

【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22年9月16日 (2010.9.16)

【公表番号】特表2010-514798(P2010-514798A)

【公表日】平成22年5月6日 (2010.5.6)

【年通号数】公開・登録公報2010-018

【出願番号】特願2009-544280(P2009-544280)

【国際特許分類】

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/155 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 239/28 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 P 31/12

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/505

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 31/22

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/155

A 6 1 K 31/137

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1  
 A 6 1 K 47/32  
 C 0 7 D 401/14  
 C 0 7 D 239/28

【手続補正書】

【提出日】平成22年7月29日(2010.7.29)

【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

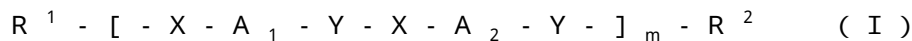
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :



[ 式中 :

X は、 $NR^8$ 、 $-N(R^8)N(R^8)-$ 、O、又は S であり ;

Y は、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 $O=S=O$ 、又は  $-C(=O)C(=O)-$  であり ;

$R^8$  は、水素又はアルキルであり ;

$A_1$  と  $A_2$  は、独立して、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、ここで  $A_1$  と  $A_2$  は、独立して、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく ; 又は

$A_1$  は、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、 $A_2$  は、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル又は  $-(CH_2)_q-$  であり (ここで q は、1 ~ 7 である)、ここで  $A_1$  と  $A_2$  は、独立して、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく ; 又は

$A_2$  は、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、 $A_1$  は、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル又は  $-(CH_2)_q-$  であり (ここで q は、1 ~ 7 である)、ここで  $A_1$  と  $A_2$  は、独立して、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく ;

$R^1$  は :

( i ) 水素、極性 (PL) 基、又は非極性 (NPL) 基であり、 $R^2$  は、 $-X-A_1-Y-R^{1'}$  であり (ここで、 $R^{1'}$  は、水素、極性 (PL) 基、又は非極性 (NPL) 基である) ; 又は

( i i )  $R^1$  と  $R^2$  は、独立して、水素、極性 (PL) 基、又は非極性 (NPL) 基であり ; 又は

( i i i )  $R^1$  と  $R^2$  は、ともに単結合であり ;

NPL は、 $-B(OR^4)_2$  及び  $-(NR^{3'})_{q_1}NPL-U^{NPL}-(CH_2)_p_{NPL}-(NR^{3''})_{q_2}NPL-R^{4'}$  より独立して選択される非極性基であり、ここで :

$R^3$ 、 $R^{3'}$ 、及び  $R^{3''}$  は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され ;

$R^4$  と  $R^{4'}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、及びヘテロアリールより独立して選択され、このいずれも、1 以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく ;

$U^{NPL}$  は、非存在であるか又は O、S、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $NR^3$ 、 $-C($

= O ) - 、 - C ( = O ) - N = N - NR<sup>3</sup> - 、 - C ( = O ) - NR<sup>3</sup> - N = N - 、 - N = N - NR<sup>3</sup> - 、 - C ( = N - N ( R<sup>3</sup> )<sub>2</sub> ) - 、 - C ( = NR<sup>3</sup> ) - 、 - C ( = O ) O - 、 - C ( = O ) S - 、 - C ( = S ) - 、 - O - P ( = O )<sub>2</sub> O - 、 - R<sup>3</sup> O - 、 - R<sup>3</sup> S - 、 - S - C = N - 、及び - C ( = O ) - NR<sup>3</sup> - O - より選択され、ここで2つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

- ( CH<sub>2</sub> )<sub>p</sub> N P L - アルキレン鎖は、1以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

p N P L は、0 ~ 8 であり；

q<sub>1</sub> N P L と q<sub>2</sub> N P L は、独立して、0、1、又は2であり；

P L は、ハロ、ヒドロキシエトキシメチル、メトキシエトキシメチル、ポリオキシエチレン、及び - ( NR<sup>5</sup> )<sub>q<sub>1</sub></sub> P L - U<sup>P L</sup> - ( CH<sub>2</sub> )<sub>p</sub> P L - ( NR<sup>5</sup> )<sub>q<sub>2</sub></sub> P L - V より選択される極性基であり、ここで：

R<sup>5</sup>、R<sup>5</sup>′、及びR<sup>5</sup>″は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

U<sup>P L</sup> は、非存在であるか又は O、S、S ( = O )、S ( = O )<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>、- C ( = O ) - 、- C ( = O ) - N = N - NR<sup>5</sup> - 、- C ( = O ) - NR<sup>5</sup> - N = N - 、- N = N - NR<sup>5</sup> - 、- C ( = N - N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> ) - 、- C ( = NR<sup>5</sup> ) - 、- C ( = O ) O - 、- C ( = O ) S - 、- C ( = S ) - 、- O - P ( = O )<sub>2</sub> O - 、- R<sup>5</sup> O - 、- R<sup>5</sup> S - 、- S - C = N - 、及び - C ( = O ) - NR<sup>5</sup> - O - より選択され、ここで2つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

V は、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、- NH ( CH<sub>2</sub> )<sub>p</sub> NH<sub>2</sub> ( ここで p は、1 ~ 4 である )、- N ( CH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> )<sub>2</sub>、ジアザミノ、アミジノ、グアニジノ、グアニル、セミカルバゾン、アリール、複素環、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、- NH ( CH<sub>2</sub> )<sub>p</sub> NH<sub>2</sub> ( ここで p は、1 ~ 4 である )、- N ( CH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> )<sub>2</sub>、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、低級アシルアミノ、又はベンジルオキシカルボニルの1以上で置換されていてもよく；

- ( CH<sub>2</sub> )<sub>p</sub> P L - アルキレン鎖は、1以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

p P L は、0 ~ 8 であり；

q<sub>1</sub> P L と q<sub>2</sub> P L は、独立して、0、1、又は2であり；そして、

m は、1 ~ 約 20 である ] の抗微生物オリゴマー、又はその許容される塩又は溶媒和物の有効量と眼科用に許容される賦形剤を含んでなる眼科用組成物。

#### 【請求項 2】

X が、NR<sup>8</sup> であり；

Y は、C = O であり；

R<sup>8</sup> は、水素であり；

A<sub>1</sub> は、置換されていてもよい o - 、m - 、又は p - フェニレンであり、A<sub>2</sub> は、- ( CH<sub>2</sub> )<sub>q</sub> - ( ここで q は、1 である ) であり、そしてここで A<sub>1</sub> と A<sub>2</sub> の一方は、1 又は 2 の極性 ( P L ) 基で置換され、そして A<sub>1</sub> と A<sub>2</sub> の他方は、1 又は 2 の非極性 ( N P L ) 基で置換されており；又は

A<sub>2</sub> は、置換されていてもよい o - 、m - 、又は p - フェニレンであり、A<sub>1</sub> は、- ( CH<sub>2</sub> )<sub>q</sub> - ( ここで q は、1 である ) であり、そしてここで A<sub>1</sub> と A<sub>2</sub> の一方は、1 又は 2 の極性 ( P L ) 基で置換され、そして A<sub>1</sub> と A<sub>2</sub> の他方は、1 又は 2 の非極性 ( N P L ) 基で置換され；

R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> は、独立して、水素、極性 ( P L ) 基、又は非極性 ( N P L ) 基であり；

N P L は、- ( NR<sup>3</sup> )<sub>q<sub>1</sub></sub> N P L - U<sup>N P L</sup> - ( CH<sub>2</sub> )<sub>p</sub> N P L - ( NR<sup>3</sup> )<sub>q<sub>2</sub></sub> N P L - R<sup>4</sup>′ であり、ここで：

R<sup>4</sup>′ は、C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>18</sub> 分岐鎖アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub> アルケ

ニル、 $C_2 - C_{10}$  アルキニル、及び  $C_6 - C_{10}$  アリールより選択され、このいずれも、1 以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく；

$U^{NPL}$  は、非存在であるか又は  $NH$ 、 $-C(=O)-$ 、 $O$ 、及び  $S$  より選択され；

$-(CH_2)_p NPL$  - アルキレン鎖は、1 以上のアミノ基で置換されていてもよく；  
 $p NPL$  は、0 ~ 8 であり；

$q_1 NPL$  と  $q_2 NPL$  は、0 であり；

$PL$  は、 $-(NR^{5'})_{q_1 PL} - U^{PL} - (CH_2)_p PL - (NR^{5'})_{q_2 PL} - V$  であり、ここで：

$U^{PL}$  は、非存在であるか又は  $O$ 、 $S$ 、 $NH$ 、及び  $-C(=O)$  より選択され；

$V$  は、アミノ、 $C_1 - C_6$  アルキルアミノ、 $-NH(CH_2)_p NH_2$  (ここで  $p$  は、1 ~ 4 である)、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、ジアザミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され；

$-(CH_2)_p PL$  - アルキレン鎖は、1 以上のアミノ基で置換されていてもよく；  
 $p PL$  は、0 ~ 8 であり；

$q_1 PL$  と  $q_2 PL$  は、0 であり；そして、

$m$  は、4 又は 5 である、請求項 1 の組成物。

### 【請求項 3】

式 I I：



[ 式中：

$X$  は、 $NR^8$ 、 $O$ 、 $S$ 、 $-N(R^8)N(R^8)-$ 、 $-N(R^8)-(N=N)-$ 、 $-(N=N)-N(R^8)-$ 、 $-C(R^7R^{7'})NR^8-$ 、 $-C(R^7R^{7'})O-$ 、又は  $-C(R^7R^{7'})S-$  であり；

$Y$  は、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 $O=S=O$ 、 $-C(=O)C(=O)-$ 、 $C(R^6R^{6'})C=O$ 、又は  $C(R^6R^{6'})C=S$  であり；

$R^8$  は、水素又はアルキルであり；

$R^7$  と  $R^{7'}$  は、独立して、水素又はアルキルであるか、又は  $R^7$  と  $R^{7'}$  は、一緒に  $-(CH_2)_p-$  (ここで  $p$  は、4 ~ 8 である) であり；

$R^6$  と  $R^{6'}$  は、独立して、水素又はアルキルであるか、又は  $R^6$  と  $R^{6'}$  は、一緒に  $(CH_2)_2NR^{12}(CH_2)_2$  であり (ここで  $R^{12}$  は、水素、 $-C(=N)CH_3$ 、又は  $C(=NH)-NH_2$  である)；

