

【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22年9月16日(2010.9.16)

【公表番号】特表2008-535781(P2008-535781A)

【公表日】平成20年9月4日(2008.9.4)

【年通号数】公開・登録公報2008-035

【出願番号】特願2007-555382(P2007-555382)

【国際特許分類】

C 07 F 5/02 (2006.01)

A 61 K 31/69 (2006.01)

A 61 P 31/10 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

【F I】

C 07 F 5/02 C S P C

A 61 K 31/69

A 61 P 31/10

A 61 P 31/04

A 61 P 17/00 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年7月16日(2010.7.16)

【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

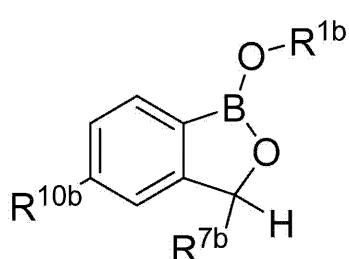
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記構造を有する化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【化1】



(式中、R^{10b}は、ハロゲンであり、R^{7b}はHであり、R^{1b}は、負電荷、H、および塩対イオンから選択されるメンバーである。)

【請求項2】

1,3-ジヒドロ-5-フルオロ-1-ヒドロキシ-2、1-ベンゾキサボロール又はその薬学的に許容可能な塩。

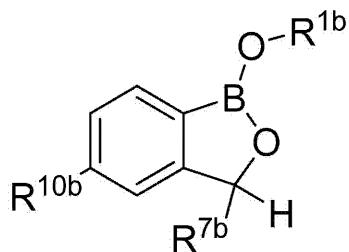
【請求項3】

1,3-ジヒドロ-5-クロロ-1-ヒドロキシ-2、1-ベンゾキサボロール又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項4】

(a) 下記構造を有する化合物又はその薬学的に許容可能な塩と、

【化2】



(式中、R^{10b}は、ハロゲンであり、R^{7b}はHであり、R^{1b}は、負電荷、H、および塩対イオンから選択されるメンバーである。)

(b) 薬学的に許容可能な賦形剤と、を含む、微生物による感染症を患っている動物に投与するための医薬製剤。

【請求項5】

前記化合物が、1,3-ジヒドロ-5-フルオロ-1-ヒドロキシ-2、1-ベンゾキサボロール又はその薬学的に許容可能な塩である、請求項4に記載の医薬製剤。

【請求項6】

前記化合物が、1,3-ジヒドロ-5-クロロ-1-ヒドロキシ-2、1-ベンゾキサボロール又はその薬学的に許容可能な塩である、請求項4に記載の医薬製剤。

【請求項7】

前記賦形剤が、薬学的に許容可能な局所キャリアである、請求項4~6のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項8】

ラッカー、ローション、クリーム、ゲル、軟膏、およびスプレーから選択されるメンバーである、請求項4~7のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項9】

ラッカーである、請求項4~8のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項10】

ゲルである、請求項4~8のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項11】

乳化剤、皮膚軟化剤、抗酸化剤、保存料、キレート剤、中和剤、粘度増化剤、浸透促進剤、抗炎症剤、ビタミン、抗老化剤、日焼け止め、および座瘡治療薬から選択されるメンバーを1以上さらに含む、請求項4~10のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項12】

増粘剤、ゲル相キャリア、爪浸透促進剤、および粘度増加剤からなる群から選択されるメンバーを1以上さらに含む、請求項4~11のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項13】

キレート剤を含む、請求項4~12のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項14】

前記キレート剤が、クエン酸、エチレンジアミン四酢酸(EDTA)、エチレングリコール-ビス(2-アミノエチルエーテル)-N,N,N',N'-テトラ酢酸(EGTA)、および8-アミノ-2-[2-アミノ-5-メチルフェノキシ]メチル]-6-メトキシキノリン-N,N,N',N'-テトラ酢酸、テトラカリウム塩(QUIN-2)からなる群から選択される、請求項13に記載の医薬製剤。

