

【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5年12月20日(2023.12.20)

【公開番号】特開2021-102605(P2021-102605A)

【公開日】令和3年7月15日(2021.7.15)

【年通号数】公開・登録公報2021-031

【出願番号】特願2020-208924(P2020-208924)

【国際特許分類】

A 6 1 K 3 1 / 5 5 1 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 3 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

A 6 1 K 3 1 / 5 5 1

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 2 1

A 6 1 P 3 1 / 0 4

A 6 1 K 3 1 / 4 3

【手続補正書】

20

【提出日】令和5年12月11日(2023.12.11)

【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】

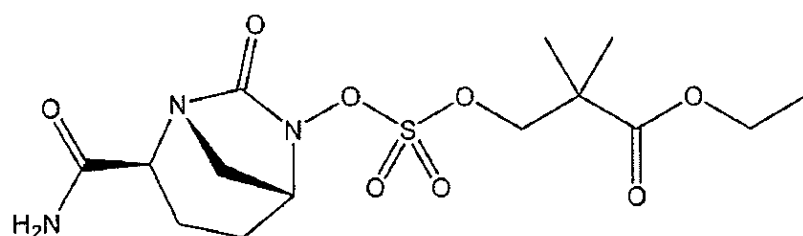
【請求項1】

アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩；および

以下の構造

30

【化3】



を有するエチル3-((((1R,2S,5R)-2-カルバモイル-7-オキソ-1,6-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-6-イル)オキシ)スルホニル)オキシ)-2,2-ジメチルプロパノエートもしくはその医薬的に許容可能な塩であるアピバクタム誘導体を含む医薬組成物。

40

【請求項2】

アピバクタム誘導体が塩酸塩を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

医薬組成物が、患者における細菌感染症を治療するための、相乗的有効量のアモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩、およびアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

50

医薬組成物が、患者における細菌感染症を治療するための、治療有効量のアモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩、および治療有効量のアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

細菌感染症がマイコバクテリウム属の細菌によって引き起こされる、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項6】

マイコバクテリウムが *M. ulcerans* 及び/又は *M. abscessus* である、請求項5に記載の医薬組成物。

【請求項7】

細菌感染症が、肺感染症、軟部組織感染症、中枢神経系感染症、菌血症、眼の感染症、または前記感染症のいずれかの組み合わせを含む、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項8】

細菌感染症が非結核性マイコバクテリア感染症を含む、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項9】

非結核性マイコバクテリア感染症が、*M. avium*, *M. intracellulare*, *M. kansasii*, *M. xenopi*, *M. marinum*, *M. malmoense*, *M. simiae*, *M. abscessus*, *M. ulcerans*, *M. chelonae*, *M. fortuitum*, または前記細菌のいずれかの組み合わせを含む非結核性マイコバクテリウムによって引き起こされる、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項10】

医薬組成物が100mg～1,000mgのアモキシシリンを含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項11】

医薬組成物が200mg～900mgのアモキシシリンを含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項12】

医薬組成物が200mg～1,400mgのアピバクタム誘導体を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項13】

医薬組成物が300mg～1,400mgのアピバクタム誘導体を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項14】

医薬組成物が200mg～2,000mgのアピバクタム相当量を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項15】

医薬組成物が300mg～1,000mgのアピバクタム相当量を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項16】

医薬組成物が、100mg～1,000mgのアモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩;および300mg～2,000mgのアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項17】

医薬組成物が経口製剤を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項18】

医薬組成物が経口剤形を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項19】

請求項1に記載の医薬組成物を含む経口剤形。

【請求項20】

10

20

30

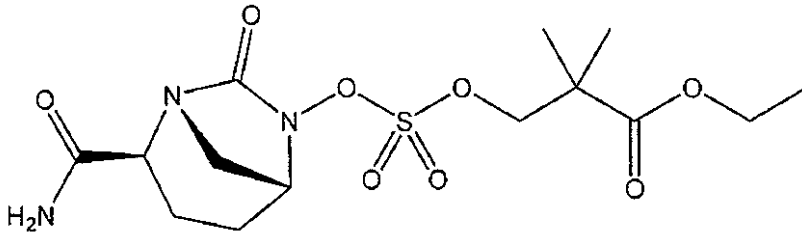
40

50

細菌感染症の治療を必要とする患者における細菌感染症の治療のために、アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩と組み合わせて用いるための、

