

【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18年6月8日(2006.6.8)

【公表番号】特表2005-523313(P2005-523313A)

【公表日】平成17年8月4日(2005.8.4)

【年通号数】公開・登録公報2005-030

【出願番号】特願2003-585659(P2003-585659)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/65 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/65

A 6 1 P 27/02

【手続補正書】

【提出日】平成18年4月17日(2006.4.17)

【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】

テトラサイクリン化合物を含むヒトの目の酒さ及び酒さ性ざ瘡を同時に治療するための医薬組成物。

【請求項2】

テトラサイクリン化合物を含むヒトの眼瞼炎及び酒さ性ざ瘡を同時に治療するための医薬組成物。

【請求項3】

前記テトラサイクリン化合物が、抗生物質量の10～80%の量で投与される抗生物質テトラサイクリン化合物である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記テトラサイクリン化合物が、20mgの用量で1日2回投与されるドキシサイクリンである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記テトラサイクリン化合物が、38mgの用量で1日1回投与されるミノサイクリン；又は38mgの用量で1日2回投与されるミノサイクリン；又は38mgの用量で1日3回投与されるミノサイクリン；又は38mgの用量で1日4回投与されるミノサイクリン；又は60mg/日の用量で1日1回投与されるテトラサイクリン；又は60mg/日の用量で1日2回投与されるテトラサイクリン；又は60mg/日の用量で1日3回投与されるテトラサイクリン；又は60mg/日の用量で1日4回投与されるテトラサイクリンである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記テトラサイクリン化合物が、1.0μg/mlという血清濃度になる量で投与されるドキシサイクリンである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項7】

前記テトラサイクリン化合物が、0.8μg/ml又は0.5μg/mlという血清濃度になる量で投与されるミノサイクリンである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項8】

前記抗生物質テトラサイクリン化合物が、ドキシサイクリン、ミノサイクリン、テトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、クロロテトラサイクリン、デメクロサイクリン又はそれらの製薬的に許容性の塩である、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記抗生物質テトラサイクリン化合物がドキシサイクリンである、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記ドキシサイクリンが約 0.1 ~ 約 0.8 $\mu\text{g/ml}$ の範囲の血清濃度を与える量で投与される、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記ドキシサイクリンが毎日 1 回 20mg の量で投与される、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記ドキシサイクリンが 24 時間にわたって徐放投与される、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記ドキシサイクリンが 40mg の量で投与される、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記テトラサイクリン化合物が非抗生物質テトラサイクリン化合物である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

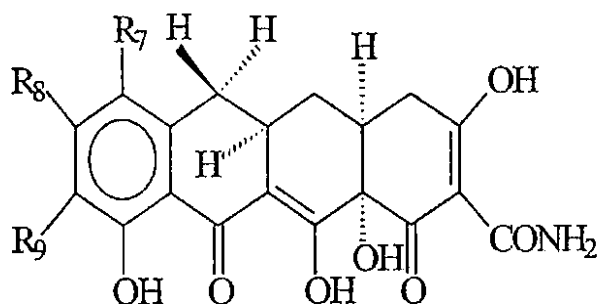
【請求項 15】

前記非抗生物質テトラサイクリン化合物が、
 4-デ(ジメチルアミノ)テトラサイクリン (CMT-1)、
 テトラサイクリノニトリル (CMT-2)、
 6-デメチル-6-デオキシ-4-デ(ジメチルアミノ)テトラサイクリン (CMT-3)、
 4-デ(ジメチルアミノ)-7-クロロテトラサイクリン (CMT-4)、
 テトラサイクリンピラゾール (CMT-5)、
 4-ヒドロキシ-4-デ(ジメチルアミノ)テトラサイクリン (CMT-6)、
 4-デ(ジメチルアミノ)-12-デオキシテトラサイクリン (CMT-7)、
 6-デオキシ-5-ヒドロキシ-4-デ(ジメチルアミノ)テトラサイクリン (CMT-8)、
 4-デ(ジメチルアミノ)-12-デオキシアニヒドロテトラサイクリン (CMT-9)、又は
 4-デ(ジメチルアミノ)ミノサイクリン (CMT-10) である、
 請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記非抗生物質テトラサイクリン化合物が、以下の構造：

