

【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5月18日(2006.5.18)

【公表番号】特表2005-527575(P2005-527575A)
【公表日】平成17年9月15日(2005.9.15)
【年通号数】公開・登録公報2005-036
【出願番号】特願2003-581774(P2003-581774)
【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 9/08 (2006.01)
A 6 1 K 9/10 (2006.01)
A 6 1 K 9/14 (2006.01)
A 6 1 K 9/20 (2006.01)
A 6 1 K 9/28 (2006.01)
A 6 1 K 9/48 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
C 0 7 D 263/20 (2006.01)
C 0 7 D 413/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 9/08
A 6 1 K 9/10
A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 9/28
A 6 1 K 9/48
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/496
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 31/04
C 0 7 D 263/20
C 0 7 D 413/14

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月17日(2006.3.17)

【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】

医薬上有効量のオキサゾリジノン抗生物質および医薬上許容される担体を含む、哺乳動物における糖尿病性足病変感染を治療するための経口または非経口の組成物。

【請求項2】

該哺乳動物がヒト、家畜動物および伴侶動物よりなる群から選択される請求項1記載の

医薬組成物。

【請求項 3】

該哺乳動物がヒトである請求項 2 記載の医薬組成物。

【請求項 4】

素錠もしくはコーティング錠、カプセル剤、ロゼンジ、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、シロップ剤またはその組合せを含む請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 5】

オキサゾリジノンの医薬上有効量が、約 200 mg ないし約 900 mg である請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6】

オキサゾリジノンの医薬上有効量が、約 500 mg ないし約 700 mg である請求項 5 記載の医薬組成物。

【請求項 7】

オキサゾリジノンの医薬上有効量が、約 600 mg である請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

さらに、第 2 の抗生物質の投与と組み合わせて該哺乳動物に投与される請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 9】

非抗生物質の投与と組み合わせて該哺乳動物に投与される請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 10】

該第 2 の抗生物質が、アミノグリコシド、セファロsporin、マクロライド、ペネム、キノロン、サルファ、テトラサイクリンおよびその組合せよりなる群から選択される請求項 8 記載の医薬組成物。

【請求項 11】

該第 2 の抗生物質が、成体につき 1 日当たり 1 ~ 10 mg / kg で経口、非経口、静脈内または局所投与される請求項 8 記載の医薬組成物。

【請求項 12】

1 ないし 60 日間投与される請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 13】

毎日 2 ないし 4 回投与される請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 14】

該糖尿病性足病変感染が、破壊または破壊されていない皮膚下および発熱と関連し得る足の化膿性もしくは非化膿性の排膿または分泌、紅斑、波動、熱もしくは局在性の熱、触診に対する痛みもしくは圧痛、炎症性、赤みがあった、腫れた、硬化したまたは触ると痛い領域により明らかにされる請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 15】

該感染が、ブドウ球菌、連鎖球菌、腸球菌またはその組合せにより惹起される請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 16】

該感染が、ブドウ球菌により惹起される請求項 15 記載の医薬組成物。

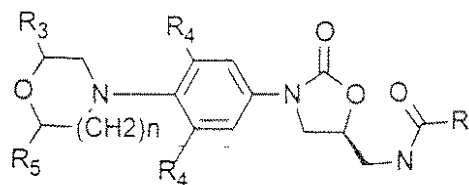
【請求項 17】

該感染が、メチシリン耐性黄色ブドウ球菌 (MRSA)、バイコマイシン耐性腸球菌 (VRE)、グリコペプチド低感受性黄色ブドウ球菌 (GISA) およびバイコマイシン耐性黄色ブドウ球菌 (VISA) ならびにその組合せよりなる群から選択される細菌の耐性株により惹起される請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 18】

該オキサゾリジノンが、式：

【化 1】



[式中、n は 0、1 または 2 ;

R は、

水素 ;

F、Cl、ヒドロキシ、C₁ - C₈ アルコキシ、C₁ - C₈ アシロキシまたは - CH₂ - フェニルよりなる群から選択される 1 以上の置換基で所望により置換されていてもよい C₁ - C₈ アルキル ;

C₃ - C₆ シクロアルキル ;

