

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2006-505514
(P2006-505514A)

(43) 公表日 平成18年2月16日(2006.2.16)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 401/04 (2006.01)	C O 7 D 401/04 C S P	4 C O 6 3
A O 1 N 43/40 (2006.01)	A O 1 N 43/40 I O 1 M	4 C O 8 3
A 6 1 K 8/49 (2006.01)	A 6 1 K 7/00 D	4 C O 8 6
A 6 1 K 8/00 (2006.01)	A 6 1 K 7/16	4 F O 5 6
A 6 1 Q 11/00 (2006.01)	A 6 1 K 31/53	4 H O 0 3
	審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 32 頁) 最終頁に続く	

(21) 出願番号 特願2004-525277 (P2004-525277)
 (86) (22) 出願日 平成15年7月22日 (2003. 7. 22)
 (85) 翻訳文提出日 平成17年1月26日 (2005. 1. 26)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2003/007975
 (87) 国際公開番号 W02004/013124
 (87) 国際公開日 平成16年2月12日 (2004. 2. 12)
 (31) 優先権主張番号 02405669. 9
 (32) 優先日 平成14年7月31日 (2002. 7. 31)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(71) 出願人 396023948
 チバ スペシャルティ ケミカルズ ホールディング インコーポレーテッド
 Ciba Specialty Chemicals Holding Inc.
 スイス国, 4057 バーゼル, クリベツクシュトラーセ 141
 (74) 代理人 100068618
 弁理士 粁 経夫
 (74) 代理人 100104145
 弁理士 宮崎 嘉夫
 (74) 代理人 100080908
 弁理士 館石 光雄
 (74) 代理人 100093193
 弁理士 中村 壽夫

最終頁に続く

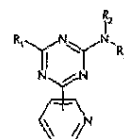
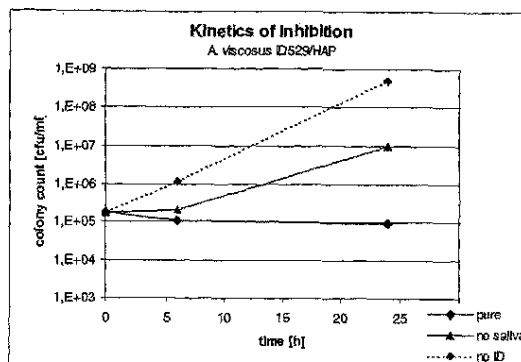
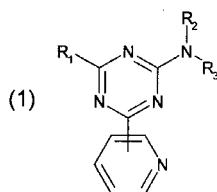
(54) 【発明の名称】 殺微生物活性物質としてのピリジントリアジン誘導体

(57) 【要約】

【課題】 殺微生物活性物質としてのトリアジン誘導体を提供する。

【解決手段】 次式(1)

【化1】



(1)

[式中、

R₁は炭素原子数1ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基

、または炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基を表し、

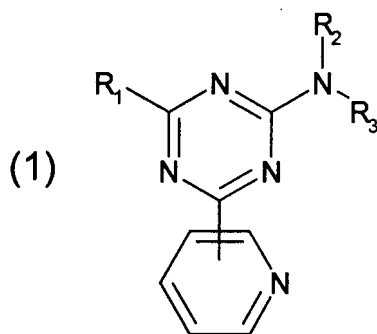
R₂は水素原子、炭素原子数1ないし20のアルキル基、または炭素原子数3ないし7の

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式 (1)

【化 1】



10

[式中、

R₁は炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル基、または炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル基を表し、

R₂は水素原子、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル基、または炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル基を表し、

20

R₃は水素原子、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル - カルボニル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル - カルボニル基、炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル - カルボニル基、またはフェニルカルボニル基を表す。]で表される化合物。

【請求項 2】

R₁は炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基を表し、R₂は水素原子を表し、R₃は炭素原子数 6 ないし 20 のアルキル基、炭素原子数 2 ないし 6 のアルキル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル - カルボニル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル - カルボニル基、または炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル - カルボニル基を表すところの、請求項 1 に記載の化合物。

30

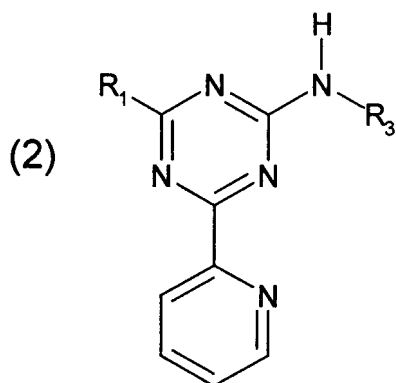
【請求項 3】

R₁は炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基を表し、R₂は水素原子を表し、R₃は炭素原子数 2 ないし 6 のアルキル基、炭素原子数 1 ないし 12 のパーフルオロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 12 のアルキル - カルボニル基、または炭素原子数 1 ないし 12 のパーフルオロアルキル - カルボニル基を表すところの、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

次式 (2)

【化 2】



10

[式中、

R₁は炭素原子数1ないし4のアルキル基を表し、

R₃は炭素原子数6ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基、炭素原子数1ないし20のアルキル-カルボニル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル-カルボニル基、または炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル-カルボニル基を表す。]に対応するところの、請求項1に記載の化合物。

20

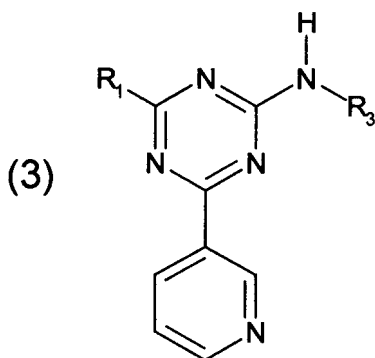
【請求項5】

R₁は第三ブチル基を表し、R₃は炭素原子数6ないし20のアルキル基、特にオクチル基を表すところの、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

次式(3)

【化 3】



30

[式中、

R₁は炭素原子数1ないし4のアルキル基を表し、

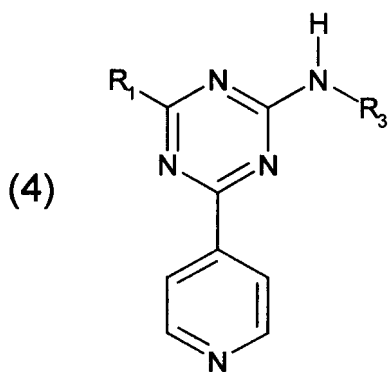
R₃は炭素原子数6ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基、炭素原子数1ないし20のアルキル-カルボニル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル-カルボニル基、または炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル-カルボニル基を表す。]に対応するところの、請求項1に記載の化合物。

40

【請求項7】

次式(4)

【化 4】



10

[式中、

R_1 は炭素原子数1ないし4のアルキル基を表し、

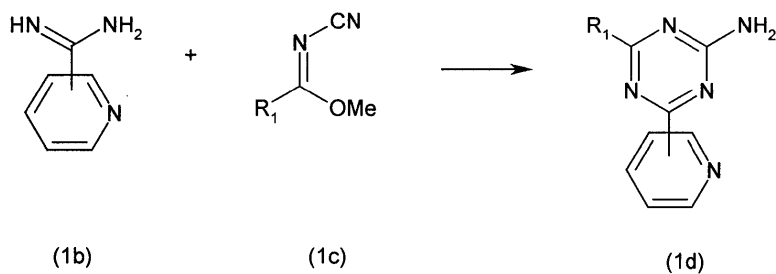
R_3 は炭素原子数6ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基、炭素原子数1ないし20のアルキル-カルボニル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル-カルボニル基、または炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル-カルボニル基を表す。]に対応するところの、請求項1に記載の化合物。

20

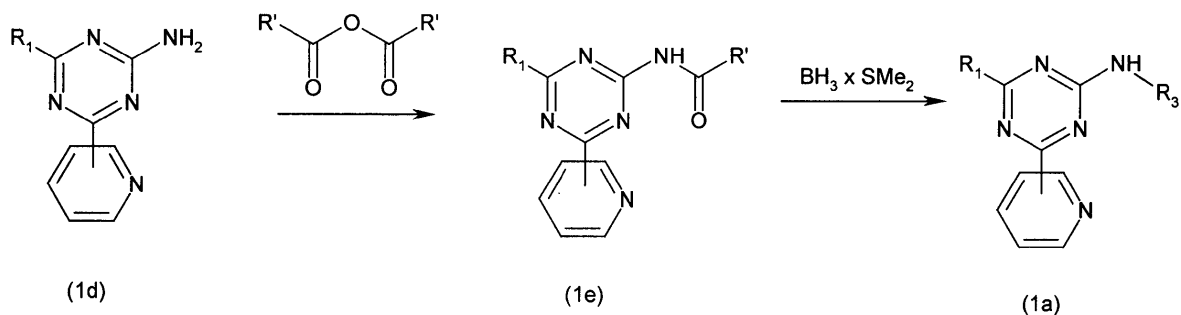
【請求項 8】

下記の反応式に従い、次式(1b)で表されるアミジンに、次式(1c)で表されるシアノイミデートを縮合することにより、次式(1d)で表されるアミノトリアジンを生成し、後者の化合物をアシル化し、その後、得られた次式(1e)で表されるN-アシルアミノトリアジンを還元することにより、次式(1a)で表される化合物を生成することからなる請求項1に記載の次式(1a)で表される化合物の製造方法。

