

【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30年7月19日 (2018.7.19)

【公表番号】特表2017-519823(P2017-519823A)

【公表日】平成29年7月20日 (2017.7.20)

【年通号数】公開・登録公報2017-027

【出願番号】特願2017-519212(P2017-519212)

【国際特許分類】

C 0 7 C 251/20 (2006.01)

A 6 1 K 8/44 (2006.01)

A 6 1 K 8/26 (2006.01)

A 6 1 K 8/29 (2006.01)

A 6 1 K 8/35 (2006.01)

A 6 1 K 8/49 (2006.01)

A 6 1 Q 17/04 (2006.01)

A 6 1 K 8/06 (2006.01)

C 0 7 C 49/753 (2006.01)

C 0 7 C 229/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 251/20 C S P

A 6 1 K 8/44

A 6 1 K 8/26

A 6 1 K 8/29

A 6 1 K 8/35

A 6 1 K 8/49

A 6 1 Q 17/04

A 6 1 K 8/06

C 0 7 C 49/753 B

C 0 7 C 229/14

【手続補正書】

【提出日】平成30年6月6日 (2018.6.6)

【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

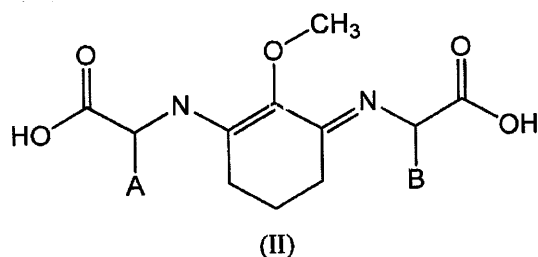
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

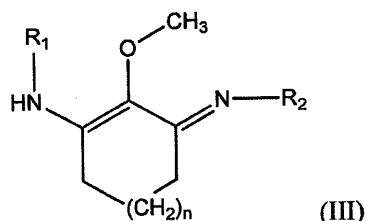
【請求項 1】

化学式 ( I I ) 又は化学式 ( I I I ) の化合物であって、

【化 3 6】



## 【化 3 7】



A は H、 $\text{CH}_3$ 、又は  $\text{CH}(\text{R})\text{COOH}$  であり、R は H、又は 1 個、2 個、又は 3 個の炭素を含むアルキル基であり、

B は H、 $\text{CH}_3$ 、又は  $\text{CH}(\text{R})\text{COOH}$  であり、R は H、又は 1 個、2 個、又は 3 個の炭素を含むアルキル基であり、

n は 0、1、2、3、及び 4 から選択され、

$\text{R}_1$  及び  $\text{R}_2$  は、それぞれが独立に、 $-(\text{CH}_2)_m-\text{COOH}$  又は  $-(\text{CH}_2)_y-\text{CH}(\text{X})-\text{COOH}$  であり、m は 1 から 9 の範囲の整数であり、

y は 0 から 8 の範囲の整数であり、

X は、 $-\text{OH}$  又は C 1 - C 3 直鎖又は分鎖のアルキル基又はアルキニル基であり、これは、任意選択で、1 つ以上の炭素原子においてヒドロキシ又は  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_3$  で置換され、 $\text{R}_3$  はエステル基であり、X とともに取得された C が二重結合を形成する場合、 $\text{CH}(\text{X})$  中の H が欠落する、

化合物。

## 【請求項 2】

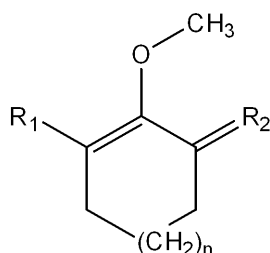
前記化合物は、化学式 (III) の化合物であり、

$\text{R}_1$  及び  $\text{R}_2$  は、それぞれ独立に、 $-\text{CH}_2-\text{COOH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{COOH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_3-\text{COOH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_4-\text{COOH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_5-\text{COOH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_6-\text{COOH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_7-\text{COOH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_8-\text{COOH}$ 、及び  $-(\text{CH}_2)_9-\text{COOH}$  から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

化学式 (IA) を有する前記化合物であって、

## 【化 3 8】



## IA

$\text{R}_1$  は、 $\text{NHCH}_2\text{COOH}$  又は  $\text{NH}(\text{CH}_2)_m\text{COOH}$  であり、