【請求項15】

前記キレート剤が、エチレンジアミン四酢酸である、請求項13または14に記載の医薬製剤。

【請求項16】

前記キレート剤が0.005%~2.0%の量で存在する、請求項13~15のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項17】

アルコールを含む、請求項4～16のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項18】

アルコールおよび水を含む、請求項4～17のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項19】

エタノールおよびプロピレングリコールから選択されるメンバーを1以上含む、請求項4～18のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項20】

約20%のプロピレングリコール、約70%のエタノール、および約10%の化合物を含む、請求項4～17および19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項21】

約70%のエタノール、約20%のポリ(ビニルメチルエーテル-*alt*-マレイン酸モノブチルエステル)、および約10%の化合物を含む、請求項4～17および19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項22】

約56%のエタノール、約14%の水、約15%のポリ(2-ヒドロキシエチルメタクリレート)、約5%のセバシン酸ジブチル、約10%の化合物を含む、請求項4～19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項23】

約55%のエタノール、約15%の酢酸エチル、約15%のポリ(酢酸ビニル)、約5%のセバシン酸ジブチル、約10%の化合物を含む、請求項4～17および19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項24】

前記化合物が、製剤中に約0.5%～約15%の濃度で存在する、請求項4～19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項25】

前記化合物が、製剤中に約0.1%～約12.5%の濃度で存在する、請求項4～19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項26】

前記化合物が、製剤中に約1%～約5%の濃度で存在する、請求項4～19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項27】

前記化合物が、製剤中に約2%～約8%の濃度で存在する、請求項4～19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項28】

前記化合物が、製剤中に約4%～約9%の濃度で存在する、請求項4～19のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項29】

前記化合物が、水との水和物、アルコールとの溶媒和物、アミノ化合物の付加物、酸の付加物から選択されるメンバーである形態で存在する、請求項4～28のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項30】

投与の部位が、皮膚、爪、髪、爪を取り囲む皮膚、または髪を取り囲む皮膚である、請求項4～29のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項31】

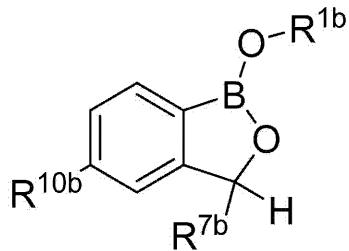
前記微生物が、真菌または酵母である、請求項4～30のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項32】

動物における感染症を治療する方法であって(但し、ヒトを除く。)、感染症を治療するに十分な、治療的に有効量の下記構造を有する化合物、その薬学的に許容可能な塩、または請求項4～31のいずれか一項に記載の医薬製剤を、動物に投与することを含む、方

法 :

【化 3】



(式中、R^{1 0 b}は、ハロゲンであり、R^{7 b}はHであり、R^{1 b}は、負電荷、H、および塩対イオンから選択されるメンバーである。)。

【請求項 3 3】

前記化合物が、1, 3 - ジヒドロ - 5 - フルオロ - 1 - ヒドロキシ - 2、1 - ベンゾキサボロールまたはその薬学的に許容可能な塩である、請求項 3 2 に記載の方法。

【請求項 3 4】

前記化合物が、1, 3 - ジヒドロ - 5 - クロロ - 1 - ヒドロキシ - 2、1 - ベンゾキサボロールまたはその薬学的に許容可能な塩である、請求項 3 2 に記載の方法。

【請求項 3 5】

前記感染症が、全身感染症、皮膚感染症、および爪または爪周囲感染症から選択されるメンバーである、請求項 3 2 ~ 3 4 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 6】

前記感染症が、爪周囲炎、類丹毒、淋病、プール肉芽腫、ハンセン病、急性細菌性爪周炎、スプロトリクム症、梅毒、皮膚疣状結核、野兎病、スプロトリクム症、真菌性角膜炎、拡張性眼真菌症、内因性眼真菌症、ロボア症、菌腫、砂毛症、癪風、体部白癬、股部白癬、足部白癬、白癬性毛瘡、頭部白癬、黒癬、耳真菌症、黄癬、黒色真菌感染症、および渦状癬から選択されるメンバーである、請求項 3 2 ~ 3 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 7】

