

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
IPC分類：

A6
B6

本案已向：

國(地區) 申請專利, 申請日期: 案號: , 有 無主張優先權
 法 1999.01.27 9900882

有關微生物已寄存於: , 寄存日期: , 寄存號碼:

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明 (/)

發明內容：

本發明係關於至少一種含苯脒片斷之化合物的用途，其係用於局部美容用組成物中或用來製造局部皮膚用組成物，這些組成物係用來脫色素及/或漂白人類皮膚、體毛或頭髮。

人類膚色取決於各種不同的因素，特別是一年中的季節、種族和性別，而且主要係由黑色素細胞所製造之黑色素的性質和濃度來決定。黑色素細胞為特型 (specialized) 細胞，其經由特定胞器 (黑素體) 來合成黑色素。除此之外，在生命中的不同時期，某些個體的皮膚 (尤其是手上) 會發展出較深及/或較有色的斑點，而使皮膚不均勻。這些斑點亦因為位於皮膚表面之角質細胞中有大量濃度的黑色素所致。

同樣的，體毛和頭髮的顏色也是因為黑色素，而且當體毛或頭髮為深色時，某些個體希望能使它們淺一點。這對體毛特別適合，當其變淺之後比較看不出來。

最常用來作為脫色素劑的物質特定來說是氫醌及其衍生物，尤其是其醌類，如氫醌單甲基醚和單乙基醚。不幸地，雖然這些化合物有某種程度的效用，但由於其毒性之故難免會有副作用，使得它們在使用上有問題或甚至有危險。這種毒性起因於一個事實，亦即它們藉由殺死細胞而介入黑色素生成的基本機制，進而產生擾亂其生物環境的風險，因此強迫皮膚藉由產生毒素來除去它們。

氫醌是一種對黑色素細胞特別刺激且有細胞毒性的化

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (2)

合物，因此已經有許多作者構思其全部或部分的取代物。

最特別需要的是使用具良好效用之無害局部脫色素物質，以便處理因黑色素細胞過度活動所造成的區域性過度色素沈澱，例如在懷孕期間或在雌性激素產生的(oestrogenic)避孕期間發生的自發性黑皮病（懷孕期間者為”孕斑”或黃褐斑）；因過度活動和良性黑色素細胞擴散所引起的局部過度色素沈澱，如所知的光化性雀斑、意外性過度色素沈澱或脫色素等衰老色素沈澱之斑點，其可能是因為感光作用或因為傷害後的傷疤癒合所造成；以及某些白斑，如白斑病。對於最後的色素沈澱情況（可能是傷疤癒合造成疤痕而使皮膚有較白的外觀以及白斑），由於失去對受損皮膚再形成色素的能力，最後所採納的方法就是對剩下的正常皮膚部位進行脫色素，以便使整片皮膚為均勻的白色調。

因此，需要一種新穎試劑來漂白人類皮膚、體毛及/或頭髮，其作用和已知試劑同樣有效，但沒有它們的缺點，亦即對皮膚不刺激、無毒性及/或不過敏，且在組成物中很安定。

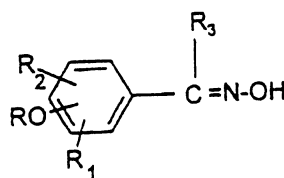
本申請者意外地發現到，含苯肼片斷之化合物即使在低濃度下仍具有脫色素的活性，而未顯示出任何細胞毒性。

這些化合物有些經說明可作為防光（photoprotective）化合物，其係針對保護皮膚對抗光引起的老化和太陽曬斑（WO 95/01157）；可作為治療癌症之口服組成物中的酪

五、發明說明 (3)

胺酸酶抑制劑 (其係與干擾素混合) (US-4 762 705) ; 或在抗發炎組成物中作為脂肪氧化酵素 (lipoxygenase) 抑制劑 (US-4 816 487) 。然而, 就申請者所知, 尚未有人建議使用它們作為脫色素劑或用於脫色素組成物中。

因此本發明之一目的為至少一種下式 (I) 之化合物用於脫色素及/或漂白人類皮膚、體毛或頭髮之美容用組成物中的用途, 該組成物包含美容上可接受的媒質且係局部施用於皮膚及/或其表體增生物:



(I)

其中:

• R 代表一種選自下列的基團:

- 氫原子;
- 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基, 視需要可經一或多個羥官能基經基化;

- 芳基, 其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代:

