

【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29年3月30日 (2017.3.30)

【公表番号】特表2016-513642(P2016-513642A)

【公表日】平成28年5月16日 (2016.5.16)

【年通号数】公開・登録公報2016-029

【出願番号】特願2016-500713(P2016-500713)

【国際特許分類】

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/19 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 7/06 Z N A

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 9/19

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/18

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月17日 (2017.2.17)

【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

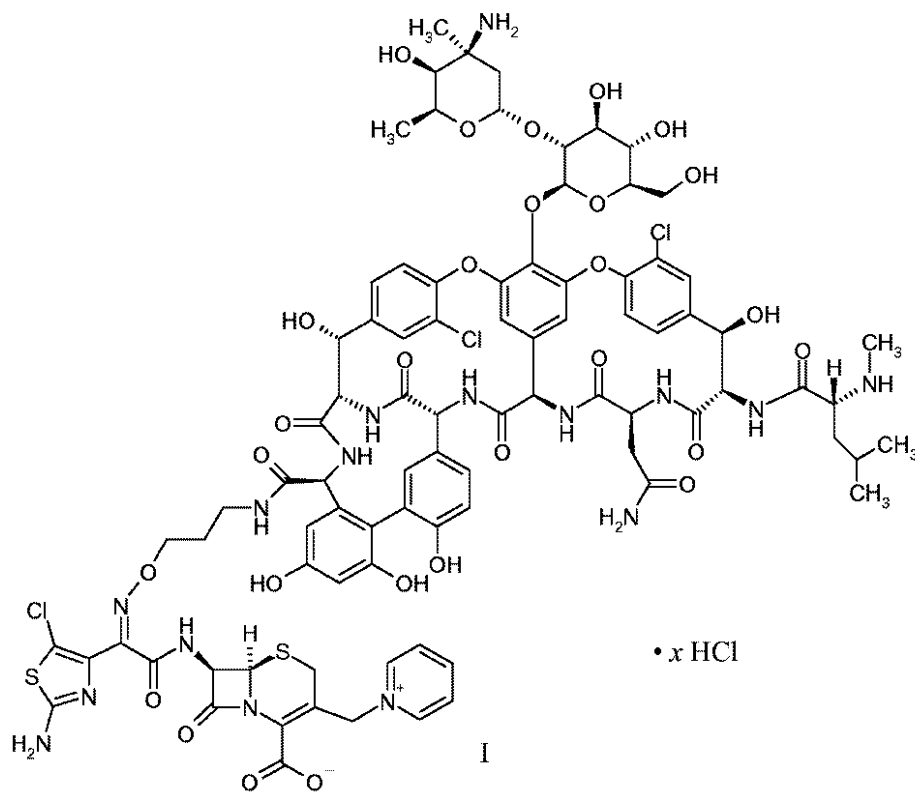
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 6】



(式中、 x は約 1 ~ 約 2 の範囲にある) の化合物。

【請求項 2】

x が約 1 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

x が約 2 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

薬学的に許容される担体および請求項 1、2 または 3 に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 5】

(a) 請求項 1、2 または 3 に記載の化合物、(b) スクロースおよび (c) グリシンまたは薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

【請求項 6】

凍結乾燥組成物である、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

- (a) 請求項 1、2 または 3 に記載の化合物、
 (b) 約 0.5 ~ 約 2.0 重量部のスクロース、および
 (c) 約 0.5 ~ 約 2.0 重量部のグリシン (遊離塩基当量として)

を含み、

スクロースおよびグリシンの重量部が、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物 (遊離塩基当量として) の重量部に基づく、医薬組成物。

【請求項 8】

約 1.0 重量部のスクロースおよび約 1.5 重量部のグリシンを含む、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記医薬組成物中の請求項 1、2 または 3 に記載の化合物（遊離塩基当量として）の純度の変化が、約 18 ～ 約 25 の範囲の温度で 12 か月間貯蔵した後に高速液体クロマトグラフィーにより測定するとき、約 10 % 未満である、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

患者における細菌感染症を処置するための組成物であって、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物を含む組成物。

【請求項 11】

患者における細菌感染症を処置するための医薬組成物であって、薬学的に許容される担体および請求項 1、2 または 3 に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 12】

治療に使用するための、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物を含む組成物。

【請求項 13】

医薬の製造に使用するための、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

【請求項 14】

(a) 26 - [[[3 - [[(Z) - [1 - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 4 - チアゾリル) - 2 - [[(6 R , 7 R) - 2 - カルボキシ - 8 - オキソ - 3 - (ピリジニオメチル) - 5 - チア - 1 - アザビシクロ [4 . 2 . 0] オクタ - 2 - エン - 7 - イル] アミノ] - 2 - オキソエチリデン] アミノ] オキシ] プロピル] アミノ] - カルボニル] - 26 - デカルボキシバンコマイシンおよび塩酸を約 1 : 1 ～ 約 1 : 2 のモル比で含む水性組成物を形成させるステップ、