$A_1$  と  $A_2$  は、独立して、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、ここで  $A_1$  と  $A_2$  は、独立して、1 以上の極性 ( $PL$ ) 基、1 以上の非極性 ( $NPL$ ) 基、又は 1 以上の極性 ( $PL$ ) 基と 1 以上の非極性 ( $NPL$ ) 基の組合せで置換されていてもよく；

$R^1$  は：

(i) 水素、極性基 ( $PL$ )、又は非極性基 ( $NPL$ ) であり、 $R^2$  は、 $-X - A_1 - X - R^1$  であり、ここで  $A_1$  は、上記に定義される通りであり、1 以上の極性 ( $PL$ ) 基、1 以上の非極性 ( $NPL$ ) 基、又は 1 以上の極性 ( $PL$ ) 基と 1 以上の非極性 ( $NPL$ ) 基の組合せで置換されていてもよく；又は

(ii) 水素、極性基 ( $PL$ )、又は非極性基 ( $NPL$ ) であり、 $R^2$  は、 $-X - A' - X - R^1$  であり、ここで  $A'$  は、アリーレン又はヘテロアリーレンであり、1 以上の極性 ( $PL$ ) 基、1 以上の非極性 ( $NPL$ ) 基、又は 1 以上の極性 ( $PL$ ) 基と 1 以上の非極性 ( $NPL$ ) 基の組合せで置換されていてもよく；

(iii)  $-Y - A_2 - Y - R^2$  であり、 $R^2$  は、水素、極性基 ( $PL$ )、又は非極性基 ( $NPL$ ) であり；又は

(iv)  $-Y - A'$  であり、 $R^2$  は、 $-X - A'$  であり、ここで  $A'$  は、アリーレン又はヘテロアリーレンであり、1 以上の極性 ( $PL$ ) 基、1 以上の非極性 ( $NPL$ ) 基、又は 1 以上の極性 ( $PL$ ) 基と 1 以上の非極性 ( $NPL$ ) 基の組合せで置換されていてもよく；  
 又は

(v)  $R^1$  と  $R^2$  は、独立して、極性基 (PL) 又は非極性基 (NPL) であり；又は

(vi)  $R^1$  と  $R^2$  は、一緒に単結合を形成し；

NPL は、 $-B(OR^4)_2$  及び  $-(NR^{3'})_{q1}NPL-U^{NPL}-(CH_2)_pNPL-(NR^{3''})_{q2}NPL-R^{4'}$  より独立して選択される非極性基であり、ここで：

$R^3$ 、 $R^{3'}$ 、及び  $R^{3''}$  は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

$R^4$  と  $R^{4'}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、及びヘテロアリールより独立して選択され、このいずれも、1 以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく；

$U^{NPL}$  は、非存在であるか又は O、S、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $NR^3$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-N=N-NR^3-$ 、 $-C(=O)-NR^3-N=N-$ 、 $-N=N-NR^3-$ 、 $-C(=N-N(R^3)_2)-$ 、 $-C(=NR^3)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-P(=O)_2O-$ 、 $-R^3O-$ 、 $-R^3S-$ 、 $-S-C=N-$ 、及び  $-C(=O)-NR^3-O-$  より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

$-(CH_2)_pNPL$  - アルキレン鎖は、1 以上のアルキル、アミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

pNPL は、0 ~ 8 であり；

$q1NPL$  と  $q2NPL$  は、独立して、0、1、又は 2 であり；

PL は、ハロ、ヒドロキシエトキシメチル、メトキシエトキシメチル、ポリオキシエチレン、及び  $-(NR^{5'})_{q1}PL-U^{PL}-(CH_2)_pPL-(NR^{5''})_{q2}PL-V$  より選択される極性基であり、ここで：

$R^5$ 、 $R^{5'}$ 、及び  $R^{5''}$  は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

$U^{PL}$  は、非存在であるか又は O、S、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $NR^5$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-N=N-NR^5-$ 、 $-C(=O)-NR^5-N=N-$ 、 $-N=N-NR^5-$ 、 $-C(=N-N(R^5)_2)-$ 、 $-C(=NR^5)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-P(=O)_2O-$ 、 $-R^5O-$ 、 $-R^5S-$ 、 $-S-C=N-$ 、及び  $-C(=O)-NR^5-O-$  より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

V は、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-NH(CH_2)_pNH_2$  (ここで p は、1 ~ 4 である)、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、ジアザミノ、アミジノ、グアニジノ、グアニル、セミカルバゾン、アリール、複素環、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $-NH(CH_2)_pNH_2$  (ここで p は、1 ~ 4 である)、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、低級アシルアミノ、又はベンジルオキシカルボニルの 1 以上で置換されていてもよく；

$-(CH_2)_pPL$  - アルキレン鎖は、1 以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

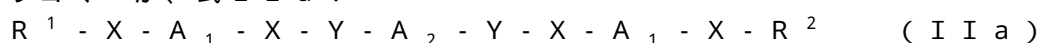
pPL は、0 ~ 8 であり；

$q1PL$  と  $q2PL$  は、独立して、0、1、又は 2 であり；そして、

m は、1 ~ 約 20 である ] の抗微生物オリゴマー、又はその許容される塩又は溶媒和物の有効量と眼科用に許容される賦形剤を含んでなる眼科用組成物。

#### 【請求項 4】

オリゴマーが、式 I Ia：



[ 式中：

X は、 $\text{NR}^8$ 、O、S、又は  $-\text{N}(\text{R}^8)\text{N}(\text{R}^8)-$  であり；

Y は、 $\text{C}=\text{O}$ 、 $\text{C}=\text{S}$ 、又は  $\text{O}=\text{S}=\text{O}$  であり；

$\text{R}^8$  は、水素又はアルキルであり；

$\text{A}_1$  と  $\text{A}_2$  は、独立して、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、ここで  $\text{A}_1$  と  $\text{A}_2$  は、独立して、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく；

$\text{R}^1$  は、極性基 (PL) 又は非極性基 (NPL) であり；

$\text{R}^2$  は、 $\text{R}^1$  であり；

NPL は、非極性基： $-(\text{NR}^{3'})_{q1}\text{NPL}-\text{U}^{\text{NPL}}-(\text{CH}_2)_p\text{NPL}-(\text{NR}^{3''})_{q2}\text{NPL}-\text{R}^{4'}$  であり、ここで：

$\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{3'}$ 、及び  $\text{R}^{3''}$  は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

$\text{R}^4$  と  $\text{R}^{4'}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、及びヘテロアリールより独立して選択され、このいずれも、1 以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく；

$\text{U}^{\text{NPL}}$  は、非存在であるか又は O、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{NR}^3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}=\text{N}-\text{NR}^3-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^3-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}=\text{N}-\text{NR}^3-$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{N}(\text{R}^3)_2)-$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^3)-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{S}-$ 、 $-\text{C}(=\text{S})-$ 、 $-\text{O}-\text{P}(=\text{O})_2\text{O}-$ 、 $-\text{R}^3\text{O}-$ 、 $-\text{R}^3\text{S}-$ 、 $-\text{S}-\text{C}=\text{N}-$ 、及び  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^3-\text{O}-$  より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

$-(\text{CH}_2)_p\text{NPL}-$  アルキレン鎖は、1 以上のアルキル、アミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

$p\text{NPL}$  は、0 ~ 8 であり；

$q1\text{NPL}$  と  $q2\text{NPL}$  は、独立して、0、1、又は 2 であり；

PL は、ハロ、ヒドロキシエトキシメチル、メトキシエトキシメチル、ポリオキシエチレン、及び  $-(\text{NR}^{5'})_{q1}\text{PL}-\text{U}^{\text{PL}}-(\text{CH}_2)_p\text{PL}-(\text{NR}^{5''})_{q2}\text{PL}-\text{V}$  より選択される極性基であり、ここで：

$\text{R}^5$ 、 $\text{R}^{5'}$ 、及び  $\text{R}^{5''}$  は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

$\text{U}^{\text{PL}}$  は、非存在であるか又は O、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{NR}^5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}=\text{N}-\text{NR}^5-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^5-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}=\text{N}-\text{NR}^5-$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{N}(\text{R}^5)_2)-$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^5)-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{S}-$ 、 $-\text{C}(=\text{S})-$ 、 $-\text{O}-\text{P}(=\text{O})_2\text{O}-$ 、 $-\text{R}^5\text{O}-$ 、 $-\text{R}^5\text{S}-$ 、 $-\text{S}-\text{C}=\text{N}-$ 、及び  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^5-\text{O}-$  より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

V は、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-\text{NH}(\text{CH}_2)_p\text{NH}_2$  (ここで p は、1 ~ 4 である)、 $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2)_2$ 、ジアザミノ、アミジノ、グアニジノ、グアニル、セミカルバゾン、アリール、複素環、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $-\text{NH}(\text{CH}_2)_p\text{NH}_2$  (ここで p は、1 ~ 4 である)、 $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2)_2$ 、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、低級アシルアミノ、又はベンジルオキシカルボニルの 1 以上で置換されていてもよく；

$-(\text{CH}_2)_p\text{PL}-$  アルキレン鎖は、1 以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

$p\text{PL}$  は、0 ~ 8 であり；

$q1\text{PL}$  と  $q2\text{PL}$  は、独立して、0、1、又は 2 である ]、又はその許容される塩又は溶媒和物を有する、請求項 1 又は請求項 2 の組成物。

## 【請求項 5】

X が、NR<sup>8</sup> であり；

Y は、C = O であり；

R<sup>8</sup> は、水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルであり；

A<sub>1</sub> と A<sub>2</sub> は、独立して、置換されていてもよいフェニレン又は置換されていてもよいピリミジニレンであり、ここで A<sub>1</sub> は、1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基で置換されていて、A<sub>2</sub> は、1 以上の極性 (PL) 基で置換されているか又は未置換であり；

R<sup>1</sup> は、極性基 (PL) であり；

R<sup>2</sup> は、R<sup>1</sup> であり；

NPL は、非極性基：- (NR<sup>3'</sup>)<sub>q1NPL</sub> - U<sup>NPL</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>pNPL</sub> - (NR<sup>3''</sup>)<sub>q2NPL</sub> - R<sup>4'</sup> であり、ここで：