- OH; -NH₂; -COOH; -NO₂; -OR₅ 且 $R_5 = C_1-C_{24}$ 烷基;
- COOR₆ 且 $R_6 = C_1-C_{24}$ 烷基; -NR₇R₈ 且 $R_7 = H$ 或 C_1-C_{24} 烷基, $R_8 = H$ 或 C_1-C_{24} 烷基;

- -COR₉ 基團, R_9 代表一種直鏈、支鏈或環狀之飽和

五、發明說明 (4)

或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；或一種芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代： $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR_5$ 、 $-COOR_6$ 、及 $-NR_7R_8$ ，其中 R_5 、 R_6 、 R_7 及 R_8 之定義同上；

- R_1 和 R_2 ，可代表相同或不同的基團，其係選自：

- 氫原子；

- 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；

- 芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代： $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR_5$ 、 $-COOR_6$ 及 $-NR_7R_8$ ，其中 R_5 、 R_6 、 R_7 及 R_8 之定義同上；

- 選自下列的基團： $-OH$ ； $-OQ_1$ ； $-COQ_2$ ； $-COOQ_3$ ； $-NQ_4Q_5$ ； $-CONQ_6Q_7$ ； $-SQ_8$ ； $-CH_2OQ_9$ ； Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 、 Q_5 、 Q_6 、 Q_7 、 Q_8 及 Q_9 可相同或不同且係選自：氫原子；直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；或芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代： $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR_5$ 、 $-COOR_6$ 、及 $-NR_7R_8$ ，其中 R_5 、 R_6 、 R_7 及 R_8 之定義同上；以及

- 胺基酸殘基及環狀或非環狀碳水化合物殘基；

- R_3 代表一種選自下列的基團：

- 氫原子；

- 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；以及

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明 (5)

- 芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代： $-OH$ 、 NH_2 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR_5$ 、 $-COOR_6$ 、及 $-NR_7R_8$ ，其中 R_5 、 R_6 、 R_7 及 R_8 之定義同上。

本發明之目的亦為使用至少一種上式 (I) 之化合物來製造皮膚用組成物，該組成物係用來脫色素及/或漂白人類皮膚及/或從皮膚上除去色素沈澱斑點及/或脫去體毛及/或頭髮的色素，其包含皮膚上可接受的媒質且係局部施用於皮膚及/或其表體增生物。

這些化合物有容易取得的優點。特別可由胥 (hydroxylamine) 與一種醛 (乙醛肟) 或一種酮 (酮肟) 反應而得到之。視需要得以縮醛形式來使用羰基試劑。

在含 1 至 24 個碳原子之直鏈飽和烷基當中，可特別提及者有：甲基、乙基、丙基、丁基、己基、辛基、壬基、十二烷基、十六烷基、二十二烷基及十八烷基。

在含 1 至 24 個碳原子之支鏈飽和烷基當中，可特別提及者有：異丙基、第三丁基、2-乙基己基、2-丁基辛基及 2-己基癸基。

在不飽和烷基當中，可更特定提及者為烯丙基。

當烷基為環狀者，可特別提及者有：環己基、膽硬脂基或第三丁基環己基。

根據一較佳具體實施例，本發明之式 (I) 化合物為遵守至少一項下列條件者：

- $R = H$ 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基，
- OR 係在相對於亞胺官能基之鄰位或對位的位置，

五、發明說明 (6)

- $R_1 = R_2 = H$ 或 OH 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基，
- $R_3 = H$ 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基。

根據一特佳具體實施例，本發明之式 (I) 化合物為遵守至少一項下列條件者：

- $R = H$ ，
- OR 係在相對於亞胺官能基之鄰位或對位的位置，
- $R_1 = R_2 = H$ ，

R_3 為一種含 1 至 6 個碳原子之烷基，較佳為甲基。

較佳之式 (I) 化合物為對羥基乙醯苯胺。

相對於先前技藝中已知作為脫色素劑的化合物，式 (I) 之化合物具有更有效的優點，如以下試驗所示者。

根據本發明之組成物適合局部使用，也因此包含美容上或皮膚科可接受的媒質，亦即相容於皮膚、體毛或頭髮的媒質。

無庸多言，式 (I) 之衍生物在根據本發明組成物中的量係取決於所需效果，因此變化範圍很廣。最好，式 (I) 之衍生物 (群) 存在於組成物中的量為組成物總重量之 0.001 至 10%，且較佳為 0.005 至 5%。