【化 5】



30



40

[式中、

R_1 は炭素原子数1ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基、または炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基を表し、

50

R₃は水素原子、炭素原子数1ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基、炭素原子数1ないし20のアルキル-カルボニル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル-カルボニル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル-カルボニル基、またはフェニルカルボニル基を表し、

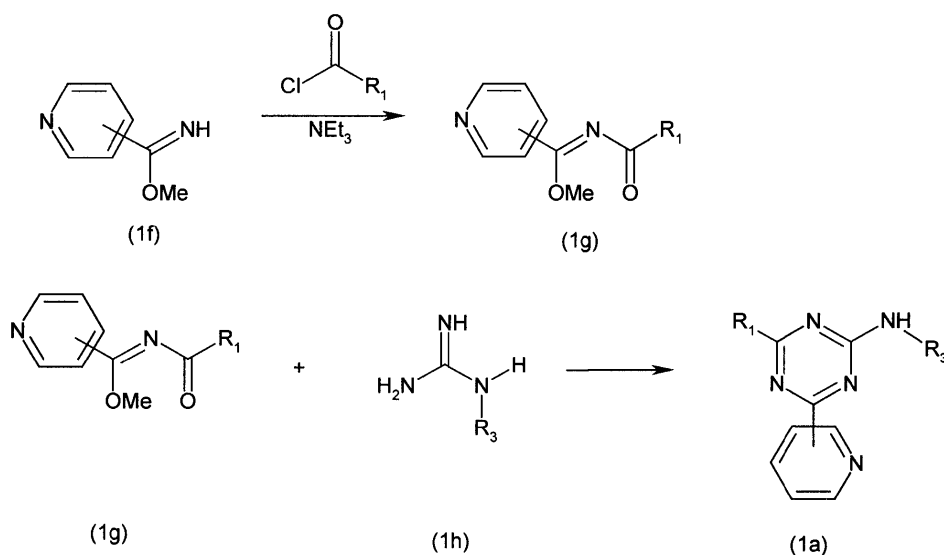
R'は炭素原子数1ないし4のアルキル基を表す。]

【請求項9】

下記の反応式に従い、次式(1f)で表されるピリジリイミノエステルをアシル化し、その結果得られる、次式(1g)で表されるN-アシルイミノエステルとモノ若しくはジ置換のグアニジンまたはそれらの塩とを不活性溶媒中反応させることにより、次式(1a)で表される化合物を生成することからなる請求項1に記載の次式(1a)で表される化合物の製造方法。

10

【化6】



20

30

【式中、R₁およびR₃は請求項aに記載と同様の意味を表す。】

【請求項10】

請求項1に記載の式(1)で表される化合物の、表面の抗菌処理への使用。

【請求項11】

式(1)で表される化合物が皮膚、口腔および他の粘膜、歯の表面並びに毛髪の抗菌処理、防臭及び消毒に使用される請求項10に記載の使用。

【請求項12】

式(1)で表される化合物が消毒及び防臭に使用される請求項11に記載の使用。

【請求項13】

式(1)で表される化合物の、織物繊維材料の処理への請求項10に記載の使用。

40

【請求項14】

式(1)で表される化合物の、保存への請求項10に記載の使用。

【請求項15】

式(1)で表される化合物の、洗浄用及び清浄用製剤への請求項10に記載の使用。

【請求項16】

式(1)で表される化合物の、プラスチック、紙、不織布、木材、または皮革への抗菌性の付与及び保存への請求項10に記載の使用。

【請求項17】

式(1)で表される化合物の、工業製品、特に、デンブンまたはセルロース誘導体の印刷

50

用増粘剤、表面被覆剤、及び塗料への抗菌性の付与及び保存への請求項 10 に記載の使用。

【請求項 18】

式(1)で表される化合物の、工業的プロセス、特に、紙処理における殺生剤としての請求項 10 に記載の使用。

【請求項 19】

式(1)で表される化合物の、バイオフィームへの浸透及びバイオフィームの除去、及び歯の表面及び口の粘膜へのバイオフィームの付着及び形成の防止への請求項 10 に記載の使用。

【請求項 20】

組成物の総質量に対して 0.01 ないし 15 質量%の、請求項 1 で定義された式(1)で表される化合物、及び化粧品に許容される補助剤を含有するパーソナルケア用配合物。

【請求項 21】

組成物の総質量に対して 0.01 ないし 15 質量%の、請求項 1 で定義された式(1)で表される化合物、及び口腔用的に許される補助剤を含有する口腔用組成物。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、殺微生物活性物質としてのピリジルトリアジン誘導体に関する。

20

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0002】

本発明は、選ばれた 2 - アルキル - 4 - アミノ - 6 - ピリジル - 1, 3, 5 - トリアジン誘導体、それらの化合物の製造方法、及び表面の抗菌処理におけるそれらの化合物の、グラム陽性及びグラム陰性菌、酵母並びにカビに対する抗菌活性物質としての使用、並びに化粧品、家庭用品、織物及びプラスチックの保存への使用、また、消毒薬への使用に関する。

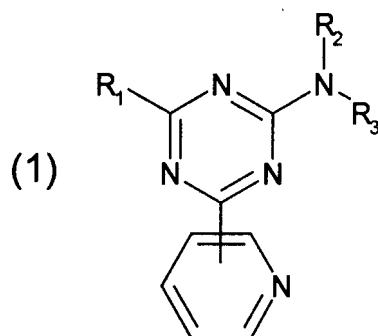
【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明に係る化合物は、次式(1)

30

【化 1】



40

[式中、

R₁は炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル基、または炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル基を表し、

R₂は水素原子、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル基、または炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル基を表し、

R₃は水素原子、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロ

50

アルキル基、炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル - カルボニル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル - カルボニル基、炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル - カルボニル基、またはフェニルカルボニル基を表す。]に対応するものである。

【発明を実施するための最良の形態】

【0004】

炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル基は、直鎖または分岐したアルキル基であり、例えば、メチル基、エチル基、n - プロピル基、イソプロピル基、n - ブチル基、第二ブチル基、第三ブチル基、アミル基、イソアミル基、第三アミル基、ヘキシル基、2 - エチルヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、イソオクチル基、ノニル基、デシル基、ウンデシル基、ドデシル基、テトラデシル基、ペンタデシル基、ヘキサデシル基、ヘプタデシル基、オクタデシル基、またはエイコシル基等である。

10

【0005】

炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル基は、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘプチル基、および特にシクロヘキシル基である。

それらの基は、例えば、1 個またはそれ以上の同一または異なる炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基、特に、メチル基及び / または水酸基で置換されているがよい。

シクロアルキル基が 1 個またはそれ以上の置換基で置換される場合、それらは、1, 2 または 4 個、特に 1 または 2 個の同一または異なる置換基により置換されていることが好ましい。

20

【0006】

本発明は、好ましくは、式 (1) [式中、 R_1 は炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基を表し、 R_2 は水素原子を表し、 R_3 は炭素原子数 6 ないし 20 のアルキル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキル - カルボニル基、炭素原子数 3 ないし 7 のシクロアルキル - カルボニル基、または炭素原子数 1 ないし 20 のパーフルオロアルキル - カルボニル基を表す。] で表される化合物に関する。

【0007】

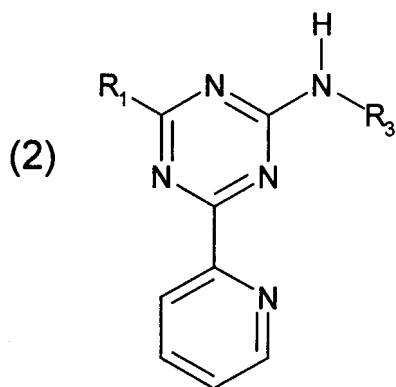
特に好ましいものとしては、式 (1) [式中、 R_1 は炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基を表し、 R_2 は水素原子を表し、 R_3 は炭素原子数 2 ないし 6 のアルキル基、炭素原子数 1 ないし 12 のパーフルオロアルキル基、炭素原子数 1 ないし 12 のアルキル - カルボニル基、または炭素原子数 1 ないし 12 のパーフルオロアルキル - カルボニル基を表す。] で表される化合物である。

30

【0008】

特に好ましいものは、次式 (2)