R<sup>4</sup> と R<sup>4'</sup> は、水素と、1 以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよいアルキルより独立して選択され；

U<sup>NPL</sup> は、非存在であるか又は O、S、NR<sup>3</sup>、及び -C(=O)- より選択され；

pNPL は、0 ~ 6 であり；

q1NPL と q2NPL は、0 であり；

PL は、極性基：- (NR<sup>5'</sup>)<sub>q1PL</sub> - U<sup>PL</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>pPL</sub> - (NR<sup>5''</sup>)<sub>q2PL</sub> - V であり、ここで：

U<sup>PL</sup> は、非存在であるか又は O、S、NR<sup>5</sup>、及び -C(=O)- より選択され；

V は、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>NH<sub>2</sub> (ここで p は、1 ~ 4 である)、-N(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、ジアザミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>NH<sub>2</sub> (ここで p は、1 ~ 4 である)、-N(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、及び低級アシルアミノの 1 以上で置換されていてもよく；

pPL は、0 ~ 8 であり；そして、

q1PL と q2PL は、0 である、請求項 1、2、及び 4 のいずれか 1 項の組成物。

## 【請求項 6】

A<sub>1</sub> が、1 つの (PL) 基と 1 つの非極性 (NPL) 基で置換されているフェニレンであり；

A<sub>2</sub> は、未置換のピリミジニレンであるか、又は 1 又は 2 の極性 (PL) 基で置換されているピリミジニレンであり；

NPL は、R<sup>4'</sup> であり、ここで R<sup>4'</sup> は、1 以上のハロ基で置換されていてもよい (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

PL は、-U<sup>PL</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>pPL</sub> - V であり、ここで：

U<sup>PL</sup> は、O 又は S であり；

V は、アミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され；そして、

pPL は、0 ~ 6 である、請求項 1、2、4、及び 5 のいずれか 1 項の組成物。

## 【請求項 7】

A<sub>1</sub> が、1 つの (PL) 基と 1 つの非極性 (NPL) 基で置換されているフェニレンであり；

A<sub>2</sub> は、未置換のフェニレンであるか、又は 1 又は 2 の極性 (PL) 基で置換されているフェニレンであり；

NPL は、R<sup>4'</sup> であり、ここで R<sup>4'</sup> は、1 以上のハロ基で置換されていてもよい (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

PL は、-U<sup>PL</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>pPL</sub> - V であり、ここで：

U<sup>PL</sup> は、O 又は S であり；

V は、アミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され；そして、

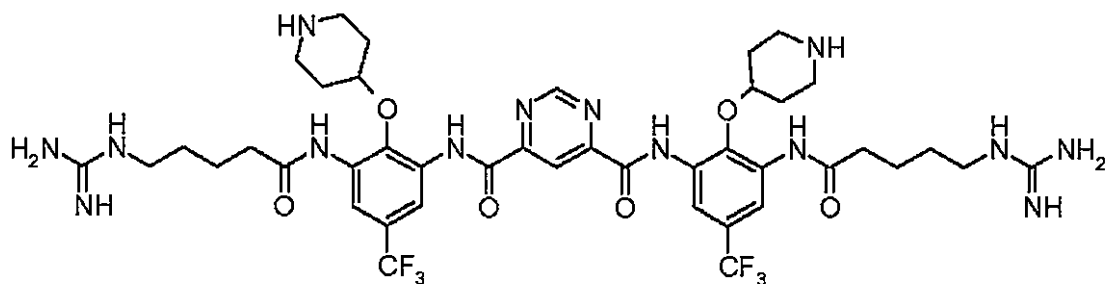
pPL は、0 ~ 6 である、請求項 1、2、4、及び 5 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 8】

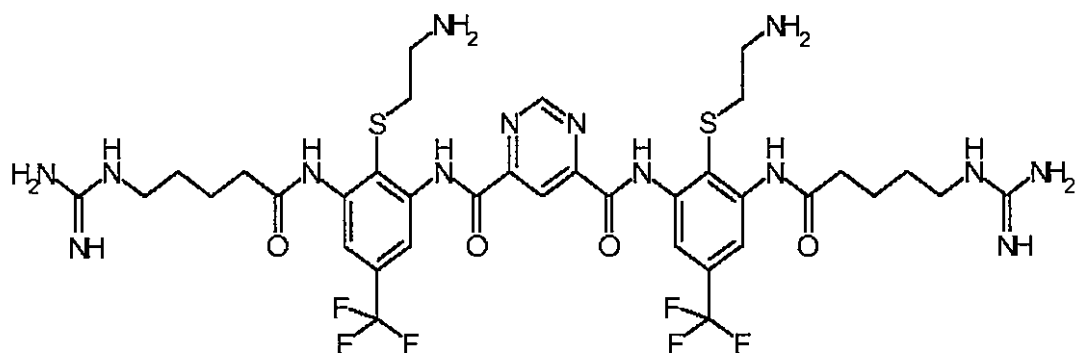
オリゴマーが：



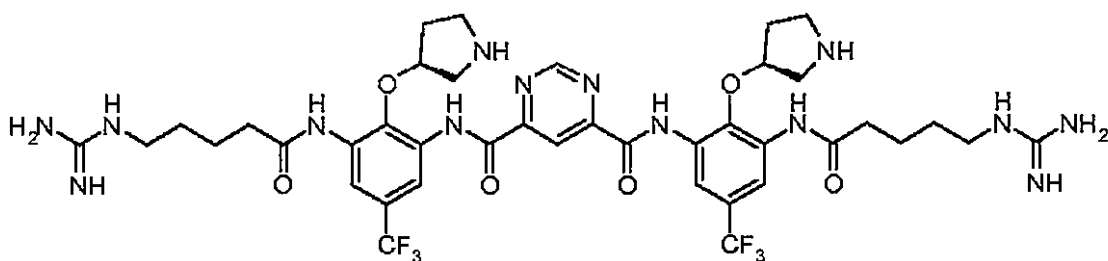
【化 1】



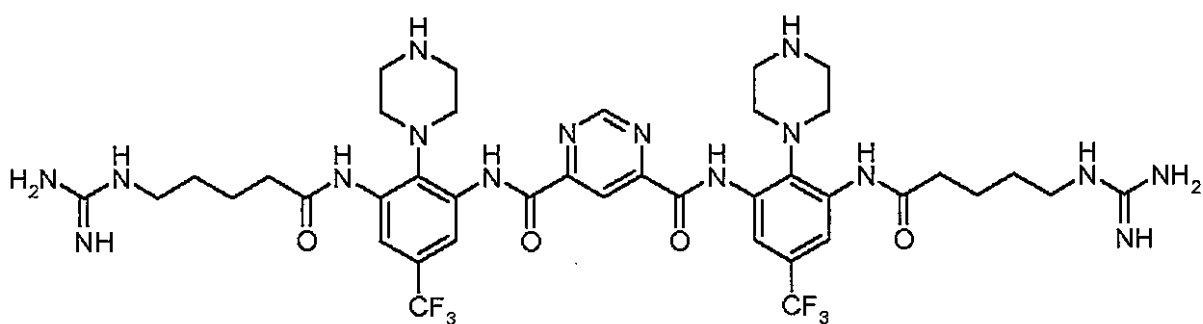
,



,

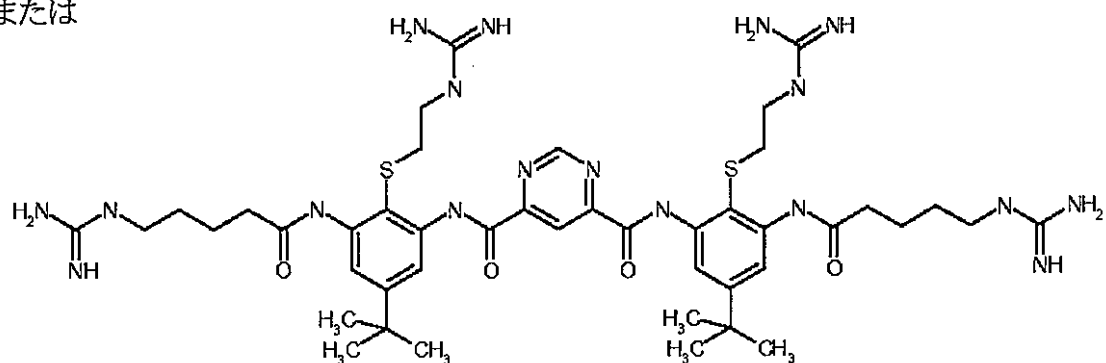


,



,

または



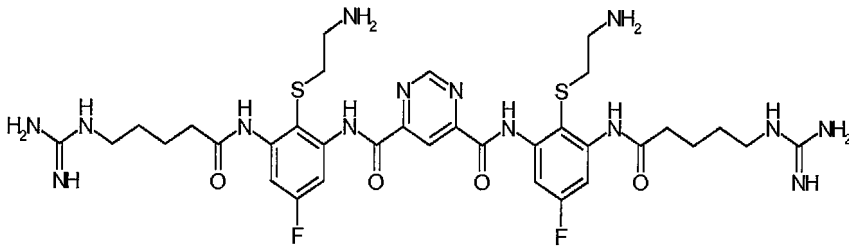
又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、及び 6 のいずれか 1 項の組成物

。

【請求項 9】

オリゴマーが：

【化 2】

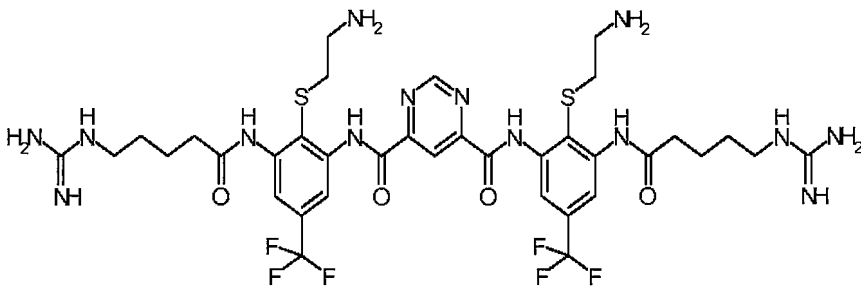


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、及び 4 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 10】

