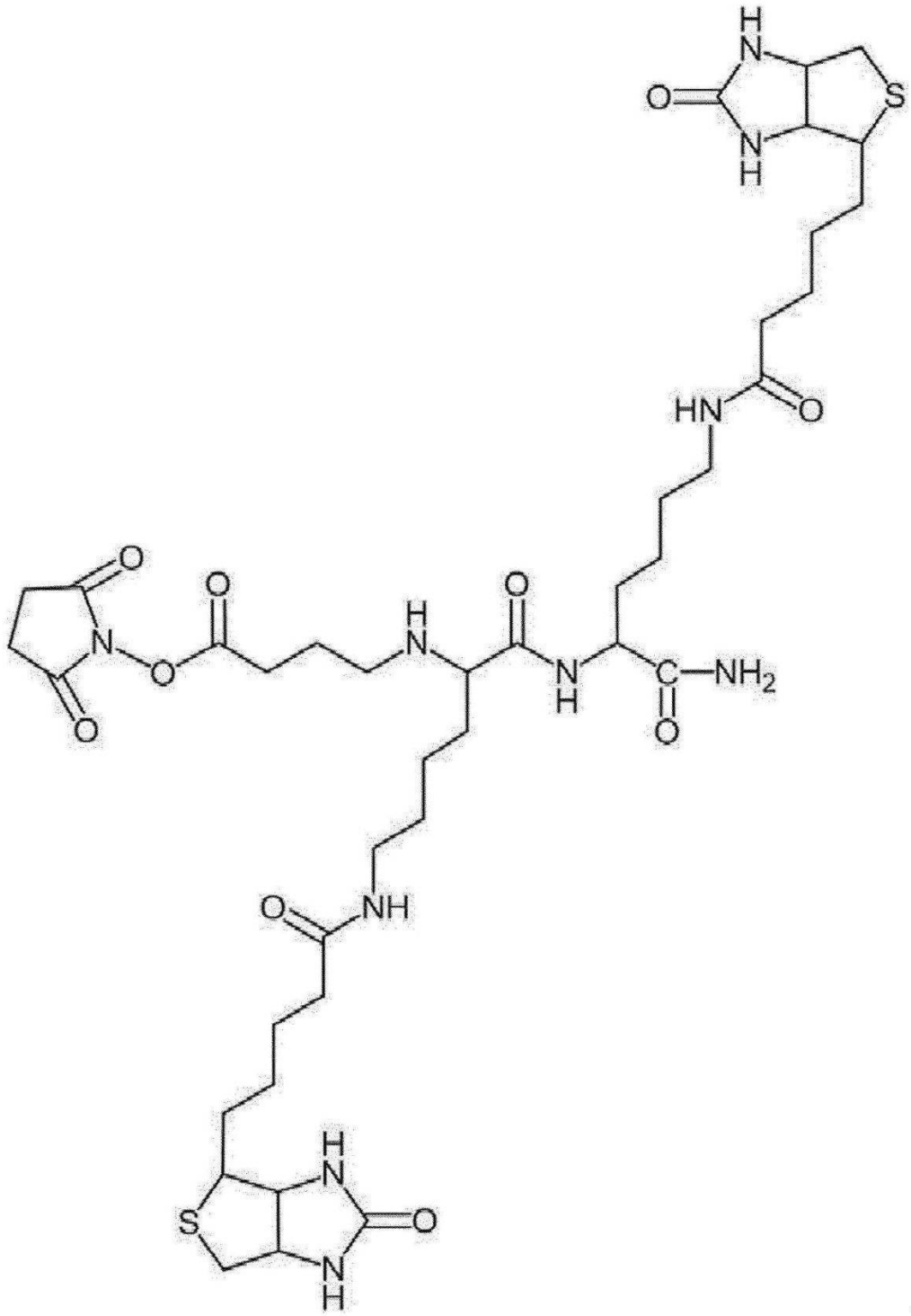
【化２１－４】



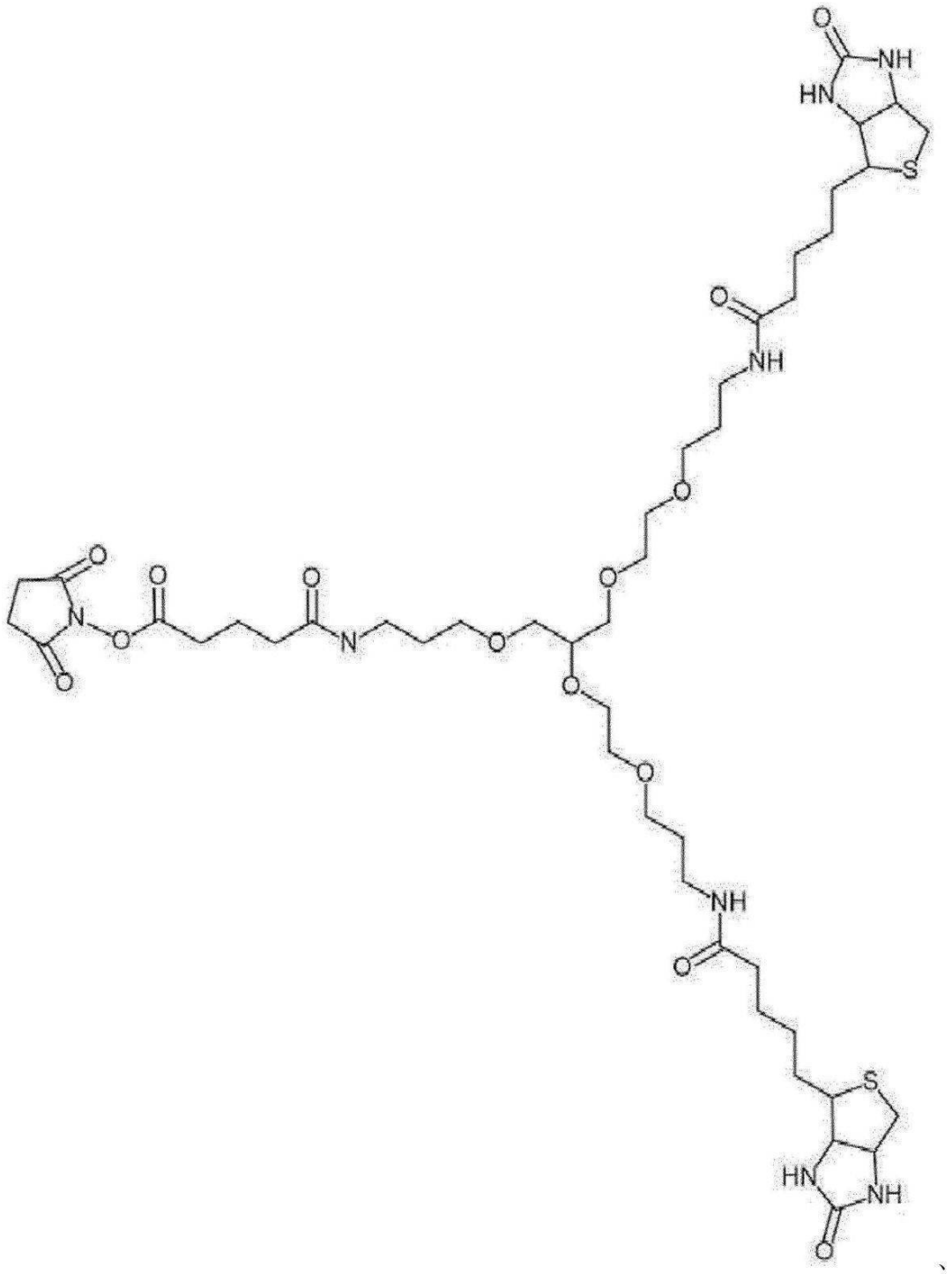
【化２１－５】



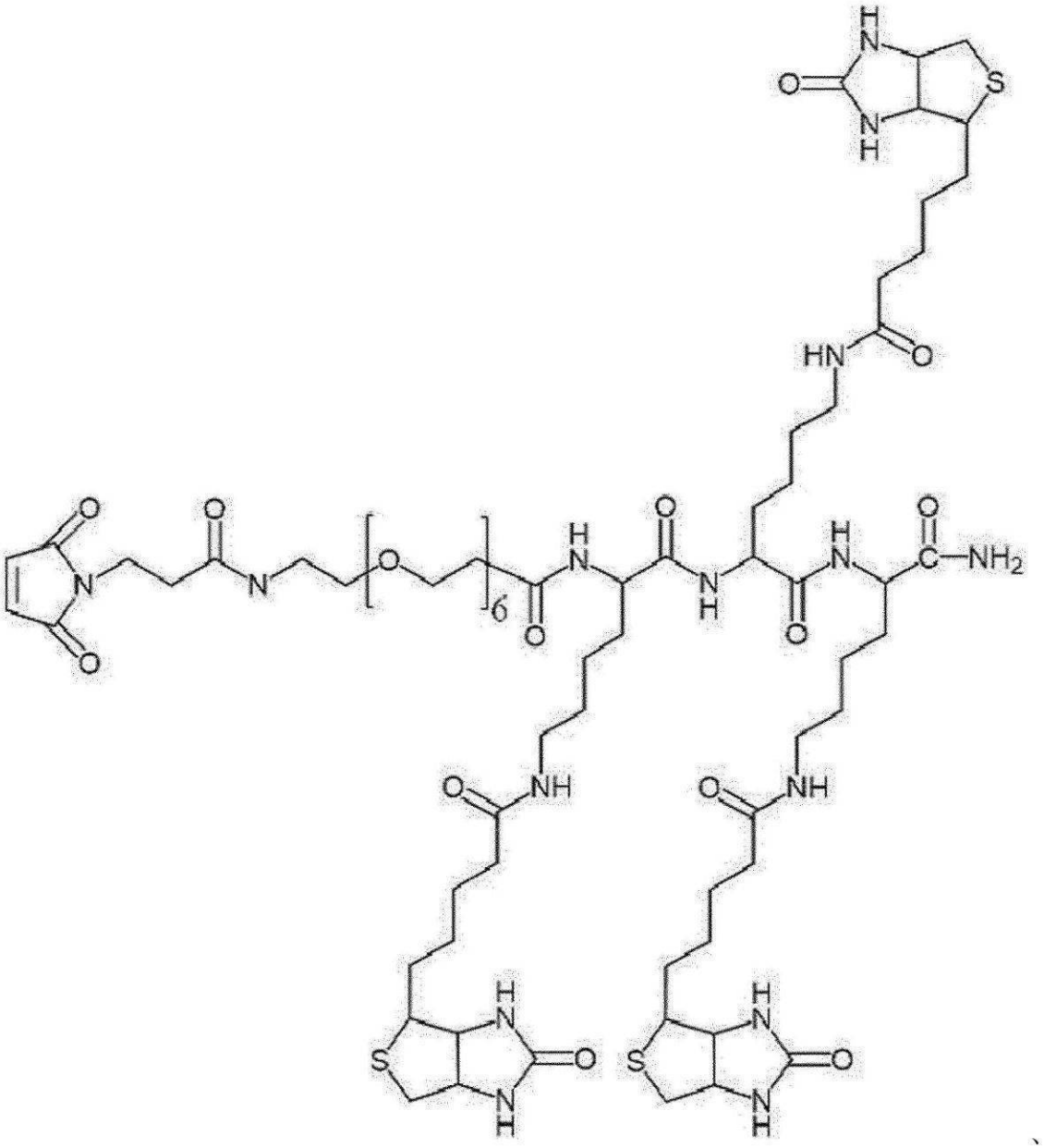
【化２１－６】



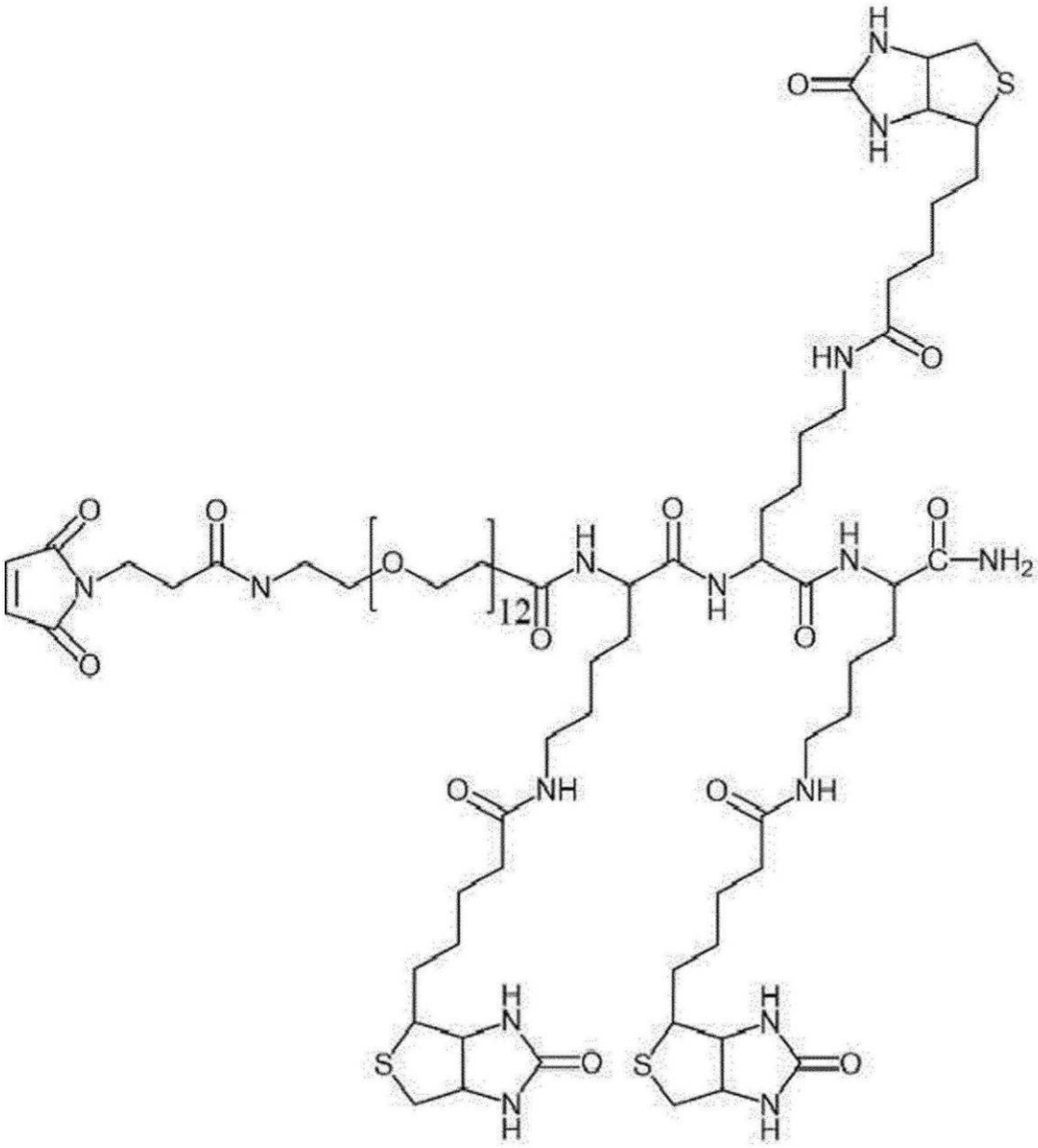
【化２１－７】



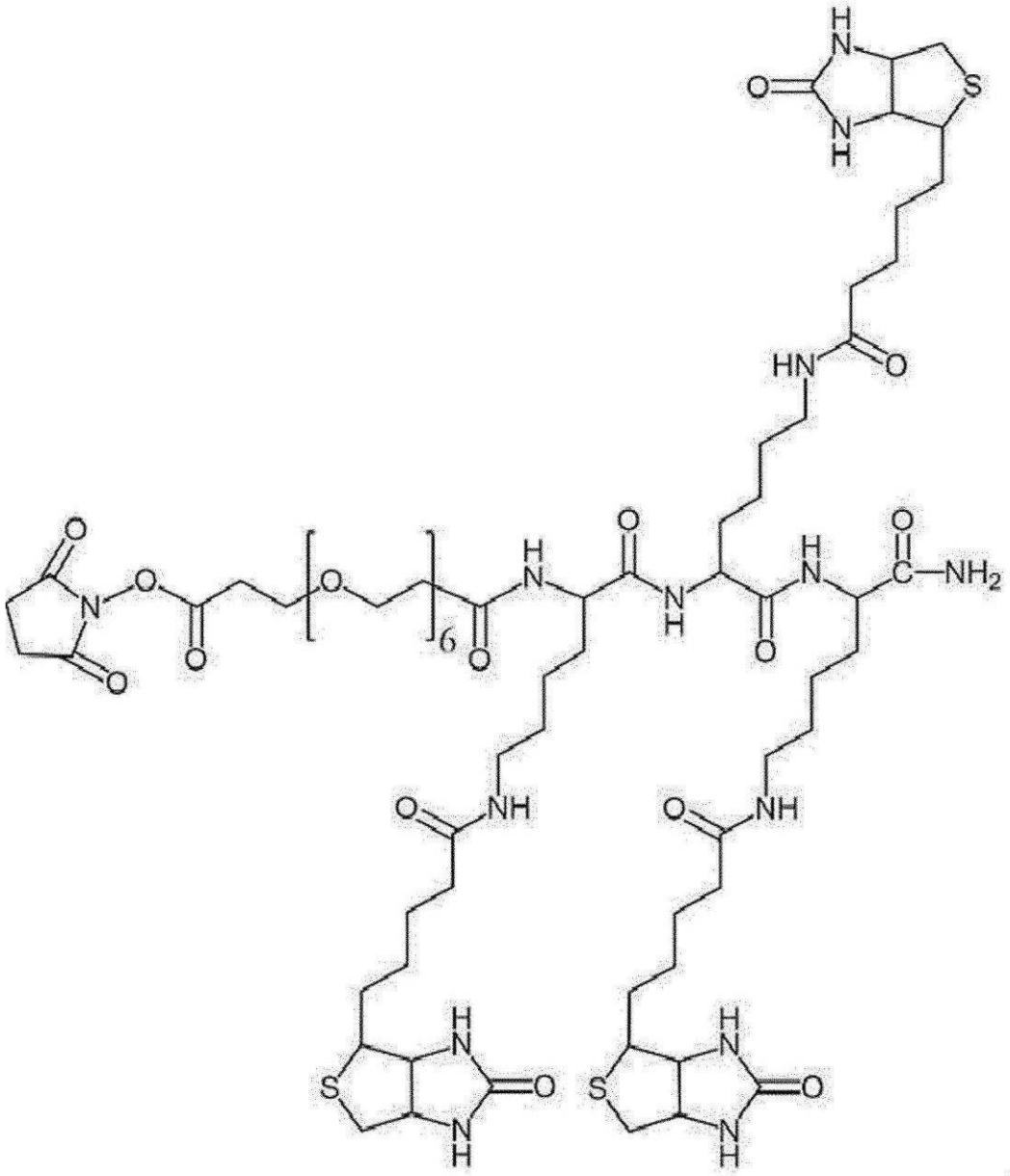
【化２１－８】



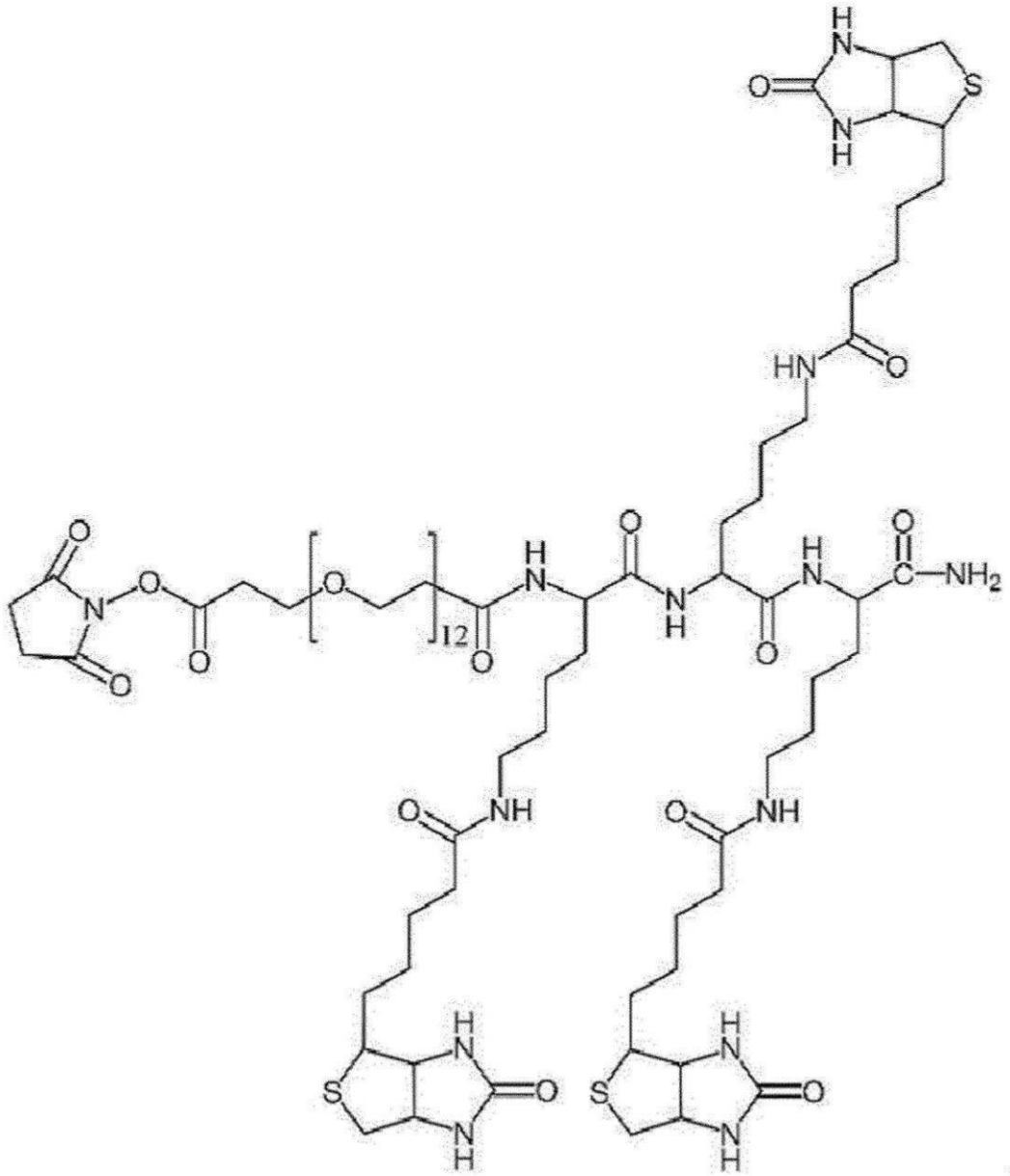
【化２１－９】



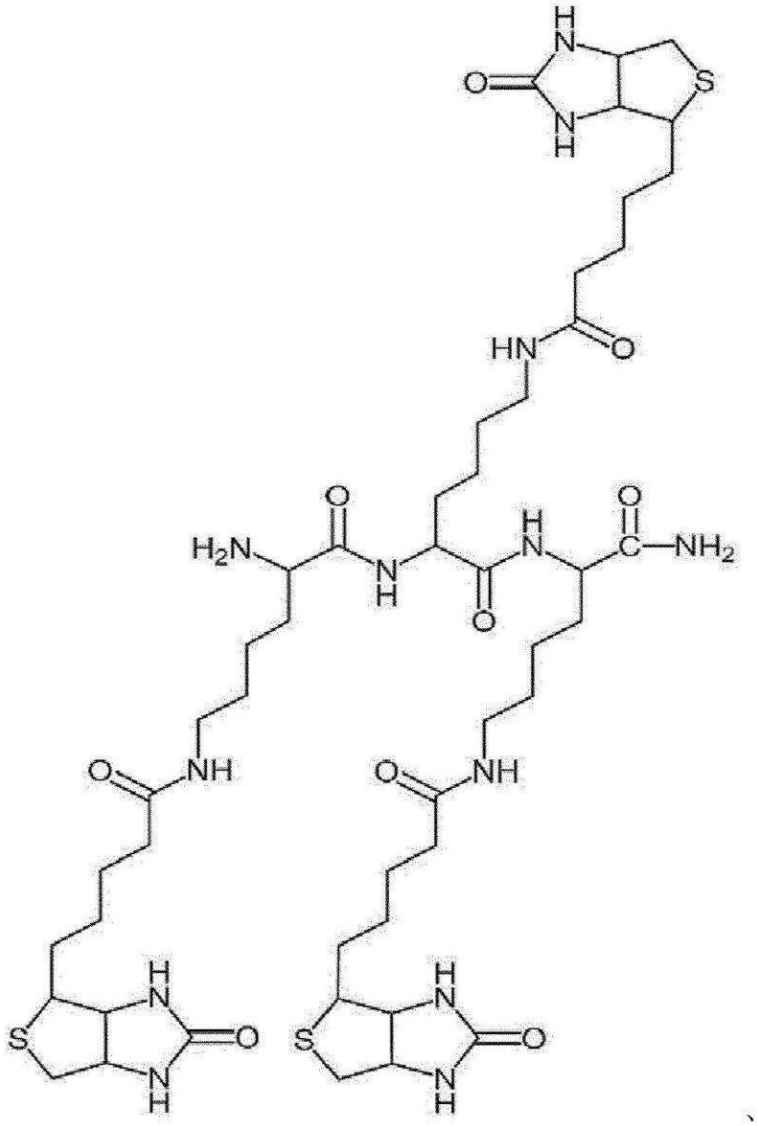
【化２１－１０】



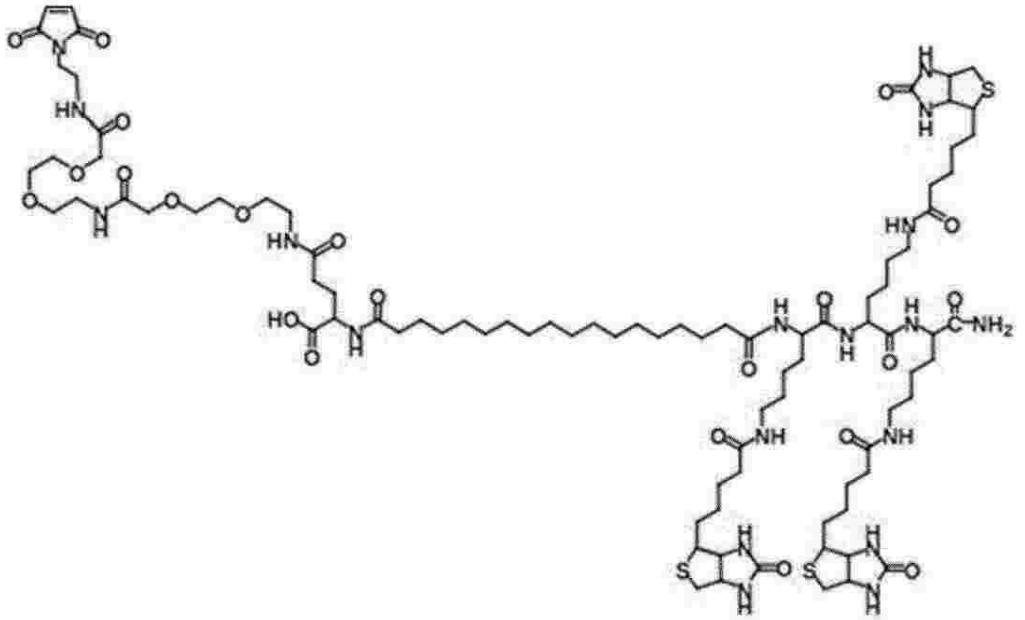
【化２１－１１】

