【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21年7月9日(2009.7.9)

【公表番号】特表2008-546675(P2008-546675A)
【公表日】平成20年12月25日(2008.12.25)
【年通号数】公開・登録公報2008-051
【出願番号】特願2008-516380(P2008-516380)
【国際特許分類】

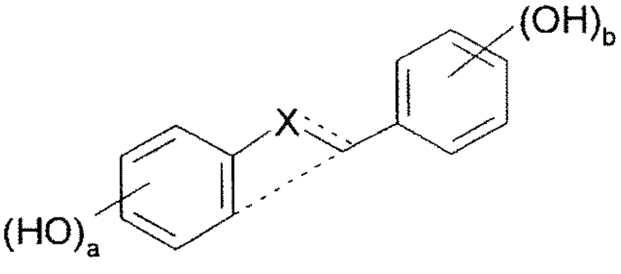
Ａ６１Ｋ	*8/37*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｋ	*8/49*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｋ	*31/381*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｋ	*31/355*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｋ	*31/216*	*(2006.01)*
Ｃ０７Ｄ	*339/04*	*(2006.01)*
Ｃ０７Ｄ	*311/72*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｐ	*17/00*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｐ	*17/10*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｐ	*3/04*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｐ	*17/06*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｐ	*17/16*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｐ	*17/18*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｐ	*39/06*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｑ	*19/08*	*(2006.01)*
Ａ６１Ｑ	*19/00*	*(2006.01)*
Ｃ０７Ｃ	*69/734*	*(2006.01)*

【ＦＩ】

Ａ６１Ｋ	8/37	
Ａ６１Ｋ	8/49	
Ａ６１Ｋ	31/381	
Ａ６１Ｋ	31/355	
Ａ６１Ｋ	31/216	
Ｃ０７Ｄ	339/04	
Ｃ０７Ｄ	311/72	１０２
Ａ６１Ｐ	17/00	
Ａ６１Ｐ	17/10	
Ａ６１Ｐ	3/04	
Ａ６１Ｐ	17/06	
Ａ６１Ｐ	17/16	
Ａ６１Ｐ	17/18	
Ａ６１Ｐ	39/06	
Ａ６１Ｑ	19/08	
Ａ６１Ｑ	19/00	
Ｃ０７Ｃ	69/734	Ｚ

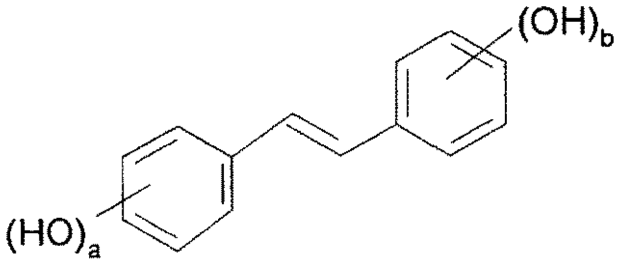
【手続補正書】
【提出日】平成21年5月20日(2009.5.20)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文

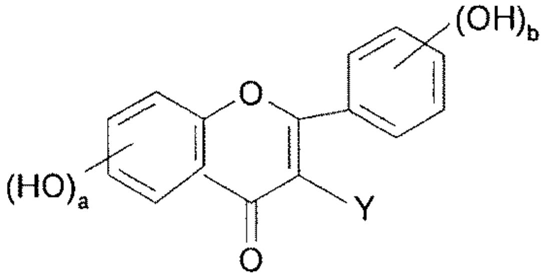
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
　下記の構造を有する生体前駆体であって、
　［Ａ］$_{n}$－ＰＰ－［Ｂ］$_{m}$
式中、
－PPは、各々の水酸基が基Aまたは基Bによって保護されているポリフェノール基であり；
－Aは、炭素原子を１～２０個、好ましくは１～４個有し、ポリフェノールと以下の（a）または（b）の方法によって結合している置換または非置換の飽和または不飽和アルキル鎖であり：
　　（a）－前記のアルキル基は、前記ポリフェノールの水酸基に対してカルボン酸エステル基により結合する；
または
　　（b）－スペーサーA’を介して結合する、ここで、Aはカルボン酸エステル基によりスペーサーA’に結合し、そしてA’は、前記ポリフェノールの水酸基に対してカルボン酸エステル基によりポリフェノールと結合する；
－nは整数で1または2以上であり、特に1、2、3、4、または5であり；
－Bは、ポリフェノールと以下の（c）または（d）の方法によって結合している生体活性分子の前駆体であり：
　　（c）－前記アルキル基は、前記ポリフェノールの水酸基に対してカルボン酸エステル基により結合する；
または
　　（d）－スペーサーB’を介して結合する、ここで、Bはカルボン酸エステル基によりスペーサーB’に結合し、そしてB’は、前記ポリフェノールの水酸基に対してカルボン酸エステル基によりポリフェノールと結合する；
－mは整数で1または2以上であり、特に1または2である生体前駆体。
【請求項２】
　ポリフェノールが少なくとも２つのフェノール核を有するタイプであることを特徴とする請求項１に記載の生体前駆体。
【請求項３】
　ポリフェノールが下記の構造式に従うことを特徴とする請求項１に記載の生体前駆体。
【化１】



