(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2014 年 2 月 6 日(06.02.2014)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2014/021282 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/415 (2006.01) *A61P 17/00* (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01) *A61P 31/10* (2006.01)
A61K 47/32 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2013/070525

(22) 国際出願日: 2013 年 7 月 30 日(30.07.2013)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
PCT/JP2012/069306 2012 年 7 月 30 日(30.07.2012) JP

(71) 出願人: Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社(**MEIJI SEIKA PHARMA CO., LTD.**) [JP/JP]; 〒1048002 東京都中央区京橋二丁目４番１６号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 古田　佳子(**FURUTA, Yoshiko**); 〒2500852 神奈川県小田原市栢山７８８番地Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内 Kanagawa (JP). 小松　千記(**KOMATSU, Kazuki**); 〒2500852 神奈川県小田原市栢山７８８番地Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内 Kanagawa (JP). 嘉屋　アーパンシリー(**KAYA, Arpansiree**); 〒2500852 神奈川県小田原市栢山７８８番地Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内 Kanagawa (JP). 高畑　祥(**TAKAHATA, Sho**); 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町７６０番地Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内 Kanagawa (JP). 田端　祐二(**TABATA, Yuji**); 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町７６０番地Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内 Kanagawa (JP).

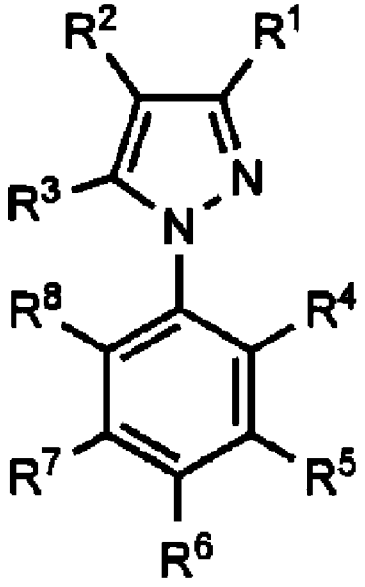
(74) 代理人: 特許業務法人　津国，外(**TSUKUNI & ASSOCIATES** et al.); 〒1000013 東京都千代田区霞が関３－７－１　霞が関東急ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

[続葉有]

(54) **Title**: ANTITRICHOPHYTOSIS SOLUTION FOR EXTERNAL USE

(54) 発明の名称 : 抗白癬菌症外用液剤



（Ｉ）

(57) **Abstract**: The present invention provides a solution for external use having antitrichophytosis activity and high nail permeability. A solution for external use for preventing or treating trichophytosis, the solution containing a coating formation agent, and a compound represented by the general formula [in the formula, R^1 represents a hydrogen atom, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, or trilfuoromethyl; R^2 represents a hydrogen atom, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, halogen, -COO ($C_{1\text{-}6}$ alkyl), or $(CH_2)_{1\text{-}3}$COOR (R represents a hydrogen atom or $C_{1\text{-}6}$ alkyl); R^3 represents a hydrogen atom, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, amino, trifluoromethyl, or OR (R represents a hydrogen atom or $C_{1\text{-}6}$ alkyl); R^4 represents a hydroxyl group; R^5 represents a hydrogen atom, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, hydroxyl group, or halogen; R^6 represents a hydrogen atom, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, trifluoromethyl, halogen, amino, -NR^aR^b, nitro, hydroxy $C_{1\text{-}6}$ alkyl, -$CONR^aR^b$, -COO ($C_{1\text{-}6}$ alkyl), -COOH, -$(CH_2)_{1\text{-}3}$COOR, or OR^a (R represents a hydrogen atom or $C_{1\text{-}6}$ alkyl, and R^a and R^b may be the same or different and represent a hydrogen atom, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, or $C_{1\text{-}6}$ acyl); R^7 is a hydrogen atom, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, -OR (R represents a hydrogen atom or $C_{1\text{-}6}$ alkyl), or halogen; and R^8 represents a hydrogen atom, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, hydroxyl group, amino, or nitro] or a salt thereof.

(57) 要約:　本発明により、抗白癬菌活性を有し、さらに高い爪透過性を有する外用液剤が提供される。　皮膜形成剤と、一般式（式中、Ｒ１は、水素原子、Ｃ

[続葉有]

WO 2014/021282 A1

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）

$_{1-6}$アルキル、またはトリフルオロメチルを表し、R^2は、水素原子、C_{1-6}アルキル、ハロゲン、－ＣＯＯ（C_{1-6}アルキル）、または（CH_2）$_{1-3}$ＣＯＯＲ（Ｒは、水素原子またはC_{1-6}アルキルを表す）を表し、R^3は、水素原子、C_{1-6}アルキル、アミノ、トリフルオロメチル、またはＯＲ（Ｒは、水素原子またはC_{1-6}アルキルを表す）を表し、R^4は、水酸基を表し、R^5は、水素原子、C_{1-6}アルキル、水酸基、またはハロゲンを表し、R^6は、水素原子、C_{1-6}アルキル、トリフルオロメチル、ハロゲン、アミノ、－ＮＲ^{a}Ｒ^b、ニトロ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、－ＣＯＮＲ^{a}Ｒ^b、－ＣＯＯ（C_{1-6}アルキル）、－ＣＯＯＨ、－（CH_2）$_{1-3}$ＣＯＯＲ、またはＯＲ^a（Ｒは、水素原子またはC_{1-6}アルキルを表し、Ｒ^{a}およびＲ^{b}は、同一でも異なっていてもよく、水素原子、C_{1-6}アルキル、またはC_{1-6}アシルを表す）を表し、R^7は、水素原子、C_{1-6}アルキル、－ＯＲ（Ｒは、水素原子またはC_{1-6}アルキルを表す）、またはハロゲンを表し、R^8は、水素原子、C_{1-6}アルキル、水酸基、アミノ、またはニトロを表す。）で示される化合物またはその塩と、を含有する、白癬菌症の予防または治療用の外用液剤。