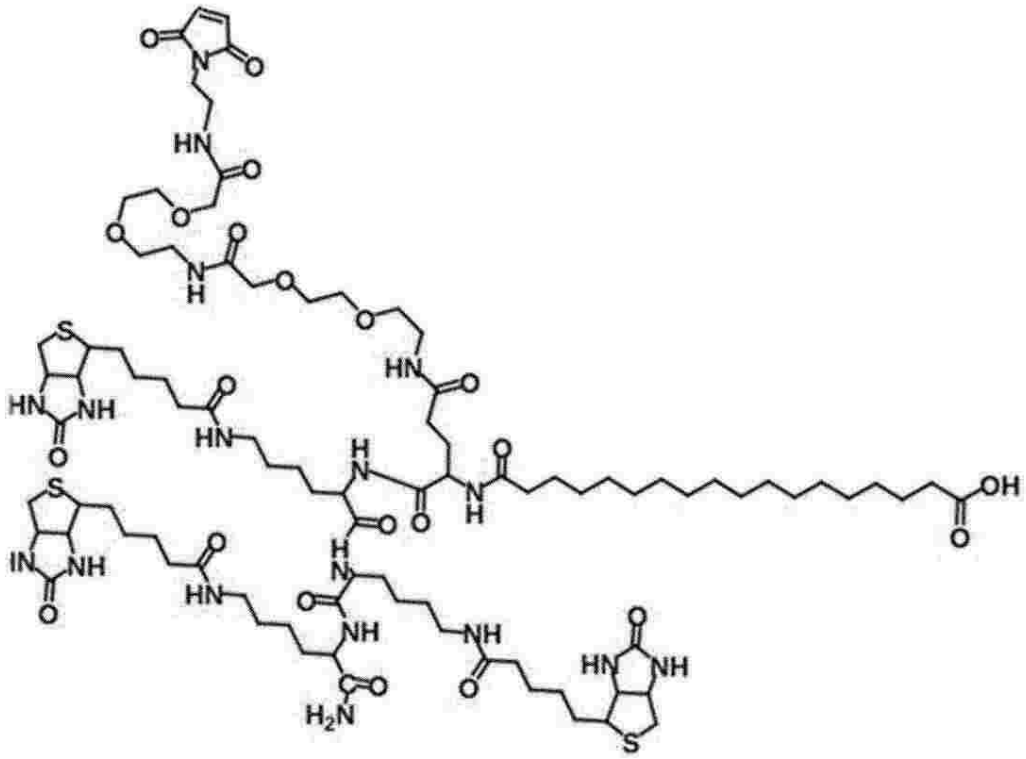


【化２１－１２】

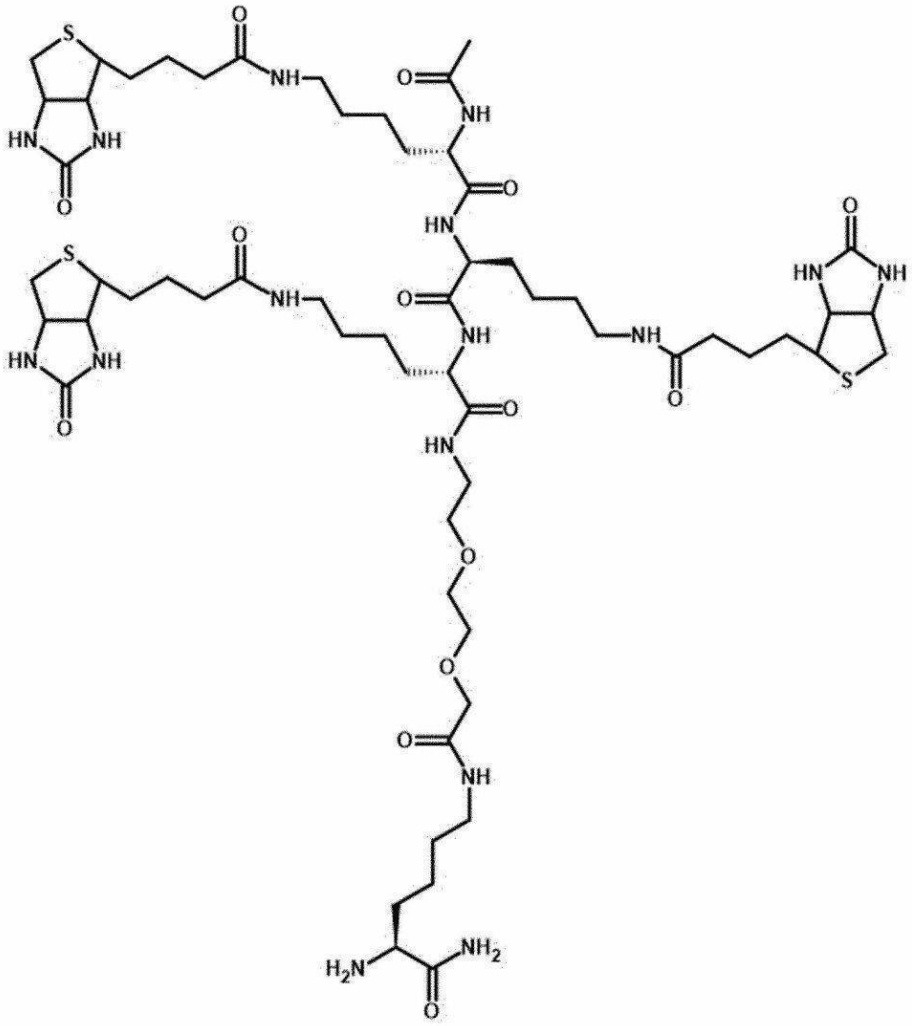


【化２１－１３】

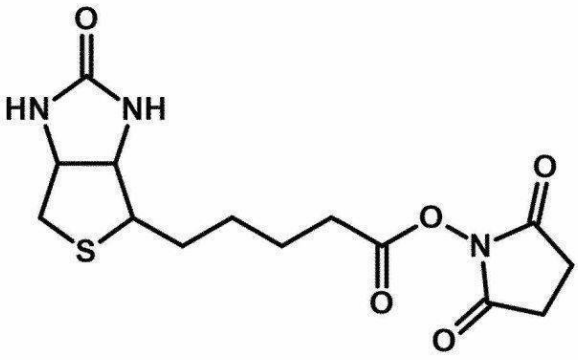




【化２１－１４】



、及び（Ｔｈｅ　ｏｒａｌ　ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ　ｆｏｒｍｕｌａｔｉｏｎ　ｓｅｌｅｃｔｅｄ　ｆｒｏｍ　ａｎｄ）



を含む群から選択される、項目１に記載の経口医薬製剤。

（項目１３）

前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、

前記脂肪酸部分が、以下の一般式Ｂ：

［一般式Ｂ］

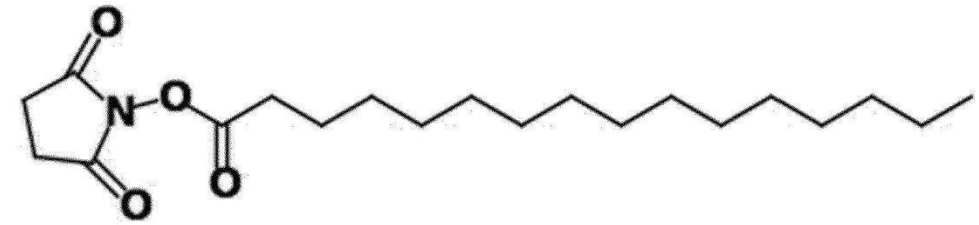
Ｘ’－Ｙ’－Ｗ