（式中、
aは、1、2、3、4、または5;
bは、1、2、3、4、または5;
Xは、N、S、O、CH、CH_2、CO、NH;
====は、一重または二重結合であり、----

　は、存在可能な分子鎖であり、Xを含んで５員環または６員環を形成し、一重または二重結合を形成し、可能ならば、一つか二つ以上OHで置換され、および／または、N、S、Oから選択されるヘテロ原子であり、ヘテロ原子が環中に位置しているか、および／または、

ヘテロ原子により置換されている。）
【請求項４】
ポリフェノールが下記の構造式に従うことを特徴とする請求項１に記載の生体前駆体。
【化２】


（式中、
aは、1、2、3、4、または5であり、bは、1、2、3、4、または5である。）
【請求項５】
aが2であり、bが1であることを特徴とする請求項４に記載の生体前駆体。
【請求項６】
ポリフェノールが下記の構造式に従うことを特徴とする請求項１に記載の生体前駆体。
【化３】


（式中、
Yは、HまたはOH、aは、1、2、3、または4であり、bは、1、2、3、4、または5である。）
【請求項７】
aが2であり、bが2である請求項６に記載の生体前駆体。
【請求項８】
ポリフェノールがレスベラトロル、ルテオリン、ケルセチン、ハイドロキノン、ピロカテコール、没食子酸、ヒドロキシチロソール、テトラヒドロクルクミン、シリマリン、エラグ酸から選択されることを特徴とする請求項１に記載の生体前駆体。
【請求項９】
生体活性分子が美容上の活性分子、製薬上の活性分子、皮膚科学的な活性分子から選択されることを特徴とする請求項１～８のいずれか一項に記載の生体前駆体。
【請求項１０】
生体活性分子は、収斂性の分子、保湿分子、抗酸化分子、抗フリーラジカル、抗脂質過酸化および／またはしわ防止分子、再生または生体刺激分子、痩身分子、微少循環刺激および／または血管系保護のための分子、タンニング活性化剤、美白および／または染み防止分子、自己タンニング剤、糖化阻害剤、免疫促進分子、光防護剤、抗紫外線分子、抗炎症剤および／または抗刺激剤、芳香分子、冷却分子、加温分子から選択されることを特徴とする請求項９に記載の生体前駆体。
【請求項１１】
生体活性分子は、抗酸化分子、抗フリーラジカル、タンニング活性化剤、美白および／または染み防止分子、自己タンニング剤、光防護剤、抗紫外線分子から選択されることを特徴とする請求項１０に記載の生体前駆体。
【請求項１２】

生体活性分子は、ポリフェノール、リポ酸、ビタミンA、B、D、E、F、不飽和またはポリ不飽和有機酸、レチノイン酸、ヒドロキシ酸、ポリオールから選択されることを特徴とする請求項１０に記載の生体前駆体。

【請求項１３】

生体前駆体の基Aがエタン酸、プロパン酸、直鎖または枝分かれブタン酸、カプロン酸、および、ラウリン酸から選択される直鎖、枝分かれまたは環状カルボン酸由来であるのが好ましいことを特徴とする請求項１～１２のいずれか一項に記載の生体前駆体。

【請求項１４】

生体前駆体のスペーサーA’およびB'は、それぞれ独立に２つの酸基または１つの酸基、および、１つの水酸基を有し、2～13個の、好ましくは2～5個の炭素原子を有する脂肪族炭化水素鎖であるのが好ましいことを特徴とする請求項１～１２のいずれか一項に記載の生体前駆体。

