

【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20年7月31日(2008.7.31)

【公表番号】特表2008-502735(P2008-502735A)

【公表日】平成20年1月31日(2008.1.31)

【年通号数】公開・登録公報2008-004

【出願番号】特願2007-527776(P2007-527776)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/16 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 39/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 Q 19/00 (2006.01)

A 6 1 Q 19/08 (2006.01)

A 6 1 Q 17/00 (2006.01)

A 6 1 K 8/44 (2006.01)

A 6 1 K 8/49 (2006.01)

A 6 1 K 8/02 (2006.01)

A 6 1 K 8/06 (2006.01)

A 6 1 K 8/14 (2006.01)

A 6 1 K 8/11 (2006.01)

A 6 1 Q 11/00 (2006.01)

A 6 1 Q 5/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/08

A 6 1 P 17/16

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 39/02

A 6 1 P 31/10  
 A 6 1 P 33/00  
 A 6 1 P 31/12  
 A 6 1 P 9/08  
 A 6 1 P 37/00  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 31/04  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 43/00 1 2 1  
 A 6 1 Q 19/00  
 A 6 1 Q 19/08  
 A 6 1 Q 17/00  
 A 6 1 K 8/44  
 A 6 1 K 8/49  
 A 6 1 K 8/02  
 A 6 1 K 8/06  
 A 6 1 K 8/14  
 A 6 1 K 8/11  
 A 6 1 Q 11/00  
 A 6 1 Q 5/12  
 A 6 1 P 1/02

## 【手続補正書】

【提出日】平成20年6月13日(2008.6.13)

## 【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】

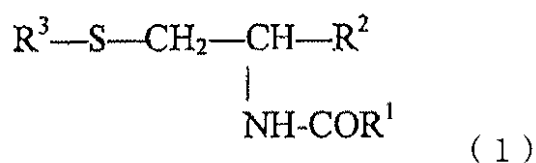
【特許請求の範囲】

【請求項1】

被験体の上皮状態を処置もしくは予防または健常な皮膚を増進するための局所用組成物であって、

下記式(1)~(3)のいずれかで表される、少なくとも1種のポリイソプレニル-タンパク質阻害剤化合物:

【化1】



$$W-Y-Q-Z \quad (2)$$

$$W-Y-Z \quad (3)$$

[上記式中、

R<sup>1</sup>は、炭素数1~3のアルキルであり、

R<sup>2</sup>は、-COX(ここで、Xは、-OH、-OCH<sub>3</sub>、-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>4</sup>、-N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>又はハロゲンである)であり、

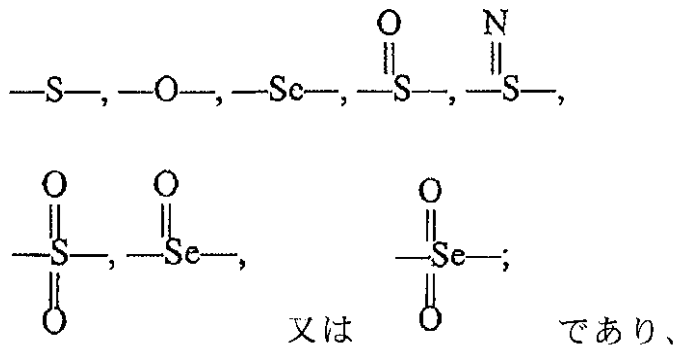
R<sup>3</sup>は、炭素数10~25の直鎖又は分枝鎖アルキル、又は炭素数10~25の直鎖又は分枝鎖アルケニルであり、