アミノ ;

C₁ - C₈ アルキルアミノ ;

C₁ - C₈ ジアルキルアミノ ; および

C₁ - C₈ アルコキシよりなる群から選択され ;

R³ は各出現にて、独立して、H、CH₃、CN、CO₂H、CO₂R および (CH₂)_m R⁶ よりなる群から選択され、ここに、m は 1 または 2 ;

R⁴ は各出現にて、独立して、H、F および Cl よりなる群から選択され ;

R⁵ は H または CH₃ ;

R⁶ は、H、OH、OR、OCOR、NH₂、NHCOR および N(R⁷)₂ よりなる群から選択され ; および

R⁷ は各出現にて、独立して、H、p - トルエンシルホニル、ならびに Cl、F、OH、C₁ - C₈ アルコキシ、アミノ、C₁ - C₈ アルキルアミノ および C₁ - C₈ ジアルキルアミノよりなる群から選択された 1 以上の置換基で所望により置換されていてもよい C₁ - C₄ アルキルよりなる群から選択される]

またはその医薬上許容される塩である請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 19】

該オキサゾリジノンが、(S) - N - [[3 - [3 - フルオロ - 4 - (4 - モルホリニル) フェニル] - 2 - オキソ - 5 - オキサゾリジニル] メチル] アセトアミドである請求項 18 記載の医薬組成物。

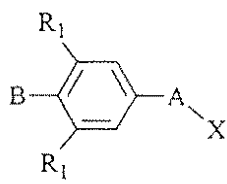
【請求項 20】

糖尿病性足病変感染の予防または治療用の医薬を製造するための医薬上有効量のオキサゾリジノン化合物を含む組成物の使用。

【請求項 21】

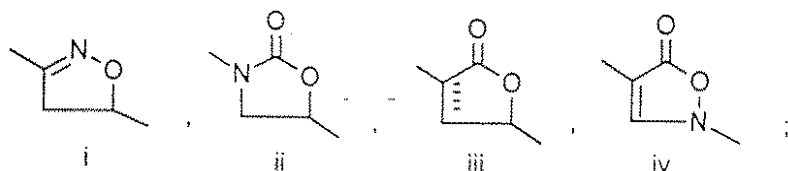
該オキサゾリジノン化合物が、式 :

【化 2】



[式中、A は、構造 i、ii、iii または iv

【化3】



Bは、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、アリール、置換アリール、hetおよび置換hetから選択されるか、あるいは

Bおよび一つのR₁は、Bおよびその一つのR₁が結合するフェニル炭素原子と一緒になって、hetを形成し、該hetは所望により置換hetであってもよく；

Xは、-CH₂-NH-C(O)-R₂、-CH₂-R₂および-CH₂-Y-R₂から選択された基；

YはO、Sまたは-NH-；

R₁は独立して、H、アルキル、アルコキシ、アミノ、NO₂、CN、ハロ、置換アルキル、置換アルコキシおよび置換アミノから選択され；および

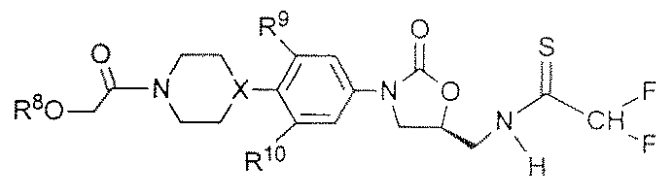
R₂は独立して、H、-OH、アミノ、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アルケニル、置換アルケニル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、het、置換het、アリールおよび置換アリールから選択される]

であるか、またはその医薬上許容される塩である請求項20記載の組成物の使用。

【請求項22】

該オキサゾリジノン化合物が、式：

【化4】



[式中、XはNまたはCH；

R⁹およびR¹⁰は独立して、HまたはFであって；

R⁸は、H、ベンジルまたは-C(=O)C₁₋₄アルキルである]

であるか、またはその医薬上許容される塩である請求項20記載の組成物の使用。

【請求項23】

該組成物が、アンピシリンを含まない請求項20記載の組成物の使用。

【請求項24】

該組成物が、第2の抗生物質を含まない請求項20記載の組成物の使用。