

【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21年11月26日(2009.11.26)

【公表番号】特表2009-510233(P2009-510233A)

【公表日】平成21年3月12日(2009.3.12)

【年通号数】公開・登録公報2009-010

【出願番号】特願2008-533794(P2008-533794)

【国際特許分類】

C 0 8 J 3/12 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/785 (2006.01)

【 F I 】

C 0 8 J 3/12 C E T

C 0 8 J 3/12 C E Z

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/12

A 6 1 P 7/08

A 6 1 K 31/785

【手続補正書】

【提出日】平成21年10月1日(2009.10.1)

【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】

重合体コア成分及び架橋重合体シェル成分を含むコア - シェルコンポジットを製造する方法であって、該方法が下記工程：

第 1 の液体中で重合体コア成分及びシェル重合体を含む第 1 の相を製造すること、ここで該シェル重合体は該第 1 の液体中に実質的に溶解すること、

第 2 の液体中で架橋剤を含む第 2 の相を製造すること、ここで該第 2 の液体は該第 1 の液体と実質的に非混和性であること、

該第 1 の相及び該第 2 の相を組み合わせる不均質な多相媒体を形成すること、

該不均質な多相媒体から該第 1 の液体の少なくとも一部分を除去すること、及び、

該コア成分の表面上で該架橋剤により該シェル重合体を架橋することによって該多相媒体中で該コア - シェルコンポジットを形成すること、を含む方法。

【請求項 2】

請求項 1 に記載のコア - シェルコンポジットを製造する方法であって、該方法が下記工程：

水溶液である第 1 の水相に前記コア成分を水和させること、ここで該コア成分は親水性コア重合体を含むこと、

該水溶液に前記シェル重合体を溶解すること、ここで該シェル重合体は親水性シェル重合体であること；および

該シェル重合体を該水和したコア成分の表面と相互作用させることにより水和したコア

- シェル中間体を形成すること、  
をさらに含む方法。

【請求項 3】

請求項 2 に記載のコア - シェルコンポジットを製造する方法であって、该方法が下記工程：

同時に ( i ) 前記コア - シェルコンポジットが形成されるように、前記水和したコア - シェル中間体を架橋条件下で前記架橋剤に接触させること、及び ( i i ) 該水溶液から水を除去すること、  
をさらに含む方法。

【請求項 4】

前記第 1 の液体が水溶液であり、そして前記除去する工程が脱水する工程である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 5】

重合体コア成分及び架橋重合体シェル成分を含むコア - シェルコンポジットを製造する方法であって、该方法が下記工程：

第 1 の水相に該コア成分を水和させること、ここで該コア成分は親水性重合体を含むこと、

該第 1 の水相にシェル重合体を溶解すること、

該第 1 の水相を第 2 の相と混合することにより不均質な多相媒体を形成すること、ここで該第 2 の相は架橋剤を含み、該第 1 の水相と実質的に非混和性であること、

該不均質な多相媒体を脱水すること、及び、

該コア成分の表面上で該架橋剤により該シェル重合体を架橋することによって該コア - シェルコンポジットを形成すること、  
を含む方法。

【請求項 6】

前記不均質な多相媒体が、前記水和したコア - シェル中間体を、前記第 1 の水相の大部分から、架橋剤を含む第 2 の液相を使用して相分離することにより調製され、該第 2 の液相が、該第 1 の水相と実質的に非混和性である、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】

前記第 1 の液相の pH を制御することを更に含む請求項 1 ~ 6 の何れかに記載の方法。

【請求項 8】

前記コア成分がカチオン交換重合体を含み、そして前記シェル重合体がアミン部分を含む実質的に正荷電の架橋アミン重合体を含む請求項 1 ~ 7 の何れか 1 項に記載の方法。