R<sup>4</sup>は、炭素数1~25のアルキルであり、

Wは、ファルネシル基、ゲラニルゲラニル基、置換ファルネシル基又は置換ゲラニルゲラニル基であり、

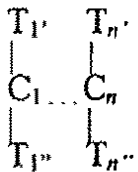
Yは、

【化2】



Qは、

【化3】



(ここで、 $n = 1, 2, 3, 4, 5$  又は  $6$  であり、 $\text{C}_1 \dots \text{C}_n$  は、炭素数  $1 \sim 6$  であり、各  $\text{T}_1 \dots \text{T}_n$  及び  $\text{T}_{1''} \dots \text{T}_{n''}$  はそれぞれ独立して、 $\text{H}$ 、 $\text{Fl}$ 、 $\text{Br}$ 、 $-\text{NHCOCH}_3$ 、 $-\text{NH}_2$ 、ペプチド、アルケン基、ポリエチレングリコール基、飽和脂肪酸、不飽和脂肪酸、単糖又は二糖である) であり、

Zは、 $-\text{COOH}$  又はそれらの塩もしくはエステルである ]、又は、

S - ファルネシル - 2 -メルカプトエタンスルホン酸、S - ファルネシルメルカプトコハク酸、S - ファルネシルチオトリアゾール、S - ファルネシルチオサリチル酸 (FTS)、2 - クロロ - 5 - ファルネシルアミノ安息香酸、2 - ファルネシル - チオニコチン酸 (FTN)、5 - フルオロ - FTS、5 - クロロ - FTS、4 - クロロ - FTS、S - ファルネシル - メチルチオサリチル酸、及び前記化合物の薬学的に許容可能な塩及びエステルから成る群から選択される、少なくとも1種のポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物；及び

保湿剤、pH調節剤、防臭剤、芳香剤、毛髪品質改良剤、キレート剤、防腐剤、乳化剤、増粘剤、可溶化剤、浸透増強剤、抗刺激薬、着色料及び界面活性剤から成る群から選択される少なくとも1種の作用物質を含むキャリアからなり、

前記局所用組成物は、粉末、ヒドロゲル、オイル、クリーム、軟膏、ゲル、ローション、シャンプー、乳液、クレンザー、保湿剤、スプレー、包帯、絆創膏又は皮膚パッチの形態であることを特徴とする組成物。

【請求項2】

ポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物が、式(1)で表される請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

ポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物が、S - ファルネシルシステイン、N - アセチル - S - ゲラニルシステイン、N - アセチル - S - ファルネシルシステイン (AFC) 又は N - アセチル - S - ゲラニルゲラニルシステイン (AGGC) である、請求項2に記載の組成物。

【請求項4】

ポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物が、式(1)で表され、 $\text{R}^1$  がメチルであ

る請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

ポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物が、式 ( 1 ) で表され、 $R^2$  が  $COOH$  である請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

ポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物が、式 ( 1 ) で表され、 $R^3$  がファルネシルである請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

薬学的に許容可能な塩が、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、アンモニウム塩及び置換アンモニウム塩から成る群から選択される請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 8】

ポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物が、式 ( 1 ) で表され、 $R^3$  が炭素数 10 ~ 25 の直鎖もしくは分枝鎖アルキル、又は炭素数 10 ~ 25 の直鎖もしくは分枝鎖アルケニルである請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

少なくとも 1 種のポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物が、*S* - ファルネシルチオ酢酸、*S* - ファルネシルメルカプトコハク酸、*S* - ファルネシルチオトリアゾール、*S* - ファルネシルチオサリチル酸 ( *FTS* )、*S* - ファルネシルチオコハク酸、2 - クロロ - 5 - ファルネシルアミノ安息香酸、2 - ファルネシル - チオニコチン酸 ( *FTN* )、5 - フルオロ - *FTS*、5 - クロロ - *FTS*、4 - クロロ - *FTS*、*S* - ファルネシル - メチルチオサリチル酸及びそれらの組合せから成る群から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

