

【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 07 D 401/14 (2006.01)
C 07 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 :

$$R^1 - [- X - A_1 - Y - X - A_2 - Y -]_m - R^2 \quad (I)$$

[式中:]

Xは、NR⁸、-N(R⁸)N(R⁸)-、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；

R⁸は、水素又はアルキルであり；

A₁とA₂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A₁とA₂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；又は

A₁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、A₂は、C₃~C₈シクロアルキル又は-(CH₂)_q-であり(ここでqは、1~7である)、ここでA₁とA₂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；又は

A₂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、A₁は、C₃~C₈シクロアルキル又は-(CH₂)_q-であり(ここでqは、1~7である)、ここでA₁とA₂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；

R¹は：

(i) 水素、極性(P L)基、又は非極性(N P L)基であり、R²は、-X-A₁-Y-R¹は、R¹は、水素、極性(P L)基、又は非極性(N P L)基である；又は

(ii) R¹とR²は、独立して、水素、極性(P L)基、又は非極性(N P L)基であり；又は

(iii) R¹とR²は、ともに単結合であり；

N P Lは、-B(OR⁴)₂及び-(NR³)_q₁N P L-U^{N P L}-(CH₂)_p_{N P L}-(NR³)_q₂N P L-R⁴より独立して選択される非極性基であり、ここで：

R³、R³'、及びR³"は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

R⁴とR⁴'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^{N P L}は、非存在であるか又はO、S、S(=O)、S(=O)₂、NR³、-C(

$= O$) - 、 - C (= O) - N = N - NR³ - 、 - C (= O) - NR³ - N = N - 、 - N = N - NR³ - 、 - C (= N - N (R³)₂) - 、 - C (= NR³) - 、 - C (= O) O - 、 - C (= O) S - 、 - C (= S) - 、 - O - P (= O)₂O - 、 - R³O - 、 - R³S - 、 - S - C = N - 、 及び - C (= O) - NR³ - 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つてよく；

- (CH₂)_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'})_{q₁PL} - U^{PL} - (CH₂)_{pPL} - (NR^{5''})_{q₂PL} - Vより選択される極性基であり、ここで：

R⁵、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、NR⁵、-C (= O) - 、 - C (= O) - N = N - NR⁵ - 、 - C (= O) - NR⁵ - N = N - 、 - N = N - NR⁵ - 、 - C (= N - N (R⁵)₂) - 、 - C (= NR⁵) - 、 - C (= O) O - 、 - C (= O) S - 、 - C (= S) - 、 - O - P (= O)₂O - 、 - R⁵O - 、 - R⁵S - 、 - S - C = N - 、 及び - C (= O) - NR⁵ - 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つてよく；

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(CH₂)_pNH₂（ここでpは、1～4である）、-N(CH₂CH₂NH₂)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(CH₂)_pNH₂（ここでpは、1～4である）、-N(CH₂CH₂NH₂)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；

- (CH₂)_{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2】

Xが、NR⁸であり；

Yは、C=Oであり；

R⁸は、水素であり；

A₁は、置換されていてよいo - 、m - 、又はp - フェニレンであり、A₂は、- (CH₂)_q - （ここでqは、1である）であり、そしてここでA₁とA₂の一方は、1又は2の極性(PL)基で置換され、そしてA₁とA₂の他方は、1又は2の非極性(NPL)基で置換されており；又は

A₂は、置換されていてよいo - 、m - 、又はp - フェニレンであり、A₁は、- (CH₂)_q - （ここでqは、1である）であり、そしてここでA₁とA₂の一方は、1又は2の極性(PL)基で置換され、そしてA₁とA₂の他方は、1又は2の非極性(NPL)基で置換され；

R¹とR²は、独立して、水素、極性(PL)基、又は非極性(NPL)基であり；

NPLは、- (NR^{3'})_{q₁NPL} - U^{NPL} - (CH₂)_{pNPL} - (NR^{3''})_{q₂NPL} - R⁴であり、ここで：

R⁴は、C₁-C₁₀アルキル、C₃-C₁₈分岐鎖アルキル、C₂-C₁₀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；

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

$-(CH_2)_{pNPL}$ -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； $pNPL$ は、0~8であり；

q_1NPL と q_2NPL は、0であり；

PL は、 $-NR^{5'}_{q_1PL} - U^{PL} - (CH_2)_{pPL} - NR^{5'}_{q_2PL}$

- 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、 $-NH(CH_2)_{pNH_2}$ （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、及びグアニジノより選択され；

$-(CH_2)_{pPL}$ -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；

pPL は、0~8であり；

q_1PL と q_2PL 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II：



[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；

(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

(v) R¹ と R² は、独立して、極性基 (P L) 又は非極性基 (N P L) であり；又は

(vi) R¹ と R² は、一緒に単結合を形成し；

N P L は、 - B (O R⁴)₂ 及び - (N R³ ')_{q1} N P L - U^{N P L} - (C H₂)_p N P L - (N R³ '')_{q2} N P L - R⁴ ' より独立して選択される非極性基であり、ここで：

R³ 、 R³ ' 、及び R³ '' は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

R⁴ と R⁴ ' 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^{N P L} は、非存在であるか又はO、S、S (= O) 、S (= O)₂ 、N R³ 、- C (= O) - 、- C (= O) - N = N - N R³ - 、- C (= O) - N R³ - N = N - 、- N = N - N R³ - 、- C (= N - N (R³)₂) - 、- C (= N R³) - 、- C (= O) O - 、- C (= O) S - 、- C (= S) - 、- O - P (= O)₂ O - 、- R³ O - 、- R³ S - 、- S - C = N - 、及び - C (= O) - N R³ - 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；

- (C H₂)_p N P L - 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 N P L は、0 ~ 8 であり；

q₁ N P L と q₂ 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 - (N R⁵ ')_{q1} P L - U^{P L} - (C H₂)_p P L - (N R⁵ ')_{q2} P L - V より選択される極性基であり、ここで：

R⁵ 、R⁵ ' 、及び R⁵ '' 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^{P L} は、非存在であるか又はO、S、S (= O) 、S (= O)₂ 、N R⁵ 、- C (= O) - 、- C (= O) - N = N - N R⁵ - 、- C (= O) - N R⁵ - N = N - 、- N = N - N R⁵ - 、- C (= N - N (R⁵)₂) - 、- C (= N R⁵) - 、- C (= O) O - 、- C (= O) S - 、- C (= S) - 、- O - P (= O)₂ O - 、- R⁵ O - 、- R⁵ S - 、- S - C = N - 、及び - C (= O) - N R⁵ - 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 (C H₂)_p N H₂ (ここで p は、1 ~ 4 である) 、- N (C H₂ C H₂ N H₂)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 (C H₂)_p N H₂ (ここで p は、1 ~ 4 である) 、- N (C H₂ C H₂ N H₂)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；