(b) 前記水性組成物を凍結乾燥して請求項 1 に記載の化合物を提供するステップを含む、請求項 1 に記載の化合物を調製するプロセス。

【請求項 15】

前記モル比が約 1 : 1 である、請求項 14 に記載のプロセス。

【請求項 16】

前記モル比が約 1 : 2 である、請求項 14 に記載のプロセス。

【請求項 17】

貯蔵中の 26 - [[[3 - [[(Z) - [1 - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 4 - チアゾリル) - 2 - [[(6 R , 7 R) - 2 - カルボキシ - 8 - オキソ - 3 - (ピリジニオメチル) - 5 - チア - 1 - アザビシクロ [4 . 2 . 0] オクタ - 2 - エン - 7 - イル] アミノ] - 2 - オキソエチリデン] - アミノ] オキシ] プロピル] アミノ] - カルボニル] - 26 - デカルボキシバンコマイシンの分解を低減する方法であって、(a) 請求項 1、2 または 3 に記載の化合物を形成させるステップ、および (b) 請求項 1、2 または 3 に記載の化合物を約 25 ～ 約 25 の範囲の温度で貯蔵するステップを含む方法。

【請求項 18】

前記温度が、約 2 ～ 約 8 の範囲にある、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 19】

貯蔵中の 26 - [[[3 - [[(Z) - [1 - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 4 - チアゾリル) - 2 - [[(6 R , 7 R) - 2 - カルボキシ - 8 - オキソ - 3 - (ピリジニオメチル) - 5 - チア - 1 - アザビシクロ [4 . 2 . 0] オクタ - 2 - エン - 7 - イル] アミノ] - 2 - オキソエチリデン] - アミノ] オキシ] プロピル] アミノ] - カルボニル] - 26 - デカルボキシバンコマイシンの分解を低減する方法であって、(a) 請求項 8 に記載の医薬組成物を形成させるステップ、および (b) 該医薬組成物を約 25 ～ 約 25 の範囲の温度で貯蔵するステップを含む、方法。

【請求項 20】

前記温度が、約 2 ～ 約 8 の範囲にある、請求項 19 に記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0031

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0031】

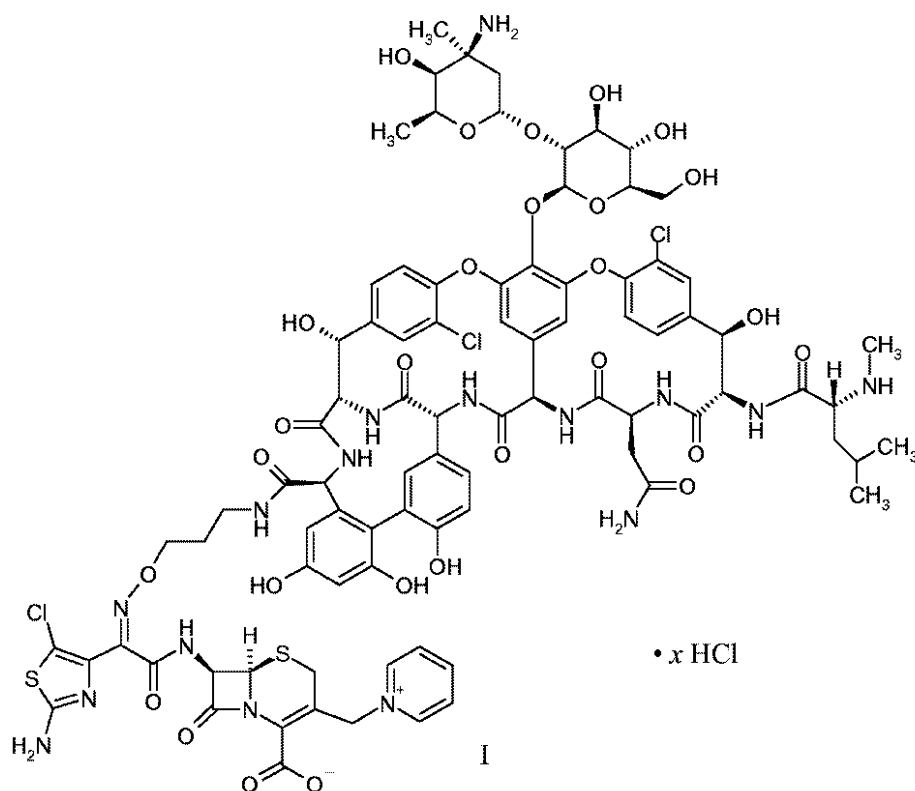
本発明の別の態様および実施形態は、本明細書において開示されている。

本発明は、例えば、以下を提供する：

(項目1)