$\text{R}_2$  は、 $\text{NCH}_2\text{COOH}$  又は  $\text{N}(\text{CH}_2)_m\text{COOH}$  であり、

m = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 又は 9 であり、

n = 1, 2, 3, 又は 4 である、

請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

前記化合物は、化学式 (III) の化合物であって、 $\text{R}_1$  及び  $\text{R}_2$  は同じものであり、又は、

請求項 3 に記載の化合物であって、 $\text{R}_1$  及び  $\text{R}_2$  は同じものである、

請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

請求項 1 又は 3 に記載の化合物、及び、化学的日焼け止め剤、物理的日焼け止め剤、薬

学的に許容されるキャリア、又はこれらの組み合わせを含む、局所組成物。

【請求項 6】

前記物理的日焼け止め剤は、酸化亜鉛又は酸化チタンのいずれかを含み、

前記化学的日焼け止め剤は、ベンゾトリアゾール、ベンゾフェノン、安息香酸 / P A B A、シンナメート、サリシレート、アボベンゾン、オキシベンゾン (ベンゾフェノン - 3)、タンニン酸、尿酸、キニーネ塩、ジヒドロキシナフトール酸、アンスラニレート、フェニルベンゾイミダゾールスルホン酸、及び P E G - 2 5 P A B A、ジオキシベンゾン、シノキサート、エチル 4 - [ビス (ヒドロキシプロピル)] アミノベンゾエート、グリセリルアミノベンゾエート、ホモサレート、メンチルアントラニレート、オクトクリレン、オクチルメトキシシンナメート、オクチルサリシレート、パディメート A、パディメート O、赤色ワセリン、二酸化チタン、4 - メンチルベンジリデンカンファー、ベンゾフェノン - 1、ベンゾフェノン - 2、ベンゾフェノン - 4、ベンゾフェノン - 6、ベンゾフェノン - 1 2、イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、ゾトクリレン、D E A - メトキシシンナメート、ジガロイルトリオレエート、及び / 又は T E A - サリシレートを含む、請求項 5 に記載の局所組成物。

【請求項 7】

追加の UV フィルタを更に含み、前記追加 UV フィルタは、p - アミノ安息香酸、その塩及びその誘導体 (エチル、イソブチル、グリセリルエステル、p - ジメチルアミノ安息香酸)、アントラニレート (o - アミノベンゾエート、メチル、メンチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、リナリル、テルピニル、及びシクロヘキセニルエステル)、サリシレート (オクチル、アミル、フェニル、ベンジル、メンチル (ホモサレート)、グリセリル、及びジプロピレングリコールエステル)、桂皮酸誘導体 (メンチル及びベンジルエステル、- フェニルシンナモニトリル、ブチルシンナモイルビルバート)、ジヒドロキシ桂皮酸誘導体 (ウンベリフェロン、メチルウンベリフェロン、メチルアセト - ウンベリフェロン)、カンファー誘導体 (3 ベンジリデン、4 メチルベンジリデン、ポリアクリルアミドメチルベンジリデン、ベンザルコニウムメトスルフェート、ベンジリデンカンファースルホン酸、及びテレフタリリデンジカンファースルホン酸)、トリヒドロキシ桂皮酸誘導体 (エスクレチン、メチルクレチン、ダフネチン、並びにグルコサイド、エスクリン、及びダフニン)、炭化水素 (ジフェニルブタジエン、スチルベン)、ジベンザルアセトン、ベンザルアセトフェノン、ナフトールスルフォネート (2 - ナフトール - 3, 6 - ジスルホン酸のナトリウム塩、及び 2 - ナフトール - 6, 8 - ジスルホン酸のナトリウム塩)、ジヒドロキシ - ナフトエ酸及びその塩、o - 及び p - ヒドロキシジフェニルジスルフォネート、クマリン誘導体 (7 - ヒドロキシ、7 - メチル、3 - フェニル)、ジアゾール (2 - アセチル - 3 - プロモインダゾール、フェニルベンゾオキサゾール、メチルナフトオキサゾール、様々なアリルベンゾチアゾール)、キニーネ塩 (重硫酸塩、硫酸塩、塩化物、オレアート、及びタンニン酸塩)、キノリン誘導体 (8 - ヒドロキシキノリン塩、2 - フェニルキノリン)、ヒドロキシ - 又はメトキシ - 置換ベンゾフェノン、尿酸誘導体、吉草酸誘導体、タンニン酸及びその誘導体、ヒドロキノン、並びに、ベンゾフェノン (オキシベンゾン、スリソベンゾン、ジオキシベンゾン、ベンゾレゾルチノール、オクタベンゾン、4 - イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、エトクリレン、及び / 又は 4 - イソプロピル - ジベンゾイルメタン) を含む、請求項 5 に記載の局所組成物。