オリゴマーが：

【化 3】

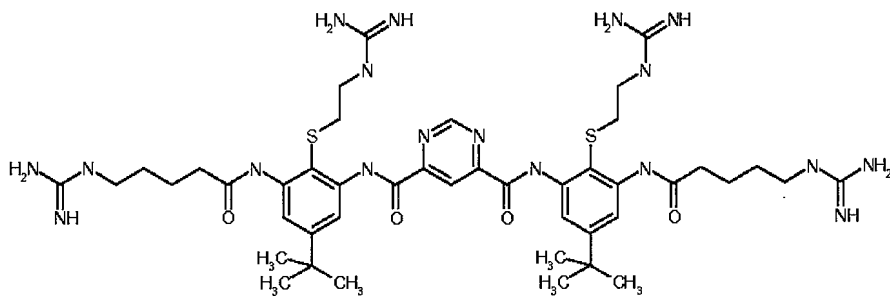


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 11】

オリゴマーが：

【化 4】

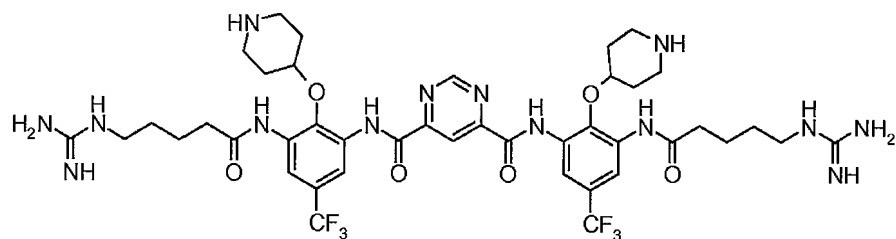


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 12】

オリゴマーが：

【化 5】



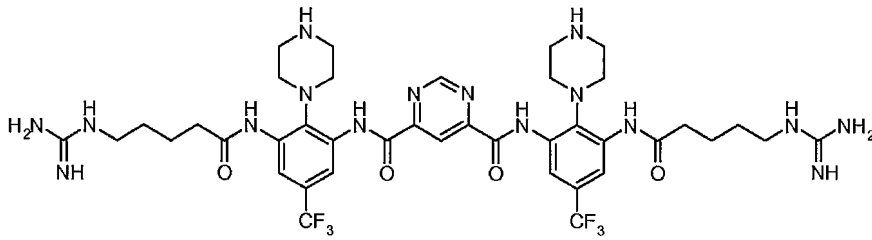
又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組

成物。

【請求項 1 3】

オリゴマーが：

【化 6】

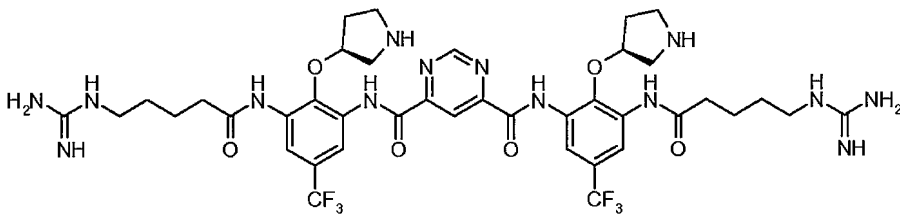


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 1 4】

オリゴマーが：

【化 7】

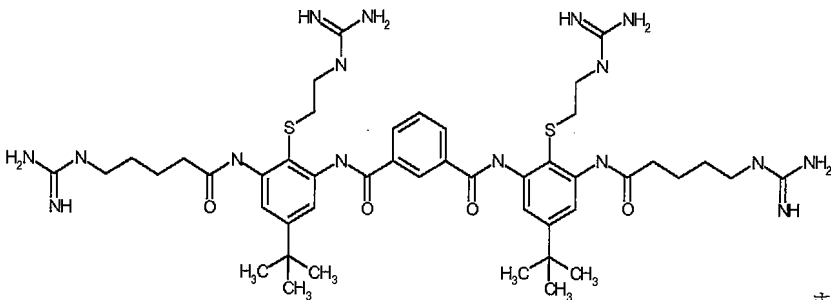


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組成物。

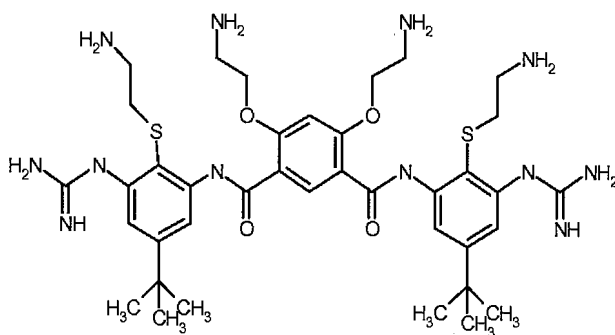
【請求項 1 5】

オリゴマーが：

【化 8】



または

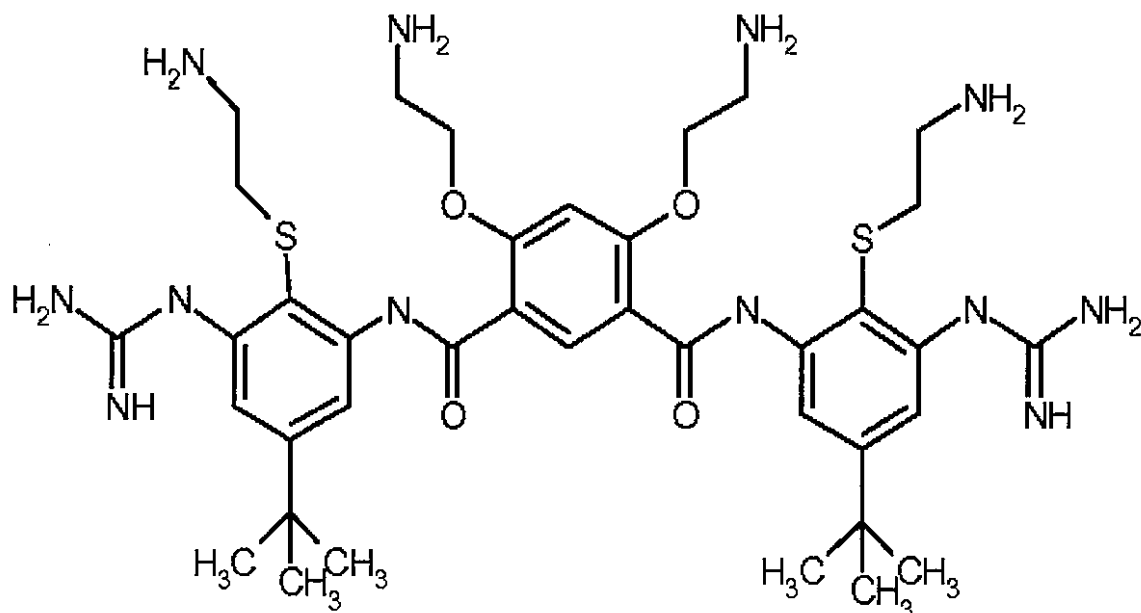


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、及び 5 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 1 6】

オリゴマーが：

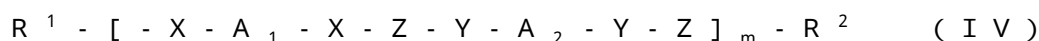
## 【化 9】



又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、及び 15 のいずれか 1 項の組成物。

## 【請求項 17】

式 I V :



[ 式中 :

X は、 $NR^8$ 、 $-NR^8NR^8-$ 、 $C=O$ 、又は O であり ;

Y は、 $NR^8$ 、 $-NR^8NR^8-$ 、 $C=O$ 、S、又は O であり ;

$R^8$  は、水素又はアルキルであり ;

Z は、 $C=O$ 、 $C=S$ 、 $O=S=O$ 、 $-NR^8NR^8-$ 、又は  $-C(=O)C(=O)-$  であり ;

$A_1$  と  $A_2$  は、独立して、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、ここで  $A_1$  と  $A_2$  は、独立して、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく ;

$R^1$  は :

( i ) 水素、極性基 (PL)、又は非極性基 (NPL) であり、 $R^2$  は、 $-X-A_1-X-R^1$  であり、ここで  $A_1$  は、上記に定義される通りであり、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく ; 又は

( i i ) 水素、極性基 (PL)、又は非極性基 (NPL) であり、 $R^2$  は、 $-X-A_1-X-Z-Y-A_2-Y-R^1$  であり、ここで  $A_1$  と  $A_2$  は、上記に定義される通りであり、そのそれぞれは、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく ;

( i i i ) 水素、極性基 (PL)、又は非極性基 (NPL) であり、 $R^2$  は、 $-X-A'-X-R^1$  であり、ここで  $A'$  は、アリール又はヘテロアリールであり、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく ; 又は

( i v ) 水素、極性基 (PL)、又は非極性基 (NPL) であり、 $R^2$  は、 $-X-A_1-X-Z-Y-A'-Y-R^1$  であり、ここで  $A_1$  は、上記に定義される通りであり、 $A'$  は、アリール又はヘテロアリールであり、そして  $A_1$  と  $A'$  のそれぞれは、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非

極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく；又は

(v) - Z - Y - A' であり、R<sup>2</sup> は、水素、極性基 (PL)、又は非極性基 (NPL) であり、ここで A' は、アリール又はヘテロアリールであり、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく；又は

(vi) - Z - Y - A' であり、R<sup>2</sup> は、- X - A'' であり、ここで A' と A'' は、独立して、アリール又はヘテロアリールであり、A' と A'' のそれぞれは、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく；又は

(vii) R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> は、独立して、極性基 (PL) 又は非極性基 (NPL) であり；又は

(viii) R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> は、一緒に単結合を形成し；

NPL は、- B (OR<sup>4</sup>)<sub>2</sub> 及び - (NR<sup>3'</sup>)<sub>q1</sub> NPL - U<sup>NPL</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> NPL - (NR<sup>3''</sup>)<sub>q2</sub> NPL - R<sup>4'</sup> より独立して選択される非極性基であり、ここで：

R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、及び R<sup>3''</sup> は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

R<sup>4</sup> と R<sup>4'</sup> は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、及びヘテロアリールより独立して選択され、このいずれも、1 以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく；