式I

【化6】



(式中、xは約1～約2の範囲にある)の化合物。

(項目2)

xが約1である、項目1に記載の化合物。

(項目3)

xが約2である、項目1に記載の化合物。

(項目4)

薬学的に許容される担体および項目1、2または3に記載の化合物を含む医薬組成物。

(項目5)

(a)項目1、2または3に記載の化合物、(b)スクロースおよび(c)グリシンまたは薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

(項目6)

凍結乾燥組成物である、項目5に記載の医薬組成物。

(項目7)

(a)項目1、2または3に記載の化合物、

(b)約0.5～約2.0重量部のスクロース、および

(c)約0.5～約2.0重量部のグリシン(遊離塩基当量として)を含み、

スクロースおよびグリシンの重量部が、項目 1、2 または 3 に記載の化合物（遊離塩基当量として）の重量部に基づく、医薬組成物。

（項目 8）

約 1.0 重量部のスクロースおよび約 1.5 重量部のグリシンを含む、項目 6 に記載の医薬組成物。

（項目 9）

前記医薬組成物中の項目 1、2 または 3 に記載の化合物（遊離塩基当量として）の純度の変化が、約 18 ～ 約 25 の範囲の温度で 12 か月間貯蔵した後に高速液体クロマトグラフィーにより測定するとき、約 10 % 未満である、項目 8 に記載の医薬組成物。

（項目 10）

患者における細菌感染症を処置する方法であって、項目 1、2 または 3 に記載の化合物を前記患者に投与するステップを含む方法。

（項目 11）

患者における細菌感染症を処置する方法であって、薬学的に許容される担体および項目 1、2 または 3 に記載の化合物を含む医薬組成物を該患者に投与するステップを含む方法。

（項目 12）

治療に使用するための、項目 1、2 または 3 に記載の化合物。

（項目 13）

医薬の製造に使用するための、項目 1、2 または 3 に記載の化合物。

（項目 14）

（a）26 - [[[3 - [[(Z) - [1 - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 4 - チアゾリル) - 2 - [[(6 R , 7 R) - 2 - カルボキシ - 8 - オキソ - 3 - (ピリジニオメチル) - 5 - チア - 1 - アザピシクロ [4 . 2 . 0] オクタ - 2 - エン - 7 - イル] アミノ] - 2 - オキソエチリデン] アミノ] オキシ] プロピル] アミノ] - カルボニル] - 26 - デカルボキシバンコマイシンおよび塩酸を約 1 : 1 ～ 約 1 : 2 のモル比で含む水性組成物を形成させるステップ、

（b）前記水性組成物を凍結乾燥して項目 1 に記載の化合物を提供するステップを含む、項目 1 に記載の化合物を調製するプロセス。

（項目 15）

前記モル比が約 1 : 1 である、項目 14 に記載のプロセス。

（項目 16）

前記モル比が約 1 : 2 である、項目 14 に記載のプロセス。

（項目 17）

貯蔵中の 26 - [[[3 - [[(Z) - [1 - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 4 - チアゾリル) - 2 - [[(6 R , 7 R) - 2 - カルボキシ - 8 - オキソ - 3 - (ピリジニオメチル) - 5 - チア - 1 - アザピシクロ [4 . 2 . 0] オクタ - 2 - エン - 7 - イル] アミノ] - 2 - オキソエチリデン] - アミノ] オキシ] プロピル] アミノ] - カルボニル] - 26 - デカルボキシバンコマイシンの分解を低減する方法であって、（a）項目 1、2 または 3 に記載の化合物を形成させるステップ、および（b）項目 1、2 または 3 に記載の化合物を約 - 25 ～ 約 25 の範囲の温度で貯蔵するステップを含む方法。

（項目 18）

前記温度が、約 2 ～ 約 8 の範囲にある、項目 17 に記載の方法。

（項目 19）

貯蔵中の 26 - [[[3 - [[(Z) - [1 - (2 - アミノ - 5 - クロロ - 4 - チアゾリル) - 2 - [[(6 R , 7 R) - 2 - カルボキシ - 8 - オキソ - 3 - (ピリジニオメチル) - 5 - チア - 1 - アザピシクロ [4 . 2 . 0] オクタ - 2 - エン - 7 - イル] アミノ] - 2 - オキソエチリデン] - アミノ] オキシ] プロピル] アミノ] - カルボニル] - 26 - デカルボキシバンコマイシンの分解を低減する方法であって、（a）項目 8 に記載の医薬組成物を形成させるステップ、および（b）該医薬組成物を約 - 25 ～ 約 25 の

範囲の温度で貯蔵するステップを含む、方法。

(項目 2 0)

前記温度が、約 2 ~ 約 8 の範囲にある、項目 1 9 に記載の方法。