

【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 12 月 25 日 (2008.12.25)

【公表番号】特表 2008-539206 (P2008-539206A)

【公表日】平成 20 年 11 月 13 日 (2008.11.13)

【年通号数】公開・登録公報 2008-045

【出願番号】特願 2008-508231 (P2008-508231)

【国際特許分類】

A 6 1 K 8/49 (2006.01)

A 6 1 Q 19/02 (2006.01)

A 6 1 Q 19/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/421 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

C 0 7 D 263/12 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 8/49

A 6 1 Q 19/02

A 6 1 Q 19/08

A 6 1 K 31/421

A 6 1 P 17/00

C 0 7 D 263/12

【手続補正書】

【提出日】平成 20 年 8 月 6 日 (2008.8.6)

【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】

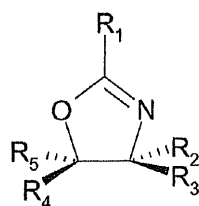
【請求項 1】

少なくとも一のオキサゾリンを、色素消失用活性成分として含有する色素消失用化粧品組成物。

【請求項 2】

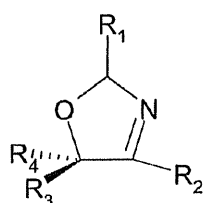
前記オキサゾリンが、以下の一般式：

【化 1】



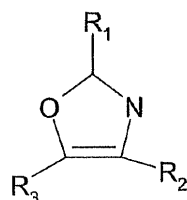
タイプ 1

【化 2】



タイプ 2

【化 3】



タイプ 3

に属することにより特徴付けられ、

式中、 R_1 が、直鎖又は分枝鎖の、飽和又は不飽和の $C_1 - C_{40}$ アルキル基であって、これらが、随意に、一以上のエチレン不飽和並びにヒドロキシ (OH) 及び $C_1 - C_6$ ($OC_1 - C_6$) アルコキシ基より形成される群より選択される一以上の置換基を含む、 $C_1 - C_{40}$ アルキル基を表し； R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 が、互いに独立して、水素原子、ヒドロキシ基又は直鎖若しくは分枝鎖の、飽和若しくは不飽和の $C_1 - C_{30}$ アルキル基であって、随意に、一以上のエチレン不飽和並びにヒドロキシ (OH)、 $C_1 - C_6$ ($OC_1 - C_6$) アルコキシ及び $C_1 - C_6$ アルコシカルボニル ($COOC_1 - C_6$) 基より形成される群より選択される一以上の置換基を含む、 $C_1 - C_{30}$ アルキル基を表すものである、請求項 1 に記載の色素消失用化粧品組成物。

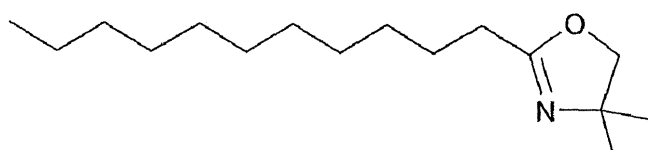
【請求項 3】

前記オキサゾリンが、2 - ウンデシル - 4 - ヒドロキシメチル - 4 - メチル - 1, 3 - オキサゾリン；2 - ウンデシル - 4, 4 - ジメチル - 1, 3 - オキサゾリン；(E) - 4, 4 - ジメチル - 2 - ヘプタデカ - 8 - エニル - 1, 3 - オキサゾリン；4 - ヒドロキシメチル - 4 - メチル - 2 - ヘプタデシル - 1, 3 - オキサゾリン；(E) - 4 - ヒドロキシメチル - 4 - メチル - 2 - ヘプタデカ - 8 - エニル - 1, 3 - オキサゾリン；及び 2 - ウンデシル - 4 - エチル - 4 - ヒドロキシメチル - 1, 3 - オキサゾリンからなる群より選択される 1 型のオキサゾリンであることにより特徴付けられる、請求項 1 又は請求項 2 に記載の色素消失用化粧品組成物。

【請求項 4】

前記オキサゾリンが、式：

【化 4】



の 2 - ウンデシル - 4, 4 - ジメチル - 1, 3 - オキサゾリンであることにより特徴付けられる、請求項 1 ~ 請求項 3 のいずれかに記載の色素消失用化粧品組成物。

【請求項 5】

組成物の総重量に対して、0.01 重量% ~ 10 重量% のオキサゾリン、及び化粧品上受容可能な媒体を含有する、請求項 1 ~ 請求項 4 のいずれかに記載の色素消失用化粧品組成物。

【請求項 6】

さらに別の色素消失用活性成分をも含有することにより特徴付けられる、請求項 1 ~ 請求項 5 のいずれかに記載の色素消失用化粧品組成物。

【請求項 7】

少なくとも一の有機太陽光フィルター又は無機太陽光フィルターをさらに含有することにより特徴付けられる、請求項 1 ~ 請求項 6 のいずれかに記載の色素消失用化粧品組成物。

【請求項 8】

組成物が、色素沈着斑を減少及び / 又は排除及び / 又は予防するためのものであることにより特徴付けられる、請求項 1 ~ 請求項 7 のいずれかに記載の色素消失用化粧品組成物。

。

【請求項 9】

組成物が、皮膚色彩均一性及び美白を改善するためのものであることにより特徴付けられる、請求項 1 ～ 請求項 8 のいずれかに記載の色素消失用化粧品組成物。

【請求項 10】

少なくとも一のオキサゾリンを、色素消失用活性成分として使用して成る活性医薬。

【請求項 11】

色素沈着斑を減少及び / 又は排除するための化粧品処置の方法であって、少なくとも一のオキサゾリンが、局所経路により適用される、方法。

【請求項 12】

色素沈着斑が、加齢斑、太陽光線斑もしくは光毒症斑又は褐色斑であることにより特徴付けられる、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 13】

