

【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30年6月7日(2018.6.7)

【公開番号】特開2017-218454(P2017-218454A)

【公開日】平成29年12月14日(2017.12.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-048

【出願番号】特願2017-181132(P2017-181132)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/78 (2006.01)

A 6 1 K 31/795 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/78

A 6 1 K 31/795

A 6 1 P 3/00

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/10

【手続補正書】

【提出日】平成30年4月20日(2018.4.20)

【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】

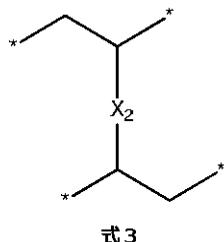
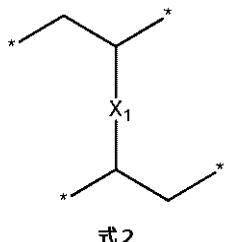
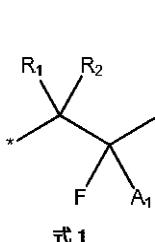
【請求項1】

経口投与形態であって、該経口投与形態が、組成物および一種以上の賦形剤を含み、該組成物が、15重量%～35重量%の線状糖アルコール、10重量%～25重量%の水、および残りは架橋陽イオン交換ポリマーまたはその塩を含み、重量%は、線状糖アルコール、水およびポリマーの総重量に基づき、

(i) 該架橋陽イオン交換ポリマーは、式1および2、式1および3、または式1、2、および3の構造単位を含み、

式1、式2、および式3は、以下の構造：

【化43】



を有し、

式中、

R₁およびR₂はそれぞれ独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、またはアリールであり、

A₁は任意で保護されているカルボン酸、ホスホン酸、またはリン酸であり、

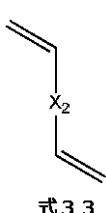
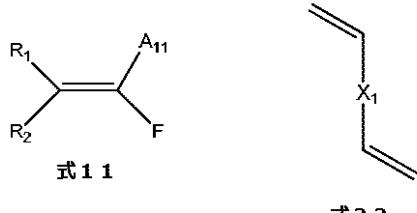
X₁ はアリーレンであり、

X₂ はアルキレン、エーテル部分、またはアミド部分であるか、または

(i i) 該架橋陽イオン交換ポリマーは、式 1 1 および 2 2、式 1 1 および 3 3、または
式 1 1、2 2、および 3 3 のモノマーを含む重合混合物の反応生成物であり、

式 1 1、式 2 2、および式 3 3 は、以下の構造：

【化 4 4】



を有し、

式中、R₁、R₂、A₁₁、X₁ および X₂ は、上に規定される通りである、
経口投与形態。

【請求項 2】

前記一種以上の賦形剤が、砂糖を含む充填剤、セルロース製剤、トラガカントゴム、ゼラチン、およびポリビニルピロリドン (PVP) から選択される、請求項 1 に記載の経口投与形態。

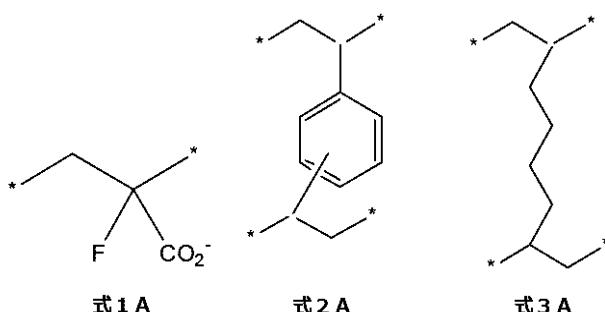
【請求項 3】

前記組成物が、架橋陽イオン交換ポリマー塩を含む、請求項 1 または 2 に記載の経口投与形態。

【請求項 4】

式 1、2、および 3 の構造単位が、以下の構造：

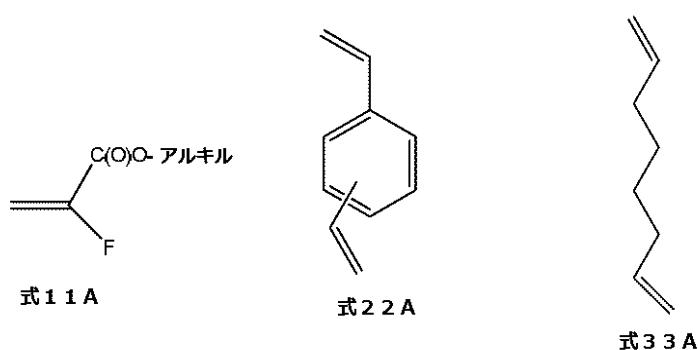
【化 4 5】



を有するか、または

式 1 1、2 2、および 3 3 のモノマーが、以下の構造：

【化 4 6】



を有する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項 5】

前記ポリマーが、式1、2および3の構造単位、または式11、22、および33のモノマーを含む、請求項1～4のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項6】

(i) 式1の構造単位が、重合混合物において使用されるモノマーの量から計算される、前記ポリマー中の式1、2、および3の構造単位の総重量に基づいて、85重量%～95重量%を占め、式2の構造単位対式3の構造単位の重量比が、4：1～1：4であるか、または

(ii) 前記ポリマー中の式1の構造単位のモル分率が、重合混合物において使用されるモノマーの量から計算される、式1、2、および3の構造単位のモルの総数に基づいて、0.87～0.94であり、式2の構造単位対式3の構造単位のモル比が、0.2：1～7：1であるか、