前記感染症が爪甲真菌症である、請求項 3 2 ~ 3 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 8】

前記爪甲真菌症が皮膚糸状菌である、請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 3 9】

前記動物が、畜牛、ヤギ、ブタ、ヒツジ、ウマ、雌牛、雄牛、イヌ、モルモット、スナネズミ、ウサギ、ネコ、ニワトリ、およびシチメンチョウから選択されるメンバーである、請求項 3 2 ~ 3 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 4 0】

投与が、皮膚と、爪と、髪と、蹄と、鉤爪から選択されるメンバーである部位である、請求項 3 2 ~ 3 9 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 4 1】

前記皮膚が、爪、髪、蹄、または鉤爪を取り囲む皮膚である、請求項 4 0 に記載の方法。

。

【請求項 4 2】

前記感染症が、真菌感染症である、請求項 3 2 ~ 4 1 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 4 3】

前記感染症が、真菌または酵母感染症である、請求項 3 2 ~ 4 1 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 4 4】

前記真菌または酵母が、カンジダ (Candida) 種、トリコフィトン (Trichophyton) 種、小胞子菌 (Mycosporium) 種、アスペルギルス (Aspergillus) 種、クリプトコッカス (Cryptococcus) 種、blastomycetes (blastomycetes) 種、コクシジオイデス (Coccidiodes)

種、ヒストプラスマ (*Histoplasma*) 種、パラコクシジオイデス (*Paracoccidioides*) 種、藻菌類 (*Phycomycetes*) 種、マラセジア (*Malassezia*) 種、フザリウム (*Fusarium*) 種、エピデルモフィトン (*Epidermophyton*) 種、スキタリジウム (*Scytaldium*) 種、スコブラリオプシス (*Scopulariopsis*) 種、アルテルナリア (*Alternaria*) 種、ペニシリウム (*Penicillium*) 種、フィアロフォラ (*Phialophora*) 種、クモノスカビ (*Rhizopus*) 種、セドスボリウム (*Scedosporium*) 種、および接合菌 (*Zygomycetes*) 級から選択されるメンバーである、請求項 4 3 に記載の方法。

【請求項 4 5】

前記真菌または酵母が、アスペルギルス・フミガーツス (*Aspergillus fumigatus*)、ブラストミセス・デルマティティディス (*Blastomyces dermatitidis*)、カンジダ・アルビカンス (*Candida Albicans*)、カンジダ・グラブラタ (*Candida glabrata*)、カンジダ・クルセイ (*Candida krusei*)、クリプトコッカス・ネオフォルマンス (*Cryptococcus neoformans*)、カンジダ・パラシローシス (*Candida parapsilosis*)、カンジダ・トロピカリス (*Candida tropicallis*)、コクシジオイデス・イミチス (*Coccidioides immitis*)、エピデルモフィトン・フロッコースム (*Epidermophyton floccosum*)、フザリウム・ソラニ (*Fusarium solani*)、ヒストプラスマ・カブスラーム (*Histoplasma capsulatum*)、マラセジア・フルフル (*Malassezia furfur*)、マラセジア・パキデルマチス (*Malassezia pachydermatis*)、マラセジア・シンポディアリス (*Malassezia sympodialis*)、オードアン小胞子菌 (*Microsporum audouinii*)、イヌ小胞子菌 (*Microsporum canis*)、石膏状小胞子菌 (*Microsporum gypseum*)、パラコクシジオイデス・ブラジリエンシス (*Paracoccidioides brasiliensis*)、毛瘡白癬菌 (*Trichophyton mentagrophytes*)、紅色白癬菌 (*Trichophyton rubrum*)、および断髪性白癬菌 (*Trichophyton tonsurans*) から選択されるメンバーである、請求項 4 3 に記載の方法。