【化 2】



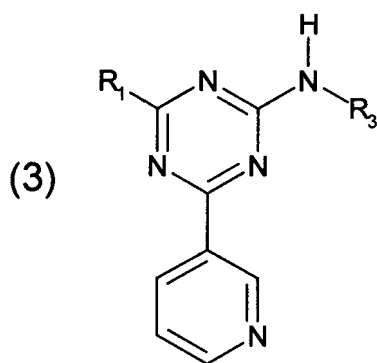
40

[式中、 R_1 は炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基、特にメチル基または第三ブチル基を

50

表し、 R_3 は炭素原子数6ないし20のアルキル基、炭素原子数2ないし6のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基、炭素原子数1ないし20のアルキル-カルボニル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル-カルボニル基、または炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル-カルボニル基を表す。]、又は次式(3)

【化3】

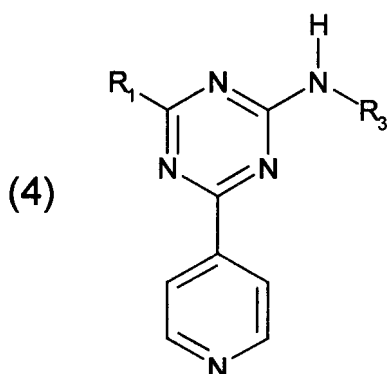


10

[式中、 R_1 は炭素原子数1ないし4のアルキル基、特にメチル基を表し、 R_3 は炭素原子数6ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基、炭素原子数1ないし20のアルキル-カルボニル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル-カルボニル基、または炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル-カルボニル基を表す。]、または次式(4)

20

【化4】



30

[式中、 R_1 は炭素原子数1ないし4のアルキル基、特に第三ブチル基を表し、 R_3 は炭素原子数6ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基、炭素原子数1ないし20のアルキル-カルボニル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル-カルボニル基、または炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル-カルボニル基を表す。]に対応する、本発明に従う化合物である。

40

【0009】

特に好ましいものは、式(2) [式中、 R_1 は第三ブチル基を表し、 R_3 は炭素原子数6ないし20のアルキル基、特にオクチル基を表す。]で表される化合物である。

【0010】

本発明に従うトリアジン誘導体の製造は、それ自体公知の製法を使用して行われ、基本構造に応じて以下に記載された1またはそれ以上の方法に従って行われる。

50

【0011】

R₁がメチル基を表す一般式(1)で表されるトリアジン類の合成は、好ましくは、以下のようにして行われる。

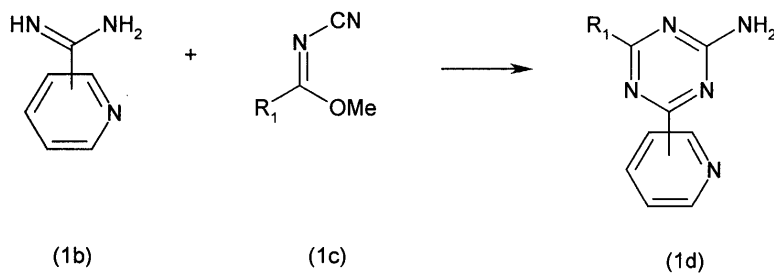
最初に、文献(例えば、Medwid, J. Med. Chem., 1990(33). 1230)から知られるピリジルアミジン類を、適当であればそれらの塩形態で、文献、例えば国際公開第00/14056号パンフレットに記載のデータに従って生成されるまたは市販で入手可能なシアノ-イミデート類、好ましくは、式(1c)で表されるシアノ-メチル-イミデート類と、不活性溶媒中、好ましくはメタノール中で、反応させることにより、式(1d)で表されるアミノ-メチル-トリアジン類を製造する。

後者の化合物はその後、文献(例えば、Beckwith, The Chemistry of Amides, Wiley, 1970(86))から知られる製法に従って、カルボン酸またはそれらの誘導体等、好ましくはカルボン酸無水物でアシル化することにより、式(1e)で表されるN-アシル-アミノ-トリアジン類を生成し、続いて、還元剤、例えば、水素、単純または複雑な金属水素化物、遷移金属またはそれらの塩等、しかし好ましくはボランを用いて還元することにより式(1a)で表されるN-アルキル-アミノ-トリアジン類を生成する。

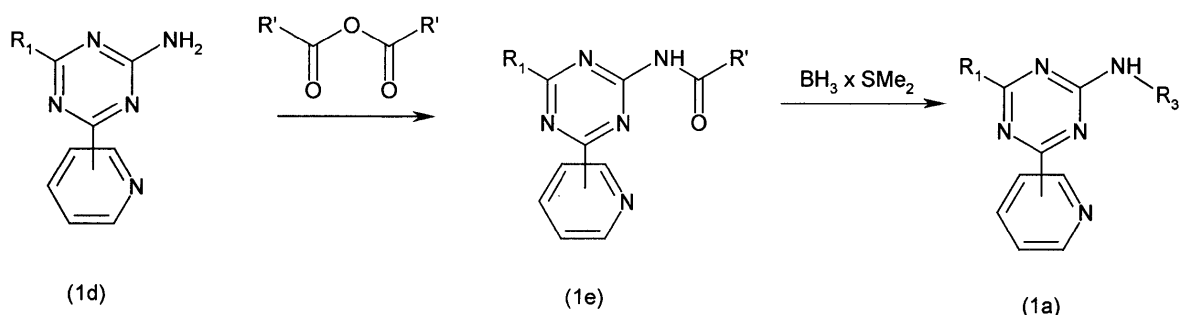
10

反応順序は以下の反応式で示され得る。

【化5】



20



30

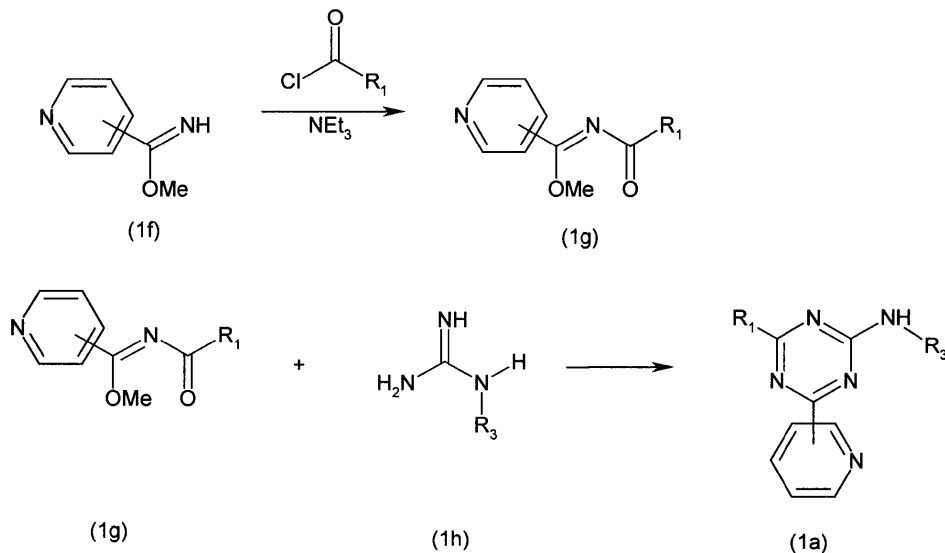
【0012】

他の方法において、2-アルキル-トリアジン類は、窒素原子がアシル化されたイミノエステル類と置換されたグアニジン類を縮合することにより製造することができる。

40

この目的を達成するために、文献に記載のデータに従って製造されるかまたは市販で入手可能な式(1f)で表されるピリジルイミノエステル類を従来の方法に従ってアシル化し、結果として得られる式(1g)で表されるN-アシル-イミノエステルを、モノまたはジ置換のグアニジンまたはそれらの塩と不活性溶媒中、好ましくはイソプロパノールまたは第三ブタノール中で反応させることにより、式(1a)で表されるピリジル-トリアジン類を生成する。

【化6】



10

【0013】

本発明はまた、本発明による2-アルキル-4-アミノ-6-ピリジル-1,3,5-トリアジン誘導体の製造方法に関する。 20

【0014】

本発明による式(1)で表されるトリアジン誘導体は、特にグラム陽性及びグラム陰性菌に対して、スキンプローラの細菌に対して並びに酵母及びカビに対してもまた、顕著な抗菌活性を示す。

それらは、従って、皮膚、粘膜及び外皮付属物(毛髪)の消毒、防臭並びに一般的な処理及び抗菌処理に特に適しており、とりわけ、手及び外傷の消毒に適している。

【0015】

それらは、従って、パーソナルケア用配合物、例えば、シャンプー、浴用添加剤、ヘアケア用配合物、液体及び固体石鹸(合成界面活性剤と飽和及び/または不飽和の脂肪酸の塩に基づく)、ローション及びクリーム、防臭剤、他の水性またはアルコール性溶液、例えば、皮膚用のクレンジング溶液、湿潤クレンジング・クロス、オイル、またはパウダー等における抗菌活性物質および保存料として適している。 30