- (C H₂)_p 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；

q₁ P L と q₂ 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 4】

オリゴマーが、式 I I a :



[式中 :

Xは、NR⁸、O、S、又は-N(R⁸)N(R⁸)-であり；

Yは、C=O、C=S、又はO=S=Oであり；

R⁸は、水素又はアルキルであり；

A₁とA₂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A₁とA₂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；

R¹は、極性基(PL)又は非極性基(NPL)であり；

R²は、R¹であり；

NPLは、非極性基：-(NR^{3'})_{q1NPL}-UNPL-(CH₂)_{pNPL}-(NR^{3''})_{q2NPL}-R^{4'}であり、ここで：

R³、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；

R⁴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；

UNPLは、非存在であるか又はO、S、S(=O)、S(=O)₂、NR³、-C(=O)-、-C(=O)-N=N-NR³-、-C(=O)-NR³-N=N-、-N=N-NR³-、-C(=N-N(R³)₂)-、-C(=NR³)-、-C(=O)O-、-C(=O)S-、-C(=S)-、-O-P(=O)₂O-、-R³O-、-R³S-、-S-C=N-、及び-C(=O)-NR³-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；

-(CH₂)_{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'})_{q1PL}-UPL-(CH₂)_{pPL}-(NR^{5'})_{q2PL}-Vより選択される極性基であり、ここで：

R⁵、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；

UPLは、非存在であるか又はO、S、S(=O)、S(=O)₂、NR⁵、-C(=O)-、-C(=O)-N=N-NR⁵-、-C(=O)-NR⁵-N=N-、-N=N-NR⁵-、-C(=N-N(R⁵)₂)-、-C(=NR⁵)-、-C(=O)O-、-C(=O)S-、-C(=S)-、-O-P(=O)₂O-、-R⁵O-、-R⁵S-、-S-C=N-、及び-C(=O)-NR⁵-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(CH₂)_pNH₂(ここでpは、1~4である)、-N(CH₂CH₂NH₂)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(CH₂)_pNH₂(ここでpは、1~4である)、-N(CH₂CH₂NH₂)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；

-(CH₂)_{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、NR⁸であり；

Yは、C=Oであり；

R⁸は、水素又は(C₁-C₄)アルキルであり；

A₁とA₂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A₁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、A₂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；

R¹は、極性基(PL)であり；

R²は、R¹であり；

NPLは、非極性基：-(NR³')(q₁NPL)-U^{NPL}-(CH₂)_{pNPL}-(NR³')(q₂NPL)-R⁴'であり、ここで：

R⁴とR⁴'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；

UNPLは、非存在であるか又はO、S、NR³、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：-(NR⁵')(q₁PL)-U^{PL}-(CH₂)_{pPL}-(NR⁵')(q₂PL)-Vであり、ここで：

UPLは、非存在であるか又はO、S、NR⁵、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(CH₂)_pNH₂(ここでpは、1~4である)、-N(CH₂CH₂NH₂)₂、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(CH₂)_pNH₂(ここでpは、1~4である)、-N(CH₂CH₂NH₂)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、及び低級アシリアミノの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】

A₁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；

A₂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、R⁴'であり、ここでR⁴'は、1以上のハロ基で置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであり；

PLは、-U^{PL}-(CH₂)_{pPL}-Vであり、ここで：

UPL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】

A₁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；

A₂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、R⁴'であり、ここでR⁴'は、1以上のハロ基で置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであり；

