

【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 2 年 6 月 18 日 (2020.6.18)

【公表番号】特表 2019-515927 (P2019-515927A)

【公表日】令和 1 年 6 月 13 日 (2019.6.13)

【年通号数】公開・登録公報 2019-022

【出願番号】特願 2018-556356 (P2018-556356)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/352 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/352

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 4 月 27 日 (2020.4.27)

【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】

感染症の処置を必要とする被験体において感染症を処置する方法において使用するための、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物であって、前記薬学的組成物が、前記感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与される、薬学的組成物。

【請求項 2】

前記薬学的組成物が、抗生物質、抗ウイルス物質もしくは抗真菌物質またはその薬学的に許容され得る塩と組み合わせて被験体に投与される、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3】

前記感染症が局所感染症である、請求項 1 または 2 に記載の薬学的組成物。

【請求項 4】

前記局所感染症が、皮膚感染症、肺感染症、気管支感染症、咽喉感染症、眼感染症、耳感染症、膀胱感染症または尿路感染症である、請求項 3 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5】

前記感染症が全身感染症である、請求項 1 または 2 に記載の薬学的組成物。

【請求項 6】

前記感染症が、細菌感染症である、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

【請求項 7】

前記細菌感染症が、シュードモナス感染症、ブドウ球菌感染症または連鎖球菌感染症である、請求項 6 に記載の薬学的組成物。

【請求項 8】

アジュレム酸を含む前記薬学的組成物が、抗生物質と組み合わせて前記被験体に投与される、請求項 2 ～ 7 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 9】

前記抗生物質が、アミカシン、ゲンタマイシン、カナマイシン、ネオマイシン、ネチルマイシン、トブラマイシン、パロモマイシン、ストレプトマイシン、スペクチノマイシン、ゲルダナマイシン、ハービマイシン、リファキシミン、ロラカルベフ、エルタペネム、ドリペネム、イミペネム/シラスタチン、メロペネム、セファドロキシル、セファゾリン、セファロチン、セファレキシン、セファクロール、セファマンドール、セフォキシチン、セフprozil、セフロキシム、セフィキシム、セフジニル、セフジトレン、セフォペラゾン、セフォタキシム、セフボドキシム、セフトジジム、セフトチブテン、セフトチゾキシム、セフトリアキソン、セフェピム、セフトアロリンフォサミル、セフトビブロール、テイコプラニン、バンコマイシン、テラバンシン、ダルババンシン、オリタバンシン、クリンダマイシン、リンコマイシン、ダブトマイシン、アジスロマイシン、クラリスロマイシン、ジリスロマイシン、エリスロマイシン、ロキシスロマイシン、トロレアンドマイシン、テリスロマイシン、スピラマイシン、アズトレオナム、フラゾリドン、ニトロフラントイン、リネゾリド、ボシゾリド、ラデゾリド、トレゾリド、アモキシシリン、アンピシリン、アズロシリン、カルベニシリン、クロキサシリン、ジクロキサシリン、フルクロキサシリン、メズロシリン、メチシリン、ナフシリン、オキサシリン、ペニシリン g , ペニシリン v、ピペラシリン、ペニシリン g , テモシリン、チカルシリン、アモキシシリンクラブラン酸、アンピシリン/スルバクタム、ピペラシリン/タゾバクタム、チカルシリン/クラブラン酸、バシトラシン、コリスチン、ポリミキシン b、シプロフロキサシン、エノキサシン、ガチフロキサシン、ゲミフロキサシン、レボフロキサシン、ロメフロキサシン、モキシフロキサシン、ナリジクス酸、ノルフロキサシン、オフロキサシン、トロバフロキサシン、グレバフロキサシン、スパルフロキサシン、テマフロキサシン、マフェニド、スルファセタミド、スルファジアジン、スルファジアジン銀、スルファジメトキシム、スルファメチゾール、スルファメトキサゾール、スルファニルアミド、スルファサラジン、スルフイソキサゾール、トリメトプリム - スルファメトキサゾール ( t m p - s m x )、スルホンアミドクリソイジン、デメクロサイクリン、ドキシサイクリン、ミノサイクリン、オキシテトラサイクリン、テトラサイクリン、クロファジミン、ダブソン、カブレオマイシン、サイクロセリン、エタンブトール ( b s )、エチオナミド、イソニアジド、ピラジナミド、リファンピシン、リファブチン、リファペンチン、ストレプトマイシン、アルスフェナミン、クロラムフェニコール、ホスホマイシン、フシジン酸、メトロニダゾール、ムピロシン、プラテンシマイシン、キヌプリスチン/ダルホプリスチン、チアンフェニコール、チゲサイクリン、チニダゾールおよびトリメトプリムから選択される、請求項 8 に記載の薬学的組成物。