本發明之組成物可以是任何正常用於局部施用的藥物形式，特別是水溶液、水-醇溶液或含油溶液，油溶於水或水溶於油或多重的乳狀液，水性或油性凝膠，液狀、糊狀或固狀無水產物，油在水相的分散體 (以小球體 (spherules) 輔助)，這些小球體可為聚合物毫微粒子 (nanoparticles)，如毫微球體 (nanospheres) 及毫微膠囊

五、發明說明（ 7 ）

（nanocapsules），或更好的是離子及/或非離子型脂囊。

本組成物可多少具有流動性，且可具有白色或有色的乳霜、軟膏、乳液、化妝水、乳漿、糊狀物或慕絲等外觀。視需要可以煙霧劑形式將其施用於皮膚或頭髮上。其亦可為固體形式，例如棒狀物形式。其可用來作為保養品及/或作為化妝品。其亦可為洗髮精或潤髮乳的形式。

在一種已知方式中，本發明之組成物亦可包含化妝品和皮膚科中常見的輔助劑，例如親水性或親油性膠凝劑、親水性或親油性活性劑、保存劑、抗氧化劑、溶劑，香料、填充劑、防曬劑、顏料、氣味吸收劑及染料等。這些不同輔助劑的量為所考量領域中的習知用量，例如：佔組成物總重量之 0.01 至 20%。依據它們的性質，這些輔助劑可被送入脂肪相、水相、脂囊及/或毫微粒子中。

無庸多言，熟諳此技藝者會謹慎選擇這些選用之活性或非活性輔助劑，及/或其量，使根據本發明之化合物的有利性質不會（或實質上不會）因所構思之添加而有不利的影響。

當本發明之組成物為一種乳狀液時，相對於組成物總重量，脂肪相之比例範圍可從 5 至 80 重量%，且較佳從 5 至 50 重量%。用於乳狀液形式之本組成物中的油、乳化劑及輔助乳化劑等係選自習知用於所考量領域者。相對於組成物總重量，乳化劑與輔助乳化劑存在於組成物中的比例範圍係從 0.3 至 30 重量%，且較佳從 0.5 至 20 重量%。

作為可用於本發明之油者，可提及者有：礦物油（液

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明(8)

體石油膏)、植物油(鱷梨油、大豆油)、動物油(羊毛脂)、合成油(全氫角鯊烯(perhydrosqualene))、矽油(環甲矽氧烷(cyclomethicone))及氟化油(全氟聚醚)。亦可使用脂肪醇(鯨蠟醇)、脂肪酸及蠟(巴西棕櫚蠟、地蠟)等作為脂肪物質。

作為可用於本發明之乳化劑與輔助乳化劑者，可提及者有例如：聚乙二醇之脂肪酸酯，如 PEG-20 硬脂酸酯，及甘油之脂肪酸酯，如硬脂酸甘油酯。

作為親水性膠凝劑者，可特別提及者有：羧乙基聚合物(碳聚物(carbomer))、丙烯酸系共聚物(如丙烯酸酯/烷基丙烯酸酯共聚物)、聚丙烯醯胺、聚糖、天然樹膠及黏土，而作為親油性膠凝劑者，可提及者有：改性黏土(如皂土)、脂肪酸之金屬鹽類、疏水性矽石及聚乙烯。

可使用之活性劑特別有：多元醇、維他命、角質溶解劑及/或去鱗片劑、抗發炎劑、鎮靜劑(calmant)及其混合物。式(I)之化合物亦可混合其他脫色素劑，例如曲酸或氫醌及其衍生物，其使這些試劑可以較小計量使用。在不相容的情況下，可將這些活性劑及/或式(I)之化合物混入小球體，特別是離子或非離子囊泡及/或毫微粒子(毫微膠囊及/或毫微球體)中，以便在組成物中使它們彼此隔離。

在這些組成物中亦可使用親油性或親水性之 UV 遮蔽劑，例如：苯-1,4-雙(3-亞甲基-10-樟腦磺酸)、2-乙基己

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (9)

基 α - 氰基 - β, β - 二苯基 丙烯酸 或 氰 雙 苯 丙 烯 酸 辛 酯 (octocrylen)、丁基甲氧基二苯甲醯基甲烷、甲氧基肉桂酸辛酯及/或氧化鈦和氧化鋅。

現在以下列實施例為輔來說明本發明。所給濃度為重量百分比。

化合物之實施例：對羥基乙醯苯肱之製備

取 1.1 當量之鹽酸胍加至對羥基乙醯苯之吡啶溶液 (16% 稀釋度) 中。反應混合物維持在回流狀態直到起始之乙醯苯消失為止，然後將其倒入冰水中。用乙酸乙酯萃取該媒質。乾燥之後，有機相已除去，可得到定量上對應之肱。元素分析係依據結構而定。