〔上記式中、

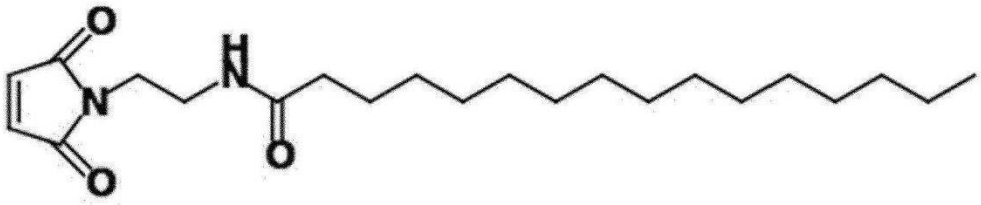
Ｘ’は、前記生理活性物質に結合することができる官能基であり、

Ｙ’はスペーサーであり、
Ｗは脂肪酸である〕
で表される、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目１４）
Ｘ’が、
マレイミド、スクシンイミド、Ｎ－ヒドロキシスクシンイミド、コハク酸スクシンイミジル、グルタル酸スクシンイミジル、スクシンイミジル　メチルエステル、スクシンイミジル　ペンチルエステル、炭酸スクシンイミジル、炭酸ｐ－ニトロフェニル、アルデヒド、アミン、チオール、オキシアミン、ヨードアセトアミド、アミノオキシル、ヒドラジド、ヒドロキシ、プロピオネート、ピリジル、アルキルハライド、ビニルスルホン、カルボキシル、ヒドラジド、ハロゲンアセトアミド、C_{2-5}アルキニル、C_{6-20}アリールジスルフィド、C_{5-20}ヘテロアリールジスルフィド、イソシアネート、チオエステル、イミノエステル、テトラフルオロフェニルエステル、炭酸ニトロフェニル、ニトロフェニル、及びその誘導体
を含む群から選択される、項目１３に記載の生理活性物質結合体。
（項目１５）
Ｙ’が直接結合であるか、あるいは
Ｙの構造が、
置換もしくは非置換C_{1-50}直鎖状アルキレン、置換もしくは非置換C_{1-50}非直鎖状アルキレン、置換もしくは非置換C_{1-50}直鎖状ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換C_{1-50}非直鎖状ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換C_{1-50}アリーレン、置換もしくは非置換C_{1-50}ヘテロアリーレン、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ－または－ＮＯＲ－を含む群の少なくとも１つを含み、Ｒが、水素、または非置換C_{1-50}アルキル、置換もしくは非置換C_{1-50}アリール、またはエチレングリコール繰り返し単位（－（CH_2CH_2O）$_n$－、式中、ｎは、少なくとも１であるが２０を上回らない整数である）である、
項目１３に記載の生理活性物質結合体。
（項目１６）
Ｙ’が、繰り返し単位として－Ｃ（Ｏ）－（OCH_2CH_2）$_u$－ＮＨ－を含み、ｕが１～２０の整数である、項目１３に記載の生理活性物質結合体。
（項目１７）
Ｙ’が、成分としてグルタミン酸、グルタミン、グリシン、イソロイシンまたはリジンを含む、項目１３に記載の生理活性物質結合体。
（項目１８）
前記（ｉ）ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した生理活性物質結合体において、
前記脂肪酸部分が、