【請求項 10】

前記感染症が、ウイルス感染症である、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の薬学的組

成物。

【請求項 1 1】

前記感染症はレトロウイルス感染症、ヘルペスウイルス感染症、パピローマウイルス感染症、ポックスウイルス感染症、ピコルナウイルス感染症、ヘパドナウイルス感染症、フラビウイルス感染症、トガウイルス感染症、オルトミクソウイルス感染症、フィロウイルス感染症またはパラミクソウイルス感染症である、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

アジュレム酸を含む前記薬学的組成物が、抗ウイルス物質と組み合わせて前記被験体に投与される、請求項 2 ～ 5、1 0 または 1 1 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 3】

前記抗ウイルス物質が、ビダラビン、アシクロビル、ガンシクロビル、バルガンシクロビル、AZT、ddI、ddC、d4T、3TC、ネビラビン、デラビルジン、サキナビル、リトナビル、インジナビル、ネルフィナビル、リバビリン、インターフェロン、ヌクレオシド・アナログ逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシド逆転写酵素阻害剤またはプロテアーゼ阻害剤から選択される、請求項 1 2 に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 4】

前記感染症が、真菌感染症である、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 5】

前記真菌感染症が Aspergillus 感染症、Candida 感染症、Cryptococcus 感染症または Fusarium 感染症である、請求項 1 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 6】

アジュレム酸を含む前記薬学的組成物が、抗真菌物質と組み合わせて前記被験体に投与される、請求項 1 ～ 5、1 4 または 1 5 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 7】

前記抗真菌物質は、アンホテリシン B、カンジシジン、フィリピン、ハマイシン、ナタマイシン、ナイスタチン、リモシジン、ビホナゾール、ブトコナゾール、クロトリマゾール、エコナゾール、フェンチコナゾール、イソコナゾール、ケトコナゾール、ルリコナゾール、ミコナゾール、オモコナゾール、オキシコナゾール、セルタコナゾール、スルコナゾール、チオコナゾール、トリアゾール、アルバコナゾール、エフィナコナゾール、エボキシコナゾール、フルコナゾール、イサブコナゾール、イトラコナゾール、ボサコナゾール、プロビコナゾール、ラブコナゾール、テルコナゾール、ポリコナゾール、チアゾール、アバフンギン、アモロルフィン、ブテナフィン、ナフチフィン、テルビナフィン、アニデュラファンギン、カスポファンギン、ミカファンギン、シクロピロクス、フルシトシン、グリセオフルビン、トルナフテートおよびウンデシレン酸から選択される、請求項 1 6 に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 8】

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物が、第 1 の時間にわたって投与され、前記抗生物質、抗ウイルス物質もしくは抗真菌物質またはその薬学的に許容され得る塩が、第 2 の時間にわたって投与され、

- 前記第 1 の時間が、前記第 2 の時間の前に行われるか、
  - 前記第 2 の時間が、前記第 1 の時間の前に行われるか、または
  - 前記第 1 の時間と前記第 2 の時間は、同時に生じる、
- 請求項 2 ～ 1 7 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 9】

前記感染症の消失に関連する時間の長さが、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む前記薬学的組成物を投与されていない被験体における同じタイプの感染症と比べて、20%またはそれを超えて短縮されるか、あるいは50%またはそれを超えて短縮される、請求項 1 ～ 1 8 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 20】

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む前記薬学的組成物が、経口的に、吸入によって、局所的に、静脈内に、間質内に、パッチを介して、インプラントを介して、または眼投与による投与のために製剤化されている、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 21】

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩の有効量が、1 日あたり約 5 mg という用量、1 日あたり約 20 mg という用量または 1 日あたり約 40 mg という用量を含む、請求項 1 ～ 20 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 22】

