

【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 25 年 2 月 14 日 (2013.2.14)

【公表番号】特表 2012-513380 (P2012-513380A)

【公表日】平成 24 年 6 月 14 日 (2012.6.14)

【年通号数】公開・登録公報 2012-023

【出願番号】特願 2011-541506 (P2011-541506)

【国際特許分類】

C 0 7 C 69/587 (2006.01)

C 0 7 C 67/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/232 (2006.01)

A 6 1 K 31/231 (2006.01)

A 6 1 P 17/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 8/37 (2006.01)

A 6 1 Q 19/00 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 69/587 C S P

C 0 7 C 67/08

A 6 1 K 31/232

A 6 1 K 31/231

A 6 1 P 17/08

A 6 1 P 17/10

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 K 8/37

A 6 1 Q 19/00

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 12 月 17 日 (2012.12.17)

【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

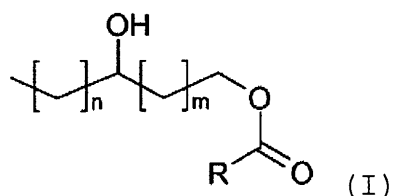
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記一般式 (I) で表される化合物：

【化 1】



(式中：

n は 1 ～ 15 の整数であり、

m は 0、1、2、または 3 であり、および

R は、オメガ - 3 多価不飽和脂肪酸およびオメガ - 6 多価不飽和脂肪酸から選択される多価不飽和脂肪酸の炭化水素鎖である）。

【請求項 2】

n が 1 ～ 10 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

n が 1、2、3、4、または 5 である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

m が 0 または 1 である、請求項 1 ～ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

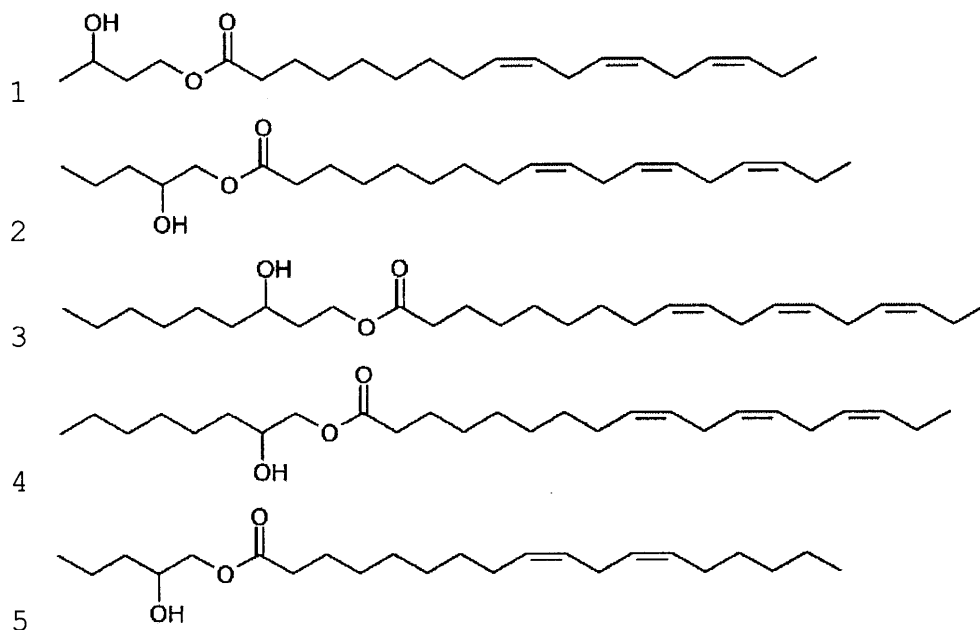
【請求項 5】

多価不飽和脂肪酸が、 α - リノレン酸、ステアリドン酸、エイコサトリエン酸、エイコサテトラエン酸、エイコサペンタエン酸、ドコサペンタエン酸、ドコサヘキサエン酸、テトラコサペンタエン酸、テトラコサヘキサエン酸、リノール酸、 γ - リノレン酸、エイコサジエン酸、ジホモ - γ - リノレン酸、アラキドン酸、ドコサテトラエン酸、ドコサペンタエン酸、アドレン酸、およびカレンド酸から選択され、好ましくは α - リノレン酸、ステアリドン酸、またはリノール酸である、請求項 1 ～ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

下記分子から選択される、請求項 1 ～ 5 のいずれか一項に記載の化合物：

【化 2】



【請求項 7】

請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の少なくとも一種の式 (I) で表される化合物と、少なくとも一種の薬学上または化粧品上許容される賦形剤と組み合わせて含む、医薬組成物または化粧品組成物。

【請求項 8】

組成物が、組成物の総重量に対して 0.01 重量% ～ 10 重量%、好ましくは 0.1 重量% ～ 1 重量% の、前記一種以上の式 (I) で表される化合物を含む、請求項 7 に記載の医薬組成物または化粧品組成物。

【請求項 9】

皮膚上へ塗布するための、請求項 7 または 8 に記載の医薬組成物または化粧品組成物。

【請求項 10】

薬物として用いるための、請求項 7 に記載の医薬組成物または化粧品組成物。

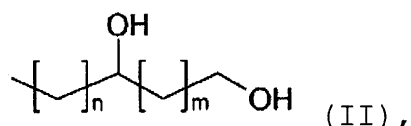
【請求項 1 1】

アクネまたは脂漏性皮膚炎の治療のための、請求項 7 に記載の医薬組成物または化粧品組成物。

【請求項 1 2】

請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の式 (I) で表される化合物の製造方法であって、カルボン酸官能基が遊離型または活性化型である、オメガ - 3 脂肪酸およびオメガ - 6 脂肪酸から選択される多価不飽和脂肪酸と、下記式 (II) で表されるジオールとをカップリングすることによる、方法：

【化 3】



(式中、 n は 1 ～ 15、好ましくは 1 ～ 10 の整数であり、 m は 0、1、2、または 3、好ましくは 0 または 1 である)。

【請求項 1 3】

カップリング反応が、N - ヒドロキシスクシンイミド、N - ヒドロキシベンゾトリアゾール、3,4 - ジヒドロ - 3 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 1,2,3 - ベンゾトリアゾール、1 - ヒドロキシ - 7 - アザベンゾトリアゾール、ジメチルアミノピリジン、または N - ヒドロキシスルホスクシンイミドからなる群から選択されるカップリング助剤と場合により組み合わせてよい、ジイソプロピルカルボジイミド、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩、カルボニルジイミダゾール、2 - H - ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - 1,1,3,3 - テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスファート、2 - (1H - ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - 1,1,3,3 - テトラメチルウロニウムテトラフルオロボラート、または O - (7 - アゾベンゾトリアゾール - 1 - イル) - 1,1,3,3 - テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスファートからなる群から選択されるカップリング剤の存在下で、カルボン酸官能基が遊離型である多価不飽和脂肪酸から行われる、請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 4】

カップリング剤が 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩であり、カップリング助剤がジメチルアミノピリジンである、請求項 1 2 および 1 3 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 1 5】

カップリング反応が、特にピリジンおよびジメチルアミノピリジンの存在下で、カルボン酸官能基が酸塩化物の形で活性化される多価不飽和脂肪酸から行われる、請求項 1 2 に記載の方法。