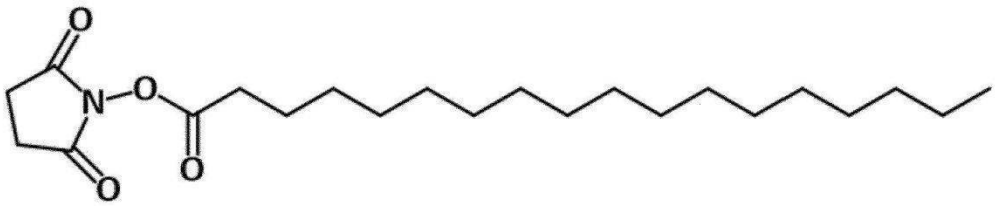
【化２２－１】



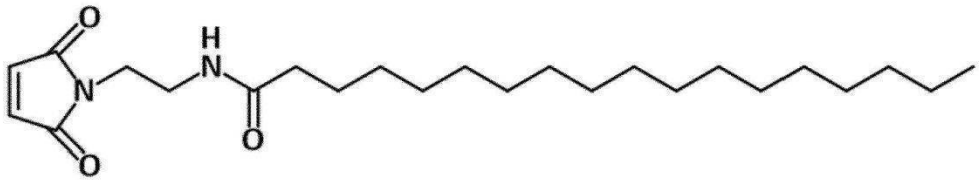
、



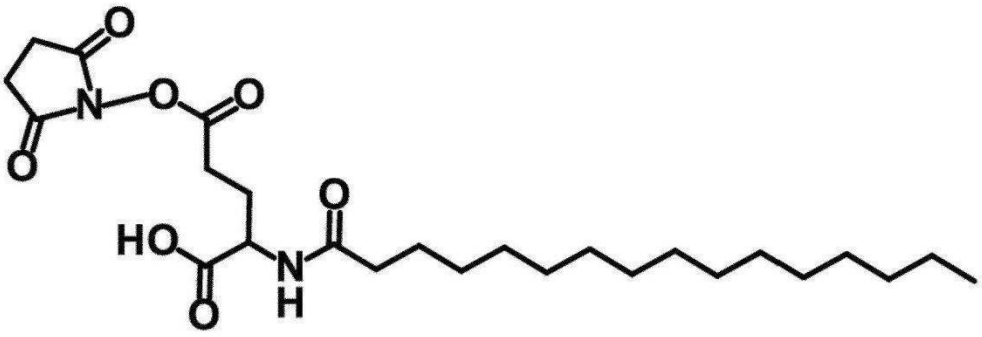
、



、

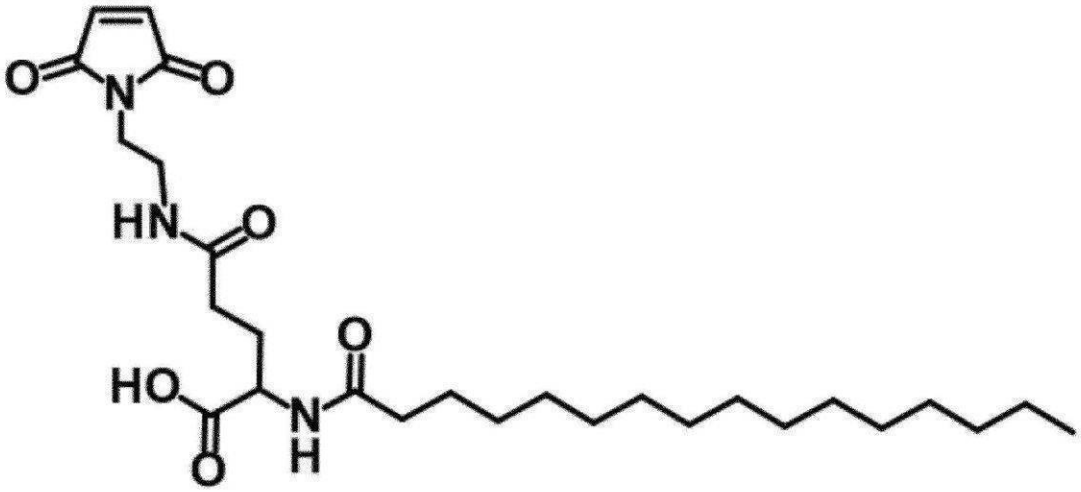


、

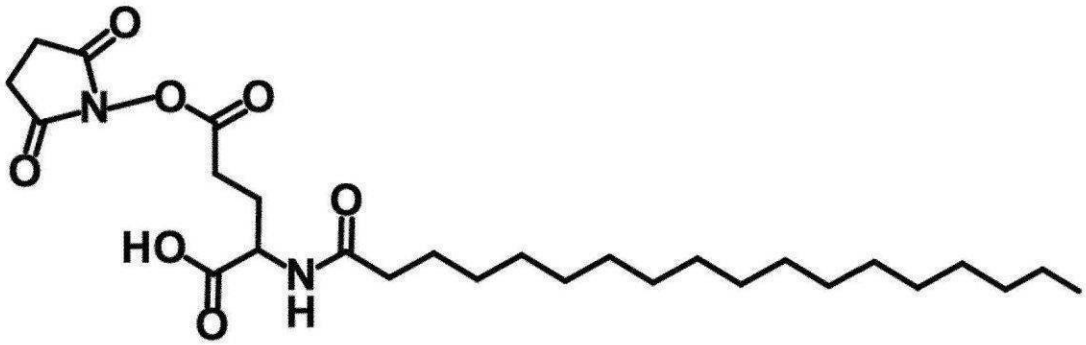


、

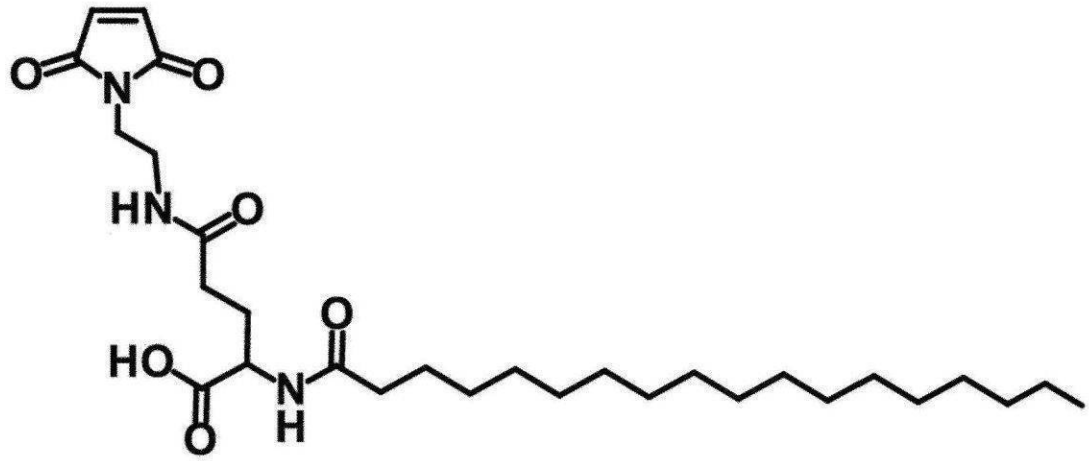
【化２２－２】



、

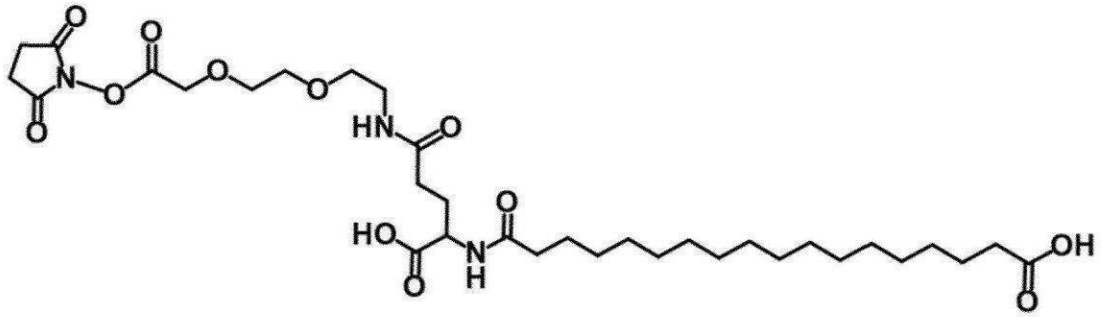


、

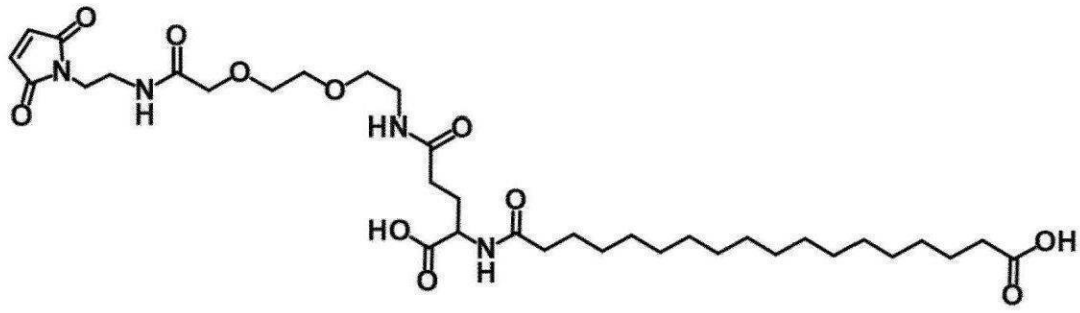


、

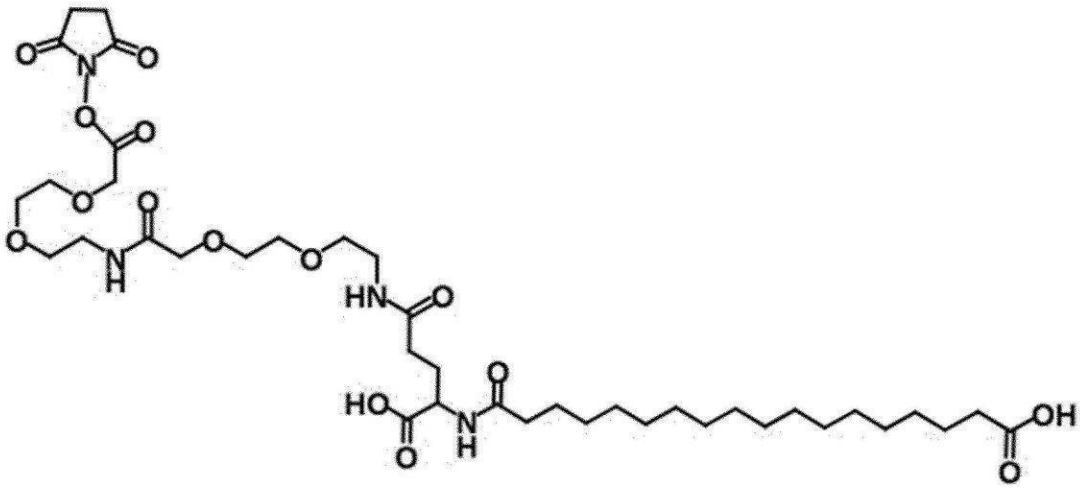
【化２２－３】



、

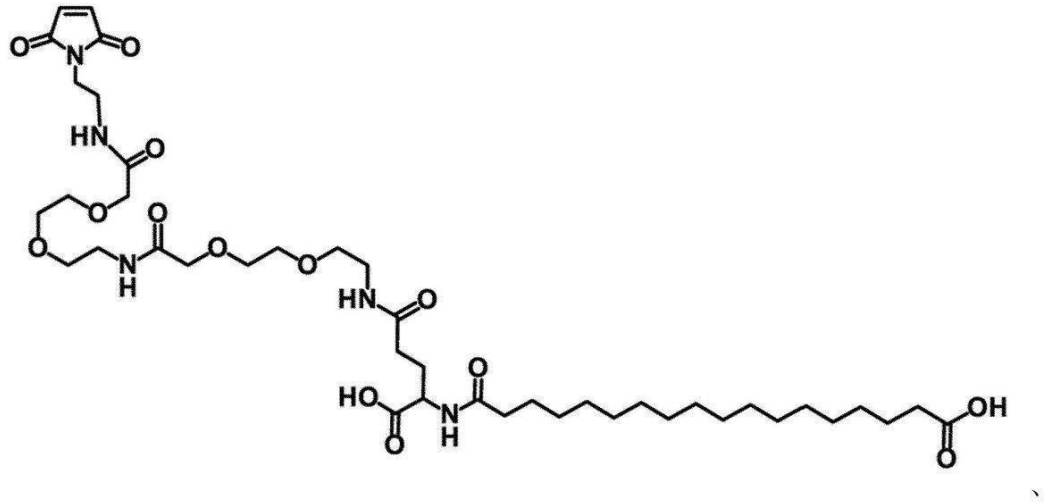


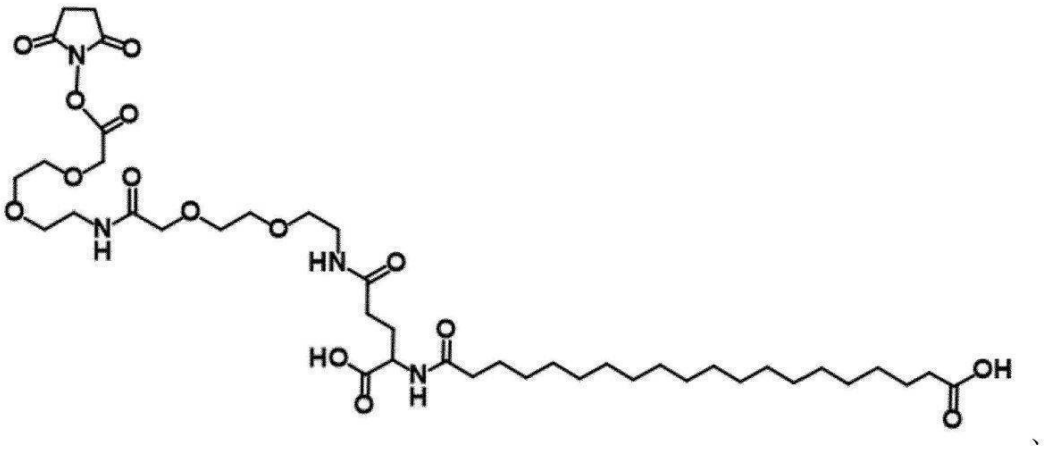
、

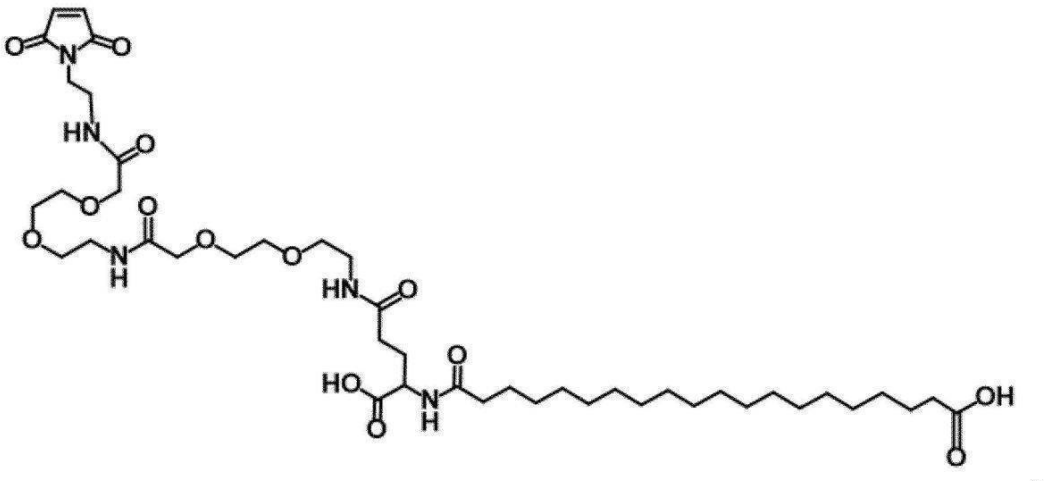


、

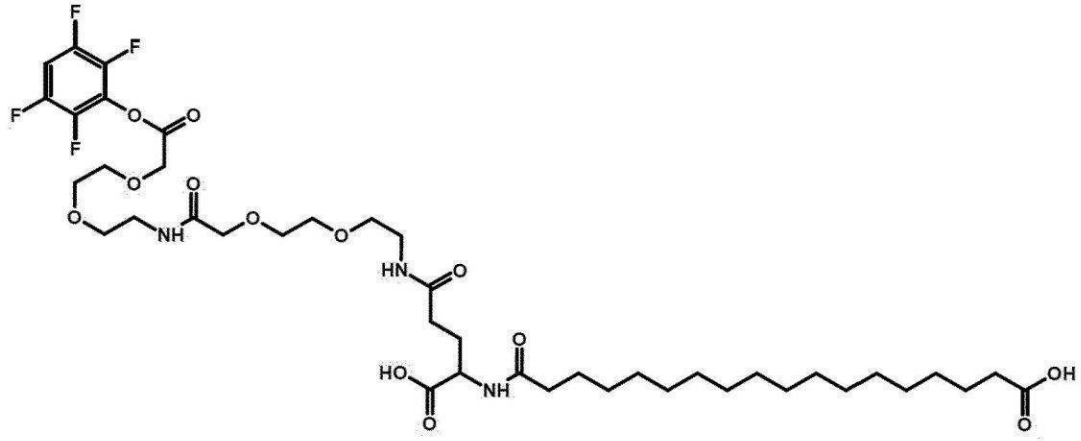
【化２２－４】


、