前記被験体が、嚢胞性線維症を有しない、請求項 1 ～ 21 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 23】

前記被験体が、HIV を有しない、請求項 1 ～ 21 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0176

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0176】

本発明をその特定の実施形態に関連して説明してきたが、さらなる改変が可能であること、および本願は、概して本発明の原理に従い、本発明が属する分野における公知の慣例または習慣的な慣例に入る本発明からのそのような逸脱を含み、上記の本明細書に示された本質的な特徴に適用され得、請求項の範囲に従う、本発明の任意のバリエーション、使用または適合を包含すると意図されていることが理解される。他の実施形態が、請求項の範囲内である。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

感染症の処置を必要とする被験体において感染症を処置する方法であって、該方法は、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含み、ここで、前記被験体は、嚢胞性線維症または HIV 感染症を有しない、方法。

(項目 2)

局所感染症の処置を必要とする被験体において局所感染症を処置する方法であって、該方法は、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記局所感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含み、ここで、前記被験体は、嚢胞性線維症を有しない、方法。

(項目 3)

前記局所感染症が、皮膚感染症、肺感染症、気管支感染症、咽喉感染症、眼感染症、耳感染症、膀胱感染症または尿路感染症である、項目 2 に記載の方法。

(項目 4)

全身感染症の処置を必要とする被験体において全身感染症を処置する方法であって、該方法は、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記全身感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含み、ここで、前記被験体は、HIV 感染症を有しない、方法。

(項目 5)

該感染症が、細菌感染症である、項目 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 6)

該細菌感染症が、シュードモナス感染症、ブドウ球菌感染症または連鎖球菌感染症である、5に記載の方法。

(項目7)

アジュレム酸を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症の細菌負荷量を減少させる、項目5または6に記載の方法。

(項目8)

該感染症が、ウイルス感染症である、項目1～4のいずれか1項に記載の方法。

(項目9)

アジュレム酸を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症のウイルス量を減少させる、項目8に記載の方法。

(項目10)

該感染症が、真菌感染症である、項目1～4のいずれか1項に記載の方法。

(項目11)

アジュレム酸を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症の真菌量を減少させる、項目10に記載の方法。

(項目12)

細菌感染症の処置を必要とする被験体において細菌感染症を処置する方法であって、該方法は、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記細菌感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含む、方法。

(項目13)

該細菌感染症が、シュードモナス感染症、ブドウ球菌感染症または連鎖球菌感染症である、12に記載の方法。

(項目14)

アジュレム酸を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症の細菌負荷量を減少させる、項目12または13に記載の方法。

(項目15)

ウイルス感染症の処置を必要とする被験体においてウイルス感染症を処置する方法であって、該方法は、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記ウイルス感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含む、方法。

(項目16)

アジュレム酸を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症のウイルス量を減少させる、項目15に記載の方法。

(項目17)

真菌感染症の処置を必要とする被験体において真菌感染症を処置する方法であって、該方法は、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記真菌感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含む、方法。

(項目18)

アジュレム酸を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症の真菌量を減少させる、項目17に記載の方法。

(項目19)

細菌感染症の処置を必要とする被験体において細菌感染症を処置する方法であって、該方法は、

(e) 抗生物質またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を投与する工程；および

(f) アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を投与する工程

を含み、ここで、該細菌感染症の消失に関連する時間の長さは、該抗生物質だけを含む薬学的組成物を投与された被験体における同じタイプの細菌感染症の消失に関連する時間の長さ未満である、方法。

(項目 2 0)

ウイルス感染症の処置を必要とする被験体においてウイルス感染症を処置する方法であって、該方法は、

( c ) 抗ウイルス物質またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を投与する工程；および

( d ) アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を投与する工程

を含み、ここで、該ウイルス感染症の消失に関連する時間の長さは、該抗ウイルス物質だけを含む薬学的組成物抗ウイルス物質だけを含む薬学的組成物を投与された被験体における同じタイプのウイルス感染症の消失に関連する時間の長さ未満である、方法。

(項目 2 1)

真菌感染症の処置を必要とする被験体において真菌感染症を処置する方法であって、該方法は、

( e ) 抗真菌物質またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を投与する工程；および

( f ) アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を投与する工程

を含み、ここで、該真菌感染症の消失に関連する時間の長さは、該抗真菌物質だけを含む薬学的組成物を投与された被験体における同じタイプの真菌感染症の消失に関連する時間の長さ未満である、方法。

