

【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1年5月30日(2019.5.30)

【公表番号】特表2018-513193(P2018-513193A)  
 【公表日】平成30年5月24日(2018.5.24)  
 【年通号数】公開・登録公報2018-019  
 【出願番号】特願2017-555572(P2017-555572)  
 【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)  
 A 6 1 K 38/12 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/404 (2006.01)  
 A 6 1 K 41/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/06  
 A 6 1 P 31/00  
 A 6 1 P 31/04  
 A 6 1 K 38/12  
 A 6 1 K 31/404  
 A 6 1 K 41/00

【手続補正書】

【提出日】平成31年4月19日(2019.4.19)

【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】

状態の処置への使用のための医薬組成物であって、前記使用が、その処置が必要な対象に、前記医薬組成物を投与することを含み、

a) 前記医薬組成物が、治療的に有効な量の化合物を含み、

b) 前記化合物が、生物学的構造に結合して、細胞における薬剤耐性を低減させ、

c) 前記化合物が、暗所におけるよりも光の存在下で有効であり、そして

d) 前記医薬組成物が、治療的に有効な量の第2の薬剤と組み合わせて使用される、ことを特徴とする使用のための医薬組成物。

【請求項2】

前記対象が、ヒトである、請求項1に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項3】

前記使用が、約200～約800nmの波長を有する光で前記化合物を照射することをさらに含む、請求項1に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項4】

前記状態が、微生物によって引き起こされる、請求項1に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項5】

前記微生物が、細菌である、請求項4に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項6】

前記微生物が、グラム陽性細菌である、請求項4に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項7】

前記微生物が、グラム陰性細菌である、請求項4に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項8】

前記微生物が、薬剤耐性細菌である、請求項4に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項9】

前記微生物が、メチシリン耐性黄色ブドウ球菌である、請求項4に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項10】

前記微生物が、アシネトバクター・バウマンニである、請求項4に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項11】

前記微生物が、大腸菌である、請求項4に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項12】

前記生物学的構造が、排出ポンプである、請求項1に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項13】

前記化合物が、前記微生物の薬剤耐性機構の活性を低下させる、請求項1に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項14】

前記第2の薬剤が、抗生物質である、請求項1に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項15】

前記抗生物質が、ポリミキシンB又はその医薬的に許容され得る塩である、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項16】

前記抗生物質が、バンコマイシン又はその医薬的に許容され得る塩である、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項17】

前記抗生物質が、ノルフロキサシン又はその医薬的に許容され得る塩である、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項18】

前記抗生物質が、オキサシリン又はその医薬的に許容され得る塩である、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項19】

前記抗生物質が、ジクロキシシリン又はその医薬的に許容され得る塩である、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項20】

前記抗生物質が、テトラサイクリン又はその医薬的に許容され得る塩である、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項21】

前記抗生物質が、リポペプチドである、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項22】

前記抗生物質が、モノバクタムである、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項23】

前記抗生物質が、アンサマイシンである、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項24】

前記抗生物質が、-ラクタムである、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項25】

前記抗生物質が、カルバペネムである、請求項14に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項26】

前記抗生物質が、セファロスポリンである、請求項 1 4 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 2 7】

前記抗生物質が、ニトロフランである、請求項 1 4 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 2 8】

前記抗生物質が、グリコペプチドである、請求項 1 4 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 2 9】

前記抗生物質が、リンコサミドである、請求項 1 4 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 0】

前記化合物及び前記第 2 の薬剤が、共通の単位剤形で投与される、請求項 1 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 1】

前記投与が、経口投与である、請求項 1 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 2】

前記投与が、静脈内投与である、請求項 1 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 3】

前記投与が、皮下投与である、請求項 1 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 4】

前記投与が、局所投与である、請求項 1 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 5】

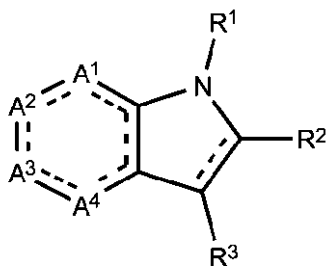
前記治療的に有効な量が、約5mg/kg ~ 約50mg/kgである、請求項 1 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 6】

前記使用が、前記化合物及び前記第 2 の薬剤を照射することをさらに含む、請求項 1 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 7】