U<sup>NPL</sup> は、非存在であるか又は O、S、S (= O)、S (= O)<sub>2</sub>、NR<sup>3</sup>、- C (= O) -、- C (= O) - N = N - NR<sup>3</sup> -、- C (= O) - NR<sup>3</sup> - N = N -、- N = N - NR<sup>3</sup> -、- C (= N - N (R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>) -、- C (= NR<sup>3</sup>) -、- C (= O) O -、- C (= O) S -、- C (= S) -、- O - P (= O)<sub>2</sub> O -、- R<sup>3</sup> O -、- R<sup>3</sup> S -、- S - C = N -、及び - C (= O) - NR<sup>3</sup> - O - より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> NPL - アルキレン鎖は、1 以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

p NPL は、0 ~ 8 であり；

q<sub>1</sub> NPL と q<sub>2</sub> NPL は、独立して、0、1、又は 2 であり；

PL は、ハロ、ヒドロキシエトキシメチル、メトキシエトキシメチル、ポリオキシエチレン、及び - (NR<sup>5'</sup>)<sub>q1</sub> PL - U<sup>PL</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> PL - (NR<sup>5''</sup>)<sub>q2</sub> PL - V より選択される極性基であり、ここで：

R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、及び R<sup>5''</sup> は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

U<sup>PL</sup> は、非存在であるか又は O、S、S (= O)、S (= O)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>、- C (= O) -、- C (= O) - N = N - NR<sup>5</sup> -、- C (= O) - NR<sup>5</sup> - N = N -、- N = N - NR<sup>5</sup> -、- C (= N - N (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>) -、- C (= NR<sup>5</sup>) -、- C (= O) O -、- C (= O) S -、- C (= S) -、- O - P (= O)<sub>2</sub> O -、- R<sup>5</sup> O -、- R<sup>5</sup> S -、- S - C = N -、及び - C (= O) - NR<sup>5</sup> - O - より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

V は、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、- NH (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> NH<sub>2</sub> (ここで p は、1 ~ 4 である)、- N (CH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub> NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、ジアザミノ、アミジノ、グアニジノ、グアニル、セミカルバゾン、アリール、複素環、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、- NH (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> NH<sub>2</sub> (ここで p は、1 ~ 4 である)、- N (CH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub> NH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、低級アシルアミノ、又はベンジルオキシカルボニルの 1 以上で置換されていてもよく；

- (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> PL - アルキレン鎖は、1 以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されて

いてもよく、又は不飽和であり；

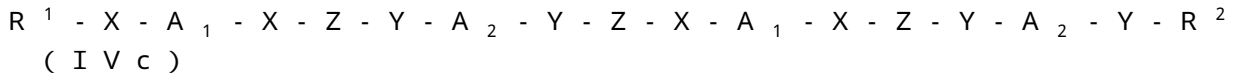
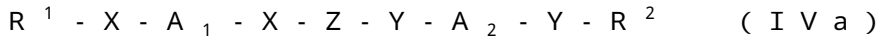
p P L は、0 ~ 8 であり；

q 1 P L と q 2 P L は、独立して、0、1、又は2であり；そして、

m は、1 ~ 約 20 である] の抗微生物オリゴマー、又はその許容される塩又は溶媒和物の有効量と眼科用に許容される賦形剤を含んでなる眼科用組成物。

【請求項 18】

オリゴマーが、式 I V a、式 I V b、又は式 I V c：



[ 式中：

X は、NR<sup>8</sup>、- NR<sup>8</sup>NR<sup>8</sup>-、C=O、又はOであり；

Y は、NR<sup>8</sup>、- NR<sup>8</sup>NR<sup>8</sup>-、C=O、S、又はOであり；

R<sup>8</sup> は、水素又はアルキルであり；

Z は、C=O、C=S、O=S=O、- NR<sup>8</sup>NR<sup>8</sup>-、又は - C(=O)C(=O)- であり；

A<sub>1</sub> と A<sub>2</sub> は、独立して、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、ここで A<sub>1</sub> と A<sub>2</sub> は、独立して、1 以上の極性 (P L) 基、1 以上の非極性 (N P L) 基、又は 1 以上の極性 (P L) 基と 1 以上の非極性 (N P L) 基の組合せで置換されていてもよく；

R<sup>1</sup> は、水素、極性基 (P L)、又は非極性基 (N P L) であり；

R<sup>2</sup> は、R<sup>1</sup> であり；

N P L は、非極性基： - (NR<sup>3'</sup>)<sub>q 1 N P L</sub> - U<sup>N P L</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>p N P L</sub> - (NR<sup>3''</sup>)<sub>q 2 N P L</sub> - R<sup>4'</sup> であり、ここで：

R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、及び R<sup>3''</sup> は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

R<sup>4</sup> と R<sup>4'</sup> は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、及びヘテロアリールより独立して選択され、このいずれも、1 以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく；

U<sup>N P L</sup> は、非存在であるか又は O、S、S(=O)、S(=O)<sub>2</sub>、NR<sup>3</sup>、- C(=O)-、- C(=O)-N=N-NR<sup>3</sup>-、- C(=O)-NR<sup>3</sup>-N=N-、- N=N-NR<sup>3</sup>-、- C(=N-N(R<sup>3</sup>))<sub>2</sub>-、- C(=NR<sup>3</sup>)-、- C(=O)O-、- C(=O)S-、- C(=S)-、- O-P(=O)<sub>2</sub>O-、- R<sup>3</sup>O-、- R<sup>3</sup>S-、- S-C=N-、及び - C(=O)-NR<sup>3</sup>-O- より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

- (CH<sub>2</sub>)<sub>p N P L</sub> - アルキレン鎖は、1 以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

p N P L は、0 ~ 8 であり；

q 1 N P L と q 2 N P L は、独立して、0、1、又は2であり；

P L は、ハロ、ヒドロキシエトキシメチル、メトキシエトキシメチル、ポリオキシエチレン、及び - (NR<sup>5'</sup>)<sub>q 1 P L</sub> - U<sup>P L</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>p P L</sub> - (NR<sup>5''</sup>)<sub>q 2 P L</sub> - V より選択される極性基であり、ここで：

R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、及び R<sup>5''</sup> は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

U<sup>P L</sup> は、非存在であるか又は O、S、S(=O)、S(=O)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>、- C(=O)-、- C(=O)-N=N-NR<sup>5</sup>-、- C(=O)-NR<sup>5</sup>-N=N-、- N=N-NR<sup>5</sup>-、- C(=N-N(R<sup>5</sup>))<sub>2</sub>-、- C(=NR<sup>5</sup>)-、- C(=O)O-、- C(=O)S-、- C(=S)-、- O-P(=O)<sub>2</sub>O-、- R<sup>5</sup>O-、- R<sup>5</sup>S-、- S-C=N-、及び - C(=O)-NR<sup>5</sup>-O- より選択され、ここで 2 つの化学的

に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

Vは、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-NH(CH_2)_pNH_2$ （ここでpは、1～4である）、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、ジアザミノ、アミジノ、グアニジノ、グアニル、セミカルバゾン、アリール、複素環、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $-NH(CH_2)_pNH_2$ （ここでpは、1～4である）、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、低級アシルアミノ、又はベンジルオキシカルボニルの1以上で置換されていてもよく；

$-(CH_2)_{pPL}-$ アルキレン鎖は、1以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

pPLは、0～8であり；そして、

q1PLとq2PLは、独立して、0、1、又は2である]、又はその許容される塩又は溶媒和物を有する、請求項17の組成物。

#### 【請求項19】

式V：



[式中：

$A_1$ と $A_2$ は、独立して、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、ここで：

(i)  $A_1$ と $A_2$ は、独立して、1以上の極性(PL)基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく；又は

(ii)  $A_1$ 又は $A_2$ の一方は、上記に定義される通りであり、1以上の極性(PL)基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく；そして $A_1$ 又は $A_2$ の他方は、基： $-C(CH_2)_pC-$ であり（ここでpは、0～8であり、そして $-(CH_2)_p-$ アルキレン鎖は、1以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよい）；

Wは、非存在であるか、又は $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、又は $-C(CH_3)_2-$ を表し；

$R^1$ は：

(i) 水素、極性基(PL)、又は非極性基(NPL)であり、 $R^2$ は、 $-A_1-R^1$ であり、ここで $A_1$ は、上記に定義される通りであり、1以上の極性(PL)基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく；又は

(ii) 水素、極性基(PL)、又は非極性基(NPL)であり、 $R^2$ は、 $-A_1-W-A_2-R^1$ であり、ここで $A_1$ と $A_2$ のそれぞれは、上記に定義される通りであり、1以上の極性(PL)基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく；又は

(iii)  $A'-W-$ であり、 $R^2$ は、 $-A_1-W-A'$ であり、ここで $A'$ は、アリール又はヘテロアリールであり、そのいずれか一方は、1以上の極性(PL)基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく；又は

(iv)  $A'-W-$ であり、 $R^2$ は、 $-A'$ であり、ここで $A'$ は、アリール又はヘテロアリールであり、そのいずれか一方は、1以上の極性(PL)基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく；又は

(v)  $R^1$ と $R^2$ は、一緒に単結合を形成し；

NPLは、 $-B(OR^4)_2$ 又は $-(NR^{3'})_{q1NPL}-U^{NPL}-(CH_2)_p_{NPL}-(NR^{3''})_{q2NPL}-R^4$ より独立して選択される非極性基であり、ここで

:

$R^3$ 、 $R^{3'}$ 、及び $R^{3''}$ は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され

;

$R^4$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、1以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく;

$U^{NPL}$ は、非存在であるか又はO、S、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $NR^3$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-(C=O)-N=N-NR^3-$ 、 $-(C=O)-NR^3-N=N-$ 、 $-N=N-NR^3-$ 、 $-C(=N-N(R^3)_2)-$ 、 $-C(=NR^3)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-P(=O)_2O-$ 、 $-R^3O-$ 、 $-R^3S-$ 、 $-S-C=N-$ 、及び $-(C=O)-NR^3-O-$ より選択され、ここで2つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく;

$-(CH_2)_pNPL$ -アルキレン鎖は、1以上のアルキル、アミノ又はヒドロキシル基で置換されていてもよく、又は該アルキレン鎖は、不飽和であり;

$pNPL$ は、0~8であり;

$q_1NPL$ と $q_2NPL$ は、独立して、0~2であり;