【0016】

本発明は、従って、少なくとも1つの式(1)で表される化合物及び化粧品に許容される担体または補助剤を含有するパーソナルケア用配合物にも関する。

【0017】

本発明のパーソナルケア用配合物は、組成物の全質量に対して0.01ないし15質量%、好ましくは0.1ないし10質量%の式(1)で表される化合物及び化粧品に許容される補助剤を含む。 40

【0018】

パーソナルケア用配合物の形態に応じて、この配合物は、式(1)で表されるトリアジン誘導体に加えて、更なる成分、例えば、金属イオン封鎖剤、着色料、香油、増粘剤または凝固剤(粘度調節剤)、皮膚軟化剤、UV吸収剤、皮膚保護剤、抗酸化剤、ジカルボン酸及び/または炭素原子数14ないし22の脂肪酸のアルミニウム、亜鉛、カルシウム若しくはマグネシウム塩のような機械的特性を改善する添加剤、並びに所望により保存料を含む。

【0019】

本発明に従うパーソナルケア用配合物は、油中水型若しくは水中油型エマルジョン、アルコール性若しくはアルコール含有製剤、イオン性若しくは非イオン性両親媒性脂質の小 50

胞分散液、ゲル、固体スティックまたはエアロゾル製剤の形態であってよい。

油中水型または水中油型エマルジョンとして、化粧品として許容される補助剤は、好ましくは、5ないし50%の油相、5ないし20%の乳化剤及び30ないし90%の水を含む。

油相は、化粧品製剤に適切な任意の油、例えば、1種以上の炭化水素油、ロウ、天然油、シリコン油、脂肪酸エステルまたは脂肪族アルコールを含んでいてもよい。

好ましいモノまたはポリオールは、エタノール、イソプロパノール、プロピレングリコール、ヘキシレングリコール、グリセリン及びソルビトールである。

【0020】

本発明に従う化粧品製剤は、種々の分野において使用することができる。

10

例えば、特に、以下に示す配合物が考えられる。

・スキンケア用配合物、例えば、錠剤型若しくは液体石鹸、合成洗剤または洗浄ペーストの形態の皮膚洗浄及びクレンジング用配合物、

・浴用配合物、例えば、液体（泡風呂、ミルク、シャワー用配合物）または固形浴用配合物、例えば、バスキューブ及びバスソルト；

・スキンケア用配合物、例えば、皮膚用エマルジョン、多層エマルジョンまたは皮膚用オイル；

・化粧品パーソナルケア用配合物、例えば、デイクリームまたはパウダークリームの形態の顔用メイクアップ、フェイスパウダー（ルースまたは固形）、ルージュまたはクリームのメイクアップ、アイケア用配合物、例えば、アイシャドウ用配合物、マスカラ、アイライナー、アイクリームまたはアイフィックスクリーム；リップケア用配合物、例えば、口紅、リップグロス、リップ輪郭ペンシル、ネイルケア用配合物、例えば、マニキュア、マニキュア除光液、爪硬化剤または甘皮剥離剤；

20

・下着用衛生配合物、例えば、下着用洗浄ローションまたは下着用スプレー；

・フットケア用配合物、例えば、足浴、足用パウダー、フットクリームまたは足用バルサム、足専用防臭剤及び制汗薬またはたこ除去用配合物；

・サンミルク、ローション、クリーム若しくはオイル、日焼け止めまたはトロピカルオイルのような光保護用配合物、日焼け前用配合物または日焼け後用配合物；

・皮膚日焼け用配合物、例えば、セルフトanningクリーム；

・脱色用配合物、例えば、皮膚を漂白するための配合物または皮膚ライトニング用配合物；

30

・防虫剤、例えば、防虫オイル、ローション、スプレーまたはスティック；

・防臭性スプレー、ポンプ式スプレー、防臭性ゲル、スティックまたはロールオンのような防臭剤；

・制汗薬、例えば、制汗性スティック、クリームまたはロールオン；

・病んだ皮膚のクレンジング及び手入れ用配合物、例えば、合成洗剤（固体または液体）、ピーリング若しくはスクラブ用配合物またはピーリングマスク；

・薬品形態の除毛用配合物（脱毛）、例えば、除毛パウダー、液体除毛用配合物、クリーム若しくはペースト状除毛用配合物、ゲル状若しくはエアロゾル泡状の除毛用配合物；

・髭剃り用配合物、例えば、髭剃り用石鹸、発泡性シェービングクリーム、非発泡性シェービングクリーム、フォーム及びゲル、ドライシェービング用プレシェーブ配合物、アフターシェーブまたはアフターシェーブローション；

40

・芳香性配合物、例えば、香水（オーデオロン、オードトワレ、オードパルファム、パルファムドトワレ、香水）、香油または芳香クリーム；

・歯のケア、義歯のケア及び口腔のケア用配合物、例えば、練り歯磨き、ゲル状歯磨き、歯磨き粉、洗口濃縮液、抗プラーク性洗口液、義歯用洗浄剤または義歯用固定剤；

・化粧品毛髪用配合物、例えば、シャンプー及びコンディショナーの形態の毛髪洗浄用配合物、ヘアケア用配合物、例えば、前処理用配合物、ヘアートニック、スタイリングクリーム、スタイリングゲル、ポマード、ヘアーリンス、トリートメントパック、集中的ヘアートリートメント、毛髪構成化用配合物、例えば、パーマネントウェーブ用ヘアーウェー

50

ブ用配合物（ホットウェーブ、マイルドウェーブ、コールドウェーブ）、直毛化用配合物、液体ヘアセット用配合物、ヘアフォーム、ヘアスプレー、漂白用配合物、例えば、過酸化水素溶液、ライトニングシャンプー、漂白クリーム、漂白パウダー、漂白ペースト若しくはオイル、一時的、半永久性若しくは耐久性毛髪着色料、自己酸化性染料を含む配合物またはヘナ若しくはカモミールのような天然毛髪着色料。

【0021】

抗菌性石鹼は、例えば、下記の組成を有する：0.01ないし5質量%の式(1)で表される化合物、0.3ないし1質量%の二酸化チタン、1ないし10質量%のステアリン酸、100%までの石鹼基剤、例えば、獣脂脂肪酸若しくはココナツ脂肪酸のナトリウム塩またはグリセリン。

10

【0022】

シャンプーは、例えば、下記の下記の組成を有する：0.01ないし5質量%の式(1)で表される化合物、12.0質量%のラウレス-2-硫酸ナトリウム、4.0質量%のコカミドプロピルベタイン、3.0質量%のNaCl及び100%までの水。

【0023】

防臭剤は、例えば、下記の組成を有する：0.01ないし5質量%の式(1)で表される化合物、60質量%のエタノール、0.3質量%の香油及び100%までの水。

【0024】

本発明は、また、組成物の総質量に基づき、0.01ないし15質量%の式(1)で表される化合物及び口腔的に許容される補助剤を含む口腔用組成物に関する。

20

【0025】

口腔用組成物の例：10質量%のソルビトール、10質量%のグリセリン、15質量%のエタノール、15質量%のプロピレングリコール、0.5質量%のラウリル硫酸ナトリウム、0.25質量%のココイルメチルタウリンナトリウム、0.25質量%のポリオキシプロピレン/ポリオキシエチレンブロックコポリマー、0.10質量%のペパーミント香料、0.1ないし0.5質量%の式(1)で表される化合物、及び48.6質量%の水。

【0026】

本発明の口腔用組成物は、例えば、ゲル、ペースト、クリームまたは水性配合物（洗口液）の形態であってよい。

30

【0027】

本発明の口腔用組成物はまた、う蝕の形成に対して有効なフッ化物イオンを放出する化合物、例えば、無機フッ化物塩、例えば、フッ化ナトリウム、フッ化カリウム、フッ化アンモニウム若しくはフッ化カルシウム、または有機フッ化物塩、例えば、商標名オーラフルオール(Olafluor)で知られているアミンフッ化物を含んでいてよい。

【0028】

本発明の式(1)で表されるトリアジン誘導体はまた、織物繊維材料の処理、特に保存に適している。それらの材料は、未染色及び染色されたまたは印刷された繊維材料、例えば、絹、羊毛、ポリアミドまたはポリウレタン、及び特に、全ての種類のセルロース系繊維材料である。そのような繊維材料としては、セルロース及び再生セルロースのみならず、例えば、綿、リネン、黄麻及び麻のような天然セルロースも挙げられる。好適な織物繊維材料は、綿製のものである。