試驗：

一項生物試驗可說明式 (I) 化合物的脫色素活性。

本試驗和本申請者所提申之專利 FR 2 734 825 以及由 R.Schmidt、P. Krien 和 M. Régnier 在分析生化 (Anal. Biochem., 235 (2), 113-18, (1996) 發表的文章中所說明的一項試驗相同。因此本試驗係在角質細胞與黑色素細胞之共同培養上進行。

對各試驗化合物測定 IC_{50} 值，其相當於觀察到有 50% 之黑色素生成抑制作用的微莫耳濃度 (μM)。

此外，為這些化合物分級代表它們最大的脫色素活性

:

等級 1：相對於控制組 (不含試驗化合物之相同實驗) 有 10 至 30% 之黑色素生成抑制作用。

五、發明說明 (11)

-聚丙烯醯胺/C ₁₃₋₁₄ 異鏈烷烴/ 月桂乙基 (laureth)	
-7 (Sepigel 305)	0.5%
-甘油	5%
-UV 遮蔽劑	7%
-保存劑	0.5%
-對羥基乙醯苯肼	0.5%
-軟化水	qs 100%

當每天施用時，所得之乳狀液可漂白皮膚。

實施例 2：處理流體

-二甘醇/CHDM/間 苯二甲酸酯/SIP 共聚物	2%
-甘油	5%
-杏樹油	14%
-環戊矽氧烷	6%
-保存劑	1%
-UV 遮蔽劑	7%
-對羥基乙醯苯肼	1%
-軟化水	qs100%

所得之流體可每天使用且能夠脫去皮膚色素。

實施例 3：處理凝膠

-甘油	5%
-----	----

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(12)

-丙烯酸酯/C₁₀-C₃₀ 烷基

丙烯酸酯共聚物

(Pemulen TR2) 0.5%

-保存劑 0.1%

-乙醇 5%

-UV 遮蔽劑 7%

-對羥基乙醯苯酚 1%

-水 qs100%

當用於色素沈澱斑點上時，所得之凝膠可使其變淡或使其完全消失。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

申請日期	89.1.15
案 號	89100587
類 別	A01K7/45, 7/06, 7/35

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書
新 型

一、發明 名稱	中 文	用於局部施用於皮膚及/或其表體增生物之含有至少一種含苯肟片斷化合物的組成物
	英 文	Composition for topical application to the skin and/or its superficial body growths, comprising at least one compound comprising a phenyloxime fragment
二、發明 創作人	姓 名	1.杜魯 雷米 2.菲利普 米歇爾
	國 籍	法 國
	住、居所	1.法國 75014 巴黎市,棕色大道 193 號 2.法國 91320 威蘇斯,皮耶及瑪莉居禮街 34 號
三、申請人	姓 名 (名稱)	歐萊雅公司
	國 籍	法 國
	住、居所 (事務所)	法國 75008 巴黎市,皇家路 14 號
	代 表 人 姓 名	克里斯多夫 安德拉

裝

訂

線

8/10/16 修正
補充
五、發明說明()

等級 2：相對於控制組（不含試驗化合物之相同實驗）有 30 至 60% 之黑色素生成抑制作用。

等級 3：相對於控制組（不含試驗化合物之相同實驗）有 60 至 100% 之黑色素生成抑制作用。

結果係對照於下表：

	濃度	等級
曲酸	500 μM	2
對羥基乙醯苯酚	1 μM	1
	10 μM	2

除此之外，曲酸之 IC_{50} 值為 500 μM ，而對羥基乙醯苯酚之 IC_{50} 值為 200 μM 。

因此這些式 (I) 之化合物具有比曲酸大的脫色素效用。此外，其還具有對角質細胞與黑色素細胞無細胞毒性的優點，該細胞毒性為已知脫色素劑的主要缺點。

組成物之實施例

實施例 1：O/W 乳狀液

-硬脂酸甘油酯與	
PEG-100 硬脂酸酯	3%
-二十二醇	2.5%
-硬脂酸	1.5%
-蜂蠟	4%
-辛酸/癸酸甘油三酯	7%
-氫化聚異丁烯	12%

四、中文發明摘要（發明之名稱：)