$PL$ は、ハロ、ヒドロキシエトキシメチル、メトキシエトキシメチル、ポリオキシエチレン、及び $-(NR^5)-$  $_{q_1PL}$ - $U^{PL}$ - $(CH_2)_pPL$ - $(NR^5)-$  $_{q_2PL}$ -Vより選択される極性基であり、ここで:

$R^5$ 、 $R^{5'}$ 、及び $R^{5''}$ は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され

;

$U^{PL}$ は、非存在であるか又はO、S、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $NR^5$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-(C=O)-N=N-NR^5-$ 、 $-(C=O)-NR^5-N=N-$ 、 $-N=N-NR^5-$ 、 $-C(=N-N(R^5)_2)-$ 、 $-C(=NR^5)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-P(=O)_2O-$ 、 $-R^5O-$ 、 $-R^5S-$ 、 $-S-C=N-$ 、及び $-(C=O)-NR^5-O-$ より選択され、ここで2つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく;

Vは、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-NH(CH_2)_pNH_2$ 、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、ジアザミノ、アミジノ、グアニジノ、グアニル、セミカルバゾン、アリール、複素環、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $-NH(CH_2)_pNH_2$ 、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、低級アシルアミノ、又はベンジルオキシカルボニルの1以上で置換されていてもよく;

$-(CH_2)_pPL$ -アルキレン鎖は、1以上のアミノ又はヒドロキシル基で置換されていてもよく、又は該アルキレン鎖は、不飽和であり;

$pPL$ は、0~8であり;

$q_1PL$ と $q_2PL$ は、独立して、0~2であり;そして、

mは、1~約25である]の抗微生物オリゴマー、又はその許容される塩又は溶媒和物の有効量と眼科用に許容される賦形剤を含んでなる眼科用組成物。

#### 【請求項20】

オリゴマーが、式Va:



[式中:

$A_1$ と $A_2$ は、独立して、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、ここで:

(i)  $A_1$ と $A_2$ は、独立して、1以上の極性(PL)基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく;又は

(ii)  $A_1$ 又は $A_2$ の一方は、上記に定義される通りであり、1以上の極性(PL)



基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく；そしてA<sub>1</sub>又はA<sub>2</sub>の他方は、基： $-C(C(CH_2)_p)C-$ であり(ここでpは、0~8であり、そして $-(CH_2)_p-$ アルキレン鎖は、1以上のアミノ又はヒドロキシル基で置換されていてもよい)；

Wは、 $-C(C)-$ であり；

R<sup>1</sup>は、水素、極性基(PL)、非極性基(NPL)、又は $-W-A'$ であり、ここでA'は、アリール又はヘテロアリールであり、そのいずれか一方は、1以上の極性(PL)基、1以上の非極性(NPL)基、又は1以上の極性(PL)基と1以上の非極性(NPL)基の組合せで置換されていてもよく；

R<sup>2</sup>は、R<sup>1</sup>であり；

NPLは、非極性基： $-(NR^{3'})_{q1}NPL-U^{NPL}-(CH_2)_pNPL-(NR^{3''})_{q2}NPL-R^4$ であり；

R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、及びR<sup>3''</sup>は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

R<sup>4</sup>は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、1以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく；

U<sup>NPL</sup>は、非存在であるか又はO、S、S(=O)、S(=O)<sub>2</sub>、NR<sup>3</sup>、 $-(C=O)-$ 、 $-(C=O)-N=N-NR^3-$ 、 $-(C=O)-NR^3-N=N-$ 、 $-N=N-NR^3-$ 、 $-C(=N-N(R^3)_2)-$ 、 $-C(=NR^3)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-P(=O)_2O-$ 、 $-R^3O-$ 、 $-R^3S-$ 、 $-S-C=N-$ 、及び $-(C=O)-NR^3-O-$ より選択され、ここで2つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

アルキレン鎖： $-(CH_2)_pNPL-$ は、1以上のアルキル、アミノ又はヒドロキシル基で置換されていてもよく、又は該アルキレン鎖は、不飽和であり；

pNPLは、0~8であり；

q<sub>1</sub>NPLとq<sub>2</sub>NPLは、独立して、0~2であり；

PLは、ハロ、ヒドロキシエトキシメチル、メトキシエトキシメチル、ポリオキシエチレン、及び $-(NR^{5'})_{q1}PL-U^{PL}-(CH_2)_pPL-(NR^{5''})_{q2}PL-V$ より選択される極性基であり、ここで；

R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、及びR<sup>5''</sup>は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

U<sup>PL</sup>は、非存在であるか又はO、S、S(=O)、S(=O)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>、 $-(C=O)-$ 、 $-(C=O)-N=N-NR^5-$ 、 $-(C=O)-NR^5-N=N-$ 、 $-N=N-NR^5-$ 、 $-C(=N-N(R^5)_2)-$ 、 $-C(=NR^5)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-P(=O)_2O-$ 、 $-R^5O-$ 、 $-R^5S-$ 、 $-S-C=N-$ 、及び $-(C=O)-NR^5-O-$ より選択され、ここで2つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

Vは、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $-NH(CH_2)_pNH_2$ 、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、ジアザミノ、アミジノ、グアニジノ、グアニル、セミカルバゾン、アリール、複素環、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $-NH(CH_2)_pNH_2$ 、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、低級アシルアミノ、又はベンジルオキシカルボニルの1以上で置換されていてもよく；

アルキレン鎖： $-(CH_2)_pPL-$ は、1以上のアミノ又はヒドロキシル基で置換されていてもよく、又は該アルキレン鎖は、不飽和であり；

pPLは、0~8であり；そして、

q<sub>1</sub>PLとq<sub>2</sub>PLは、独立して、0~2である]、又はその許容される塩又は溶媒和物を有する、請求項19の組成物。

## 【請求項 2 1】

$A_1$  と  $A_2$  が、独立して、置換されていてもよい  $m$ -フェニレンであり、ここで  $A_1$  は、2つの極性(PL)基で置換されていてもよく、そして  $A_2$  は、未置換であり；

$R^1$  は、極性基であり；

PL は、独立して、ハ口又は  $-(NR^{5'})_{q1PL}-U^{PL}-(CH_2)_{pPL}-(NR^{5'})_{q2PL}-V$  であり、ここで：

$U^{PL}$  は、非存在であるか又は O、S、 $NR^5$ 、及び  $-C(=O)-$  より選択され；

V は、アミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され、このいずれも、アミノ、ハ口、 $-NH(CH_2)_pNH_2$  (ここで  $p$  は、1~4である)、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、及び低級アシルアミノの1以上で置換されていてもよく；

$pPL$  は、0~8であり；そして、

$q1PL$  と  $q2PL$  は、0である、請求項 19 又は請求項 20 の組成物。

## 【請求項 2 2】

$R^1$  がハ口であり；

PL は、又は  $-U^{PL}-(CH_2)_{pPL}-V$  であり、ここで：

$U^{PL}$  は、非存在であり；

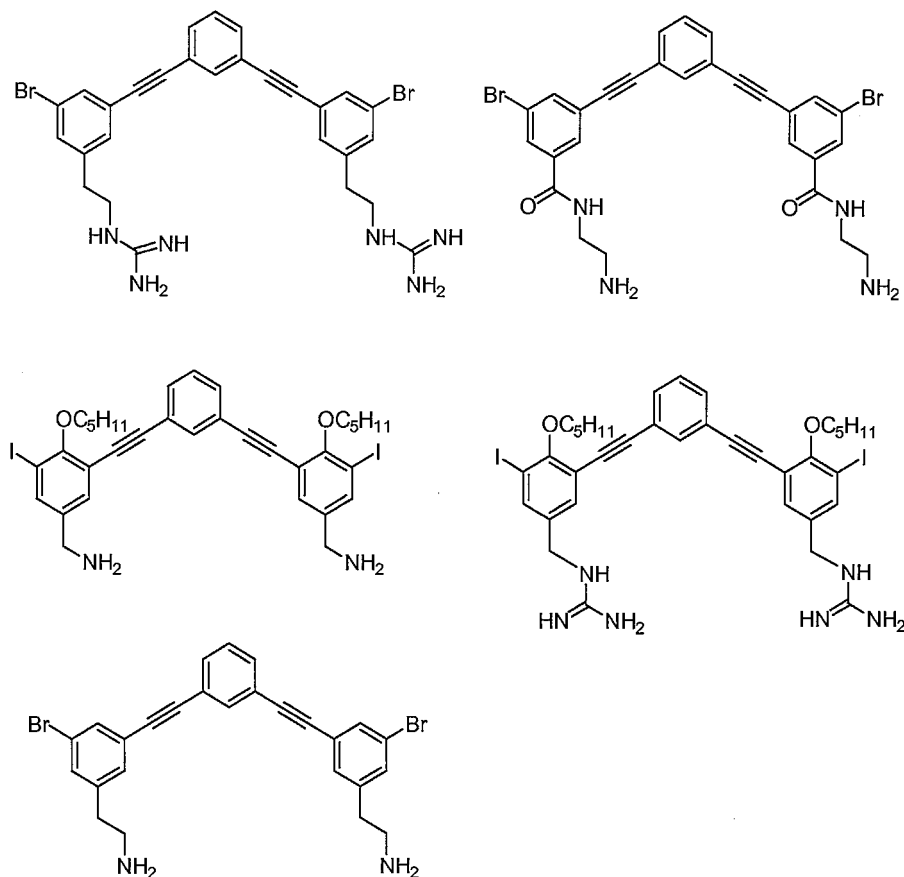
V は、アミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され、このいずれも、アミノ及びハ口の1以上で置換されていてもよく；そして、