PLは、-U^{PL}-(CH₂)_{pPL}-Vであり、ここで：

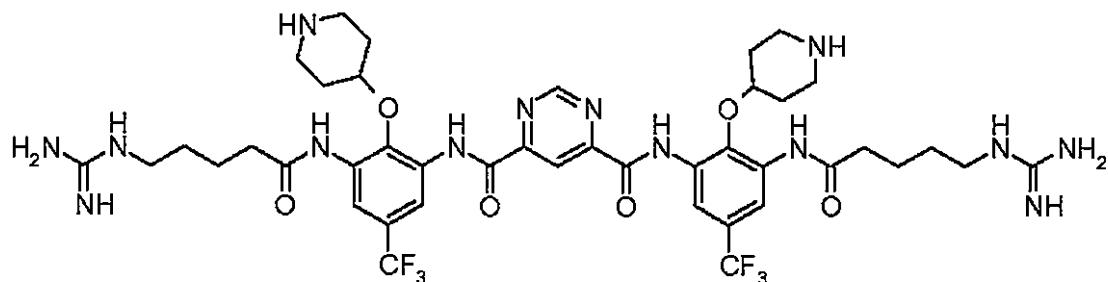
UPLは、O又はSであり；

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、

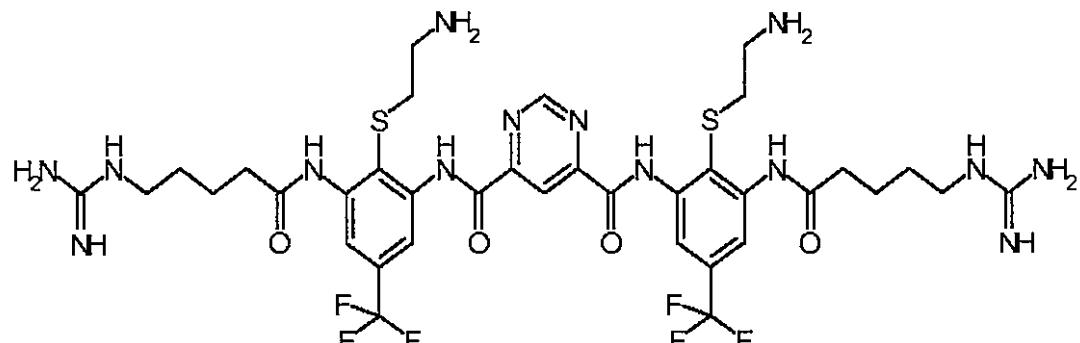
pPLは、0~6である、請求項1、2、4、及び5のいずれか1項の組成物。

【請求項 8】
オリゴマーが：

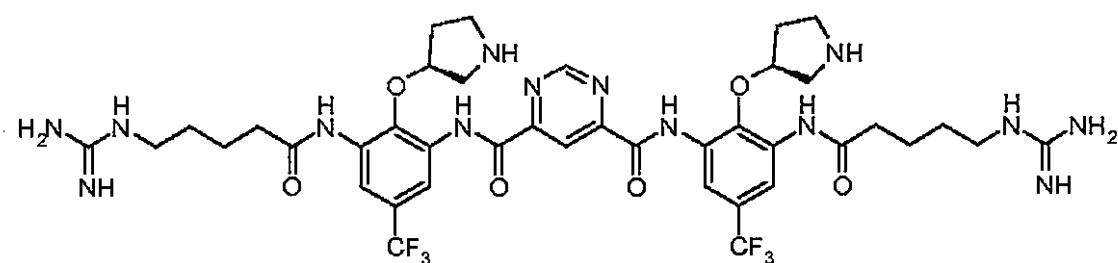
【化1】



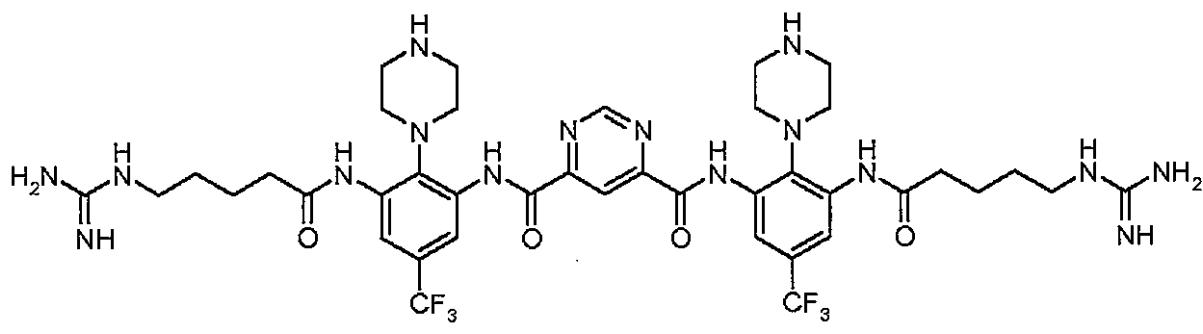
,



,

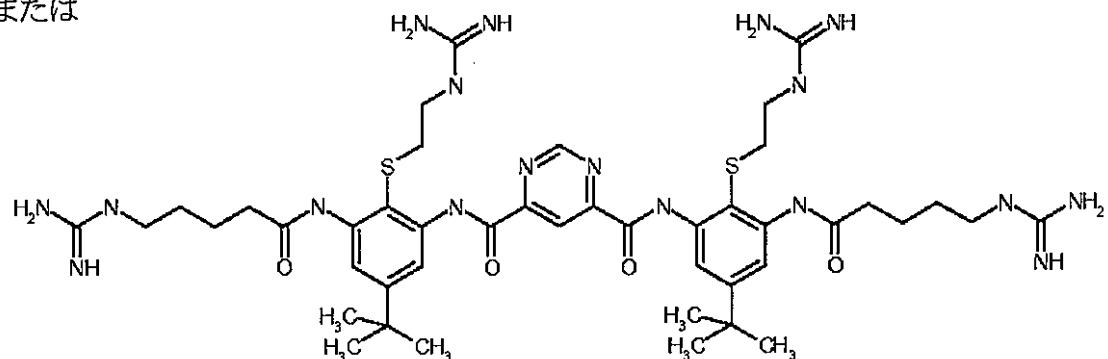


,



,

または



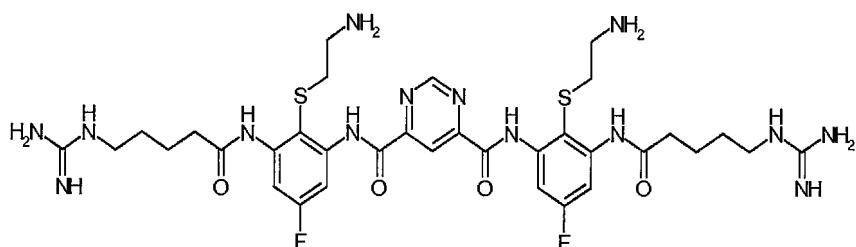
又はその塩又は溶媒和物である、請求項1、2、4、5、及び6のいずれか1項の組成物

。

【請求項 9】

オリゴマーが：

【化 2】

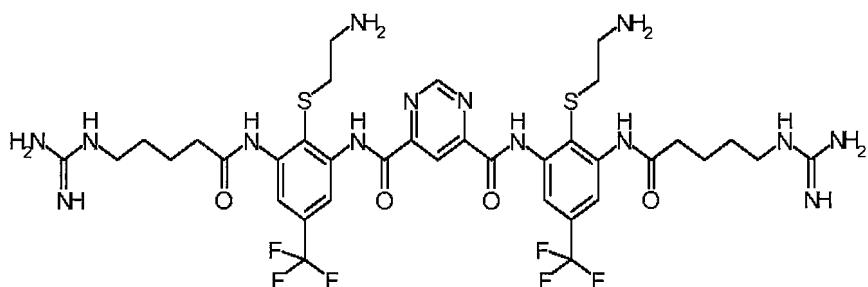


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、及び 4 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 10】

