

【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】平成22年7月15日(2010.7.15)

【公表番号】特表2009-542653(P2009-542653A)

【公表日】平成21年12月3日(2009.12.3)

【年通号数】公開・登録公報2009-048

【出願番号】特願2009-518197(P2009-518197)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/295 (2006.01)

A 6 1 K 31/785 (2006.01)

A 6 1 K 31/787 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 33/06 (2006.01)

A 6 1 K 33/30 (2006.01)

A 6 1 K 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 K 33/26 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/295

A 6 1 K 31/785

A 6 1 K 31/787

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 33/06

A 6 1 K 33/30

A 6 1 K 33/00

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 3/00

A 6 1 K 33/26

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月27日(2010.5.27)

【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】

a) 酢酸鉄(II)、酸化鉄(II)、塩化鉄(II)およびそれらの組み合わせから選択される薬学的に許容され得る第一鉄化合物；

b) アミンポリマーまたはその薬学的に許容され得る塩；ならびに

c) 薬学的に許容され得る担体

を含む医薬組成物。

【請求項2】

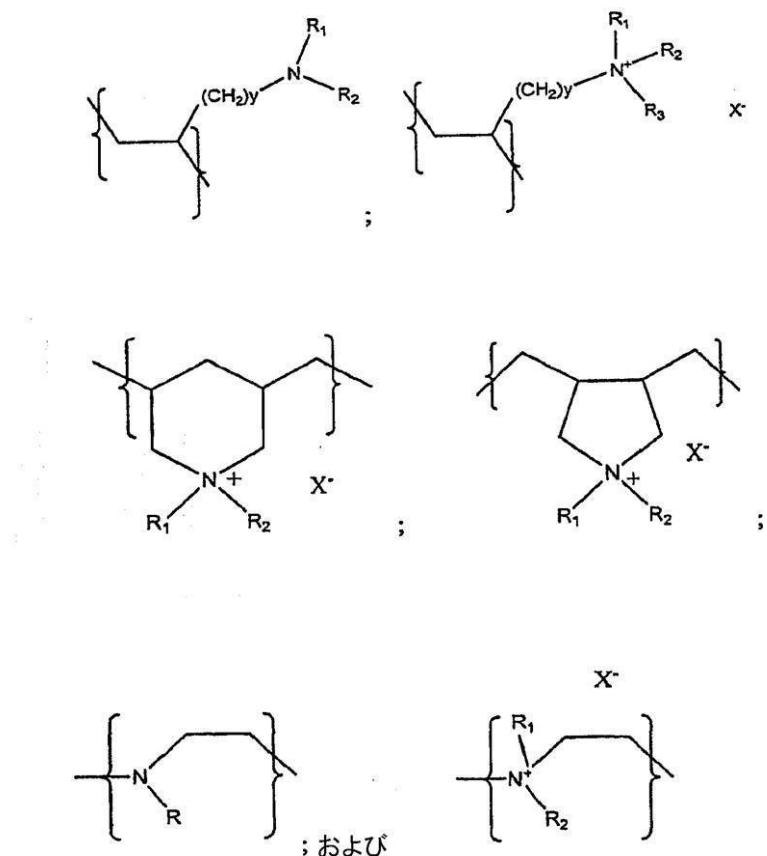
第二鉄イオンを本質的に含まない、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項3】

アミンポリマーが脂肪族アミンポリマーである、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項4】

## 脂肪族アミンポリマーが



(式中 :

yは独立して、0または1~10の整数である;

R、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、およびR<sub>3</sub>は独立してH、置換もしくは非置換のアルキル基またはアリール基である; およびX<sup>-</sup>は交換可能な負電荷の対イオンである)

から選択される構造式で表される1つ以上の繰り返し単位を含むものであるか、またはその塩である、請求項3記載の医薬組成物。

## 【請求項5】

脂肪族アミンポリマーが架橋される、請求項4記載の医薬組成物。

## 【請求項6】

第一鉄化合物が架橋脂肪族アミンポリマー内に運ばれ取り込まれている、請求項5記載の医薬組成物。

## 【請求項7】

脂肪族アミンポリマーが二官能性架橋剤で架橋される、請求項5記載の医薬組成物。

## 【請求項8】

架橋剤が脂肪族アミンモノマーおよび架橋剤の全重量中約0.5~35重量%の量で存在する、請求項7記載の医薬組成物。

## 【請求項9】

脂肪族アミンポリマーが架橋ポリアリルアミンである、請求項8記載の医薬組成物。

## 【請求項10】

ポリアリルアミンポリマーがセベラマーである、請求項9記載の医薬組成物。

## 【請求項11】

ポリアリルアミンポリマーがセベラマーの塩化物である、請求項10記載の医薬組成物。

。

## 【請求項 1 2】

ポリアリルアミンポリマーがセベラマーの炭酸塩である、請求項 1 0 記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 3】

ポリアリルアミンポリマーがセベラマーの塩化物および炭酸塩の混合物である、請求項 1 0 記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 4】

ポリアリルアミンがコレセベラムである、請求項 9 記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 5】

錠剤である、請求項 1 記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 6】

被験体のリン酸過剰血症を治療するための医薬組成物の製造における、

a) 酢酸鉄(II)、酸化鉄(II)、塩化鉄(II)およびそれらの組み合わせから選択される薬学的に許容され得る第一鉄化合物；ならびに

b) 脂肪族アミンポリマーまたはその薬学的に許容され得る塩の使用。

## 【請求項 1 7】

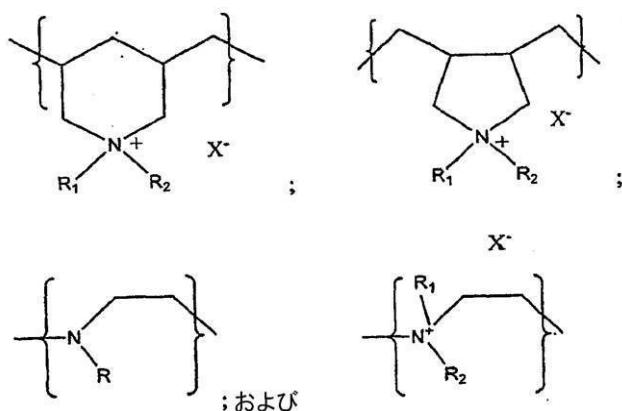
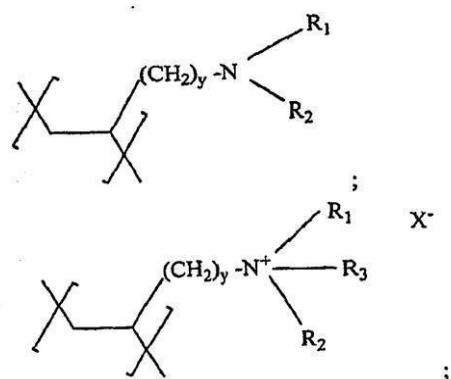
第一鉄化合物が本質的に第二鉄イオンを含まない、請求項 1 6 記載の使用。

## 【請求項 1 8】

アミンポリマーが脂肪族アミンポリマーである、請求項 1 6 記載の使用。

## 【請求項 1 9】

脂肪族アミンポリマーが



(式中：

yは0または1~10の整数である；

R、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、およびR<sub>3</sub>は独立してH、置換もしくは非置換のアルキル基またはアリール基で

ある；および

X<sup>-</sup>は交換可能な負電荷の対イオンである）

からなる群より選択される式で表される1つ以上の繰り返し単位を含むものであるか、またはその塩もしくはコポリマーである、請求項1\_8記載の使用。

【請求項 2\_0】

脂肪族アミンポリマーが多官能性架橋剤により架橋されたポリアリルアミンである、請求項1\_9記載の使用。

【請求項 2\_1】

第一鉄化合物が架橋ポリアリルアミン内に運ばれ取り込まれている、請求項2\_0記載の使用。

【請求項 2\_2】

ポリアリルアミンがセベラマーである、請求項2\_0記載の使用。

【請求項 2\_3】

ポリアリルアミンがコレセベラムである、請求項2\_0記載の使用。

【請求項 2\_4】

第一鉄化合物の第一鉄イオンが医薬組成物の5~35無水重量%を含んでなる、請求項1\_6記載の使用。

【請求項 2\_5】

該医薬組成物がリン酸金属イオン封鎖剤をさらに含み、該リン酸金属イオン封鎖剤が薬学的に許容され得るカルシウム化合物、薬学的に許容され得るアルミニウム化合物、薬学的に許容され得るマグネシウム化合物、薬学的に許容され得るランタン化合物、および薬学的に許容され得る亜鉛化合物からなる群より選択される、請求項1\_6記載の使用。