皮膚を美白化するための化粧品処置の方法であって、少なくとも一のオキサゾリンを含有する組成物が、局所経路により適用される方法。

【請求項 14】

少なくとも一のオキサゾリンの、色素消失用活性成分としての化粧品又は活性医薬の調製のための使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0030

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0030】

式中、 R_1 は、直鎖又は分枝鎖の、飽和又は不飽和の、 $C_1 - C_{40}$ アルキル基を表し、これらは、随意に、一以上のエチレン不飽和、並びにヒドロキシ (OH) 及び $C_1 - C_6$ ($OC_1 - C_6$) から形成される群より選択される一以上の置換基を含み； R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は、互いに独立して、水素原子、ヒドロキシ基又は直鎖若しくは分枝鎖の、飽和若しくは不飽和の、 $C_1 - C_{30}$ アルキル基を表し、これらは、随意に、一以上のエチレン不飽和並びにヒドロキシ (OH)、 $C_1 - C_6$ ($OC_1 - C_6$) アルコキシ及び $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル ($COOC_1 - C_6$) 基から形成される群より選択される一以上の置換基を含む。本発明の意義において、「 $C_1 - C_6$ ($OC_1 - C_6$) アルコキシ」は、アルキル基が 1 つから 6 つの炭素原子を有するアルコキシ基を意味する。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0031

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0031】

R_1 は、有利には、直鎖又は分枝鎖の、飽和又は不飽和の、 $C_8 - C_{30}$ アルキル基を、より一層有利には、 $C_8 - C_{20}$ を表し、これらは、随意に、一以上のエチレン不飽和並びにヒドロキシ (OH) 及び $C_1 - C_6$ ($OC_1 - C_6$) アルコキシ基より形成される群より選択される一以上の置換基を含む。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0032

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0032】

有利には、 R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は、互いに独立して、水素原子、ヒドロキシ基又

は直鎖若しくは分枝鎖の、飽和若しくは不飽和の、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基を、より一層有利には $C_1 - C_6$ を表し、これらは、随意に、一以上のエチレン不飽和並びにヒドロキシ (OH)、 $C_1 - C_6$ (OC₁ - C₆) アルコキシ基及び $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル (COOC₁ - C₆) 基より形成される群より選択される一以上の置換基を含む。本発明の有利な実施形態に従えば、当該オキサゾリンは、2 - ウンデシル - 4 - ヒドロキシメチル - 4 - メチル - 1, 3 - オキサゾリン; 2 - ウンデシル - 4, 4 - ジメチル - 1, 3 - オキサゾリン; (E) - 4, 4 - ジメチル - 2 - ヘプタデカ - 8 - エニル - 1, 3 - オキサゾリン; 4 - ヒドロキシメチル - 4 - メチル - 2 - ヘプタデシル - 1, 3 - オキサゾリン; (E) - 4 - ヒドロキシメチル - 4 - メチル - 2 - ヘプタデカ - 8 - エニル - 1, 3 - オキサゾリン; 及び 2 - ウンデシル - 4 - エチル - 4 - ヒドロキシメチル - 1, 3 - オキサゾリンからなる群より選択される 1 型のオキサゾリンである。有利には、当該オキサゾリンは、2 - ウンデシル - 4, 4 - ジメチル - 1, 3 - オキサゾリンであり、これは、OX100と呼ばれ、式：

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0035

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0035】

本発明に従うオキサゾリンを調製するための多くの合成経路が公知である。従って、当該オキサゾリンは、脂肪酸（又はメチルエステル）及びアミノアルコールの反応による化学合成によって、非常にしばしば共沸剤の存在下で、形成された水（及びメタノール）の排除を促進して、調製され得る。別の可能性ある合成経路は、強塩基（strong basis）又は炭酸ナトリウムの存在下、ハロゲンアミドを濃縮する工程からなる（R. M. Lusskin, J. Amer. Chem. Soc., 72, (1950), 5577）。オキサゾリンは、エポキシドとニトリルとの反応、塩化チオニルとヒドロキシアミドとの反応、又はアジリジニルホスフィンに対する酸の作用によっても又、合成され得る。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0127

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0127】

プロトコール：

1) 試験のために、M / K 共培養を、PMA（酢酸ミリスチン酸ホルボール）フリーの培地中に接触し、60-80% コンフルエンスの状態に至らせる。

2) 3つの同一培養シリーズを以下の測定のために調製する：

- MTT（テトラゾリウム塩）試験及び細胞の形態学的観察による細胞毒性

- メラニン量

- 総蛋白量（総蛋白質に対するメラニンの比を決定するために）

3) 処理条件は以下の通りである：

- 3つの濃度でのOX100： 2×10^{-6} 、 10^{-5} 、 2×10^{-5} M

- コウジ酸（色素消失用分子）

- IBMX（3-イソブチル-1-メチルキサンチン、色素沈着促進基準分子）

各処理条件は、3部構成で実行する。共培養を、上記化合物の存在下又は非存在下において、240時間インキュベートする。

【手続補正 7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0135

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 1 3 5 】

O X 100は、非照射共培養において、 2×10^{-5} Mで約12%抑制し、有意にメラニンの合成を減少させる（ $p < 0.01$ ）。