

【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、抗生素質量の10~80%の量で投与される抗生素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0.8μg/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。

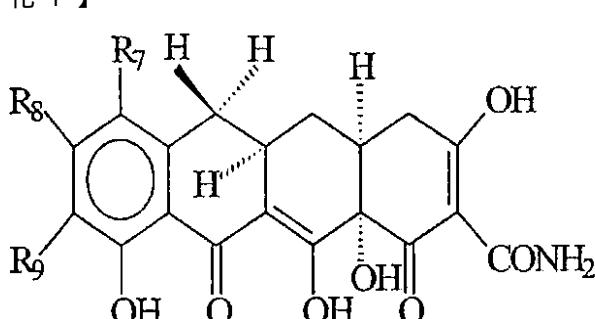
**【請求項 15】**

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-デオキシアン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R7、R8、及びR9は、以下の意味を有する。

R7

R8

R9

アジド

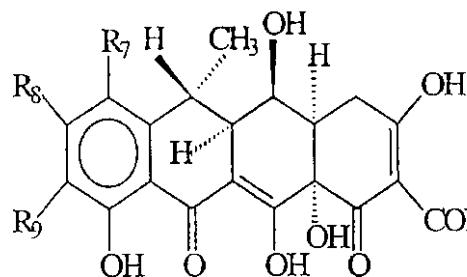
水素

水素

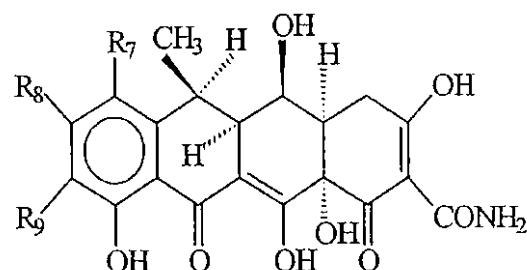
ジメチルアミノ	水素	アジド
水素	水素	アミノ
水素	水素	アジド
水素	水素	ニトロ
ジメチルアミノ	水素	アミノ
アシルアミノ	水素	水素
水素	水素	アシルアミノ
アミノ	水素	ニトロ
水素	水素	(N,N-ジメチル)グリシルアミノ
アミノ	水素	アミノ
水素	水素	エトキシチオカルボニルチオ
ジメチルアミノ	水素	アシルアミノ
ジメチルアミノ	水素	ジアゾニウム
ジメチルアミノ	クロロ	アミノ
水素	クロロ	アミノ
アミノ	クロロ	アミノ
アシルアミノ	クロロ	アシルアミノ
アミノ	クロロ	水素
アシルアミノ	クロロ	水素
モノアルキルアミノ	クロロ	アミノ
ニトロ	クロロ	アミノ
ジメチルアミノ	クロロ	アシルアミノ
ジメチルアミノ	クロロ	ジメチルアミノ
水素	水素	ジメチルアミノ
ジメチルアミノ	水素	水素
トリメチルアンモニウム	水素	水素) ;

及び

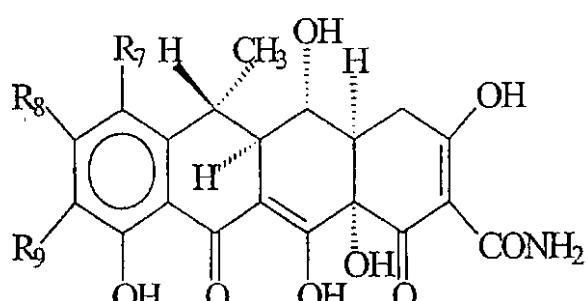
【化2】



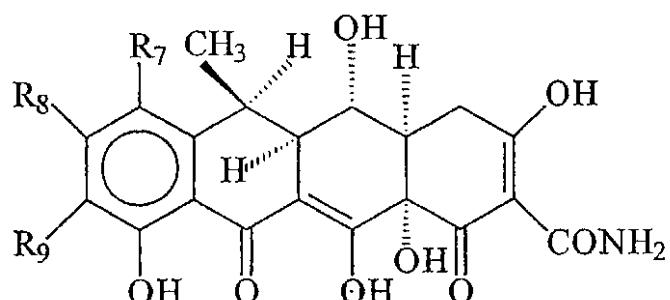
構造L



構造M



構造N



構造O

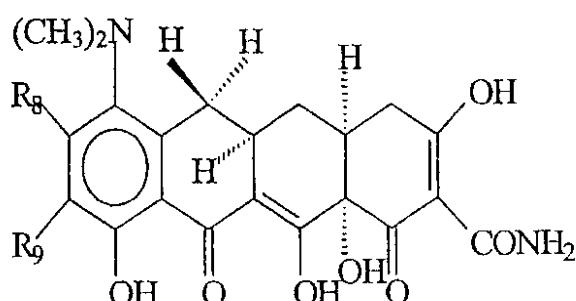
(式中、各場合にまとめてR7、R8、及びR9は、以下の意味を有する。)

R7	R8	R9
アジド	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
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
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	アシルアミノ
水素	水素	ジアゾニウム
水素	水素	ジメチルアミノ
ジアゾニウム	水素	水素
エトキシチオカルボニルチオ	水素	水素
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