$pPL$  は、0~6である、請求項 19~21 のいずれか1項の組成物。

## 【請求項 2 3】

オリゴマーが：

## 【化 1 0】

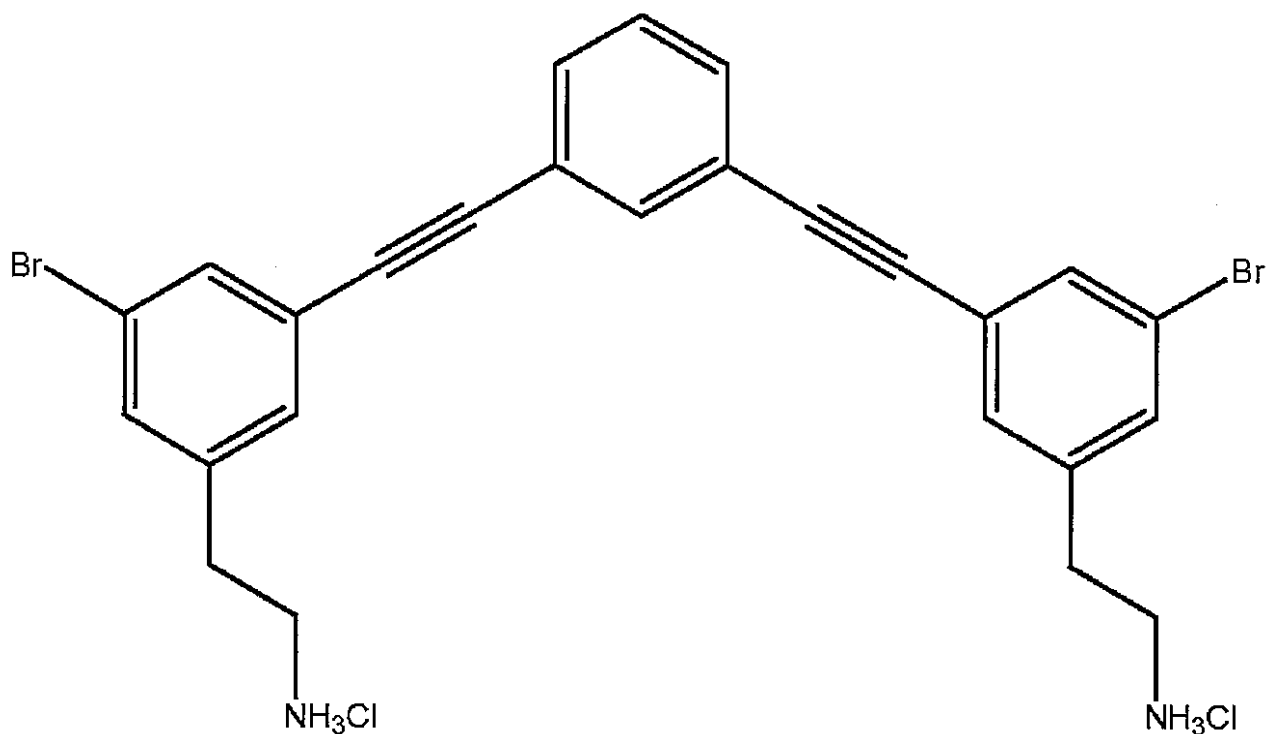


の1つ、又はその塩又は溶媒和物である、請求項 19~21 のいずれか1項の組成物。

## 【請求項 2 4】

オリゴマーが：

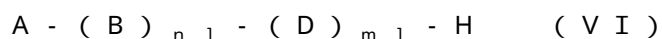
【化 1 1】



である、請求項 19 ~ 21 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 25】

式 VI :



[ 式中 :

A は、連鎖移動剤の残基であり ;

B は、 $- [CH_2 - C(R^{11})(B_{11})] -$  であり、ここで  $B_{11}$  は、 $-X_{11}-Y_{11}-Z_{11}$  であり、ここで

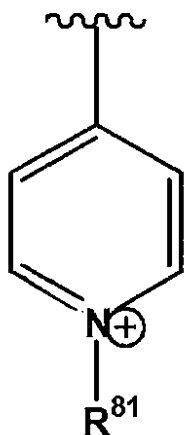
$X_{11}$  は、カルボニル ( $-C(=O)-$ ) であるか、又は置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキレンであるか ; 又は  $X_{11}$  は、非存在であり ;

$Y_{11}$  は、O、NH、又は置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキレンであるか ; 又は  $Y_{11}$  は、非存在であり ;

$Z_{11}$  は、 $-Z_{11A}-Z_{11B}$  であり、ここで  $Z_{11A}$  は、アルキレン、アリーレン、又はヘテロアリーレンであり、このいずれも、置換されていてもよく ; 又は  $Z_{11A}$  は、非存在であり ; そして  $Z_{11B}$  は、 $-$ グアニジノ、 $-$ アミジノ、 $-N(R^3)(R^4)$ 、又は  $-N^+(R^3)(R^4)(R^5)$  であり、ここで  $R^3$ 、 $R^4$ 、及び  $R^5$  は、独立して、水素、アルキル、アミノアルキル、アリール、ヘテロアリール、複素環式、又はアラキルであり ; 又は

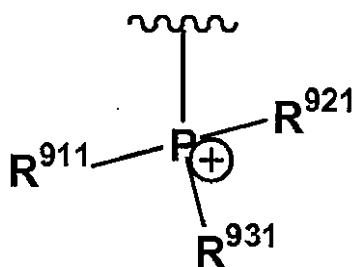
$Z_{11}$  は、ピリジニウム :

## 【化 1 2】



又はホスホニウム：

## 【化 1 3】



{ 式中、 $R^{81}$ 、 $R^{911}$ 、 $R^{921}$ 、及び  $R^{931}$  は、独立して、水素又はアルキルである } であり；

$R^{11}$  は、水素又は  $C_{1-4}$  アルキルであり；

D は、 $-[CH_2 - C(R^{21})(D_{21})] -$  であり、ここで  $D_{21}$  は、 $-X_{21} - Y_{21} - Z_{21}$  であり、ここで

$X_{21}$  は、カルボニル ( $-C(=O)-$ ) 又は置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキレンであるか；又は  $X_{21}$  は、非存在であり；

$Y_{21}$  は、O、NH、又は置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキレンであるか、又は  $Y_{21}$  は、非存在であり；

$Z_{21}$  は、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリール、又はアラルキルであり、このいずれも、置換されていてもよく；

$R^{21}$  は、水素又は  $C_{1-4}$  アルキルであり；

$m_1$  (D モノマーのモル分率) は、約 0.1 ~ 約 0.9 であり；そして、

$n_1$  (B モノマーのモル分率) は、 $1 - m_1$  であり；

ここで共重合体は、B 及び D モノマーのランダム共重合体であり、そして

ここで共重合体は、約 5 ~ 約 50 の重合度を有する ] の抗微生物ランダム共重合体、又はその許容される塩又は溶媒和物の有効量と眼科用に許容される賦形剤を含んでなる眼科用組成物。

## 【請求項 26】

A が、 $C_{1-4}$  アルコシカルボニル ( $C_{1-4}$ ) アルキルチオであり；

$X_{11}$  と  $X_{21}$  は、カルボニルであり；

$Y_{11}$  と  $Y_{21}$  は、O であり；

$Z_{11}$  は、 $-Z_{11A} - Z_{11B}$  であり、ここで  $Z_{11A}$  は、 $C_{1-4}$  アルキル又はアリールで置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキレンであり；そして  $Z_{11B}$  は、 $-N(R$

$R^{3'}$ 、 $R^{4'}$ 、又は  $-N^+(R^{3'}) (R^{4'}) (R^{5'})$  であり、ここで  $R^{3'}$ 、 $R^{4'}$ 、及び  $R^{5'}$  は、独立して、水素又は  $C_{1-4}$  アルキルであり；

$Z_{2'}$  は、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  アリール、又は  $C_{1-6}$  アル ( $C_{1-4}$ ) アルキルであり；そして、

$R^{1'}$  と  $R^{2'}$  は、独立して、水素又はメチルであり；

$m_1$  は、約 0.35 ~ 約 0.60 であり；そしてここで、

共重合体は、約 5 ~ 約 10 の重合度を有する、請求項 25 の組成物。

【請求項 27】

(a) 動物の眼の微生物感染症の治療及び / 又は予防に有効な量の、式 I Ia：



[ 式中：

X は、 $NR^8$ 、O、S、又は  $-N(R^8)N(R^8)-$  であり；

Y は、 $C=O$ 、 $C=S$ 、又は  $O=S=O$  であり；

$R^8$  は、水素又はアルキルであり；

$A_1$  と  $A_2$  は、独立して、置換されていてもよいアリーレン又は置換されていてもよいヘテロアリーレンであり、ここで  $A_1$  と  $A_2$  は、独立して、1 以上の極性 (PL) 基、1 以上の非極性 (NPL) 基、又は 1 以上の極性 (PL) 基と 1 以上の非極性 (NPL) 基の組合せで置換されていてもよく；

$R^1$  は、極性基 (PL) 又は非極性基 (NPL) であり；

$R^2$  は、 $R^1$  であり；

NPL は、 $-B(OR^4)_2$  及び  $-(NR^{3'})_{q1}NPL-U^{NPL}-(CH_2)_pNPL-(NR^{3''})_{q2}NPL-R^{4'}$  より独立して選択される非極性基であり、ここで：

$R^3$ 、 $R^{3'}$ 、及び  $R^{3''}$  は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

$R^4$  と  $R^{4'}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、及びヘテロアリールより独立して選択され、このいずれも、1 以上のアルキル又はハロ基で置換されていてもよく；

$U^{NPL}$  は、非存在であるか又は O、S、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $NR^3$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-N=N-NR^3-$ 、 $-C(=O)-NR^3-N=N-$ 、 $-N=N-NR^3-$ 、 $-C(=N-N(R^3)_2)-$ 、 $-C(=NR^3)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-P(=O)(O)-$ 、 $-R^3O-$ 、 $-R^3S-$ 、 $-S-C=N-$ 、及び  $-C(=O)-NR^3-O-$  より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

$-(CH_2)_pNPL$  - アルキレン鎖は、1 以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

$pNPL$  は、0 ~ 8 であり；

$q1NPL$  と  $q2NPL$  は、独立して、0、1、又は 2 であり；

PL は、ハロ、ヒドロキシエトキシメチル、メトキシエトキシメチル、ポリオキシエチレン、及び  $-(NR^{5'})_{q1}PL-U^{PL}-(CH_2)_pPL-(NR^{5''})_{q2}PL-V$  より選択される極性基であり、ここで：

$R^5$ 、 $R^{5'}$ 、及び  $R^{5''}$  は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

$U^{PL}$  は、非存在であるか又は O、S、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $NR^5$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-N=N-NR^5-$ 、 $-C(=O)-NR^5-N=N-$ 、 $-N=N-NR^5-$ 、 $-C(=N-N(R^5)_2)-$ 、 $-C(=NR^5)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-P(=O)(O)-$ 、 $-R^5O-$ 、 $-R^5S-$ 、 $-S-C=N-$ 、及び  $-C(=O)-NR^5-O-$  より選択され、ここで 2 つの化学的に非同等な末端のある基は、ともに可能な配向をとってよく；