【請求項 9】

前記シェル重合体の前記アミン部分の少なくとも 2 % が第 4 級アンモニウムである請求項 8 記載の方法。

【請求項 10】

前記アミン部分が、アルキル、式 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - HET - (R<sub>x</sub>)<sub>t</sub> を有する (alk) 複素環部分又は式 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - Ar - (R<sub>x</sub>)<sub>t</sub> を有する (alk) アリール部分で置換されており、ここで m は 0 ~ 10 であり、t は 0 ~ 5 であり、HET は複素環部分であり、Ar はアリール部分であり、そして R<sub>x</sub> はヒドロカルビル又は置換ヒドロカルビルである請求項 8 または 9 の何れか 1 項に記載の方法。

【請求項 11】

前記コア - シェル粒子が 1 μm ~ 500 μm の大きさ及び 5 . 5 より高値の pH において少なくとも 1 . 5 mmol / g のカリウムに対する結合能力を有する請求項 8 ~ 10 の何れか 1 項に記載の方法。

【請求項 12】

前記架橋アミン重合体がアルキレンイミン反復単位を含む請求項 8 ~ 11 の何れか 1 項に記載の方法。

【請求項 13】

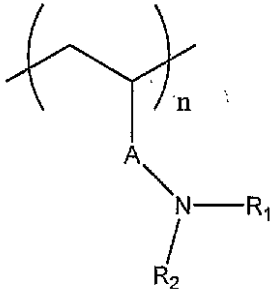
前記架橋アミン重合体がエチレンイミン反復単位を含み、そして前記アルキレンイミン反復単位がアルキル、(a 1 k) 複素環部分又は(a 1 k) アリール部分で置換されている請求項 1 2 記載の方法。

【請求項 1 4】

前記架橋アミン重合体が下記式 I :

【化 1】

式 I



[ 式中、n は少なくとも 4 であり、

R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub> は独立して水素、置換又は未置換のアルキル、置換又は未置換のフェニル、置換又は未置換のアリールあるいは置換又は未置換の複素環であり、そして

A は重合体骨格の N 原子と C 原子との間の共有結合、置換又は未置換のアルキル、置換又は未置換のアリール、置換又は未置換の複素環、アルキル基が置換又は未置換であるカルボキシアルキル、アルキル基が置換又は未置換であるカルボキサミドアルキル、あるいはアルキル基が置換又は未置換であるアミノアルキルである ] で表されるか、又はその共重合体であるビニル反復単位を含む請求項 8 記載の方法。

【請求項 1 5】

R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub> が式 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - A r - ( R<sub>x</sub> )<sub>t</sub> を有する請求項 1 4 記載の方法。

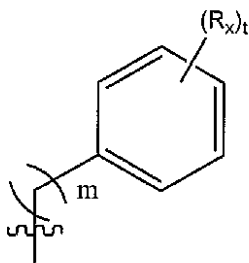
【請求項 1 6】

R<sub>x</sub> が C<sub>1</sub> - C<sub>18</sub> アルキル又は C<sub>1</sub> - C<sub>18</sub> アルキレンである請求項 1 4 又は 1 5 記載の方法。

【請求項 1 7】

R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub> が下記式 :

【化 2】



式 IV

[ 式中、

m は 0 ~ 10 であり ;

R<sub>x</sub> は直鎖又は分枝鎖の C<sub>1</sub> - C<sub>18</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>18</sub> アルケニル、C<sub>1</sub> - C<sub>18</sub> アルキニル又は C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub> アリールであり ;

t は 0 ~ 5 である ] を有する請求項 1 4 記載の方法。

## 【請求項 18】

m が 1 ～ 3 であり、 t が 1 である請求項 9 ～ 12 および 14 ～ 16 の何れか 1 項に記載の方法。

## 【請求項 19】

請求項 1 ～ 18 の何れか 1 項に記載の方法に従ってコア - シェル粒子を製造することを含む医薬の製造のための方法。

## 【請求項 20】

前記医薬が高カリウム血症の治療的な処置のためのものである請求項 19 記載の方法。

## 【請求項 21】

製薬上許容しうる賦形剤および請求項 1 ～ 18 の何れか 1 項に記載の方法に従って製造されたコア - シェル粒子を含む医薬組成物。

## 【請求項 22】

高カリウム血症の治療的な処置のための請求項 21 記載の医薬組成物。