

【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30年3月15日(2018.3.15)

【公表番号】特表2016-516765(P2016-516765A)

【公表日】平成28年6月9日(2016.6.9)

【年通号数】公開・登録公報2016-035

【出願番号】特願2016-507106(P2016-507106)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/06	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2017.01)
A 6 1 K	9/107	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/10	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/522	(2006.01)
A 6 1 K	31/085	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 K	8/06	(2006.01)
A 6 1 K	8/37	(2006.01)
A 6 1 K	8/31	(2006.01)
A 6 1 K	8/49	(2006.01)
A 6 1 Q	5/02	(2006.01)
A 6 1 Q	5/12	(2006.01)
A 6 1 Q	19/00	(2006.01)
A 6 1 K	8/34	(2006.01)
A 6 1 K	8/58	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/14	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	47/06	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	9/107	
A 6 1 P	17/00	1 0 1
A 6 1 P	17/10	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/522	
A 6 1 K	31/085	
A 6 1 K	31/55	
A 6 1 K	8/06	
A 6 1 K	8/37	
A 6 1 K	8/31	
A 6 1 K	8/49	

A 6 1 Q	5/02
A 6 1 Q	5/12
A 6 1 Q	19/00
A 6 1 K	8/34
A 6 1 K	8/58
A 6 1 P	31/12
A 6 1 P	31/10
A 6 1 P	31/04

【誤訳訂正書】

【提出日】平成30年2月5日(2018.2.5)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

脂肪酸またはそのエステルは10以下の炭素原子をもつ脂肪酸部分を有し、該脂肪酸が、プロピオン酸、酪酸、ペンタン酸、ヘキサン酸、ヘプタン酸、カブリル酸、ノナン酸およびカプリン酸の組合せから成る群から選択され；組成物は11以上の炭素原子をもつ脂肪酸部分を有する脂肪酸またはそのエステルを含まず；該脂肪酸またはそのエステルはオイルの一部であるか、または独立した脂肪酸またはそのエステルであり；そして少なくとも1つの成分の粒子径がナノスケールの範囲内にある、

- a) 少なくとも1つの抗真菌薬、
- b) 任意に少なくとも1つの脂肪酸またはそのエステル、または両者；および
- c) 少なくとも1つの賦形剤；

を含有する抗真菌組成物。

【請求項2】

ナノスケールの範囲内にある粒子径を持つ成分が抗真菌薬である、請求項1に記載の抗真菌組成物。

【請求項3】

組成物が製剤の粒子径または小球径が約1nm～約10,000nmのナノスケール範囲；好ましくは約10nm～約1000nmの範囲にある方法で製剤化される、請求項1に記載の抗真菌組成物。

【請求項4】

製剤がクリーム、オイル剤、ローション、血清、ゲル剤、シャンプー、マニキュア液、軟膏、泡沫剤、スプレー剤、コンディショナー、ペースト剤、うがい薬、殺菌剤、溶液剤、パッチ剤または噴霧剤である、請求項3に記載の抗真菌組成物。

【請求項5】

抗真菌薬が全組成物の重量で約0.01%～約50%の範囲の濃度；好ましくは全組成物の重量で約0.01%～約10%の範囲の濃度；そしてより好ましくは全組成物の重量で約0.01%～約5%の範囲の濃度であり、かつ抗真菌薬がピロクトンオラミン、シクロピロックスオラミン、ケトコナゾール、クリンバゾール、硝酸ミコナゾール、イトラコナゾール、フルコナゾール、エコナゾール、テルコナゾール、サベルコナゾール、アモロルフィン、オキシコナゾール、クロトリマゾール、ルリコナゾール、テルビナフィン、ブテナフィン、ナフチフィン、二硫化セレン、サリチル酸、硫黄、タル、ジンクピリチオン、ヒノキチオール、ウサギギク抽出物、胡桃殻抽出物、ティーツリーオイル、ローズマリーオイルおよびバーチオイルまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択される、請求項1に記載の抗真菌組成物。

【請求項 6】

賦形剤が脂肪酸またはそのエステルを含んでいないオイル剤を含有するか、または10以下の炭素原子を持つ脂肪酸部分を有する脂肪酸またはエステルを含有する、請求項1に記載の抗真菌組成物。

【請求項 7】

オイルがパラフィンオイル、シリコンオイル、テルペン、脂肪族アルコール、アジピン酸ジブチル、アジピン酸ジオクチル、セチルアルコール、ステアリルアルコールおよびセテアリルアルコールまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択される、請求項6に記載の抗真菌組成物。