【化 1】



構造K

(式中、各場合にまとめて R 7、R 8、及び R 9 は、以下の意味を有する。

R 7

アジド

R 8

水素

R 9

水素

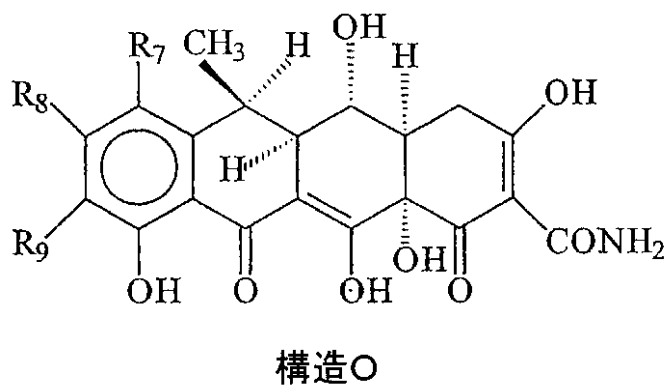
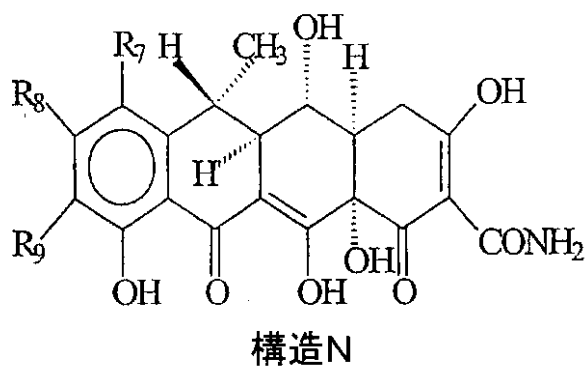
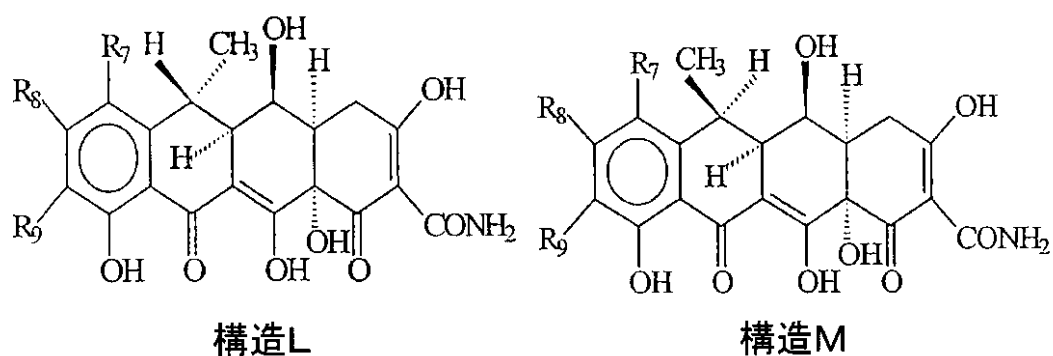
ジメチルアミノ
 水素
 水素
 水素
 ジメチルアミノ
 アシルアミノ
 水素
 アミノ
 水素
 アミノ
 水素
 ジメチルアミノ
 ジメチルアミノ
 ジメチルアミノ
 水素
 アミノ
 アシルアミノ
 アミノ
 アシルアミノ
 モノアルキルアミノ
 ニトロ
 ジメチルアミノ
 ジメチルアミノ
 水素
 ジメチルアミノ
 トリメチルアンモニウム

水素
 水素
 水素
 水素
 水素
 水素
 水素
 水素
 水素
 水素
 水素
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 クロロ
 水素
 水素
 水素
 水素

アジド
 アミノ
 アジド
 ニトロ
 アミノ
 水素
 アシルアミノ
 ニトロ
 (N,N-ジメチル)グリシルアミノ
 アミノ
 エトキシチオカルボニルチオ
 アシルアミノ
 ジアゾニウム
 アミノ
 アミノ
 アミノ
 アシルアミノ
 水素
 水素
 アミノ
 アミノ
 アシルアミノ
 ジメチルアミノ
 ジメチルアミノ
 水素
 水素) ;