【請求項１５】

生体前駆体のスペーサーA’およびB'は、それぞれ独立にコハク酸、アジピン酸、ブラシル酸、乳酸、サリチル酸、4-ヒドロキシ安息香酸、フェルラ酸、酒石酸、2-ヒドロキシブタン酸、3-ヒドロキシブタン酸、または、4-ヒドロキシブタン酸基である請求項１４に記載の生体前駆体。

【請求項１６】

生体前駆体が、

-(E)-4-(3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル-5-(1,2-ジチオラン-3-イル) ペンタノエート;

-(E)-4-(3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル-2,5,7,8-テトラメチル-2-(4,8,12-トリメチルトリデシル)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-6-イル スクシネート;

-4-((E)-3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル-(2Z,4E,6Z,8E)-3,7-ジメチル-9-(2,6,6-トリメチルシクロヘキサ-1-エニル)ノナ-2,4,6,8-テトラエニル スクシネート;

-(2E,4E,6E,8E,10E,12E)-4-((E)-3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル ドコサ-2,4,6,8,10,12-ヘキサノエート;

-(E)-4-(3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル 4-ヒドロキシ-3-メトキシベンゾエート;

-(E)-4-(3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル 3,4-ジアセトキシベンゾエート;

-(E)-4-((E)-3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル 3-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)アクリレート;

-(E)-4-((E)-3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル 3-(4-アセトキシ-3-メトキシフェニル)アクリレート;

-(E)-4-((E)-3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル 3-(4-メトキシフェニル)アクリレート;

-(E)-4-(3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル 2-アセトキシベンゾエート;

-7-アセトキシ-2-(3,4-ジアセトキシフェニル)-4-オキソ-4H-クロメン-5-イル 5-(1,2-ジチオラン-3-イル) ペンタノエート;

-7-アセトキシ-2-(3,4-ジアセトキシフェニル)-4-オキソ-4H-クロメン-5-イル 2,5,7,8-テトラメチル-2-(4,8,12-トリメチルトリデシル)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-6-イル スクシネート;

-2-メトキシ-4-(7-(3-メトキシ-4-(プロパ-1-エン-2-イルオキシ)フェニル)-3,5-ジオキソヘプチル)-フェニル 5-(1,2-ジチオラン-3-イル) ペンタノエート;

および

-2-メトキシ-4-(7-(3-メトキシ-4-(プロパ-1-エン-2-イルオキシ)フェニル)-3,5-ジオキソヘプチル)フェニル 2,5,7,8-テトラメチル-2-(4,8,12-トリメチルトリデシル)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-6-イル スクシネート

から選択されることを特徴とする請求項１に記載の生体前駆体。

【請求項１７】

生体前駆体が、

(E)-4-(3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル-5-(1,2-ジチオラン-3-イル) ペンタノエート、
および、
(E)-4-(3,5-ジアセトキシスチリル)フェニル-2,5,7,8-テトラメチル-2-(4,8,12-トリメチルトリデシル)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-6-イルスクシネート
から選択されることを特徴とする請求項１６に記載の生体前駆体。
【請求項１８】
皮膚科学的または美容上の活性分子の前駆体Bを含有する請求項１～１７のいずれか一項の生体前駆体を少なくとも一種含む皮膚科用または化粧用に適用可能な局所用処方物中の組成物。
【請求項１９】
治療用の活性分子の前駆体Bを含有する請求項１～１７のいずれか一項の生体前駆体を少なくとも一種含む治療に適用可能な局所用処方物中の組成物。
【請求項２０】
請求項１９に記載の化粧品組成物の皮膚への適用を含む化粧方法。
【請求項２１】
少なくとも以下のステップを含む請求項１～１７のいずれか一項に記載の生体前駆体の製造方法：
ａ）ポリフェノールとAの間にエステル結合を生じさせるために、ポリフェノールのOH基に反応することができる基Zを有するA-Z化合物をパーエステル化によりポリフェノールの保護するステップ
ｂ）ポリフェノール中に遊離のOH基を一つまたは二つ以上得られるように選択的に脱保護するステップ
ｃ）ステップｂ）で得られた中間体を、すでに活性化されている生体活性分子Bとカップリングさせるステップ。