【請求項 8】

10以下の炭素原子をもつ脂肪酸部分を有するエステルがプロピレングリコールとのモノまたはジエステルおよびグリセリンとのモノまたはジまたはトリエステル、またはそれらのどれかの組合せから成る群から選択される、請求項1に記載の抗真菌組成物。

【請求項 9】

脂肪酸またはそのエステルが全組成物の重量で約0.5%～約99%の範囲の濃度；好ましくは全組成物の重量で約50%～約99%の範囲の濃度；より好ましくは全組成物の重量で約0.5%～約20%の範囲の濃度である、請求項1に記載の抗真菌組成物。

【請求項 10】

賦形剤が医薬活性薬、OTC活性薬、抗炎症薬、皮膚透過エンハンサー、溶媒、乳化剤、界面活性剤、ポリマー、安定剤、オイルおよび添加剤またはそれらのどれかの組合せから成る群から選択される、請求項1に記載の抗真菌組成物。

【請求項 11】

溶媒はC-1～C-6低級脂肪族アルコール、低級アルキルアセテート、エーテル類、カルボン酸、C11より短い炭素鎖長を含む誘導体および脂肪族アルコールまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択され；乳化剤はステアレス-2、ステアレス-21、ポロキサマー、マクロゴールセトステアリルエーテル20、セチルアルコールセテアレス、セテス、イソセテス、ラウレス、オレス、ステアレス、ラウラミドDEA、およびリノレアミドDEAまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択され；界面活性剤はポロキサマー、PEG-2ステアリルエーテル、PEG-21ステアリルエーテル、ポロキサマー、ポリオキシル20セトステアリルエーテル、ナトリウムラウリルエーテル硫酸、ヤシモノエタノールアミド、コカミドプロピルベタイン、ドクサートナトリウムおよびラウリル硫酸アンモニウムまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択され；そして添加剤は増粘剤、抗酸化剤、芳香剤、エッセンシャルオイル、pH調節剤、ハーブ抽出物、保存剤、ヘアコンディショニング物質、ヘアケア補助剤、スキンケア補助剤、皮膚軟化薬、染料、保湿剤、ビタミン類、スフィンゴセリル、サンスクリーン剤、共界面活性剤、発泡剤、共乳化剤、粘度調整剤、懸濁剤、増強剤、真珠光沢剤、減熱消炎剤、イオン強度調節剤、皮膚栄養剤、抗しわ剤、光および塵プロテクターを含むベースオイルまたはスキンケア剤または両者と混合できる油溶性ポリマーまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択される、請求項10に記載の抗真菌組成物。

【請求項 12】

賦形剤が全組成物の重量で約0.5%～約99.90%の範囲の濃度である、請求項1に記載の抗真菌組成物。

【請求項 13】

請求項1に記載の抗真菌組成物を得る方法であって、少なくとも1つの抗真菌薬を少なくとも1つの賦形剤と、任意に少なくとも1つの脂肪酸またはそのエステル、または両者とともに、少なくとも1つの成分がナノスケールの範囲内の粒子径を持つような方法で混合する行為を含み、該組成物が11以上の炭素原子を持つ脂肪酸部分を有する脂肪酸またはそのエステルを含んでいない、抗真菌組成物を得る該方法。

【請求項 14】

成分は混合に先立ってナノ化に付すか、または混合は均質化に付してナノスケールの範

囲の粒子径を持った少なくとも 1 つの成分を有する組成物を得ることおよび混合の均質化が組成物を得るための方法の間にナノスケールの粒子が *in situ* で生成することを特徴とする、請求項 1 3 に記載の方法。

【請求項 1 5】

ナノ化が：

- a) 少なくとも 1 つの成分を搅拌下に界面活性剤と混合して懸濁液を得て；
- b) 得られた懸濁液を高圧でホモジナイザーを通過させ、出てきた分散液を集め；そして
- c) 分散液を再循環させ、適切にサイズ化されたナノ化粒子を有するナノ分散液を得る；という行為を含む方法によって行われる、請求項 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 6】

ナノスケールの範囲の粒子径を持つ成分が抗真菌薬である、請求項 1 3 に記載の方法。

【請求項 1 7】

真菌感染症の治療用キットであって、取扱説明書と共に抗真菌薬、1 0 以下の炭素原子を持つ脂肪酸部分を有する脂肪酸またはそのエステルおよび賦形剤またはそれらの組合せから成る群から選択される成分を含んで成る該キット。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 1】