【請求項 2\_6】

該医薬組成物がリン酸塩輸送インヒビター、HMG-CoAレダクターゼインヒビター、アルカリホスファターゼインヒビターおよび胆汁酸金属イオン封鎖剤からなる群より選択される薬物をさらに含む、請求項1\_6記載の使用。

【請求項 2\_7】

コレセベラムがコレセベラムHClである、請求項1\_4記載の医薬組成物。

【請求項 2\_8】

セベラマーがセベラマーの塩化物である、請求項2\_2記載の使用。

【請求項 2\_9】

セベラマーがセベラマーの炭酸塩である、請求項2\_2記載の使用。

【請求項 3\_0】

セベラマーがセベラマーの塩化物および炭酸塩の混合物である、請求項2\_2記載の使用

。

【請求項 3\_1】

コレセベラムがコレセベラムHClである、請求項2\_3記載の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0\_0\_2\_4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0\_0\_2\_4】

鉄(II)結合ポリマーは、本発明において単独または上記の薬学的に許容され得る第一鉄化合物と組み合わせて使用され得る。鉄(II)結合ポリマーが上記の薬学的に許容され得る第一鉄化合物と組み合わせて使用される場合、第一鉄化合物は、ポリマー内に任意に運ばれ取り込まれ(entrain)得る。本明細書で使用されるように、句「鉄(II)結合ポリマー内に運ばれ取り込まれている第一鉄化合物」は、第一鉄化合物または第一鉄化合物の第一鉄イオンがポリマー中、例えば、架橋によって作製されたポリマーのポケット(1つまたは複数)内などのポリマー網目中に捕捉されていることを意味する。

## 【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0069

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0069】

いくつかの態様において、アミンポリマー、好ましくは脂肪族アミンポリマー、および薬学的に許容され得る第一鉄化合物は、単一の医薬組成物に同時製剤化される。アミンポリマーおよび薬学的に許容され得る第一鉄化合物は、その混合物で存在し得る。あるいは、薬学的に許容され得る第一鉄化合物は、上記のような架橋アミンポリマー、好ましくは架橋脂肪族アミンポリマー内に運ばれ取り込まれ得る。本明細書で使用されるように、句「架橋アミンポリマー内に運ばれ取り込まれている薬学的に許容され得る第一鉄化合物」は、架橋アミンポリマーが薬学的に許容され得る第一鉄化合物または鉄化合物の第一鉄イオンを、例えば、架橋によって作製されたポケット(1つまたは複数)内に捕捉していることを意味する。架橋アミンポリマー、好ましくは架橋脂肪族アミンポリマー内に運ばれ取り込まれている薬学的に許容され得る第一鉄化合物は、上記のアミンポリマーを薬学的に許容され得る第一鉄化合物の存在下で架橋させることにより調製され得る。例えば、ポリアリルアミンポリマーは、酸化鉄(II)の存在下でエピクロロヒドリンなどの多官能性架橋剤(1つまたは複数)によって架橋され、酸化鉄(II)または酸化鉄(II)の鉄(II)カチオンが運ばれ取り込まれている架橋ポリアリルアミンポリマーが形成され得る。アミンポリマー、架橋剤および薬学的に許容され得る第一鉄化合物に関する種々の例および好ましい値は、上記の通りである。典型的に、架橋アミンポリマー、好ましくは架橋脂肪族アミンポリマー内に運ばれ取り込まれている薬学的に許容され得る第一鉄化合物が使用される場合、架橋剤は、アミンモノマー+架橋剤の総重量に基づいて0.5~35重量%(0.5~30重量%、2.5~30重量%、5~25重量%、5~20重量%または5~15重量%など)の量で存在する。