オリゴマーが：

【化 3】

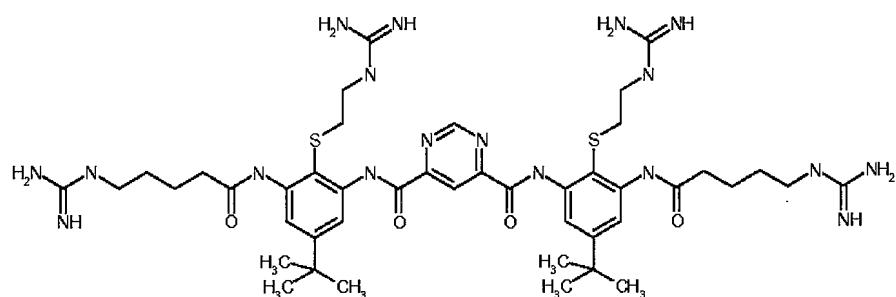


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 11】

オリゴマーが：

【化 4】

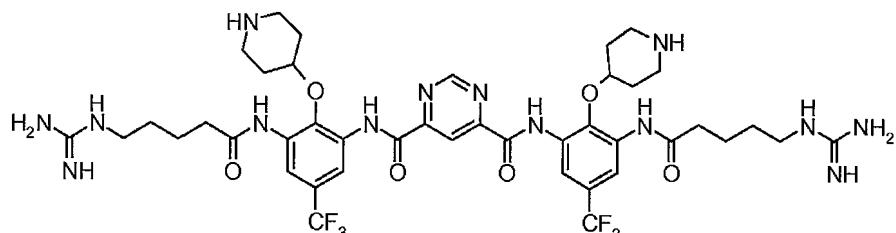


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 12】

オリゴマーが：

【化 5】



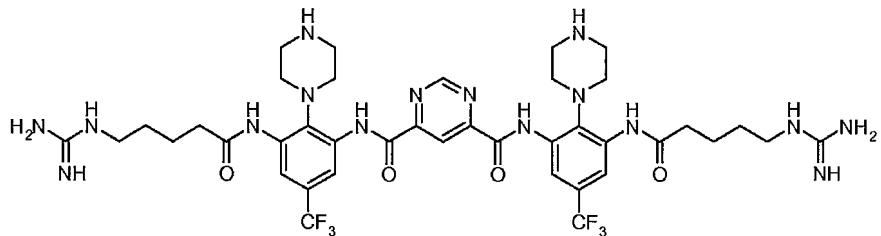
又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組

成物。

【請求項 1 3】

オリゴマーが：

【化 6】

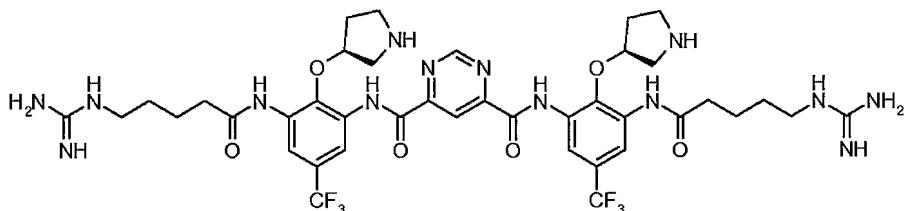


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 1 4】

オリゴマーが：

【化 7】

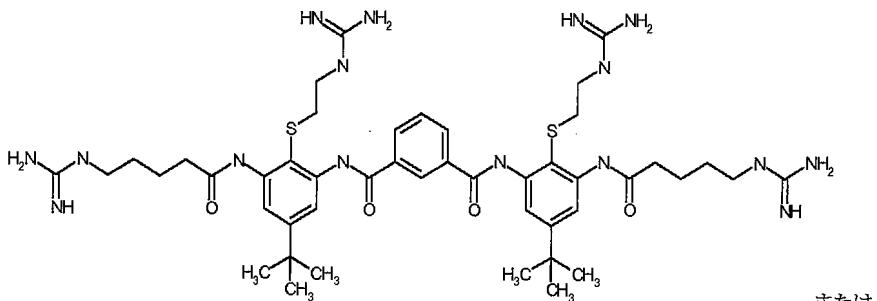


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、5、6、及び 8 のいずれか 1 項の組成物。

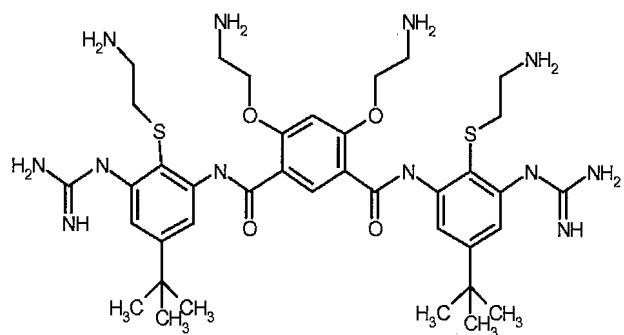
【請求項 1 5】

オリゴマーが：

【化 8】



または

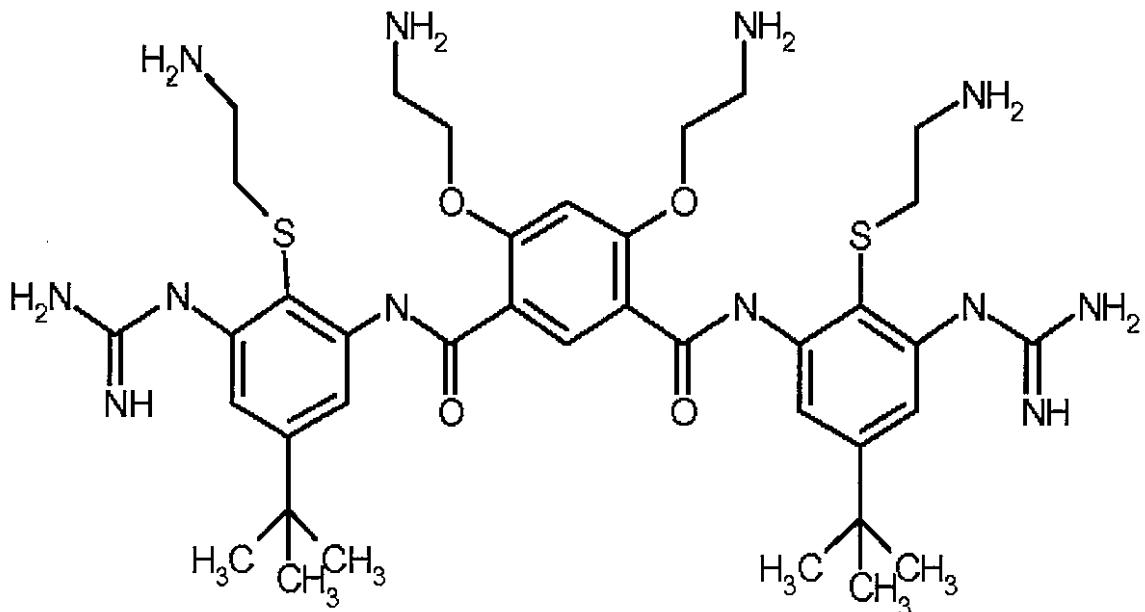


又はその塩又は溶媒和物である、請求項 1、2、4、及び 5 のいずれか 1 項の組成物。

【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IV：

$$R^1 - [- X - A_1 - X - Z - Y - A_2 - Y - Z]_m - R^2 \quad (\text{IV})$$

[式中：

Xは、NR⁸、-NR⁸NR⁸-、C=O、又はOであり；Yは、NR⁸、-NR⁸NR⁸-、C=O、S、又はOであり；R⁸は、水素又はアルキルであり；Zは、C=O、C=S、O=S=O、-NR⁸NR⁸-、又は-C(=O)C(=O)-であり；