用於局部施用於皮膚及/或其表體增生物之含有至少一種含苯肼片斷化合物的組成物

本發明係關於至少一種含苯肼片斷化合物的用途，其係用於局部美容用組成物中或用來製造局部皮膚用組成物，這些組成物係用來脫色素（depigmenting）及/或漂白人類皮膚、體毛或頭髮。

較佳的含苯肼片斷化合物是對羥基乙醯苯肼。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

訂

線

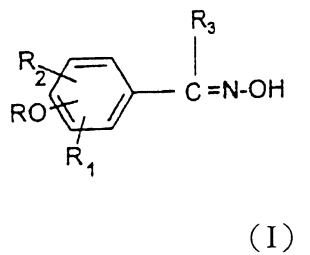
英文發明摘要（發明之名稱： COMPOSITION FOR TOPICAL APPLICATION TO THE SKIN AND/OR ITS SUPERFICIAL BODY GROWTHS, COMPRISING AT LEAST ONE COMPOUND COMPRISING A PHENYLOXIME FRAGMENT)

The invention relates to the use, in a topical cosmetic composition, or for the manufacture of a topical dermatological composition, intended for depigmenting and/or bleaching human skin, body hair or head hair, of at least one compound comprising a phenyloxime fragment.

The preferred compound containing a phenyloxime fragment is *para*-hydroxyacetophenone oxime.

六、申請專利範圍

1. 一種用於脫色素或漂白人類皮膚、體毛或頭髮之美容用組成物，其包含至少一種下式 (I) 之衍生物及美容上可接受的媒質：



其中：

• R 代表一種選自下列的基團：

- 氫原子；
- 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；

- 芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代：

- OH；NH₂；-COOH；-NO₂；-OR₅ 且 R₅ = C₁-C₂₄ 烷基；
-COOR₆ 且 R₆ = C₁-C₂₄ 烷基；-NR₇R₈ 且 R₇ = H 或 C₁-C₂₄ 烷基，R₈ = H 或 C₁-C₂₄ 烷基；

- -COR₉ 基團，R₉ 代表一種直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；或一種芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代：-OH、NH₂、-COOH、-NO₂、-OR₅、-COOR₆、及 -NR₇R₈，其中 R₅、R₆、R₇ 及 R₈ 之定義同上；

• R₁ 和 R₂，可代表相同或不同的基團，其係選自：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

家

訂

線

六、申請專利範圍

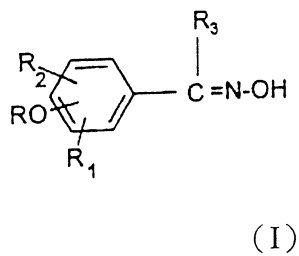
- 氫原子；
- 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C₁-C₂₄ 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；
- 芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代：-OH、-NH₂、-COOH、-NO₂、-OR₅、-COOR₆、及-NR₇R₈，其中 R₅、R₆、R₇ 及 R₈ 之定義同上；
- 選自下列的基團：-OH；-OQ₁；-COQ₂；-COOQ₃；-NQ₄Q₅；-CONQ₆Q₇；-SQ₈；-CH₂OQ₉；Q₁、Q₂、Q₃、Q₄、Q₅、Q₆、Q₇、Q₈ 及 Q₉ 可相同或不同且係選自：氫原子；直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C₁-C₂₄ 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；或芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代：-OH、-NH₂、-COOH、-NO₂、-OR₅、-COOR₆、及-NR₇R₈，其中 R₅、R₆、R₇ 及 R₈ 之定義同上；以及
- 胺基酸殘基及環狀或非環狀碳水化合物殘基；
- R₃ 代表一種選自下列的基團：
 - 氫原子；
 - 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C₁-C₂₄ 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；以及
 - 芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代：-OH、-NH₂、-COOH、-NO₂、-OR₅、-COOR₆、及-NR₇R₈，其中 R₅、R₆、R₇ 及 R₈ 之定義同上。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之組成物，其為一種用於脫色素及/或漂白人類皮膚及/或從皮膚上除去色素沈澱斑

54 修正

六、申請專利範圍

點及/或脫去體毛及/或頭髮色素的皮膚用組成物，其包含至少一種下式 (I) 之衍生物及皮膚上可接受的媒質：



其中：

- R 代表一種選自下列的基團：

- 氫原子；
- 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C₁-C₂₄ 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；

- 芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代：

- OH；-NH₂；-COOH；-NO₂；-OR₅ 且 R₅ = C₁-C₂₄ 烷基；-COOR₆ 且 R₆ = C₁-C₂₄ 烷基；-NR₇R₈ 且 R₇ = H 或 C₁-C₂₄ 烷基，R₈ = H 或 C₁-C₂₄ 烷基；