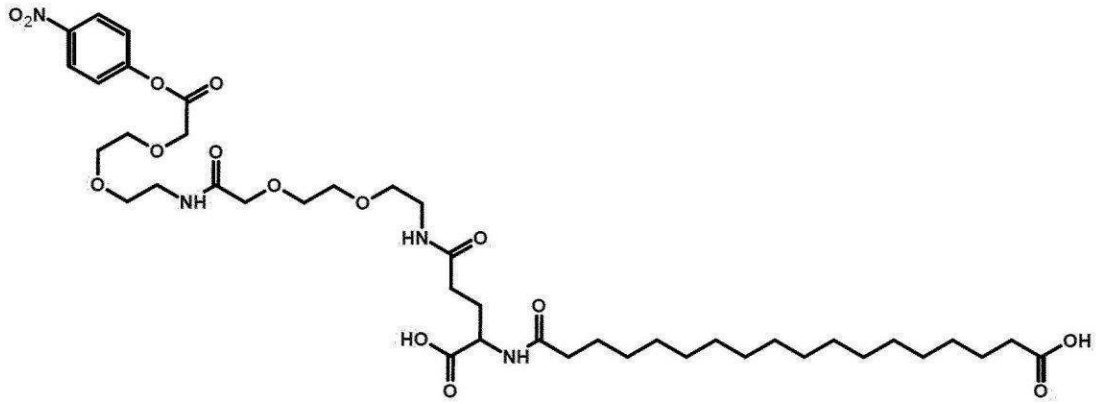

、


、

【化２２－５】



、及び



を含む群から選択される前記経口医薬製剤である、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目１９）
前記賦形剤が、胆汁酸、その誘導体、またはその薬学的に許容される塩を含む、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目２０）
前記胆汁酸が、
グリココール酸、グリコケノデオキシコール酸、タウロケノデオキシコール酸、タウロコール酸、デオキシコール酸、コール酸、ケノデオキシコール酸、ウルソデオキシコール酸及びリトコール酸
を含む群から選択される少なくとも１つである、項目１９に記載の経口医薬製剤。
（項目２１）
前記胆汁酸が、
ケノデオキシコール酸、デオキシコール酸、コール酸、グリココール酸、タウロコール酸及びウルソジオキシコール酸
を含む群から選択される１つである、項目１９に記載の経口医薬製剤。
（項目２２）
前記賦形剤が、
アルファ－トコフェロール、リンゴ酸、フマル酸、アスコルビン酸、ブチル化ヒドロキシアニソール、ブチル化ヒドロキシトルエン、リン酸ナトリウム、リン酸カルシウム、リン酸カリウム、ガラクトース、グルコース、マルトース、没食子酸、没食子酸プロピル、及びその薬学的に許容される塩
を含む群から選択される少なくとも１つをさらに含む、項目１９に記載の経口医薬製剤。