A₁とA₂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A₁とA₂は、独立して、1以上の極性(P_L)基、1以上の非極性(N_PL)基、又は1以上の極性(P_L)基と1以上の非極性(N_PL)基の組合せで置換されていてもよく；

R¹は：

(i) 水素、極性基(P_L)、又は非極性基(N_PL)であり、R²は、-X-A₁-X-R¹であり、ここでA₁は、上記に定義される通りであり、1以上の極性(P_L)基、1以上の非極性(N_PL)基、又は1以上の極性(P_L)基と1以上の非極性(N_PL)基の組合せで置換されていてもよく；又は

(ii) 水素、極性基(P_L)、又は非極性基(N_PL)であり、R²は、-X-A₁-X-Z-Y-A₂-Y-R¹であり、ここでA₁とA₂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(P_L)基、1以上の非極性(N_PL)基、又は1以上の極性(P_L)基と1以上の非極性(N_PL)基の組合せで置換されていてもよく；

(iii) 水素、極性基(P_L)、又は非極性基(N_PL)であり、R²は、-X-A'-X-R¹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(P_L)基、1以上の非極性(N_PL)基、又は1以上の極性(P_L)基と1以上の非極性(N_PL)基の組合せで置換されていてもよく；又は

(iv) 水素、極性基(P_L)、又は非極性基(N_PL)であり、R²は、-X-A₁-X-Z-Y-A'-Y-R¹であり、ここでA₁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A₁とA'のそれぞれは、1以上の極性(P_L)基、1以上の非極性(N_PL)基、又は1以上の極性(P_L)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、R² 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、R² 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) R¹ と R² は、独立して、極性基 (PL) 又は非極性基 (NPL) であり；又は

(viii) R¹ と R² は、一緒に単結合を形成し；

NPL は、- B (OR⁴)₂ 及び - (NR³)_{q1}_{NPL} - U^{NPL} - (CH₂)_p_{NPL} - (NR³)_{q2}_{NPL} - R⁴ より独立して選択される非極性基であり、ここで：

R³、R³'、及び R³" は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

R⁴ と R⁴' 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、NR³、- C (=O) -、- C (=O) - N = N - NR³ -、- C (=O) - NR³ - N = N -、- N = N - NR³ -、- C (=N - N (R³)₂) -、- C (=NR³) -、- C (=O) O -、- C (=O) S -、- C (=S) -、- O - P (=O)₂ O -、- R³ O -、- R³ S -、- S - C = N -、及び - C (=O) - NR³ - 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；

- (CH₂)_p_{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；

q₁_{NPL} と q₂_{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 - (NR⁵)_{q1}_{PL} - U^{PL} - (CH₂)_p_{PL} - (NR⁵)_{q2}_{PL} - V より選択される極性基であり、ここで：

R⁵、R⁵'、及び R⁵" 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、NR⁵、- C (=O) -、- C (=O) - N = N - NR⁵ -、- C (=O) - NR⁵ - N = N -、- N = N - NR⁵ -、- C (=N - N (R⁵)₂) -、- C (=NR⁵) -、- C (=O) O -、- C (=O) S -、- C (=S) -、- O - P (=O)₂ O -、- R⁵ O -、- R⁵ S -、- S - C = N -、及び - C (=O) - NR⁵ - 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 (CH₂)_p NH₂ (ここで p は、1 ~ 4 である)、- N (CH₂ CH₂ NH₂)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 (CH₂)_p NH₂ (ここで p は、1 ~ 4 である)、- N (CH₂ CH₂ NH₂)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；

- (CH₂)_p_{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；

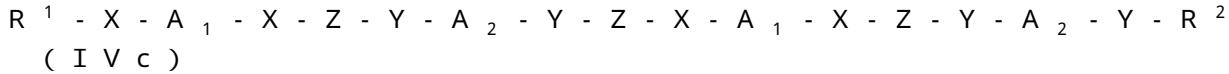
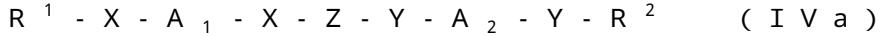
pPL は、0～8であり；

q_1PL と q_2PL 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IVa、式IVb、又は式IVc：



[式中：

Xは、NR⁸、-NR⁸NR⁸-、C=O、又はOであり；

Yは、NR⁸、-NR⁸NR⁸-、C=O、S、又はOであり；

R⁸は、水素又はアルキルであり；

Zは、C=O、C=S、O=S=O、-NR⁸NR⁸-、又は-C(=O)C(=O)-であり；

A₁とA₂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A₁とA₂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；

R¹は、水素、極性基(PL)、又は非極性基(NPL)であり；

R²は、R¹であり；

NPLは、非極性基：-(NR³)_{q1NPL}-U^{NPL}-(CH₂)_{pNPL}-(NR³)_{q2NPL}-R⁴'であり、ここで：

R³、R³'、及びR³"は、水素、アルキル、及びアルコキシより独立して選択され；

R⁴とR⁴'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、NR³、-C(=O)-、-C(=O)-N=N-NR³-、-C(=O)-NR³-N=N-、-N=N-NR³-、-C(=N-N(R³)₂)-、-C(=NR³)-、-C(=O)O-、-C(=O)S-、-C(=S)-、-O-P(=O)₂O-、-R³O-、-R³S-、-S-C=N-、及び-C(=O)-NR³-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；

-(CH₂)_{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-(NR⁵)_{q1PL}-U^{PL}-(CH₂)_{pPL}-(NR⁵)_{q2PL}-Vより選択される極性基であり、ここで：

R⁵、R⁵'、及びR⁵"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、NR⁵、-C(=O)-、-C(=O)-N=N-NR⁵-、-C(=O)-NR⁵-N=N-、-N=N-NR⁵-、-C(=N-N(R⁵)₂)-、-C(=NR⁵)-、-C(=O)O-、-C(=O)S-、-C(=S)-、-O-P(=O)₂O-、-R⁵O-、-R⁵S-、-S-C=N-、及び-C(=O)-NR⁵-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(CH₂)_pNH₂（ここでpは、1～4である）、-N(CH₂CH₂NH₂)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(CH₂)_pNH₂（ここでpは、1～4である）、-N(CH₂CH₂NH₂)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；

