

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-536046(P2004-536046A)

【公表日】平成16年12月2日(2004.12.2)

【年通号数】公開・登録公報2004-047

【出願番号】特願2002-578971(P2002-578971)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/65

A 6 1 P 17/10

A 6 1 P 43/00

【F I】

A 6 1 K 31/65

A 6 1 P 17/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成17年4月5日(2005.4.5)

【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】

ざ瘡の治療用医薬組成物であって、ビスホスホネート化合物を投与せずに、ざ瘡の治療に有効であるが、実質的に抗生作用のない量のテトラサイクリン化合物を投与する医薬組成物。

【請求項2】

前記ざ瘡が、尋常性ざ瘡、囊胞性ざ瘡、萎縮性ざ瘡、プロムざ瘡、塩素ざ瘡、集簇性ざ瘡、化粧剤性ざ瘡、洗浄剤ざ瘡、流行性ざ瘡、夏季性ざ瘡、閃光状ざ瘡、ハロゲンざ瘡、硬結性ざ瘡、ヨードざ瘡、ざ瘡ケロイド、機械的ざ瘡、丘疹ざ瘡、ポマードざ瘡、月経前ざ瘡、小膿疱ざ瘡、酒さ性ざ瘡、壞血病性ざ瘡、腺病性ざ瘡、蕁麻疹性ざ瘡、痘瘡状ざ瘡、毒物性ざ瘡、プロピオン酸ざ瘡、擦過性ざ瘡、グラム陰性ざ瘡、ステロイドざ瘡、又は小節囊胞ざ瘡である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記テトラサイクリン化合物が、10~80%の抗生物質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、38mgの用量で1日2回、38mgの用量で1日3回若しくは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、60mg/日の用量で1日2回、60mg/日の用量で1日3回若しくは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、最少抗生物質血清濃度の10~80%という血清濃度

になる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7】

前記テトラサイクリン化合物が、 $1.0 \mu\text{g}/\text{ml}$ という血清濃度になる量で、又は約 $0.1\sim\text{約}0.8 \mu\text{g}/\text{ml}$ の範囲の血清濃度を与え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8】

前記テトラサイクリン化合物が、 $0.8 \mu\text{g}/\text{ml}$ という血清濃度になる量で投与されるミノサイクリン又は $0.5 \mu\text{g}/\text{ml}$ という血清濃度になる量で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、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又は6に記載の医薬組成物。

【請求項10】

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7に記載の医薬組成物。

【請求項11】

前記ドキシサイクリンが、 40mg の量で投与される、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項12】

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。

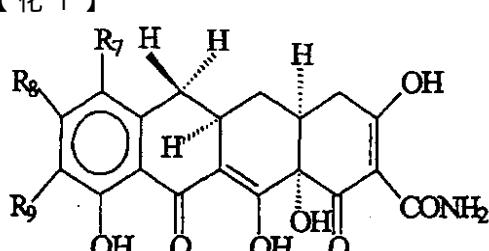
【請求項13】

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、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

水素

水素

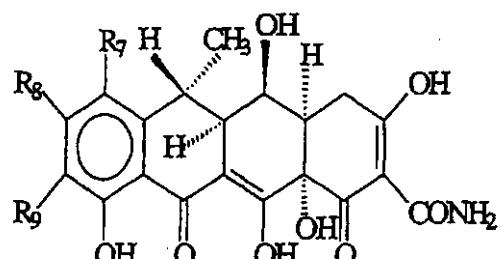
アミノ

水素
水素
及び

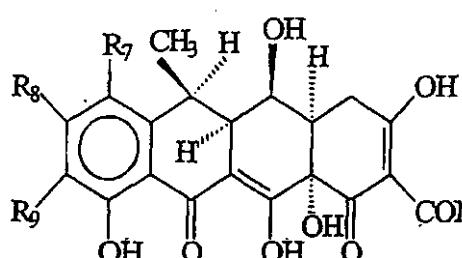
水素
水素

パルミトアミド
ジメチルアミノ) ;

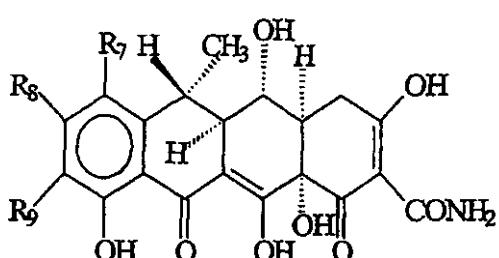
【化2】



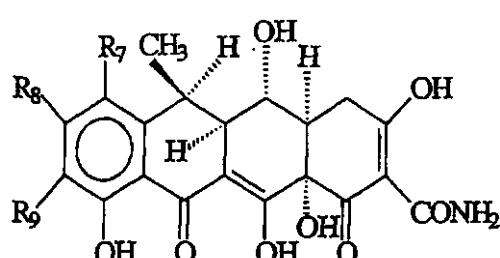
構造L



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

水素

水素

水素

水素

R8

水素

水素

水素

水素

R9

アセトアミド

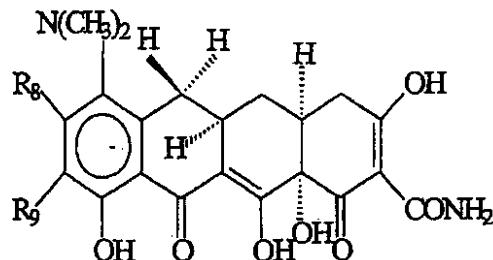
ジメチルアミノアセトアミド

ニトロ

アミノ) ;

及び

【化3】



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12に記載の医薬組成物。

【請求項15】

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により投与される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項16】

ざ瘡の治療用医薬組成物であって、ビスホスホネート化合物を投与せずに、有効量の非抗生物質テトラサイクリン化合物を局所投与により投与する医薬組成物。