本発明は、抗菌薬および賦形剤を含有する組成物であって、該組成物が 1 1 以上の炭素を有する脂肪酸またはそのエステルを含んでいないものを提供する。本発明は、また抗菌薬および賦形剤を含有する組成物であって、該組成物が少なくとも 1 つの C 1 1 より小さな炭素鎖を有する脂肪酸/エステルを有し、さらに該組成物が 1 1 以上の炭素を持つ脂肪酸またはそのエステルは含まないものも提供する。本発明の実施態様において、組成物は少なくとも 1 つの成分の粒子径がナノスケールの範囲内にあるナノコンポジットである。さらに、本発明はまた、製剤の粒子径または小球径がナノスケールの範囲内にある方法での該組成物の製剤化にも関する。本発明はまた、本発明の組成物または製剤を使用することにより微生物感染症を治療する方法と共に、該組成物または製剤を得る方法も提供する。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 9

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 9】

従って本発明は、a) 少なくとも 1 つの抗菌薬、b) 任意に少なくとも 1 つのオイル、または脂肪酸またはそのエステル、または両者および c) 少なくとも 1 つの賦形剤を含む抗菌組成物であって、該脂肪酸またはそのエステルは 1 0 以下の炭素原子を有し、該組成物は 1 1 以上の炭素原子をもつ脂肪酸またはそのエステルを含まず、そして少なくとも 1 つの成分の粒子径がナノスケールの範囲内にあるもの；上記の抗菌組成物を得る方法であって、該方法は：少なくとも 1 つの抗菌薬を少なくとも 1 つの賦形剤と、任意に少なくとも 1 つのオイル、または脂肪酸またはそのエステル、または両者とともに、少なくとも 1 つの成分がナノスケールの範囲内の粒子径を持つような方法で混合する行為を含み、そして組成物は 1 1 以上の炭素原子を持つ脂肪酸またはそのエステルを含まない；微生物感染症の疑いがあるかまたは微生物感染症を有する患者を治療する方法であって、該方法は上記の抗菌組成物を患者に投与する行為を含み；微生物感染症の治療における使用のための、上記の抗菌組成物；および微生物感染症の治療用キットであって、取扱説明書と共に抗菌薬、オイル、1 0 以下の炭素原子を持つ脂肪酸またはそのエステルおよび賦形剤または

それらの組合せから成る群から選択される成分を含んで成る該キットに関する。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0012

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0012】

本発明は、

脂肪酸またはそのエステルは10以下の炭素原子を有し；組成物は11以上の炭素原子をもつ脂肪酸またはそのエステルを含まず；そして少なくとも1つの成分の粒子径がナノスケールの範囲内である、

- a) 少なくとも1つの抗菌薬；
- b) 任意に少なくとも1つのオイル、または脂肪酸またはそのエステル、または両者；および
- c) 少なくとも1つの賦形剤；

を含有する抗菌組成物に関する。

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0016

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0016】

また本発明の他の実施態様において、オイルは脂肪酸またはそのエステルを持っていないか、またはオイル剤は10以下の炭素原子を持つ脂肪酸またはそのエステルを含んでいる。

また本発明の他の実施態様において、オイルはパラフィンオイル、シリコンオイル、テルペン、脂肪族アルコール、アジピン酸ジブチル、アジピン酸ジオクチル、セチルアルコール、ステアリルアルコールおよびセテアリルアルコールまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択される。

また本発明の他の実施態様において、10以下の炭素原子を持つ脂肪酸またはそのエステルは、プロピオン酸、酪酸、ペントン酸、ヘキサン酸、ヘプタン酸、カプリル酸、ノナン酸、カプリン酸、前記酸のプロピレングリコールとのモノまたはジエステルおよび前記酸のグリセリンとのモノまたはジまたはトリエステルまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択され；そして該脂肪酸またはそのエステルはオイルの一部であるか、または独立した脂肪酸またはそのエステルである。

また本発明の他の実施態様において、オイルまたは脂肪酸またはそのエステルは全組成物に対し重量で約0.5%～約99%の範囲の濃度；好ましくは全組成物に対し重量で約50%～約99%の範囲の濃度；より好ましくは全組成物に対し重量で約0.5%～約20%の範囲の濃度である。