- (CH₂)_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：

$$R^1 - [-A_1 - W - A_2 - W -]_m - R^2 \quad (V)$$

[式中：

A₁とA₂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) A₁とA₂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) A₁又はA₂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A₁又はA₂の他方は、基：-C=C(CH₂)_pC-C-であり（ここでpは、0～8であり、そして-(CH₂)_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、非存在であるか、又は-CH₂-、-CH₂-CH₂-、-CH=CH-、又は-C=C-を表し；

R¹は：

(i) 水素、極性基(PL)、又は非極性基(NPL)であり、R²は、-A₁-R¹であり、ここでA₁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、R²は、-A₁-W-A₂-R¹であり、ここでA₁とA₂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、R²は、-A₁-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、R²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) R¹とR²は、一緒に単結合を形成し；

NPLは、-B(OR⁴)₂又は-(NR³)_{q1}NPL-U^{NPL}-(CH₂)_p
NPL-(NR³)_{q2}NPL-R⁴より独立して選択される非極性基であり、ここで

R³、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；

R⁴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、NR³、-(C=O)-、-(C=O)-N=N-NR³-、-(C=O)-NR³-N=N-、-N=N-NR³-、-C(=N-N(R³)₂)-、-C(=NR³)-、-C(=O)O-、-C(=O)S-、-C(=S)-、-O-P(=O)₂O-、-R³O-、-R³S-、-S-C=N-、及び-(C=O)-NR³-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；

-(CH₂)_{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リ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；

q₁NPLとq₂NPLは、独立して、0~2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-(NR⁵)_{q₁PL}-U^{PL}-(CH₂)_{pPL}-(NR⁵)_{q₂PL}-Vより選択される極性基であり、ここで：

R⁵、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、NR⁵、-(C=O)-、-(C=O)-N=N-NR⁵-、-(C=O)-NR⁵-N=N-、-N=N-NR⁵-、-C(=N-N(R⁵)₂)-、-C(=NR⁵)-、-C(=O)O-、-C(=O)S-、-C(=S)-、-O-P(=O)₂O-、-R⁵O-、-R⁵S-、-S-C=N-、及び-(C=O)-NR⁵-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、ヒドロキシリル、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(CH₂)_{pNH₂}、-N(CH₂CH₂NH₂)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、ヒドロキシリル、-NH(CH₂)_{pNH₂}、-N(CH₂CH₂NH₂)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；

-(CH₂)_{pPL}-アルキレン鎖は、1以上のアミノ又はヒドロキシリ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；

q₁PLとq₂PL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：

$$R^1 - A_1 - W - A_2 - W - A_1 - R^2 \quad (Va)$$

[式中：

A₁とA₂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) A₁とA₂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) A₁又はA₂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A₁又はA₂の他方は、基：-C-C(CH₂)_pC-C-であり(ここでpは、0～8であり、そして-(CH₂)_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；

R¹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；

R²は、R¹であり；

NPLは、非極性基：-(NR^{3'})_{q1NPL}-U^{NPL}-(CH₂)_{pNPL}-(NR^{3''})_{q2NPL}-R⁴であり：

R³、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；

R⁴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、NR³、-(C=O)-、-(C=O)-N=N-NR³-、-(C=O)-NR³-N=N-、-N=N-NR³-、-C(=N-N(R³)₂)-、-C(=NR³)-、-C(=O)O-、-C(=O)S-、-C(=S)-、-O-P(=O)₂O-、-R³O-、-R³S-、-S-C=N-、及び-(C=O)-NR³-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：-(CH₂)_{pNPL}-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、又は該アルキレン鎖は、不飽和であり；

pNPLは、0～8であり；

q1NPLとq2NPL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'})_{q1PL}-U^{PL}-(CH₂)_{pPL}-(NR^{5'})_{q2PL}-Vより選択される極性基であり、ここで：

R⁵、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、NR⁵、-(C=O)-、-(C=O)-N=N-NR⁵-、-(C=O)-NR⁵-N=N-、-N=N-NR⁵-、-C(=N-N(R⁵)₂)-、-C(=NR⁵)-、-C(=O)O-、-C(=O)S-、-C(=S)-、-O-P(=O)₂O-、-R⁵O-、-R⁵S-、-S-C=N-、及び-(C=O)-NR⁵-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(CH₂)_pNH₂、-N(CH₂CH₂NH₂)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(CH₂)_pNH₂、-N(CH₂CH₂NH₂)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：-(CH₂)_{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、

q1PLとq2PL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、ハロ又は - (NR^{5'})_{q1PL} - U^{PL} - (CH₂)_{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、ハロ、- NH(CH₂)_pNH₂ (ここで p は、1 ~ 4 である)、- N(CH₂CH₂NH₂)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、及び低級アシリルアミノの 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 がハロであり；