40

【0029】

本発明の式(1)で表される化合物であるトリアジン誘導体は、また、例えば、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリウレタン、ポリエステル、ポリアミド、ポリカーボネート、ラテックス等のプラスチック類の処理、特に抗菌特性の付与または保存のために適切である。従って使用分野は、例えば、床仕上げ剤、プラスチック被覆、プラスチック容器及び梱包材料；台所及び浴室用品（例えば、ブラシ、シャワーカーテン、スポンジ、バスマット）、ラテックス、フィルタ材料（エアー及びウォーターフィルタ）、医療分野で使用されるプラスチック製品、例えば、包帯材料、シリンジ、カテーテル等、いわゆる「医療

50

用具」、手袋及びマットレス。

【0030】

紙、例えば、衛生目的に使用される紙に、本発明の式(1)で表されるトリアジン誘導体を使用して、抗菌特性を付与してもよい。

【0031】

例えば、オムツ、生理用ナプキン、パンティーライナーのような不織布及び衛生用、家庭用布に本発明に従い抗菌特性を付与することも可能である。

【0032】

また、式(1)で表されるトリアジン誘導体は、例えば、液体若しくは粉末洗剤または軟化剤等の洗浄及び洗浄製剤に使用される。

10

【0033】

また、式(1)で表されるトリアジン誘導体は、特に、硬質表面を清浄及び消毒する家庭用及び汎用清浄剤に使用することができる。

【0034】

清浄用配合物は、例えば、下記の組成を有する：0.01ないし5質量%の式(1)で表される化合物、3.0質量%のオクチルアルコール4EO、1.3質量%の炭素原子数8ないし10の脂肪族アルコールポリグルコシド、3.0質量%のイソプロパノール、100%までの水。

【0035】

化粧品及び家庭用品の保存に加えて、工業生産品の保存、工業生産品への抗菌特性の付与及び工業工程における殺生剤としての使用も可能であり、例えば、紙処理において、特に紙処理液剤、デンプンまたはセルロース誘導体の印刷用増粘剤、表面被覆剤及び塗料が挙げられる。

20

【0036】

本発明の式(1)で表されるトリアジン誘導体は、また、木材の抗菌処理並びに皮革の抗菌処理、皮革の保存及び皮革への抗菌特性の付与のために適している。

【0037】

本発明の式(1)で表されるトリアジン誘導体は、また、化粧品及び家庭用品を微生物による損害から保護するのに適している。

【0038】

その一般的な抗菌作用に加えて、本発明の式(1)で表されるトリアジン誘導体は、さらに、生物及び非生物の表面におけるバイオフィームへの浸透、表面へのバクテリアの付着及び更なるバイオフィーム蓄積の防止、そのような蓄積の分離、及び/または生体マトリックスの中でバイオフィームを形成する微生物の更なる成長の阻害またはそのような微生物の殺傷に使用することができる。

30

【0039】

バイオフィームとは、ごく一般的に、例えばポリサッカライドの様な細胞外ポリマー状物質(EPSマトリックス)の形態でのそれらの代謝物と共に生物及び非生物表面へ付着する、生きている及び死んでいる微生物、特にバクテリアが凝集したものと理解されている。

40

通常、浮遊性細胞に対して顕著な成長阻害作用または致死作用を示す抗菌物質の活性は、例えば、活性化合物の生体マトリックス内への浸透が不十分であるため、バイオフィームとして組織化された微生物に対して大きく減弱する。

【0040】

本発明において、これは特に、発生した微生物またはそれらの代謝物の結果である口腔内における変性疾患、例えば、虫歯または歯周病の発現に重要な役割を演じているヒトの歯の表面及び口の粘膜のバイオフィームに関する。

【実施例】

【0041】

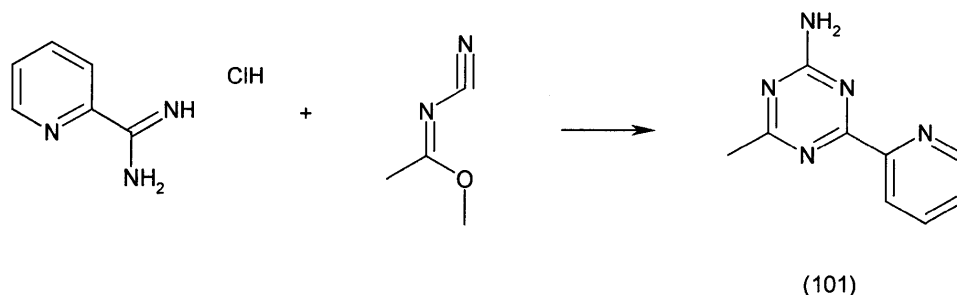
下記の実施例は本発明を説明するが、本発明を制限するものではない。

50

実施例 1 : 2 - アミノ - 4 - メチル - 6 - ピリド - 2 - イル - 1 , 3 , 5 - トリアジンの合成 :

反応式

【化 7】



10

メタノール 60 ml にナトリウムメトキシド 17.0 g (0.32 mol) を加えた溶液を、メタノール 240 ml にピリド - 2 - イルアミジン塩酸塩 50.0 g (0.32 mol) を加えた溶液へ室温下で滴下した。20 分間攪拌した後、ろ過を行い、その後ろ液をメチル - N - シアノエタンイミデート 31.4 g (0.32 mol) へ攪拌下滴下した。室温で 2 時間攪拌した後、0 に冷却し、続いて、沈殿物をろ取した。

式 (101) で表される化合物は、エタノールから再結晶して精製した。

20

収量 : 30.0 g (理論値の 50%)

【0042】

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$: 7.35-8.75(m, 4H, 芳香族水素), 6.00(s, 2H, NH_2), 2.50(s, 3H, CH_3)

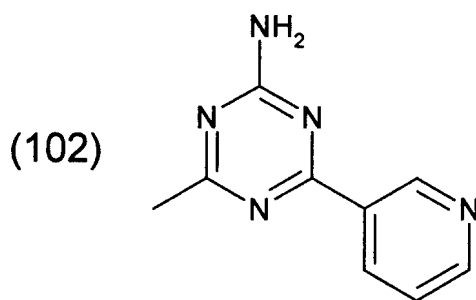
$^{13}\text{C NMR}(\text{CDCl}_3)$: 177.8 / 171.0 / 167.7 (トリアジン炭素), 153.9 / 150.4 / 137.7 / 126.4 / 124.6 (ピリジン炭素), 26.0(CH_3)

m/Z = 187(GC/MS)

【0043】

式 (102) で表される、類似の 3 - ピリジル誘導体を同様の方法で合成した。

【化 8】



30

【0044】

$^1\text{H NMR}(\text{DMSO}-d_6)$: 8.20-9.50(m, 4H, 芳香族水素), 8.15(s, 2H, NH_2), 2.45 (s, 3H, CH_3)

$^{13}\text{C NMR}(\text{DMSO}-d_6)$: 174.8 / 166.0 / 165.2 (トリアジン炭素), 145.3 / 144.1 / 142.3 / 133.8 / 127.6 (ピリジン炭素), 24.5(CH_3)

m/Z = 187(GC/MS)

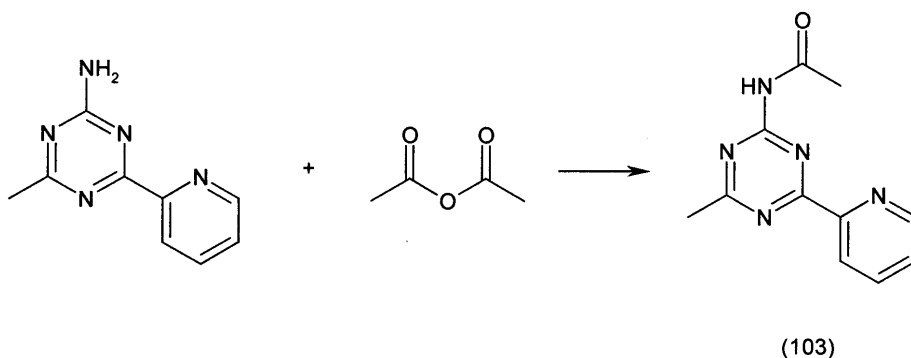
【0045】

実施例 2 : 2 - アセチルアミノ - 4 - メチル - 6 - ピリド - 2 - イル - 1 , 3 , 5 - トリアジンの合成 :

反応式

40

【化 9】



10

実施例 1 で合成した式 (1 0 2) で表される化合物 1 . 9 g (1 0 m m o l) を無水酢酸 5 m l に加え、1 0 0 で 1 2 時間攪拌した。濃縮後、残渣を塩化メチレンに取り、炭酸水素ナトリウム溶液で洗浄した。定量的に式 (1 0 3) で表される化合物が得られ、以降の反応に使用するのに十分な純度であった。(> 9 5 % G C)

【 0 0 4 6 】

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$: 7.41-8.81(m, 4H, 芳香族水素), 8.42(s, 1H, NH), 2.68(s, 3H, CH_3), 2.58(s, 3H, CH_3)