及び

【化 2】



(式中、各場合にまとめてR 7、R 8、及びR 9は、以下の意味を有する。

R 7
アジド
ジメチルアミノ
水素
水素
水素
ジメチルアミノ
アシルアミノ

R 8
水素
水素
水素
水素
水素
水素
水素

R 9
水素
アジド
アミノ
アジド
ニトロ
アミノ
水素

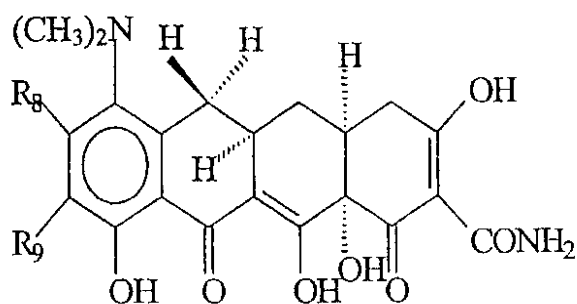
水素
アミノ
水素
アミノ
水素
ジメチルアミノ
水素
水素
ジアゾニウム
エトキシチオカルボニルチオ
ジメチルアミノ
アミノ
アシルアミノ
水素
アミノ
アシルアミノ
モノアルキルアミノ
ニトロ

水素
水素
水素
水素
水素
水素
水素
水素
クロロ
クロロ
クロロ
クロロ
クロロ
クロロ
クロロ
クロロ

アシルアミノ
ニトロ
(N,N-ジメチル)グリシルアミノ
アミノ
エトキシチオカルボニルチオ
アシルアミノ
ジアゾニウム
ジメチルアミノ
水素
水素
アミノ
アミノ
アシルアミノ
アミノ
水素
水素
アミノ
アミノ) ;

及び

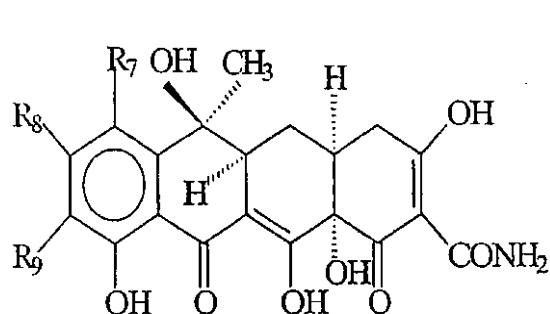
【化 3】



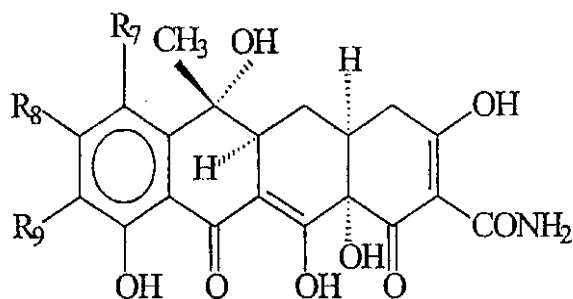
構造P

(式中、R 8 は水素又はハロゲンであり、R 9 はニトロ、(N,N-ジメチル)グリシルアミノ、及びエトキシチオカルボニルチオから成る群より選択される) ; 及び

【化 4】



構造Q



構造R

(式中、各場合にまとめてR 7、R 8、及びR 9は、以下の意味を有する。)

R 7
アミノ
ニトロ
アジド

R 8
水素
水素
水素

R 9
水素
水素
水素

ジメチルアミノ	水素	アジド
水素	水素	アミノ
水素	水素	アジド
水素	水素	ニトロ
プロモ	水素	水素
ジメチルアミノ	水素	アミノ
アシルアミノ	水素	水素
水素	水素	アシルアミノ
アミノ	水素	ニトロ
水素	水素	(N,N-ジメチル)グリシルアミノ
アミノ	水素	アミノ
ジエチルアミノ	水素	水素
水素	水素	エトキシチオカルボニルチオ
ジメチルアミノ	水素	メチルアミノ
ジメチルアミノ	水素	アシルアミノ
ジメチルアミノ	クロロ	アミノ
アミノ	クロロ	アミノ
アシルアミノ	クロロ	アシルアミノ
水素	クロロ	アミノ
アミノ	クロロ	水素
アシルアミノ	クロロ	水素
モノアルキルアミノ	クロロ	アミノ
ニトロ	クロロ	アミノ) ;