【誤訳訂正6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0018

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0018】

本発明はまた上記の抗菌組成物を得るための方法に関し、該方法は：少なくとも1つの抗菌薬を少なくとも1つの賦形剤と、任意に少なくとも1つのオイル、または脂肪酸またはそのエステル、または両者とともに、少なくとも1つの成分がナノスケールの範囲内の粒子径を持つような方法で混合する行為を含み；そして組成物は11以上の炭素原子を持つ脂肪酸またはそのエステルは含まない。

【誤訳訂正7】**【訂正対象書類名】明細書****【訂正対象項目名】0021****【訂正方法】変更****【訂正の内容】****【0021】**

また本発明の他の実施態様において、対象は人間を含む哺乳動物である。

また本発明の他の実施態様において、組成物の投与は経口、局所、経皮、粘膜、バッカルおよび歯ぐきまたはそれらのどれかの組合せから成る群から選択されるルートによる。

本発明はまた、微生物感染症の治療で使用するための、上記の抗菌組成物に関する。

本発明はまた、微生物感染症の治療用キットに関し、該キットは取扱説明書と共に抗菌薬、オイル、10以下の炭素原子を持つ脂肪酸またはそのエステルおよび賦形剤またはそれらのどれかの組合せから成る群から選択される成分を含んでいる。

本発明は、

- (A)少なくとも1つの抗菌薬；および
- (B)少なくとも1つの賦形剤

を含有する、微生物感染症の治療のための組成物を対象とし、

該組成物はC10より長い炭素鎖を有する脂肪酸/エステルは含んでいない。

本発明はまた、

- (A)少なくとも1つの抗菌薬；および
- (B)少なくとも1つの賦形剤

を含有する、微生物感染症の治療のための組成物を対象とし、

該組成物は少なくとも1つのC11より短い炭素鎖を有する脂肪酸/エステルを含み、そしてC10より長い炭素鎖を有する脂肪酸/エステルは含んでいない。

【誤訳訂正8】**【訂正対象書類名】明細書****【訂正対象項目名】0028****【訂正方法】変更****【訂正の内容】****【0028】**

本発明によれば、賦形剤としては、これらに限定されないが、溶媒、乳化剤、界面活性剤、安定剤、オイルおよび医薬および化粧品製剤で用いられる添加剤が挙げられる。本発明の組成物で用いられる賦形剤の量は、全組成物に対し重量で約0.5%～約99.90%の範囲である。

本発明の実施態様において、溶媒としては、これらに限定されないが、C-1-C-6低級脂肪族アルコール、例えば、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノールなど、低級アルキルアセテート、エーテル類、カルボン酸およびC11より短い炭素鎖長を含む誘導体（カブリル酸、カプリン酸など）またはそれらの混合物、およびウンデカノール、オレイルアルコール、ラウリルアルコール、などの脂肪族アルコールまたはそれらの組合せが挙げられる。

本発明の他の実施態様において、安定剤としては、これらに限定されないが、界面活性剤、乳化剤およびポリマーが挙げられる。

また本発明の他の実施態様において、界面活性剤としては、これらに限定されないが、ポロクサマー、PEG-2ステアリルエーテル、PEG-21ステアリルエーテル、プルロニックF127（ポロクサマー）、ポリオキシル20セトステアリルエーテル、ラウリルエーテル硫酸ナトリウム、ココモノエタノールアミド、コカミドプロピルベタイン、ドキュセートナトリウムおよびラウリル硫酸アンモニウムが挙げられる。

また本発明の他の実施態様において、乳化剤としては、これらに限定されないが、ステアレス-2、ステアレス-21、ポロクサマー、マクロゴールセトステアリルエーテル20およびセチルアルコールが挙げられる。

また本発明の他の実施態様において、オイルは脂肪酸またはそのエステルを含まないか、またはオイルは10以下の炭素原子を有する脂肪酸またはそのエステルを含有する。

また本発明の他の実施態様において、オイルとしては、これらに限定されないが、パラフィンオイル、シリコンオイル、テルペン、脂肪族アルコール、アジピン酸ジブチル、アジピン酸ジオクチル、セチルアルコール、ステアリルアルコールおよびセテアリルアルコールまたはそれらのどれかの組合せが挙げられる。