前記化合物が、下記式：



(式中：

- R<sup>1</sup>は、水素又はエステル基であり；
- R<sup>2</sup>は、水素、ハロゲン、又はL<sup>1</sup>-Ar<sup>1</sup>であり；
- R<sup>3</sup>は、水素、ハロゲン、又はL<sup>2</sup>-Ar<sup>2</sup>であり；
- 或いはR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>が結合している原子と一緒に置換又は非置換環を形成し；
- L<sup>1</sup>及びL<sup>2</sup>は、それぞれ独立に連結基又は結合であり；
- Ar<sup>1</sup>は、置換又は非置換アリール基であり；
- Ar<sup>2</sup>は、置換又は非置換アリール基であり（Ar<sup>2</sup>は、アミド、アミン、ニトロ、イミン、又はエステル基で置換されていない）；
- A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、及びA<sup>4</sup>は、それぞれ独立にC(R<sup>1a</sup>)、C(R<sup>1a</sup>)(R<sup>1b</sup>)、N、又はN(R<sup>1a</sup>)であり；
- R<sup>1a</sup>及びR<sup>1b</sup>は、それぞれ独立に水素、ハロゲン、ヒドロキシル、スルフィドリル、ニトロ、ニトロソ、シアノ、アジド、スルホキシド基、スルホン基、スルホンアミド基、スルホン酸基、イミン基、アシル基、アシルオキシ基、アルキル、アルケニル、アルキニル、

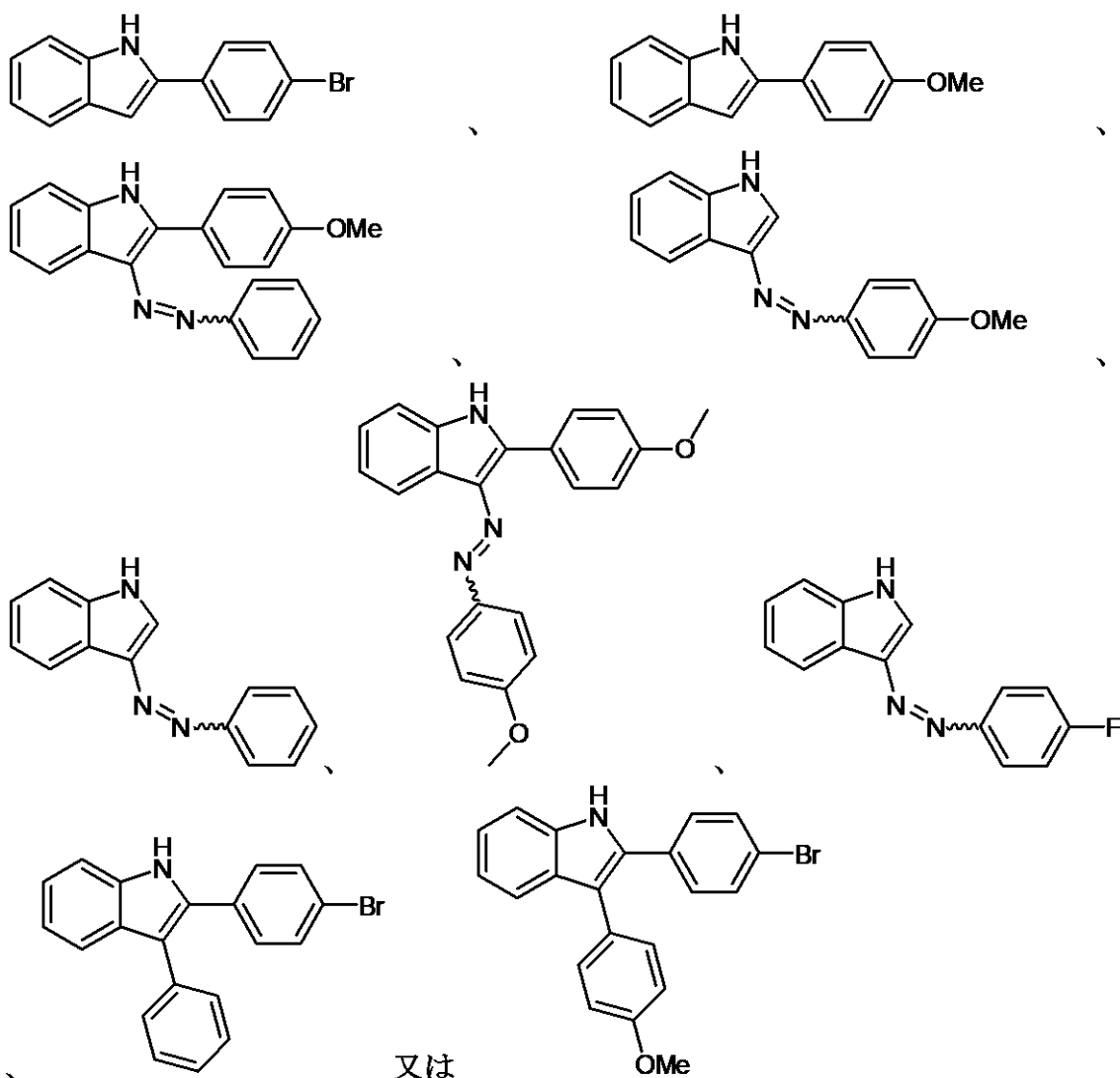
アルコキシ基、エーテル基、カルボン酸基、カルボキサリド基、エステル基、アミン基、アミド基、カルボナート基、カルバマート基、チオエーテル基、チオエステル基、チオ酸基、アリール、アリーロキシ、アリールアルキル、アリールアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、又はヘテロアリールアルキル（いずれも置換されているか又は置換されていない）であり；及び