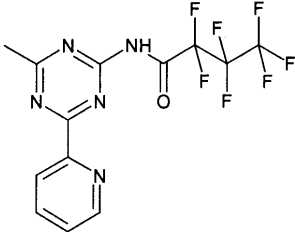
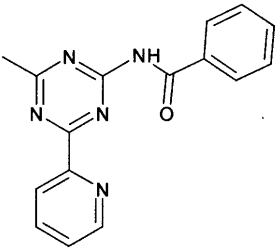
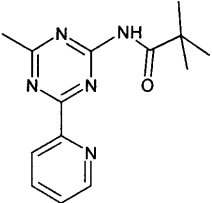
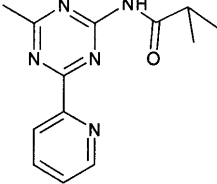
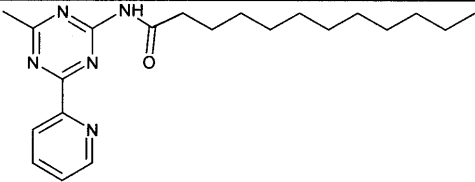
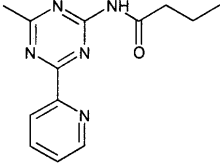
20

$^{13}\text{C NMR}(\text{CDCl}_3)$: 179.4 / 171.6 / 171.4 / 164.1 (トリアジン炭素/CO), 153.0 / 150.7 / 137.7 / 127.0 / 125.0 (ピリジン炭素), 26.5(CH_3), 26.2(CH_3)

【 0 0 4 7 】

同様にして、以下に示す N - アシルアミノ - トリアジン類を得た。(表 1) :

【表 1】

表 1 :			
化合物の式	構造	分析方法	純度 [% (FID)]
(104)		GC-MS	47
(105)		GC-MS	73
(106)		GC-MS	70
(107)		GC-MS	82
(108)		GC-MS	58
(109)		GC-MS	81

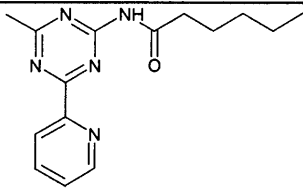
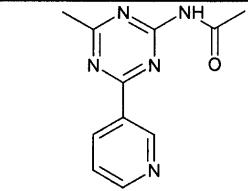
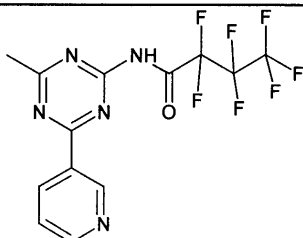
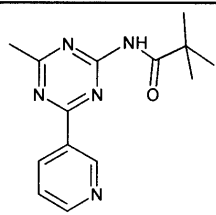
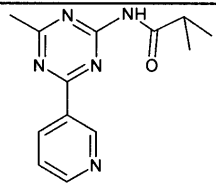
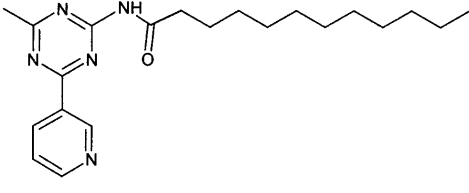
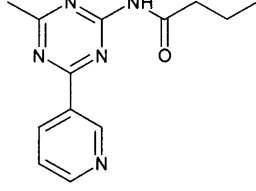
10

20

30

40

【表 2】

表 1 :			
化合物の式	構造	分析方法	純度 [% (FID)]
(110)		GC-MS	70
(111)		GC-MS	80
(112)		GC-MS/LC-MS	30
(113)		GC-MS	89
(114)		GC-MS	92
(115)		GC-MS	20
(116)		GC-MS	59

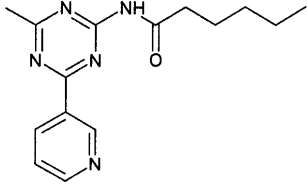
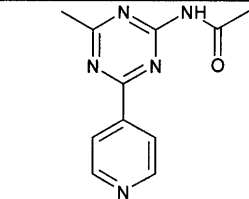
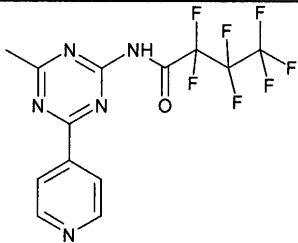
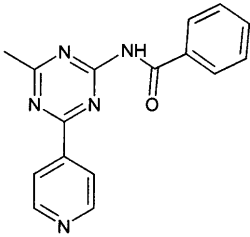
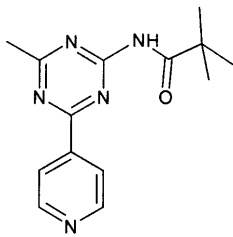
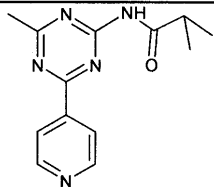
10

20

30

40

【表 3】

表 1 :			
化合物の式	構造	分析方法	純度 [% (FID)]
(117)		GC-MS	70
(118)		GC-MS	90
(119)		GC-MS	72
(120)		GC-MS	87
(121)		GC-MS	97
(122)		GC-MS	79

10

20

30

40

【表 4】

表 1 :			
化合物の式	構造	分析方法	純度 [% (FID)]
(123)		GC-MS	42
(124)		GC-MS	90
(125)		GC-MS	86
(126)		GC-MS	35

10

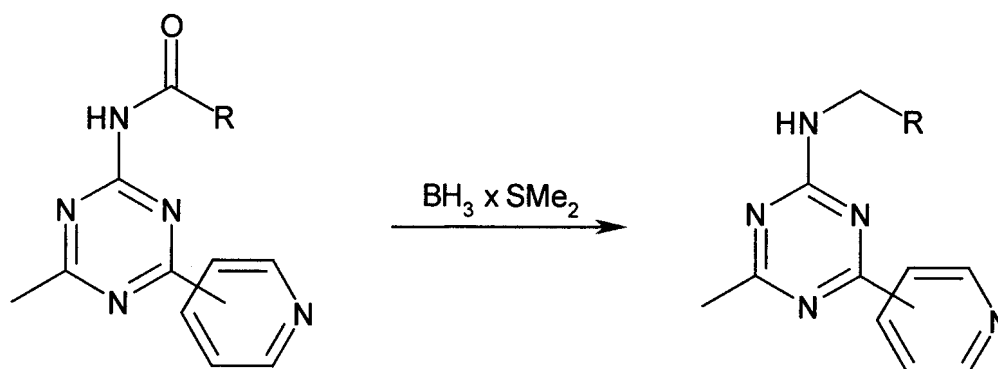
20

30

【 0 0 4 8 】

実施例 3 : 2 - アルキルアミノ - 4 - メチル - 6 - ピリジル - 1 , 3 , 5 - トリアジン類
の一般的合成

【化 1 0】

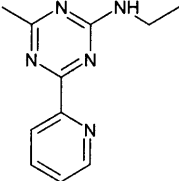
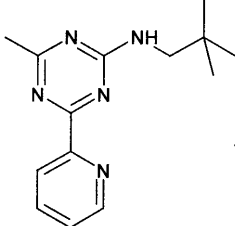
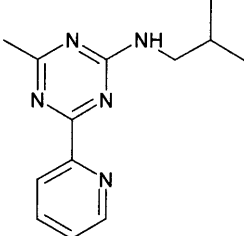
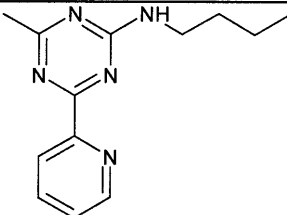
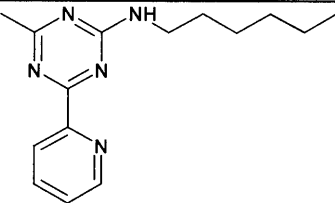
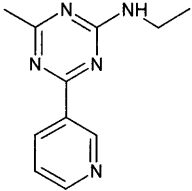


40

50

トルエン 1 ml に溶解したアシルアミノ - トリアジン 1 mmol に、0 で、化学量論量のボラン - ジメチルスルフィド錯体の 2 Mトルエン溶液を加え、4 時間加熱還流した。室温まで冷却し、反応溶液を 10 %炭酸ナトリウム溶液で処理し、乾燥及びエバポレーションによる濃縮を行った。反応生成物の同定は、GC / MS または LC / MS にて行い、それらの化合物は、更なる精製を行うことなく、微生物に対するスクリーニングに使用した。以下に示す化合物は、上記のやり方にて得た：

【表 5】

表 2			
化合物の式	構造	分析方法	純度 [% (FID)]
(127)		GC-MS	69
(128)		GC-MS	30
(129)		GC-MS	66
(130)		GC-MS	90
(131)		GC-MS	60
(132)		GC-MS	100

