

【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、嚢胞性ざ瘡、萎縮性ざ瘡、プロムざ瘡、塩素ざ瘡、集簇性ざ瘡、化粧品性ざ瘡、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、壊血病性ざ瘡、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、又は小節嚢胞ざ瘡である、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%の抗生物質量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、 $1.0 \mu\text{g/ml}$ という血清濃度になる量で、又は約 $0.1 \sim$ 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、 $0.8 \mu\text{g/ml}$ 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 $0.5 \mu\text{g/ml}$ 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、40 mg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。

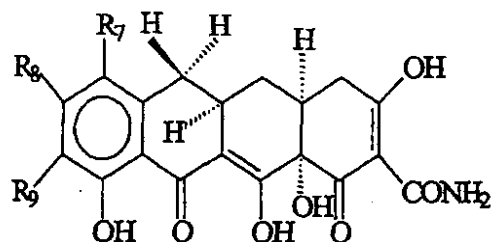
【請求項 13】

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-デオキシアニ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
水素

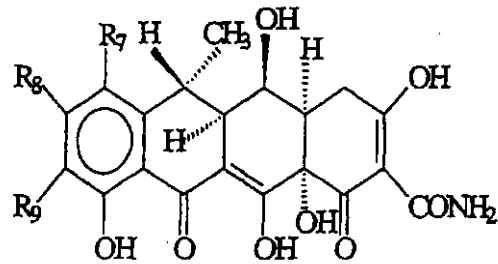
R8
水素

R9
アミノ

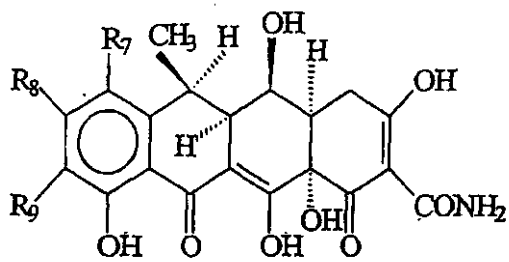
水素	水素	パルミトアミド
水素	水素	ジメチルアミノ) ;

及び

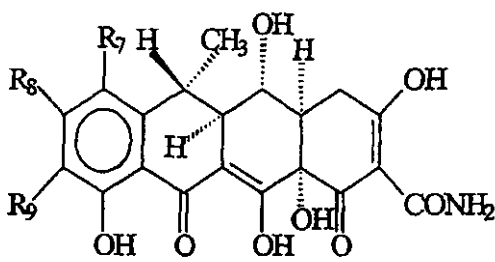
【化 2】



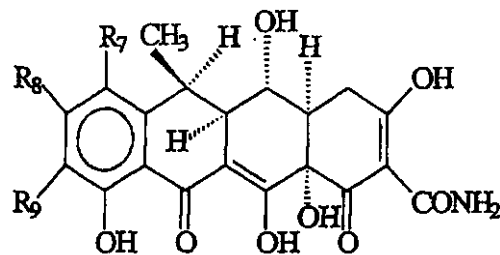
構造L



構造M



構造N



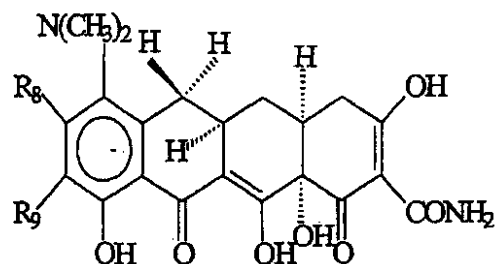
構造O

(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	R 8	R 9
水素	水素	アセトアミド
水素	水素	ジメチルアミノアセトアミド
水素	水素	ニトロ
水素	水素	アミノ) ;

及び

【化 3】



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 2 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 5】

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 1 6】

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。