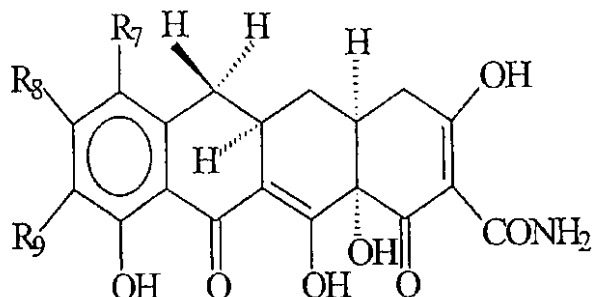
及びそれらの製薬的に許容性の塩

から成る群より選択される、請求項 1 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

前記テトラサイクリン化合物が、以下の構造：

【化 5】



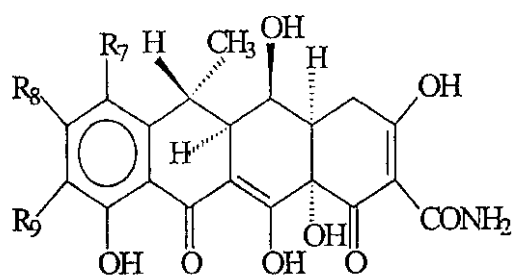
構造K

(式中、各場合にまとめて R 7、R 8、及び R 9 は、以下の意味を有する。)

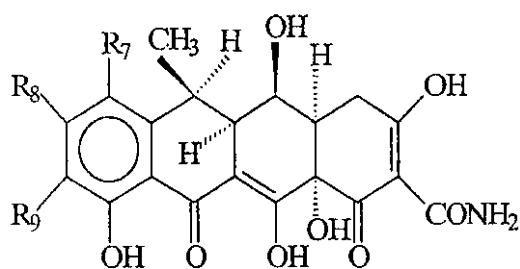
R 7	R 8	R 9
水素	水素	アミノ
水素	水素	パルミトアミド
水素	水素	ジメチルアミノ) ;

及び

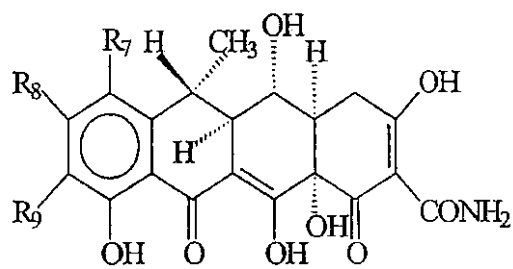
【化 6】



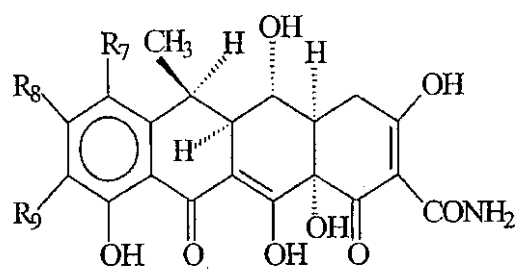
構造L



構造M



構造N



構造O

(式中、各場合にまとめて R 7、R 8、及び R 9 は、以下の意味を有する。

R 7

水素

水素

水素

水素

水素

水素

R 8

水素

水素

水素

水素

水素

水素

R 9

アセトアミド

ジメチルアミノアセトアミド

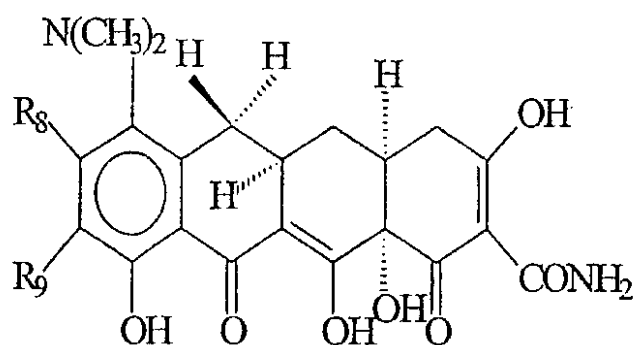
ニトロ

アミノ

パルミトアミド) ;

及び

【化 7】



構造P

(式中、まとめて R 8、及び R 9 は、それぞれ水素及びニトロである。)
 から成る群より選択される、請求項 1 4 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記 医薬組成物 が、経口投与、静脈内注射、筋肉内注射、皮下投与、経皮投与又は鼻腔内投与 用 である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 9】

非抗生物質テトラサイクリン化合物を含むヒトの目の酒さ及び酒さ性ざ瘡を同時に治療するための医薬組成物。