（項目２３）
前記賦形剤が、没食子酸プロピル、またはその薬学的に許容される塩をさらに含む、項

目１９に記載の経口医薬製剤。
（項目２４）
（ｉ）前記ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した前記生理活性物質と（ｉｉ）前記賦形剤との重量比が１：０．０１～１０００である、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目２５）
（ｉ）前記ビオチン部分、脂肪酸部分またはその組合せに結合した前記生理活性物質と（ｉｉ）前記賦形剤との重量比が１：０．１～５００である、項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目２６）
前記賦形剤が、胆汁酸、またはその薬学的に許容される塩没食子酸、および没食子酸プロピル、またはその薬学的に許容される塩を含み、
胆汁酸またはその薬学的に許容される塩と没食子酸プロピルまたはその薬学的に許容される塩との重量比が１：０．０１～８である、
項目１に記載の経口医薬製剤。
（項目２７）
前記賦形剤が、
胆汁酸、またはその薬学的に許容される塩没食子酸、および没食子酸プロピル、またはその薬学的に許容される塩を含み、かつ
１～１０００ｍｇの胆汁酸またはその薬学的に許容される塩、及び
１～１０００ｍｇの没食子酸プロピルまたはその薬学的に許容される塩
を［含む］、
項目１に記載の経口医薬製剤。