【請求項 4 6】

前記真菌または酵母が、渦状白癬菌 (*Trichophyton concentricum*)、T. ビオラセウム (*Trichophyton violaceum*)、T. シーンライニ (*Trichophyton schoenleinii*)、T. ベルコースム (*Trichophyton verrucosum*)、T. ソウダネンセ (*Trichophyton soudanense*)、石膏状小胞子菌 (*Microsporum gypseum*)、M. エクイヌム (*Microsporum equinum*)、カンジダ・ギリエルモンジイ (*Candida guilliermondii*)、マラセジア・グロボサ (*Malassezia globosa*)、M. オブツーサ (*Malassezia obtusa*)、M. レストリクタ (*Malassezia restricta*)、M. スルーフィア (*Malassezia slooffiae*)、および黄色コウジ菌 (*Aspergillus flavus*) から選択されるメンバーである、請求項 4 3 に記載の方法。

【請求項 4 7】

前記真菌または酵母が、皮膚糸状菌である、請求項 4 3 に記載の方法。

【請求項 4 8】

前記真菌または酵母が、紅色白癬菌 (*Trichophyton rubrum*)、毛瘡白癬菌 (*Trichophyton mentagrophytes*) である、請求項

4 3 に記載の方法。

【請求項 4 9】

前記感染症が、爪白癬である、請求項 3 2 ~ 3 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5 0】

前記感染症が、爪、爪周囲、または爪下感染症である、請求項 3 2 ~ 3 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5 1】

前記化合物または製剤が治療的に有効量である、請求項 3 2 ~ 5 0 のいずれか一項に記載の方法。

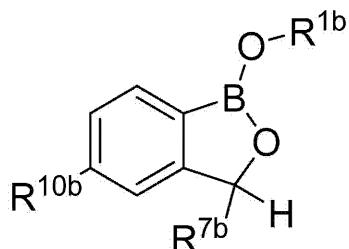
【請求項 5 2】

前記化合物または製剤が美容的に有効量である、請求項 3 2 ~ 5 0 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5 3】

動物における感染症を治療するための医薬の製造のための、下記構造を有する化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用：

【化 4】



(式中、R^{1 0 b} は、ハロゲンであり、R^{7 b} はHであり、R^{1 b} は、負電荷、H、および塩対イオンから選択されるメンバーである。)。

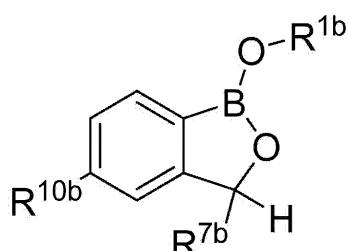
【請求項 5 4】

前記動物がヒトである、請求項 5 3 に記載の使用。

【請求項 5 5】

ヒトにおける爪甲真菌症を治療するための医薬の製造のための、下記構造を有する化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用：

【化 5】

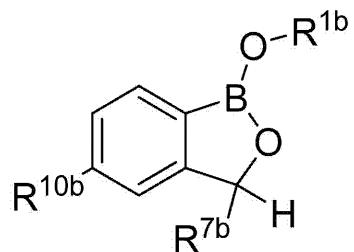


(式中、R^{1 0 b} は、ハロゲンであり、R^{7 b} はHであり、R^{1 b} は、負電荷、H、および塩対イオンから選択されるメンバーである。)。

【請求項 5 6】

ヒトにおける真菌の生育を阻害するための医薬の製造のための、下記構造を有する化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用：

【化6】



(式中、R^{10b}は、ハロゲンであり、R^{7b}はHであり、R^{1b}は、負電荷、H、および塩対イオンから選択されるメンバーである。)。

【請求項57】

前記化合物が1,3-ジヒドロ-5-フルオロ-1-ヒドロキシ-2、1-ベンゾキサボロールもしくはその薬学的に許容可能な塩、または1,3-ジヒドロ-5-クロロ-1-ヒドロキシ-2、1-ベンゾキサボロールもしくはその薬学的に許容可能な塩である、請求項53～56のいずれか一項に記載の使用。