PL は、又は - U^{PL} - (CH₂)_{pPL} - V であり、ここで：

U^{PL} は、非存在であり；

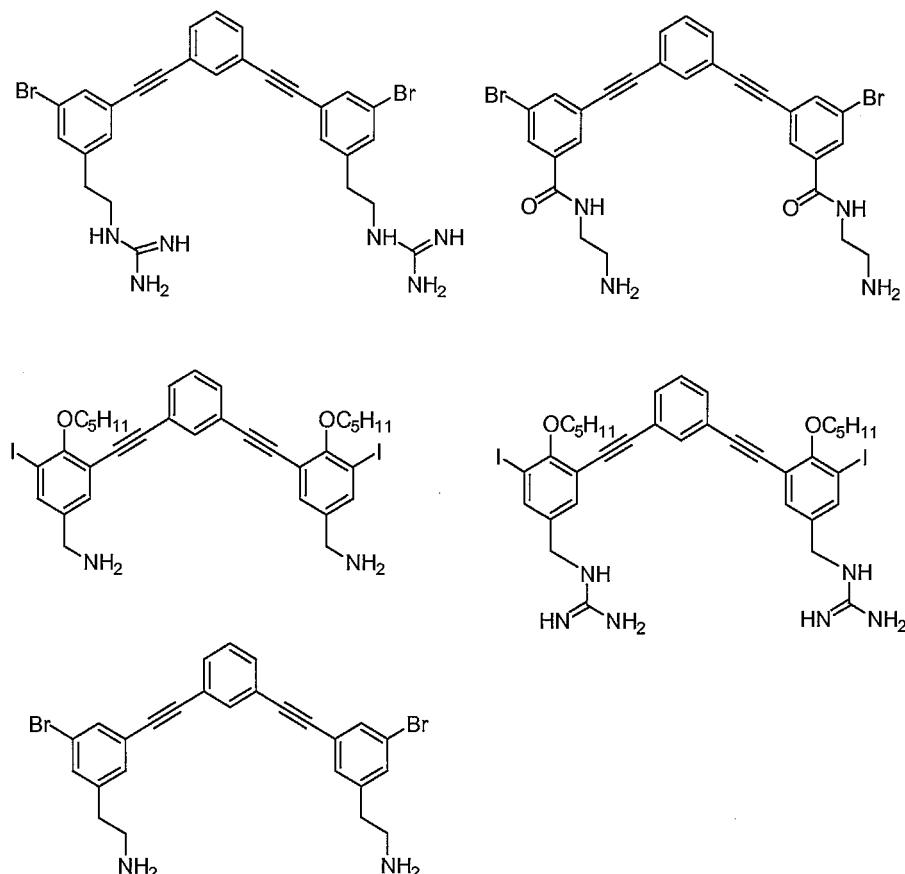
V は、アミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され、このいずれも、アミノ及びハロの 1 以上で置換されていてもよく；そして、

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】

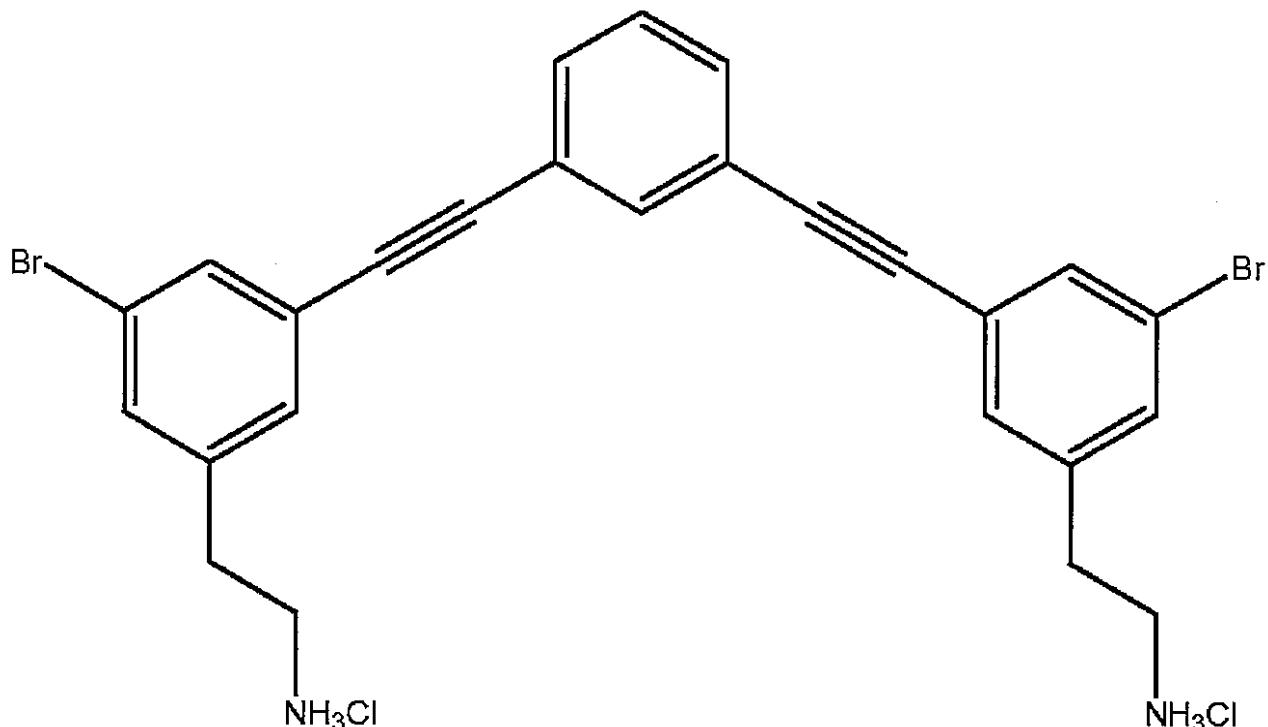


の 1 つ、又はその塩又は溶媒和物である、請求項 19 ~ 21 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 2 4】

オリゴマーが：

【化11】



である、請求項19～21のいずれか1項の組成物。

【請求項25】

式V I :

$$A - (B)_{n-1} - (D)_{m-1} - H \quad (V\ I)$$

[式中：

Aは、連鎖移動剤の残基であり；

Bは、-[CH₂-C(R¹)¹](B₁₁)-であり、ここでB₁₁は、-X₁₁-Y₁₁-Z₁₁であり、ここで

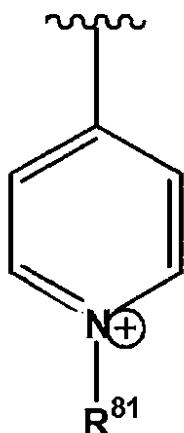
X₁₁は、カルボニル(-C(=O)-)であるか、又は置換されていてもよいC₁-₆アルキレンであるか；又はX₁₁は、非存在であり；

Y₁₁は、O、NH、又は置換されていてもよいC₁-₆アルキレンであるか；又はY₁₁は、非存在であり；

Z₁₁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(R³)(R⁴)、又は-N⁺(R³)(R⁴)(R⁵)であり、ここでR³、R⁴、及びR⁵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、又はアラルキルであり；又は