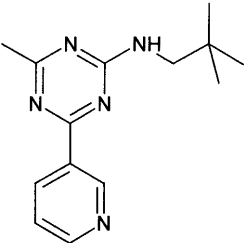
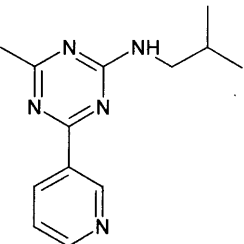
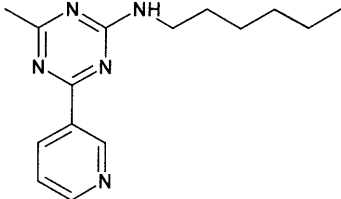
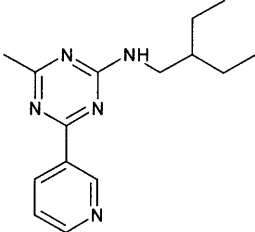
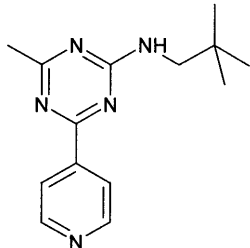
10

20

30

40

【表 6】

表 2			
化合物の式	構造	分析方法	純度 [% (FID)]
(133)		GC-MS	100
(134)		GC-MS	100
(135)		GC-MS	40
(136)		GC-MS	30
(137)		GC-MS	92

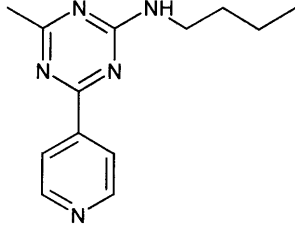
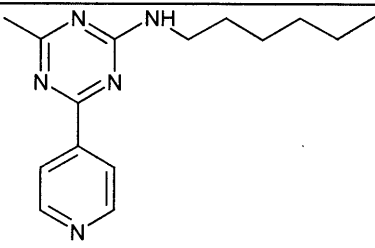
10

20

30

40

【表 7】

表 2			
化合物の式	構造	分析方法	純度 [% (FID)]
(138)		GC-MS	35
(139)		GC-MS	57

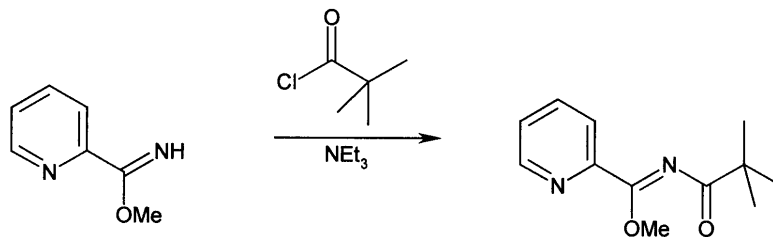
10

20

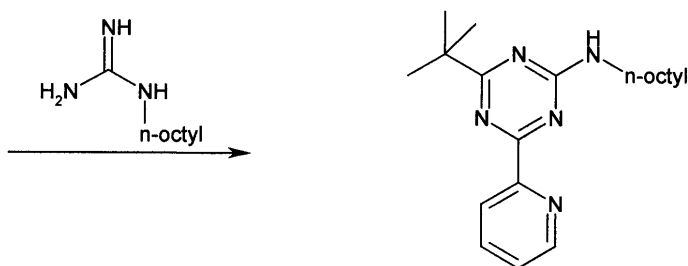
【 0 0 4 9 】

実施例 4 : 2 - 第三ブチル - 4 - n - オクチルアミノ - 6 - ピリド - 2 - イル - 1 , 3 , 5 - トリアジンの合成 (式 (1 4 0) で表される化合物)

【 化 1 1 】



30



(140)

40

トルエン 10 ml に塩化ピバロイル 2.60 g (21.5 mmol) を加えた溶液を、トルエン 30 ml に 2 - ピリジリイミドメチルエステル 2.66 g (19.5 mmol) 及び NEt_3 2.17 g (21.5 mmol) を加えた溶液に、0 でゆっくり加えた。

50

24時間室温で攪拌した後、ろ過し溶媒を取り除いた。残渣を第三ブタノール10mlに溶解し、第三ブタノール20mlにn-オクチルグアニジン6.61g(30mmol)を加えた溶液を加えた。24時間室温で反応させた後、溶媒を取り除き、式(140)で表される化合物をシリカゲルクロマトグラフィー(酢酸エチル/ヘキサン 9/1)にて精製した。

収量：5.1g(理論値の77%)

【0050】

¹H NMR(CDCl₃): 7.33-8.73(m, 4H, 芳香族水素), 5.79(s, 1H, NH), 1.54 (m, 2H, CH₂), 1.20-1.33 (m, 21H, CH₂/C(CH₃)₃), 0.81(t, 3H, CH₃)

¹³C NMR(CDCl₃): 186.3 / 169.7 / 166.8 (トリアジン炭素), 154.7 / 150.2 / 137.3 / 125.9 / 124.7 (ピリジン炭素), 39.7 / 29.2(C(CH₃)₃), 14.5(CH₃), 23.0-41.3(CH₂)
m/z = 341

【0051】

実施例5：寒天培地配合試験における最小阻止濃度(MIC)の決定(MICテスト)

培地：カゼイン/ソイミールペプトンアーガー(メルク社)

* サブロー4%グルコースアーガー(メルク社)

希釈剤：無菌0.85%NaCl溶液

試験生物：

スタフィロコッカス アウレウス(Staphylococcus aureus) ATCC 6538

スタフィロコッカス エピデルミディス(Staphylococcus epidermidis) ATCC 12228 20

コリネバクテリウム セロシス(Corynebacterium xerosis) ATCC 373

C. ミヌティシウム(C. minutissimum) ATCC 23348

プロピオニバクテリウム アクネス(Propionibacterium acnes) ATCC 6919

エシェリキア コリ(Escherichia coli) ATCC 10536

エシェリキア コリ(Escherichia coli) NCTC 8196

プロテウス ブルガリス(Proteus vulgaris) ATCC 6896

クレブシェラ ニューモニエ(Klebsiella pneumoniae) ATCC 4352

サルモネラ コレラエスイス(Salmonella choleraesuis) ATCC 9184

シュードモナス エルジノーサ(Pseudomonas aeruginosa) ATCC 15442

カンジダ アルビカンス(Candida albicans) ATCC 10231 30

アスペルギルス ニガー(Aspergillus niger) ATCC 6275

培養：37で24時間

* 28で3日間

試験溶液：全ての試験化合物の1%原液を適当な溶媒で作成し、最終濃度が1000ppmないし10ppmである希釈液系列を調製した。

試験方法：それぞれの希釈段階のもの0.3mlを、まだ液体状である培養媒体15mlと混合した。培養媒体が固化した後、それぞれの試験株の0.85%NaCl溶液による、適切な生物希釈液10μlを寒天培地にスポットした。

スタフィロコッカス アウレウス ATCC 6538 1 : 100

スタフィロコッカス エピデルミディス ATCC 12228 1 : 1000 40

コリネバクテリウム セロシス ATCC 373 1 : 1000

C. ミヌティシウム ATCC 23348 1 : 10 希釈液

プロピオニバクテリウム アクネス ATCC 6919 1 : 10 希釈液

【0052】

プレートは37で24時間培養(アスペルギルス ニガーは28で3日間)し、その後、増殖がもはや認められなくなる(MICに従って)試験物質の最高希釈液(最低濃度)を決定した。

【0053】

結果を表3及び表4に示した。

【表 8】

表 3: MIC値 [ppm]	
	式(140)で表される化合物
スタフィロコッカス アウレウス ATCC 6538	0.94
スタフィロコッカス エピデルミディス ATCC 12228	120
コリネバクテリウム セロシス ATCC 373	0.94
C. ミヌティシウム ATCC 23348	0.94
プロピオニバクテリウム アクネス ATCC 6919	0.94
エシェリキア コリ ATCC 10536	60
エシェリキア コリ NCTC 8196	60
プロテウス ブルガリス ATCC 6896	> 120
クレブシエラ ニューモニエ ATCC 4352	120
サルモネラ コレラエスイス ATCC 9184	120
シュードモナス エルジノーサ ATCC 15442	> 120
カンジダ アルビカンス ATCC 10231	> 120
アスペルギルス ニガー ATCC 6275	> 120

10

20

【表 9】

表 4: MIC値 [ppm]	
化合物の式	スタフィロコッカス アウレウス ATCC 6538
(123)	8
(131)	30
(135)	60

30

【0054】

実施例 6：ハイドロキシアパタイトにおける 2 - 第三ブチル - 4 - n - オクチルアミノ - 6 - ピリド - 2 - イル - 1, 3, 5 - トリアジン (140) の実用性の試験及び増殖阻害活性の決定