V は、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルア

ミノ、ジアルキルアミノ、 $-NH(CH_2)_pNH_2$ （ここで  $p$  は、1～4である）、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、ジアザミノ、アミジノ、グアニジノ、グアニル、セミカルバゾン、アリール、複素環、及びヘテロアリールより選択され、このいずれも、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $-NH(CH_2)_pNH_2$ （ここで  $p$  は、1～4である）、 $-N(CH_2CH_2NH_2)_2$ 、アミジノ、グアニジノ、グアニル、アミノスルホニル、アミノアルコキシ、アミノアルキルチオ、低級アシルアミノ、又はベンジルオキシカルボニルの1以上で置換されていてもよく；

$-(CH_2)_pPL$  - アルキレン鎖は、1以上のアミノ又はヒドロキシ基で置換されていてもよく、又は不飽和であり；

$pPL$  は、0～8であり；そして、

$q_1PL$  と  $q_2PL$  は、独立して、0、1、又は2である]の抗微生物オリゴマー、又はその許容される塩又は溶媒和物；及び

(b) 眼科用に許容される賦形剤、

を含んでなる抗微生物の眼科用組成物であって、眼の1以上の組織への投与に適している、前記組成物。

#### 【請求項28】

$A_1$  が、1つの(PL)基と1つの非極性(NPL)基で置換されている *m*-フェニレンであり；

$A_2$  は、未置換の *m*-ピリミジニレンであるか又は1又は2の極性(PL)基で置換されている *m*-ピリミジニレンであり；

NPL は、 $R^{4'}$  であり、ここで  $R^{4'}$  は、1以上のハロ基で置換されていてもよい( $C_1 - C_6$ )アルキルであり；

PL は、 $-U^{PL} - (CH_2)_pPL - V$  であり、ここで：

$U^{PL}$  は、O又はSであり；

V は、アミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され；そして、

$pPL$  は、0～6である、請求項27の組成物。

#### 【請求項29】

$A_1$  が、1つの(PL)基と1つの非極性(NPL)基で置換されている *m*-フェニレンであり；

$A_2$  は、未置換の *m*-フェニレンであるか又は1又は2の極性(PL)基で置換されている *m*-フェニレンであり；

NPL は、 $R^{4'}$  であり、ここで  $R^{4'}$  は、1以上のハロ基で置換されていてもよい( $C_1 - C_6$ )アルキルであり；

PL は、 $-U^{PL} - (CH_2)_pPL - V$  であり、ここで：

$U^{PL}$  は、O又はSであり；

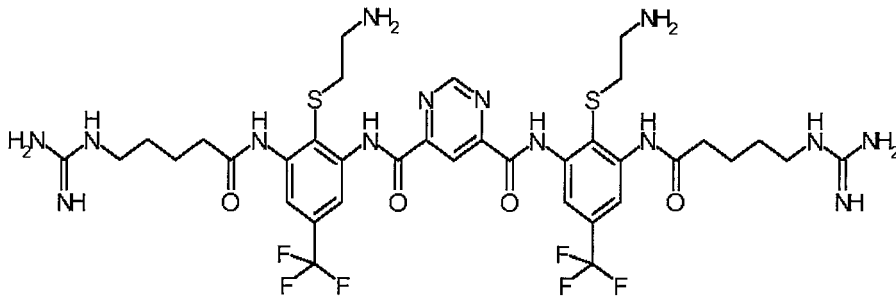
V は、アミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され；そして、

$pPL$  は、0～6である、請求項27の組成物。

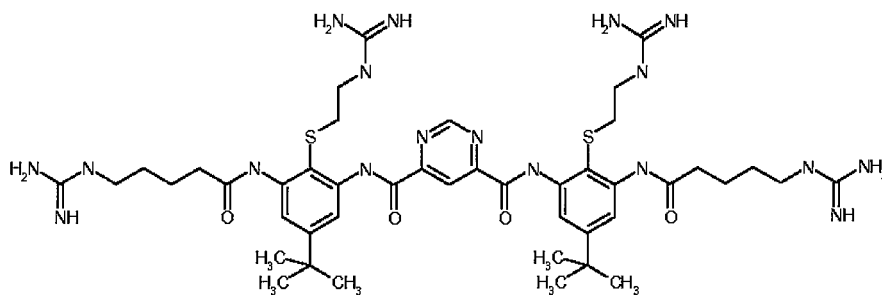
#### 【請求項30】

オリゴマーが：

## 【化 1 4】



または

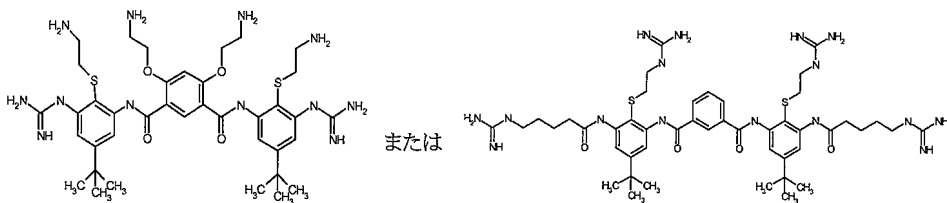


の 1 つ又はその塩又は溶媒和物である、請求項 2 7 又は請求項 2 8 の組成物。

## 【請求項 3 1】

オリゴマーが：

## 【化 1 5】



の 1 つ又はその塩又は溶媒和物である、請求項 2 7 又は請求項 2 9 の組成物。

## 【請求項 3 2】

動物の眼における微生物感染症の治療又は予防に使用の眼科用組成物であって、該組成物をその眼の 1 以上の組織へ投与するときに、請求項 1 の式 I の抗微生物オリゴマーを、該感染症を治療又は予防するのに有効な量で含む、前記組成物。

## 【請求項 3 3】

動物の眼における微生物感染症の治療又は予防に使用の眼科用組成物であって、該組成物をその眼の 1 以上の組織へ投与するときに、請求項 3 の式 I I の抗微生物オリゴマーを、該感染症を治療又は予防するのに有効な量で含む、前記組成物。

## 【請求項 3 4】

動物の眼における微生物感染症の治療又は予防に使用の眼科用組成物であって、該組成物をその眼の 1 以上の組織へ投与するときに、請求項 1 7 の式 I V の抗微生物オリゴマーを、該感染症を治療又は予防するのに有効な量で含む、前記組成物。

## 【請求項 3 5】

動物の眼における微生物感染症の治療又は予防に使用の眼科用組成物であって、該組成物をその眼の 1 以上の組織へ投与するときに、請求項 1 9 の式 V の抗微生物オリゴマーを、該感染症を治療又は予防するのに有効な量で含む、前記組成物。

**【請求項 36】**

動物の眼における微生物感染症の治療又は予防に使用の眼科用組成物であって、該組成物をその眼の1以上の組織へ投与するときに、請求項25の式ⅤⅠの抗微生物オリゴマーを、該感染症を治療又は予防するのに有効な量で含む、前記組成物。

**【請求項 37】**

動物の眼の1以上の組織への局所投与に適している、請求項1～36のいずれか1項の組成物。

**【請求項 38】**

溶液剤、懸濁液剤、乳剤、ゲル剤、軟膏剤、及び眼科用インプラントに適した固体品より選択される形態である、請求項1～36のいずれか1項の組成物。

**【請求項 39】**

オリゴマーが約0.01重量%～約20重量%の濃度で存在する、請求項38の組成物。

**【請求項 40】**

眼科用に許容される賦形剤が、保存剤、安定化剤、抗酸化剤、及び粘度増強剤、又はこれらのあらゆる組合せより選択される、請求項1～31のいずれか1項の組成物。

**【請求項 41】**

保存剤が、フェニル水銀塩、チメロサル、安定化二酸化塩素、四級アンモニウム化合物、イミダゾリジニル尿素、パラベン、フェノキシエタノール、クロロフェノキシエタノール、フェノキシプロパノール、クロロブタノール、クロロクレゾール、フェニルエチルアルコール、及びソルビン酸又はその塩、又はこれらのあらゆる組合せより選択される、請求項40の組成物。

**【請求項 42】**

抗酸化剤が、アスコルビン酸、メタ重亜硫酸ナトリウム、重亜硫酸ナトリウム、及びアセチルシステインより選択される、請求項40の組成物。

**【請求項 43】**

安定化剤がキレート剤である、請求項40の組成物。

**【請求項 44】**

キレート剤がEDTA二ナトリウム（エデト酸二ナトリウム）である、請求項43の組成物。

**【請求項 45】**

粘度増強剤が、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルアルコール、及びグリセロールより選択される、請求項40の組成物。

**【請求項 46】**

追加の眼科用に許容される賦形剤をさらに含む、請求項37の組成物。

**【請求項 47】**

追加の眼科用に許容される賦形剤が、緩衝剤、可溶化剤、界面活性剤、滑沢剤、及び眼科用に許容される塩、又はこれらのあらゆる組合せより選択される、請求項46の組成物。

**【請求項 48】**

追加の医薬品をさらに含む、請求項37の組成物。

**【請求項 49】**

追加の医薬品が、抗炎症剤、抗微生物剤、麻酔剤、及び抗アレルギー剤より選択される、請求項48の組成物。

**【請求項 50】**

追加の医薬品がステロイド性抗炎症剤である、請求項49の組成物。

**【請求項 51】**

ステロイド性抗炎症剤がグルココルチコイドである、請求項50の組成物。

**【請求項 52】**

ステロイド性抗炎症剤が、デキサメタゾン、リメキシロン、プレドニゾン、フルオロ



メトロロン、及びヒドロコチゾンより選択される、請求項 5 0 の組成物。

【請求項 5 3】

追加の医薬品が抗微生物剤である、請求項 4 9 の組成物。

【請求項 5 4】

抗微生物剤が、抗菌剤、抗真菌剤、及び抗ウイルス剤より選択される、請求項 5 3 の組成物。

【請求項 5 5】

請求項 1 の化合物の、動物における眼及び / 又は耳の感染症を治療又は予防するための医薬品の製造における使用。