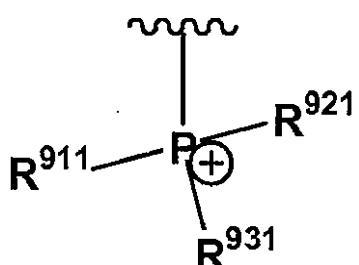
Z₁₁は、ピリジニウム：

【化12】



又はホスホニウム：

【化13】



{式中、R⁸¹、R⁹¹¹、R⁹²¹、及びR⁹³¹は、独立して、水素又はアルキルである}であり；

R¹¹は、水素又はC_{1~4}アルキルであり；

Dは、-[CH₂-C(R²¹)(D₂₁)]-であり、ここでD₂₁は、-X₂₁-Y₂₁-Z₂₁であり、ここで

X₂₁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X₂₁は、非存在であり；

Y₂₁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Y₂₁は、非存在であり；

Z₂₁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；

R²¹は、水素又はC_{1~4}アルキルであり；

m₁(Dモノマーのモル分率)は、約0.1~約0.9であり；そして、

n₁(Bモノマーのモル分率)は、1-m₁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}アルコキシカルボニル(C_{1~4})アルキルチオであり；

X₁₁とX₂₁は、カルボニルであり；

Y₁₁とY₂₁は、Oであり；

Z₁₁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

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

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

$R^{1\ 1}$ と $R^{2\ 1}$ 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 II a :



[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 - $(NR^{3'})_{q_1 NPL} - U^{NPL} - (CH_2)_p NPL - (NR^{3''})_{q_2 NPL} - R^{4'}$ 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；

$UNPL$ 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；

- $(CH_2)_p NPL$ - 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；

$pNPL$ は、0 ~ 8 であり；

$q_1 NPL$ と $q_2 NPL$ 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 - $(NR^{5'})_{q_1 PL} - U^{PL} - (CH_2)_p PL - (NR^{5'})_{q_2 PL} - V$ 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；

UPL 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(CH₂)_pNH₂（ここでpは、1～4である）、-N(CH₂CH₂NH₂)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(CH₂)_pNH₂（ここでpは、1～4である）、-N(CH₂CH₂NH₂)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；

- (CH₂)_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]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】

A₁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；

A₂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、R⁴'であり、ここでR⁴'は、1以上のハロ基で置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであり；

PLは、-U^{PL}-(CH₂)_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】

A₁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；

A₂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、R⁴'であり、ここでR⁴'は、1以上のハロ基で置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであり；

PLは、-U^{PL}-(CH₂)_pPL-Vであり、ここで：

U^{PL}は、O又はSであり；

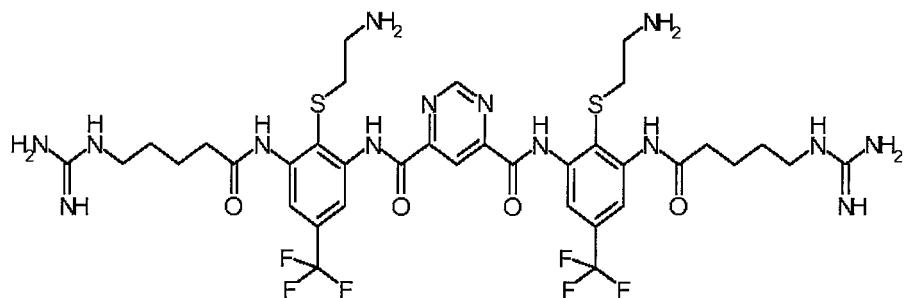
Vは、アミノ、アミジノ、及びグアニジノより選択され；そして、

pPLは、0～6である、請求項27の組成物。

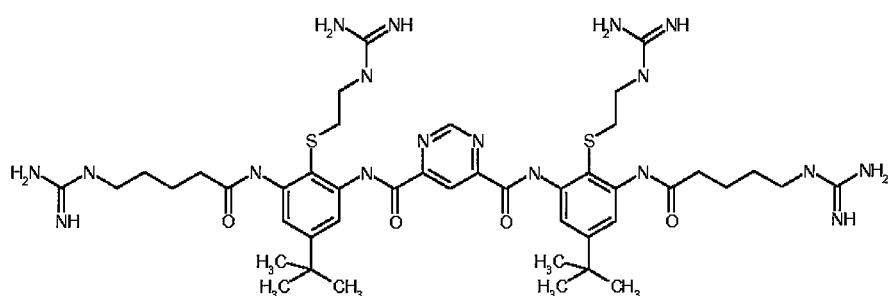
【請求項30】

オリゴマーが：

【化14】



または

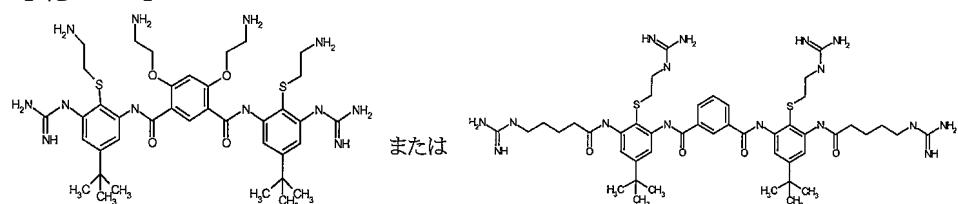


の1つ又はその塩又は溶媒和物である、請求項27又は請求項28の組成物。

【請求項31】

オリゴマーが：

【化15】



の1つ又はその塩又は溶媒和物である、請求項27又は請求項29の組成物。

【請求項32】

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33】

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II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34】

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17の式IV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35】

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19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 3 6】

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 2 5 の式 V 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 7】

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 ~ 3 6 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 3 8】

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 ~ 3 6 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 3 9】

オリゴマーが約 0 . 0 1 重量 % ~ 約 2 0 重量 % の濃度で存在する、請求項 3 8 の組成物。

【請求項 4 0】

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 ~ 3 1 のいずれか 1 項の組成物。

【請求項 4 1】

保存剤が、フェニル水銀塩、チメロサール、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 4 0 の組成物。

【請求項 4 2】

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 4 0 の組成物。

【請求項 4 3】

安定化剤がキレート剤である、請求項 4 0 の組成物。

【請求項 4 4】

キレート剤が E D T A ニナトリウム（エデト酸ニナトリウム）である、請求項 4 3 の組成物。

【請求項 4 5】

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 4 0 の組成物。

【請求項 4 6】

追加の眼科用に許容される賦形剤をさらに含む、請求項 3 7 の組成物。

【請求項 4 7】

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 4 6 の組成物。

【請求項 4 8】

追加の医薬品をさらに含む、請求項 3 7 の組成物。

【請求項 4 9】

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 4 8 の組成物。

【請求項 5 0】

追加の医薬品がステロイド性抗炎症剤である、請求項 4 9 の組成物。

【請求項 5 1】

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 5 0 の組成物。

【請求項 5 2】

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

メトロン、及びヒドロコー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。