(iii) 式11のモノマーは、重合混合物中の式11、22、および33のモノマーの総重量に基づいて、少なくとも85重量%を占め、式22のモノマー対式33のモノマーの重量比は、4：1～1：4であるか、または

(iv) 重合混合物中の式11のモノマーのモル分率は、式11、22、および33のモノマーのモル総数に基づいて、少なくとも0.87であり、重合混合物における式22のモノマー対式33のモノマーのモル比は、0.2：1～7：1であるか、のいずれかである、請求項5に記載の経口投与形態。

【請求項7】

前記ポリマーが、式1および2の構造単位、または式11および22のモノマーを含む、請求項1～4のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項8】

前記ポリマーが、式1および3の構造単位、または式11および33のモノマーを含む、請求項1～4のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項9】

A₁₁が、保護されているカルボン酸、ホスホン酸、またはリン酸であり、R₁およびR₂は、それぞれ独立して、アルキル、シクロアルキル、またはアリールであり、X₁が、フェニレンであり、X₂が、アルキレン、エーテル部分-(CH₂)_d-O-(CH₂)_e-または-(CH₂)_d-O-(CH₂)_e-O-(CH₂)_d-（式中、dおよびeは独立して、1～5の整数である）、またはアミド部分-C(O)-NH-(CH₂)_p-NH-C(O)-（式中、pは1～8の整数である）である、請求項1～8のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項10】

A₁₁は、カルボン酸、ホスホン酸、またはリン酸であり、R₁およびR₂は、それぞれ独立して、アルキル、シクロアルキル、またはアリールであり、X₁が、フェニレンであり、X₂が、アルキレンであり、そしてR₁、R₂、X₁、およびX₂は、非置換である、請求項1～8のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項11】

前記重合混合物において使用される式11A：22A：33Aのモノマーの重量比が、90：5：5である、請求項5に記載の経口投与形態。

【請求項12】

前記陽イオン交換ポリマーは、加水分解、イオン交換、または加水分解およびイオン交換を経る、請求項1～11のいずれか一項に記載の経口投与形態。

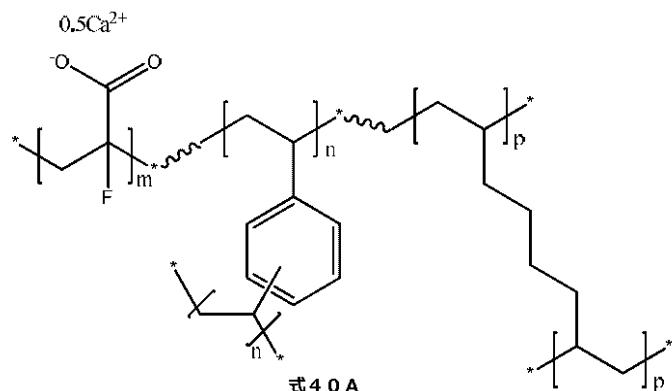
【請求項13】

前記架橋陽イオン交換ポリマーが、重合混合物の反応生成物であり、前記重合混合物が、さらに重合開始剤を含む、請求項1～12のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項14】

前記架橋陽イオン交換ポリマーが、重合混合物の反応生成物であり、前記架橋陽イオン交換ポリマー塩が、式40A：

【化47】



の一般構造によって表され、

mは、85～93モル%の範囲内であり、nは、1～10モル%の範囲内であり、pは、1～10モル%の範囲内であり、重合混合物に添加されるモノマーの比率に基づいて計算される、請求項3に記載の経口投与形態。

【請求項15】

前記架橋陽イオン交換ポリマーの陽イオンが、カルシウム、ナトリウム、またはそれらの組み合わせである、請求項1～13のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項16】

前記架橋陽イオン交換ポリマーの陽イオンが、カルシウムである、請求項15に記載の経口投与形態。

【請求項17】

前記線状糖アルコールが、アラビトール、エリトリトール、グリセロール、マルチトール、マンニトール、リビトール、ソルビトール、キシリトール、トレイトール、ガラクトール、イソマルト、イジトール、ラクチトール、およびそれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項1～16のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項18】

前記線状糖アルコールが、ソルビトール、キシリトール、またはそれらの組み合わせである、請求項17に記載の経口投与形態。

【請求項19】

貯蔵後の前記組成物中の無機フッ素は、1000ppm以下である、請求項1～18のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項20】

前記経口投与形態が、動物対象の胃腸管からカリウムを除去するためである、請求項1～19のいずれか一項に記載の経口投与形態。

【請求項21】

前記対象が、高カリウム血症を経験している、慢性腎疾患を罹患する、鬱血性心不全を罹患する、および/または透析を受けている、請求項20に記載の経口投与形態。

【請求項22】

請求項20に記載の経口投与形態であって、前記対象がヒトであり、該ヒトが、カリウム滞留をもたらす薬剤で治療されており、該カリウム滞留をもたらす薬剤が、アンジオテンシン変換酵素阻害剤（任意に、カプトプリル、ゾフェノプリル、エナラプリル、ラミプリル、キナブリル、ペリンドブリル、リシノブリル、ベナジブリル、ホシノブリル、またはそれらの組み合わせ）、アンジオテンシン受容体遮断薬（任意に、カンデサルタン、エプロサルタン、イルベサルタン、ロサルタン、オルメサルタン、テルミサルタン、バルサルタン、またはそれらの組み合わせ）、またはアルドステロン拮抗剤（任意に、スピロノラクトン、エプレレノン、またはそれらの組み合わせ）である、経口投与形態。