(項目 2 2)

該工程 ( a ) が、第 1 の時間にわたって行われ、工程 ( b ) が、第 2 の時間にわたって行われ、工程 ( a ) が、工程 ( b ) の前に行われる、項目 1 9 ~ 2 1 に記載の方法。

(項目 2 3)

該工程 ( b ) が、第 1 の時間にわたって行われ、工程 ( a ) が、第 2 の時間にわたって行われ、工程 ( b ) が、工程 ( a ) の前に行われる、項目 1 9 ~ 2 1 に記載の方法。

(項目 2 4)

該工程 ( a ) が、第 1 の時間にわたって行われ、工程 ( b ) が、第 2 の時間にわたって行われ、該第 1 の時間と該第 2 の時間は、同時に生じる、項目 1 9 ~ 2 1 に記載の方法。

(項目 2 5)

細菌感染症の処置を必要とする被験体において細菌感染症を処置する方法であって、該方法は、抗生物質またはその薬学的に許容され得る塩およびアジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記細菌感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含む、方法。

(項目 2 6)

該細菌感染症が、シュードモナス感染症、ブドウ球菌感染症または連鎖球菌感染症である、項目 2 5 に記載の方法。

(項目 2 7)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症の細菌負荷量を減少させる、項目 2 5 または 2 6 に記載の方法。

(項目 2 8)

真菌感染症の処置を必要とする被験体において真菌感染症を処置する方法であって、該方法は、抗真菌物質またはその薬学的に許容され得る塩およびアジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記真菌感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含む、方法。

(項目 2 9)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症の真菌量を減少させる、項目 2 8 に記載の方法。

(項目 3 0)

ウイルス感染症の処置を必要とする被験体においてウイルス感染症を処置する方法であ

って、該方法は、抗ウイルス物質またはその薬学的に許容され得る塩およびアジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む薬学的組成物を、前記ウイルス感染症を処置するのに有効な量で前記被験体に投与する工程を含む、方法。

(項目 3 1)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物の投与が、該感染症のウイルス量を減少させる、項目 3 0 に記載の方法。

(項目 3 2)

該感染症の消失に関連する時間の長さが、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物を投与されていない被験体における同じタイプの感染症と比べて、20%またはそれを超えて短縮される、項目 1 ~ 3 1 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 3 3)

該感染症の消失に関連する時間の長さが、アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物を投与されていない被験体における同じタイプの感染症と比べて、50%またはそれを超えて短縮される、項目 1 ~ 3 1 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 3 4)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物が、経口的に、吸入によって、局所的に、静脈内に、間質内に、パッチを介して、インプラントを介して、または眼投与によって、投与される、項目 1 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 3 5)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物が、経口的に投与される、項目 3 4 に記載の方法。

(項目 3 6)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物が、カプセル剤または錠剤として投与される、項目 3 5 に記載の方法。

(項目 3 7)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩の有効量が、1日あたり約 5 mg という用量を含む、項目 3 5 または 3 6 に記載の方法。

(項目 3 8)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩の有効量が、1日あたり約 20 mg という用量を含む、項目 3 5 または 3 6 に記載の方法。

(項目 3 9)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩の有効量が、1日あたり約 40 mg という用量を含む、項目 3 5 または 3 6 に記載の方法。

(項目 4 0)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物が、吸入によって投与される、項目 3 4 に記載の方法。

(項目 4 1)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物が、エアロゾルまたはスプレーとして投与される、項目 4 0 に記載の方法。

(項目 4 2)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物が、局所的に投与される、項目 3 4 に記載の方法。

(項目 4 3)

アジュレム酸またはその薬学的に許容され得る塩を含む該薬学的組成物が、ゲルまたはクリームとして投与される、項目 4 2 に記載の方法。

(項目 4 4)

該被験体が、ヒト被験体である、項目 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 4 5)

該被験体が、嚢胞性線維症を有しない、項目 4 ~ 4 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 4 6)

該被験体が、H I Vを有しない、項目 2 ～ 4 5 のいずれか 1 項に記載の方法。