- 各

====

は、独立に単結合又は二重結合である）

の化合物、又はその医薬的に許容され得る塩であり、ここで、前記化合物は下記化合物でない、請求項 1 に記載の使用のための医薬組成物。



【請求項 38】

Ar<sup>1</sup>が、1つの位置で臭素化されたフェニルであるとき、Ar<sup>2</sup>が、少なくとも1つの位置で置換されている、請求項 37 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 39】

Ar<sup>1</sup>が、1つのメトキシ基で置換されたフェニルであるとき、Ar<sup>2</sup>が、少なくとも1つの位置で置換されている、請求項 37 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 40】

Ar<sup>1</sup>が、置換され、かつAr<sup>2</sup>が、置換されている、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 4 1】

Ar<sup>1</sup>が、置換されず、かつAr<sup>2</sup>が、置換されていない、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 4 2】

L<sup>1</sup>とL<sup>2</sup>が、両方とも独立に



である、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 4 3】

Ar<sup>1</sup>とAr<sup>2</sup>が、両方とも独立に水素、ハロゲン、又はアルキルオキシで置換されている、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 4 4】

各連結基が、独立にアルキレン、アルケニレン、O、S、SO<sub>2</sub>、CO、N<sub>2</sub>、又は結合である、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 4 5】

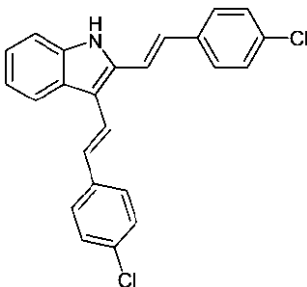
各

====

が、芳香族系を形成するように独立に選択される、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。

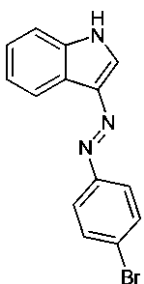
【請求項 4 6】

前記化合物が、下記化合物である、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。



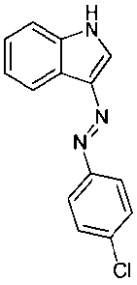
【請求項 4 7】

前記化合物が、下記化合物である、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。



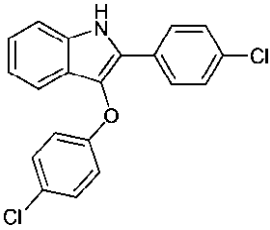
【請求項 4 8】

前記化合物が、下記化合物である、請求項3 7に記載の使用のための医薬組成物。



【請求項 49】

前記化合物が、下記化合物である、請求項 37 に記載の 使用のための医薬組成物。



【請求項 50】

前記化合物が、下記化合物である、請求項 37 に記載の 使用のための医薬組成物。