構造：

【化9】



10

を有するエチル3-((((1R,2S,5R)-2-カルバモイル-7-オキソ-1,6-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-6-イル)オキシ)スルホニル)オキシ)-2,2-ジメチルプロパノエートもしくはその医薬的に許容可能な塩であるアビバクタム誘導体を含む医薬組成物。

【請求項21】

細菌感染症が放線菌目細菌によって引き起こされる、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項22】

細菌感染症が、Mycobacteriaceae属細菌、Actinomycetaceae属細菌、Nocardiaceae属細菌、または前記細菌の組み合わせによって引き起こされる、請求項20に記載の医薬組成物。

20

【請求項23】

細菌感染症がMycobacteriaceae属細菌によって引き起こされる、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項24】

細菌感染症がM.ulceransによって引き起こされる、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項25】

細菌感染症がM.abscessusによって引き起こされる、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項26】

細菌感染症が、肺感染症、軟部組織感染症、中枢神経系感染症、菌血症、眼の感染症、または前記感染症のいずれかの組み合わせを含む、請求項20に記載の医薬組成物。

30

【請求項27】

細菌感染症が非結核性マイコバクテリア感染症を含む、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項28】

非結核性マイコバクテリア感染症が、M.avium, M.intracellulare, M.kansasii, M.xenopi, M.marinum, M.malmoense, M.simiae, M.abscessus, M.ulcerans, M.chelonae, M.fortuitum, または前記細菌のいずれかの組み合わせを含む非結核性マイコバクテリウムによって引き起こされる、請求項27に記載の医薬組成物。

40

【請求項29】

細菌感染症の治療が、アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩およびアビバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を、一日当たり1~4回別々に投与することを含む、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項30】

細菌感染症の治療が、アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩の600mg~1,500mgの合計日用量;およびアビバクタム誘導体の600mg~4,200mgアビバクタム相当量の合計日用量;を患者に経口投与することを含む、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項31】

50

細菌感染症の治療が、アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩の600mg～1,500mgの合計日用量;およびアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩の900mg～1,800mgの合計日用量;を患者に経口投与することを含み、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項32】

細菌感染症の治療が、8µg/ml以上のMICを超えるアモキシシリンの持続血漿濃度を達成する量のアモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩を投与することを含み、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項33】

細菌感染症の治療が、16µg/ml以上のみMICを超えるアモキシシリンの持続血漿濃度を達成する量のアモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩を投与することを含み、請求項20に記載の医薬組成物。

10

【請求項34】

経口投与することが、アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩、およびアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を含んでなる経口剤形を経口投与することを含み、請求項30または31に記載の医薬組成物。

【請求項35】

経口投与することが、アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩を含んでなる第1の経口剤形を経口投与すること;およびアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を含んでなる第2の剤形を経口投与することを含む、請求項30または31に記載の医薬組成物。

20

【請求項36】

細菌感染症の治療が、アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩、およびアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を患者に同時投与することを含み、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項37】

細菌感染症の治療が、第1の量のアモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩、および第1の量のアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を患者に経口投与することを含み第1の治療フェーズ;ならびに

30

第2の量のアモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩、および第2の量のアピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩を患者に経口投与することを含み第2の治療フェーズ

を含む、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項38】

アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩の第1の量が、アモキシシリンもしくはその医薬的に許容可能な塩の第2の量より多い、請求項37に記載の医薬組成物。

【請求項39】

アピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩の第1の量が、アピバクタム誘導体もしくはその医薬的に許容可能な塩の第2の量より多い、請求項37に記載の医薬組成物。

40

【請求項40】

第1の治療フェーズが12週間未満の継続期間を有する、請求項37に記載の医薬組成物。

【請求項41】

第1の治療フェーズが4週間未満の継続期間を有する、請求項37に記載の医薬組成物。

【請求項42】

第2の治療フェーズが12ヶ月未満の継続期間を有する、請求項37に記載の医薬組成物。

50

【請求項 4 3】

第2の治療フェーズが6ヶ月未満の継続期間を有する、請求項 3 7 に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50