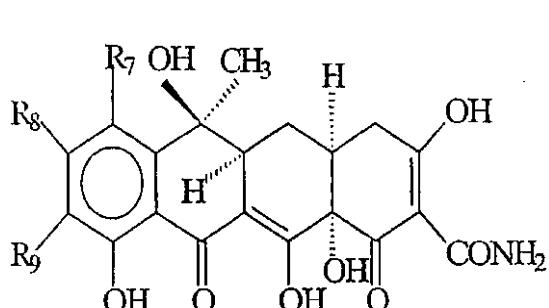
## 【化3】



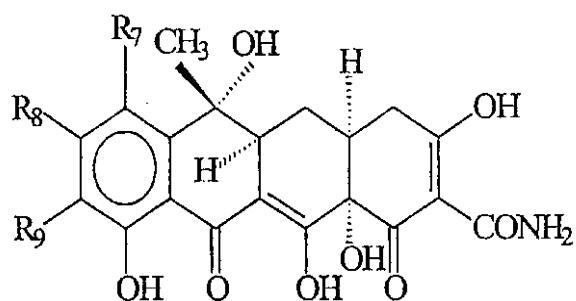
構造P

(式中、R8は水素又はハロゲンであり、R9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R7、R8、及びR9は、以下の意味を有する。

R7	R8	R9
アミノ	水素	水素
ニトロ	水素	水素
アジド	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)；

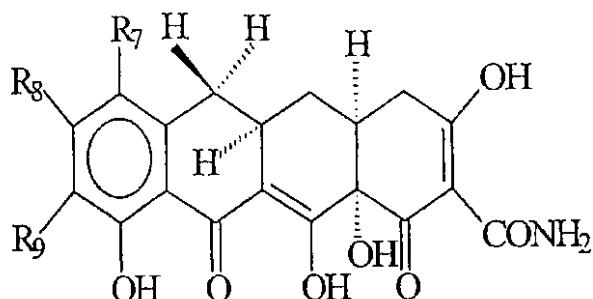
及びそれらの製薬的に許容性の塩

から成る群より選択される、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項17】

前記テトラサイクリン化合物が、以下の構造：

【化5】



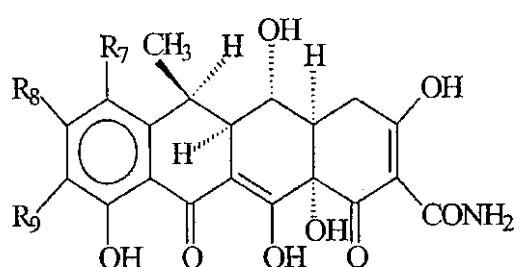
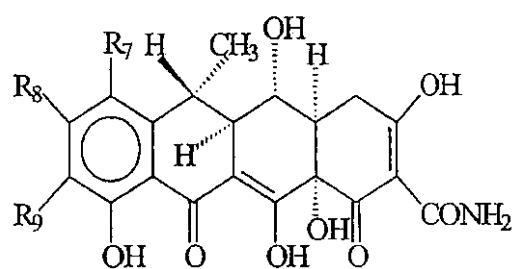
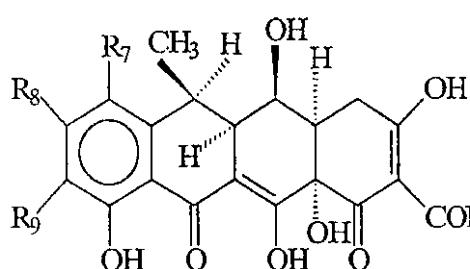
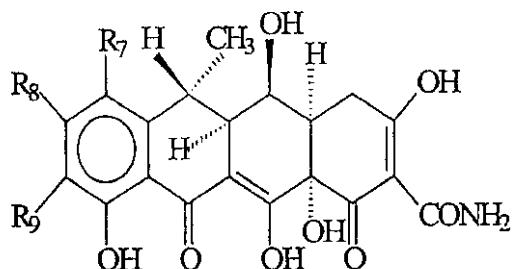
構造K

(式中、各場合にまとめてR7、R8、及びR9は、以下の意味を有する。

R7	R8	R9
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】



(式中、各場合にまとめてR7、R8、及びR9は、以下の意味を有する。

R7

水素

水素

水素

水素

水素

R8

水素

水素

水素

水素

水素

R9

アセトアミド

ジメチルアミノアセトアミド

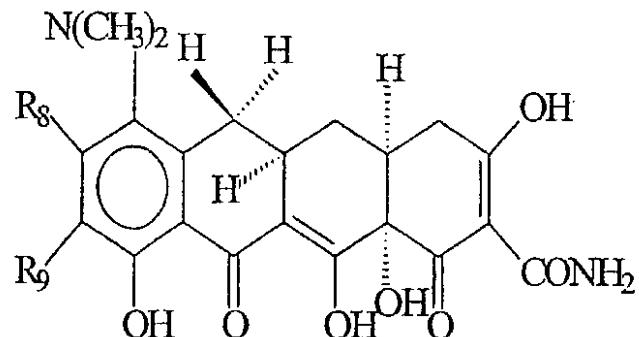
ニトロ

アミノ

パルミトアミド) ;

及び

## 【化7】



## 構造P

(式中、まとめてR8及びR9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14に記載の医薬組成物。

## 【請求項18】

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19】

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。