- -COR₉ 基團，R₉ 代表一種直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C₁-C₂₄ 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；或一種芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代：-OH、-NH₂、-COOH、-NO₂、-OR₅、-COOR₆、及 -NR₇R₈，其中 R₅、R₆、R₇ 及 R₈ 之定義同上；

- R₁ 和 R₂，可代表相同或不同的基團，其係選自：

- 氫原子；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

六、申請專利範圍

- 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；

- 芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代： $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR_5$ 、 $-COOR_6$ 、及 $-NR_7R_8$ ，其中 R_5 、 R_6 、 R_7 及 R_8 之定義同上；

- 選自下列的基團： $-OH$ ； $-OQ_1$ ； $-COQ_2$ ； $-COOQ_3$ ； $-NQ_4Q_5$ ； $-CONQ_6Q_7$ ； $-SQ_8$ ； $-CH_2OQ_9$ ； Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 、 Q_5 、 Q_6 、 Q_7 、 Q_8 及 Q_9 可相同或不同且係選自：氫原子；直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；或芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代： $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR_5$ 、 $-COOR_6$ 、及 $-NR_7R_8$ ，其中 R_5 、 R_6 、 R_7 及 R_8 之定義同上；以及

- 胺基酸殘基及環狀或非環狀碳水化合物殘基；

• R_3 代表一種選自下列的基團：

- 氫原子；

- 直鏈、支鏈或環狀之飽和或不飽和 C_1-C_{24} 烷基，視需要可經一或多個羥官能基羥基化；以及

- 芳基，其可未經取代或經一或多個選自下列的官能基取代： $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR_5$ 、 $-COOR_6$ 、及 $-NR_7R_8$ ，其中 R_5 、 R_6 、 R_7 及 R_8 之定義同上。

3. 根據申請專利範圍第 1 項之組成物，其特徵為該衍生物顯示至少一項下列條件：

- $R = H$ 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基，

六、申請專利範圍

- -OR 係在相對於亞胺官能基為鄰位或對位的位置，
- $R_1 = R_2 = H$ 或 OH 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基，
- $R_3 = H$ 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基。

4. 根據申請專利範圍第 2 項之組成物，其特徵為該衍生物顯示至少一項下列條件：

- $R = H$ 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基，
- OR 係在相對於亞胺官能基為鄰位或對位的位置，
- $R_1 = R_2 = H$ 或 OH 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基，
- $R_3 = H$ 或一種含 1 至 6 個碳原子之烷基。

5. 根據申請專利範圍第 3 項之組成物，其特徵為該衍生物顯示至少一項下列條件：

- $R = H$ ，
- OR 係在相對於亞胺官能基為對位的位置，
- $R_1 = R_2 = H$ ，
- $R_3 = CH_3$ 。

6. 根據申請專利範圍第 4 項之組成物，其特徵為該衍生物顯示至少一項下列條件：

- $R = H$ ，
- OR 係在相對於亞胺官能基為對位的位置，
- $R_1 = R_2 = H$ ，
- $R_3 = CH_3$ 。

7. 根據申請專利範圍第 5 項之組成物，其特徵為該衍生物是對羥基乙醯苯胺。

8. 根據申請專利範圍第 6 項之組成物，其特徵為該衍

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

修正
補充

六、申請專利範圍

生物是對羥基乙醯苯肪。

9.根據申請專利範圍第 1 項之組成物，其特徵為該式 (I) 衍生物存在的量範圍為組成物總重量之 0.001 至 10%

10.根據申請專利範圍第 9 項之組成物，其特徵為該式 (I) 衍生物存在的量範圍為組成物總重量之 0.005 至 5%

11.根據申請專利範圍第 2 項之組成物，其特徵為該式 (I) 衍生物存在的量範圍為組成物總重量之 0.001 至 10%

12.根據申請專利範圍第 11 項之組成物，其特徵為該式 (I) 衍生物存在的量範圍為組成物總重量之 0.005 至 5%

13.根據申請專利範圍第 1 項之組成物，其特徵為該組成物亦包含至少一種活性劑，其係選自角質溶解劑及/或去鱗片劑、UV 遮蔽劑及其他脫色素劑。

14.根據申請專利範圍第 2 項之組成物，其特徵為該組成物亦包含至少一種活性劑，其係選自角質溶解劑及/或去鱗片劑、UV 遮蔽劑及其他脫色素劑。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線