また本発明の他の実施態様において、C11より少ない脂肪酸および/またはそのエステルとしては、これらに限定されないが、プロピオン酸、酪酸、ペンタン酸、ヘキサン酸、ヘプタン酸、カプリル酸、ノナン酸、カプリン酸、これらの酸のプロピレングリコールとのモノ/ジエステル、これらの酸のグリセリンとのモノ/ジ/トリエステル、およびそれらの組合せが挙げられる。

また本発明の他の実施態様において、本発明の組成物で用いられるオイルの量は全組成物に対し重量で約0.5%～約99%の範囲である。他の実施態様において、本発明の組成物で使用するオイルの量は、オイル剤として製剤化する場合は約50%～約99%、クリーム/軟膏として製剤化する場合は約5%～約50%の範囲、ゲル剤/血清/スプレー剤として製剤化する場合は約0.5%～約20%の範囲である。

【誤訳訂正9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0058

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0058】

亜鉛ピリチオンヘアコンディショナーのナノ製剤(組成物D)の調製

一つ又は複数のナノ-API(実施例6の亜鉛ピリチオン)及び炭素鎖の長さが10以下の油成分(脂肪酸エステル)を含むコンディショナーを設計し、製剤化する。それらの組成を表7示す。

【表7】

成分	強度 (%)	含量 (%)		
		組成物 D1	組成物 D2	組成物 D3
フェース A				
水	NA	qs.	qs.	qs.
カーボポール	30	3	3	2
ナトリウムラウリルエーテル硫酸塩	30	5	5	5
水酸化ナトリウム	18	qs.	qs.	qs.
フェース B				
ステアレス-2	NA	3	3	3
ステアレス-21	NA	2	2	2
プロピレングリコール モノカブリレート	NA	9	9	3
マクロゴールセトステアリルエーテル 20	NA	6	6	6
ココモノエタノールアミド	NA	1.2	1.2	1.2
セチルアルコール	NA	5	5	5
ステアアミドプロピルジメチルアミン	NA	2	2	1
乳酸	50	qs.	qs.	qs.
フェース C				
コカミドプロピルベタイン	30	10	10	10
セトリモニウムクロリド	30	2	2	2
ポリクオタニウム-22	NA	0.5	0.5	0.5
アモジメチコンエマルション	NA	0.5	0.5	0.5
カシアヒドロキシプロピルトリモニウムクロリド	1	5	5	5
プロピレングリコール	NA	2	2	2
グリセリン	NA	5	5	5
亜鉛ピリチオンナノ分散液	50* / 10	1*	1*	10
炭酸亜鉛	NA	1	1	1
二酸化チタン	NA	0.5	0.5	0.5L
リナロール	NA	1	1	1
芳香剤	NA	qs.	qs.	qs.
クロロメチルメチルイソチアゾリノン	1.51	0.05	0.05	0.05

【誤訳訂正 10】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0060

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0060】

ナノ亜鉛ピリチオンを基質としたシャンプー製剤(組成物E)の調製

一つ又は複数のナノ-API(実施例6の亜鉛ピリチオン)及び炭素鎖の長さが10以下の油成分(脂肪酸エステル)を含むシャンプー製剤を設計し、製剤化する。それらの組成を表8に示す。

【表8】

成分	強度 %	含量 (%)		
		実施例-4	実施例-5	実施例-6
フェース A				
水	NA	qs.	qs.	qs.
カーボポール	NA	2.5	2.5	2.5
ラウリル硫酸アンモニウム	30	10	10	10
ラウリルエーテル硫酸ナトリウム	30	30	30	30
水酸化ナトリウム	18	qs.	qs.	qs.
フェース B				
ココモノエタノールアミド	NA	1	1	1
セチルアルコール	NA	0	4	0
プロピレングリコールモノカブリレート	NA	4	0.1	4
メントール	NA	0.2	0.1	0.1
フェース C				
ピリチオン亜鉛ナノ分散剤 / 粉末*	10 / NA*	10	10	1*
硫酸マグネシウム	NA	0.5	0.5	0.5
アモジメチコン	NA	1	1	1
セトリモニウムクロリド	NA	1	0	0
プロピレングリコール	NA	1	1	1
炭酸亜鉛	NA	1	1	1
コカミドプロピルベタイン	30	10	10	10
カシアヒドロキシプロピルトリモニウムクロリド	1	10	10	10
クロロメチル/メチルイソチアゾリノン	1.51	0.05	0.05	0.05
芳香剤	NA	qs.	qs.	qs.
クエン酸	50	qs.	qs.	qs.
塩化ナトリウム	30	qs.	qs.	qs.