40

原理：ハイドロキシアパタイト板（直径 10 mm）を人工唾液（Deutsche Zeitschrift社 D ZZ 5/2002）で 4 時間処理し、NaCl 溶液で 4 回洗浄後、5 ppm の試験物質（140）のエタノール溶液中で 30 分間インキュベートした。該ディスクはそれからヌンクロン（Nunclon）表面滴定プレート（12 ウェル）に移し、アクチノマイセス ビスコサス（*Actinomyces viscosus*）ATCC 43146（約 10^5 / ml）を接種した CASO 培養媒体中、37 で 24 時間インキュベートした。

【0055】

結果：図 1 は、人工唾液でハイドロキシアパタイト板を前処理し試験物質を吸着させると

50

、試験物質（140）により、未処理のコントロールに比して、アクチノマイセス ビスコサスの増殖が阻害されることを示している。この実用性は、唾液の存在に依存する。

【0056】

実施例7：バイオフィームモデルにおける2-第三ブチル-4-n-オクチルアミノ-6-ピリド-2-イル-1,3,5-トリアジン（140）の活性試験

原理：Guggenheim 他. (2001), "Validation of an in vitro biofilm model of supragingival plaque", J. Dent Res. 80(1)参照

ハイドロキシアパタイト板を人間の唾液で前処理し、種々のグラム陽性及びグラム陰性の口腔微生物（連鎖球菌、アクチノマイセス種、ビルオネラ&フソバクテリウム種及びその他の種）並びに酵母（カンジダ アルビカンス）の混合培養物よりなるバイオフィームを該ハイドロキシアパタイト上で成長させた。4日間に及ぶこの試験の間に、該板は、該試験物質（0.5%（140））の適用製剤に数回浸された。最後に、該バイオフィームは採られ、生きた細胞数が決定された。

10

【0057】

結果：結果を表3に示した。トリアジン化合物は、活性物質を含まないプラセボ製剤及び10%エタノールを含むコントロールと比較して、ハイドロキシアパタイト上のバイオフィームにおける明確な微生物数の減少を起こした。同様の活性を示さない比較物質も試験した。

【表10】

20

表3:				
サンプル	コントロール (10%エタノール)	比較物質	式(140)の製剤	プラセボ製剤
(平均値) [CFU/ディスク]	4.9×10^8	1.6×10^7	1.1×10^5	1.4×10^7

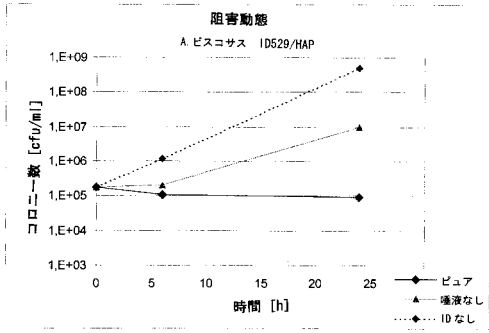
【図面の簡単な説明】

【0058】

30

【図1】人工唾液でハイドロキシアパタイト板を前処理し試験物質を吸着させると、試験物質（140）により、未処理のコントロールに比して、アクチノマイセス ビスコサスの増殖が阻害されることを示している。

【図 1】



【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No PCT/EP 03/07975
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 C07D401/04 A01N43/66		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07D		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, PAJ, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 407 899 A (HOECHST AG) 16 January 1991 (1991-01-16) * see claim 1 and page 4, lines 36 - 38 * the whole document	1-21
Y	EP 0 515 942 A (BAYER AG) 2 December 1992 (1992-12-02) * see claim 1, definition of R4 = Amino, R1-R3 and R5 = H * the whole document	1-21
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 016, no. 140 (C-0926), 8 April 1992 (1992-04-08) & JP 04 001192 A (NISSAN CHEM IND LTD), 6 January 1992 (1992-01-06) abstract	1-21
--- -/--		
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C.		<input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.
* Special categories of cited documents :		
A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		*T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. *&* document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search 30 October 2003		Date of mailing of the international search report 13/11/2003
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016		Authorized officer Stellmach, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

 International Application No
 PCT/EP 03/07975

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 98 57957 A (FURUSAWA HIROYUKI ;MORIMOTO KATSUSHI (JP); NISSAN CHEMICAL IND LTD) 23 December 1998 (1998-12-23) * see the definition of X,Y W and L * the whole document ---	1-21
Y	WO 02 053560 A (CEDERBAUM FREDRIK ;EBERLE MARTIN (CH); ACKERMANN PETER (CH); ZIEGL) 11 July 2002 (2002-07-11) * see the claims * the whole document -----	1-21

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

 International Application No
 PCT/EP 03/07975

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0407899	A	16-01-1991	DE 3922735 A1	24-01-1991
			DE 59008571 D1	06-04-1995
			EP 0407899 A2	16-01-1991
			HU 54280 A2	28-02-1991
			PT 94645 A ,B	20-03-1991
			US 5250530 A	05-10-1993
EP 0515942	A	02-12-1992	DE 4117560 A1	03-12-1992
			EP 0515942 A1	02-12-1992
			JP 5178707 A	20-07-1993
			NO 921907 A	30-11-1992
JP 04001192	A	06-01-1992	NONE	
WO 9857957	A	23-12-1998	AU 8033598 A	04-01-1999
			WO 9857957 A1	23-12-1998
WO 02053560	A	11-07-2002	CA 2428604 A1	11-07-2002
			EP 1349849 A1	08-10-2003
			WO 02053560 A1	11-07-2002

フロントページの続き

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 K 31/53 (2006.01)	A 6 1 P 17/00 1 0 1	4 H 0 1 1
A 6 1 P 17/00 (2006.01)	A 6 1 P 31/04	4 J 0 3 8
A 6 1 P 31/04 (2006.01)	C 0 9 D 5/14	4 J 0 3 9
C 0 9 D 5/14 (2006.01)	C 0 9 D 7/12	4 L 0 3 3
C 0 9 D 7/12 (2006.01)	C 0 9 D 11/02	4 L 0 5 5
C 0 9 D 11/02 (2006.01)	C 0 9 D 101/08	
C 0 9 D 101/08 (2006.01)	C 0 9 D 103/02	
C 0 9 D 103/02 (2006.01)	C 1 4 C 9/00	
C 1 4 C 9/00 (2006.01)	D 0 6 M 13/358	
D 0 6 M 13/358 (2006.01)	D 2 1 H 19/10 A	
D 2 1 H 19/10 (2006.01)	D 2 1 H 21/36	
D 2 1 H 21/36 (2006.01)	C 1 1 D 3/48	
C 1 1 D 3/48 (2006.01)		

(81) 指定国 AP(GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(74) 代理人 100104385

弁理士 加藤 勉

(74) 代理人 100109690

弁理士 小野塚 薫

(74) 代理人 100131266

弁理士 高 昌宏

(74) 代理人 100093414

弁理士 村越 祐輔

(74) 代理人 100131141

弁理士 小宮 知明

(72) 発明者 ヴェルナー ヘルツル

フランス国, 6 8 4 4 0 エッシェンツヴィラー, リュドウルアルジャン 4

(72) 発明者 ガブルエレ アイハッケル

ドイツ連邦共和国, 7 9 5 9 1 エイメルジンゲン, アルテ バスレルシュトラッセ 8

(72) 発明者 アンドレア プレウス

スイス国, 4 0 5 3 バーゼル, ホーホシュトラッセ 3 5

F ターム(参考) 4C063 AA01 BB01 CC43 DD12 EE01 EE10

4C083 AC851 AC852 CC01 CC02 CC41 EE18 EE34

4C086 AA01 AA02 AA03 AA04 BC64 GA07 GA08 MA01 MA04 NA14

ZA67 ZA89 ZA92 ZB35

4F056 AA01 CC10 CC54 CC80 FF01 FF18

4H003 EB20 FA34

4H011 AA01 BB09 DA13 DD07

4J038 BA021 BA111 JB36 KA07 NA26

4J039 AB01 AB02 BC33 BC50 BC52 BE19 BE23

4L033 AB07 AC10 BA58

4L055 AG35 AG39 AH21 BE08 BE10 EA30 FA20 GA27 GA29

【要約の続き】

シクロアルキル基を表し、

R₃は水素原子、炭素原子数1ないし20のアルキル基、炭素原子数3ないし7のシクロ

アルキル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル基、炭素原子数1ないし20のアルキル-カルボニル基、炭素原子数3ないし7のシクロアルキル-カルボニル基、炭素原子数1ないし20のパーフルオロアルキル-カルボニル基、またはフェニルカルボニル基を表す。]で表される化合物、それらの化合物のグラム陽性及びグラム陰性菌、酵

母並びにカビに対する顕著な効果及び人の歯の表面及び口腔の粘膜におけるバイオフィルムの防止または処理。