活性成分をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

活性成分が、保護剤、皮膚軟化薬、収斂剤、刺激薬、角質溶解剤、日焼け防止剤、日焼け剤、抗生剤、抗真菌剤、抗ウイルス剤、抗原虫剤、抗挫瘡剤、麻酔剤、ステロイド系抗炎症剤、非ステロイド系抗炎症剤、かゆみ止め剤、酸化防止剤、化学療法剤、抗ヒスタミン剤、ビタミン、ホルモン、ふけ防止剤、しわ防止剤、抗皮膚萎縮剤、硬化剤、クレンジング剤、腐食剤及び低顔料着色剤から成る群から選択される少なくとも 1 種の成分である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

レチノイドをさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 13】

レチノイドが、ビタミン A、レチノール、レチナール、レチニルパルミチン酸、レチノイン酸、トレチノインもしくはイソ - トレチノイン又はそれらの混合物のうち少なくとも 1 つである、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

- ヒドロキシ酸をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 15】

- ヒドロキシ酸が、グリコール酸、乳酸、酒石酸、リンゴ酸もしくはクエン酸又はそれらの混合物のうち少なくとも 1 つである、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 16】

- ヒドロキシ酸をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 17】

抗生物質をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 18】

抗真菌剤をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 19】

日焼け止め剤をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 20】**

ステロイド系抗炎症剤をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 21】**

二酸化チタン、酸化亜鉛、過酸化ベンゾイル、フルオロウラシル、レゾルシノール、もしくはサリチル酸又はそれらの混合物をさらに含む、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 22】**

少なくとも 1 種のポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物が、AFC である請求項 12 ~ 21 に記載の組成物。

**【請求項 23】**

上皮状態を有する哺乳動物に局所的に塗布して健常な皮膚を増進する、請求項 1 ~ 22 のいずれかに記載の局所用組成物の使用。

**【請求項 24】**

上皮状態は、しわ、紫外光による老化、乾燥皮膚及び炎症性状態から成る群から選択される、請求項 23 に記載の使用。

**【請求項 25】**

上皮状態が、皮膚炎、挫瘡、毛囊炎、鬚髯偽性毛囊炎、凍瘡、汗疹、酒さ、湿疹、乾癬、細菌感染、外科的介入、腸性先端皮膚炎、スウィート病、アミロイドーシス、じんま疹、遠心性環状紅斑、ペーチェット症候群、虫刺され、動物咬傷、刺創、真菌感染、酵母感染、寄生虫、ウイルス感染、血管拡張、外傷、自己免疫状態、水疱性疾患、薬物有害反応、免疫過反応性状態、癌、火傷、創傷、嚢胞、汗腺腫瘍及び蜂巣炎から成る群から選択される、請求項 23 に記載の使用。

**【請求項 26】**

開放創傷、慢性創傷、裂傷、痔核、または傷ついた口部組織への塗布である、請求項 23 に記載の使用。

**【請求項 27】**

上皮表面に塗布する請求項 23 に記載の使用。

**【請求項 28】**

哺乳動物がヒトである請求項 23 に記載の使用。

**【請求項 29】**

請求項 1 に記載の局所用組成物の製造方法であって、少なくとも 1 種のポリイソプレニル - タンパク質阻害剤化合物及びキャリアを混合して、粉末、ヒドロゲル、オイル、クリーム、軟膏、ゲル、ローション、シャンプー、乳液、クレンザー、保湿剤、スプレー、包帯、絆創膏又は皮膚パッチを形成することからなり、

前記キャリアが、保湿剤、pH 調節剤、防臭剤、芳香剤、毛髪品質改良剤、キレート剤、防腐剤、乳化剤、増粘剤、可溶化剤、浸透増強剤、抗刺激薬、着色料及び界面活性剤から成る群から選択される少なくとも 1 種の作用物質を含むことを特徴とする方法。

**【手続補正 2】**

**【補正対象書類名】**明細書

**【補正対象項目名】**0067

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

**【0067】**

さらなる増粘剤、浸透増強剤及び他の補助剤は概して、非特許文献 6（これは、参照により本明細書に援用される）に見出され得る。