

【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19年5月17日(2007.5.17)

【公表番号】特表2006-522056(P2006-522056A)

【公表日】平成18年9月28日(2006.9.28)

【年通号数】公開・登録公報2006-038

【出願番号】特願2006-504963(P2006-504963)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/706 (2006.01)

A 6 1 K 31/635 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/5383 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 K 31/7036 (2006.01)

A 6 1 K 31/203 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/706

A 6 1 K 31/635

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/5383

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 K 31/7036

A 6 1 K 31/203

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/10

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月22日(2007.3.22)

【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】

抗菌剤と組合せたかまたは混合したマクロライド系 T 細胞免疫調節剤または免疫抑制剤を、少なくとも 1 種の薬学的に許容される希釈剤または担体と共に含んでなる、医薬組成物。

【請求項 2】

スルファサラジン、シプロフロキサシン、オフロキサシン、エリスロマイシンまたはゲンタマイシンと組合せたかまたは混合した 3,3-エピクロロ-3,3-デスオキシアスコマイシンを含んでなる、請求項 1 記載の組成物。

【請求項 3】

細菌感染が関与しているかまたは細菌感染が疑われるかもしくはは予期される疾患の処置の、または、細菌定着が役割を演ずるかまたは細菌定着が疑われるかもしくはは予期される状態における、または菌耐性の状態における免疫調節または免疫抑制の、かかる感染または状態に罹患しているかまたは危険がある被験者における方法であって、高い適合性を有するかまたは相乗的有效量の請求項 1 記載の組成物を共投与することを含んでなる、方法。

【請求項 4】

マクロライド系 T 細胞免疫調節剤または免疫抑制剤と、少なくとも 1 種の薬学的に許容される希釈剤または担体と組合せたかまたは混合した抗菌剤を混合することを含む、請求項 1 記載の組成物を製造する方法。

【請求項 5】

使用のための説明書と共に、個別の単位用量剤形でマクロライド系 T 細胞免疫調節剤または免疫抑制剤および抗菌剤を含んでなる、キット。

【請求項 6】

レチノイドである薬学的に活性な薬剤をさらに含む、請求項 1 または 2 記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0011

【補正方法】変更

【補正の内容】

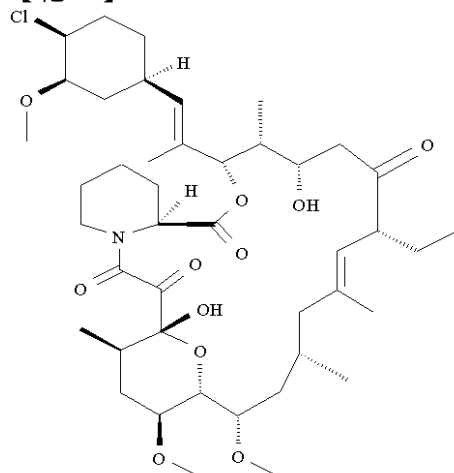
【0011】

そして、とりわけ、

ーピメクロリムス（INN 推薦）（ASM981；エリデル（Elidel）（商標））、すなわち

式 I

【化 1】



で示される、{ [1E - (1R, 3R, 4S)] 1R, 9S, 12S, 13R, 14S,

17R, 18E, 21S, 23S, 24R, 25S, 27R} - 12 - [2 - (4 - クロロ - 3 - メトキシシクロヘキシル) - 1 - メチルビニル] - 17 - エチル - 1, 14 - ジヒドロキシ - 23, 25 - ジメトキシ - 13, 19, 21, 27 - テトラメチル - 11, 28, ジオキサ - 4 - アザトリシクロ [22. 3. 1. 0 (4, 9)] オクタコス - 18 - エン - 2, 3, 10, 16 - テトラオン (EP 427680 の実施例 66a) (以下に「33 - エピクロロ - 33 - デスオキシアスコマイシン」として示す)

である。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

適当な抗菌剤は、例えば：

－サリチル酸またはサリチル酸誘導体：例えば、4 - アミノサリチル酸 (Apacil (登録商標)) または 5 - アミノサリチル酸 (メサラミン；メサラジン；アサコール (Asacol) (登録商標)) またはその誘導体、例えばオルサラジン (olsalazin) (メサラミンの二量体；5, 5' - アザビス [サリチル酸]) またはスルファサラジン (5 - [p - (2 - ピリジルスルファモイル) フェニラゾ] サリチル酸；アザルフィジン (Azulfidine) (登録商標)) など；

－スルファセタミドまたはスルファジアジンなどのスルホンアミド；

－抗生物質：例えば、

a) ペニシリン、例えばペニシリン自体またはクロキサシリン；

b) アモキシシリン；テトラサイクリン、例えばテトラサイクリン自体、ドキシサイクリン、オキシテトラサイクリンまたはミノサイクリン；またはセファロスポリン、例えばセフトジウムまたは WO 96/35692、WO 98/43981 および WO 99/48896 に記載のセファロスポリン；

c) シプロフロキサシン、オフロキサシン、ノルフロキサシン、レボフロキサシンまたはロメフロキサシンなどのキノロン；

d) エリスロマイシンなどのマクロライド系抗生物質；

e) クリンダマイシン；

f) クロラムフェニコールまたはアジダムフェニコール (azidamfenicol) (ロイコマイシン N (Leukomycin N) (登録商標))；または、

g) ゲンタマイシン、カナマイシン、ネオマイシンまたはトブラマイシンなどのアミノグリコシド；

h) ナタマイシンなどのポリエン (polyene)；

i) ムピロシン (シュードモニック酸 (pseudomonic acid) A) などのシュードモニック酸；

j) セフロキシム；

k) WO 98/07745 に記載のオミガナン (omiganan) (MBI 594；MBI 226)；または、

l) プレウロムチリン (pleuromutilin)；

－フシジン酸 (ラマイシン (ramycin)) およびその誘導体；

－メトロニダゾール；または、

－バシトラシン (batracin)、ポリミキシン、例えばポリミキシン B、またはチロトリシンなどのポリペプチド・グリコペプチド；

であり、

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0037

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0037】

実施例 1：クリーム

【表 1】

成分	量(g)
33-エピクロロ-33-デスオキシアスコマイシン	1.00
エリスロマイシン	2.00
中鎖トリグリセリド	15.00
オレイルアルコール	10.00
セチルステアリル硫酸ナトリウム	1.00
セチルアルコール	4.00
ステアリルアルコール	4.00
モノステアリン酸グリセリン	2.00
ベンジルアルコール	1.00
プロピレングリコール	5.00
クエン酸	0.05
水酸化ナトリウム	*
水	100.0まで加える
* pH5.5に調節するために必要な量	

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0038

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0038】

製造を、エマルジョンのための常套的な製造方法で行う。薬剤物質を、中鎖トリグリセリド、オレイルアルコール、セチルステアリル硫酸ナトリウム、セチルアルコール、ステアリルアルコールおよびモノステアリン酸グリセリンを含む、加熱した均質の油相に加える。並行して、ベンジルアルコール、プロピレングリコール、クエン酸および水酸化ナトリウムを含む水相を、油相と同じ温度で加熱する。油相を水相に加え、均質化する。得られたクリームを、室温まで冷やす。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0039

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0039】

実施例 2：ローション

【表 2】

成分	量(g)
3,3-エピクロロ-3,3-デスオキシアスコマイシン	1.00
エリスロマイシン	2.00
ブロピレングリコール	40.00
オレイルアルコール	5.00
イソプロパノール	<u>52.00</u>
合計	100.00