【請求項 8】

UV A 及び / 又は UV B の放射を吸収する、第 2 の化合物を更に含み、請求項 5 に記載の局所組成物。

【請求項 9】

前記第 2 の化合物は、日焼け及び皮膚老化、皮膚損傷、及び DNA 損傷に対する保護を行うことが可能である、請求項 8 に記載の局所組成物。

【請求項 10】

UV A 及び / 又は UV B の放射を吸収することにより、臨界波長値 (吸光度の 90%)

の測定値が、単独で取得される各成分の臨界波長値より高くなる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、請求項5に記載の局所組成物。

【請求項11】

UV A及び/又はUV Bの放射を吸収することにより、任意のUV曝露の前と後とで比UV A：UV Bの差のパーセンテージが小さくなる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、請求項5に記載の局所組成物。

【請求項12】

UV A及び/又はUV Bの放射を吸収することにより、総吸光度が可視スペクトル（400nm）に向かってシフトする（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、請求項5に記載の局所組成物。

【請求項13】

UV A及び/又はUV Bの放射を吸収することにより、総吸光度が増加し、単独で取得される各成分の吸光度値より高くなる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、請求項5に記載の局所組成物。

【請求項14】

UV A及び/又はUV Bの放射を吸収することにより、製剤、キャリア、ローション、ゲル、又は噴霧液における、UV A及び/又はUV Bを吸収する2つ以上の化合物の濃度を減らすことが可能になり、且つ、2より大きいSPF値が維持される第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、請求項5に記載の局所組成物。

【請求項15】

UV A及び/又はUV Bの放射を吸収することにより、高いほうの耐水性値が、単独で取得される各成分の耐水性値より高い値になる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、請求項5に記載の局所組成物。

【請求項16】

UV A及び/又はUV Bの放射を吸収することにより、UV Bに対してUV Aの値が高くなる第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、あるいは、

UV A及び/又はUV Bの放射を吸収することにより、UV放射と人間の皮膚との接触が減る第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、請求項5に記載の局所組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0119

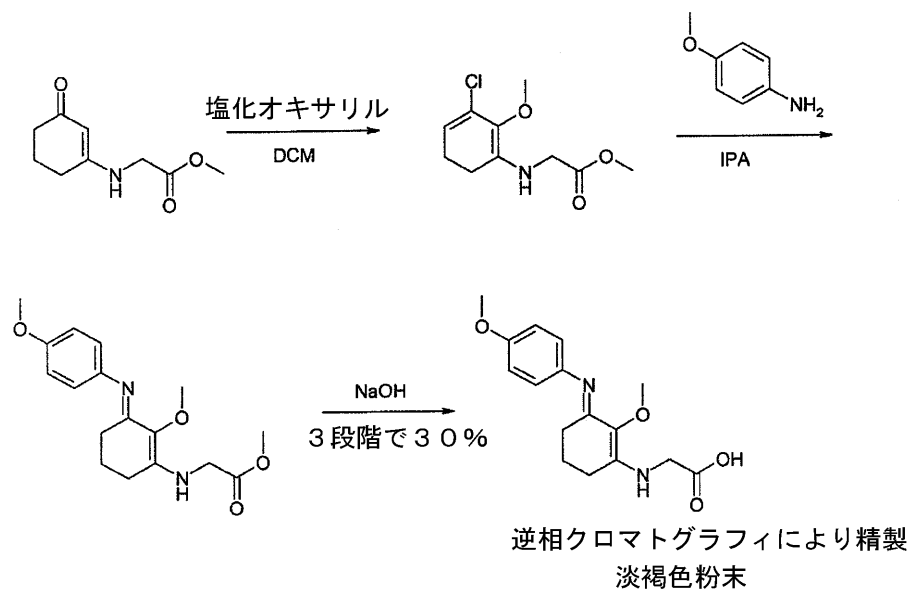
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0119】

2 - メトキシ - 3 - { ( 4 - メトキシフェニル ) イミノ } シクロヘクス - 1 - エネアミノ酢酸 ( T o p C H E M 4 ) の合成

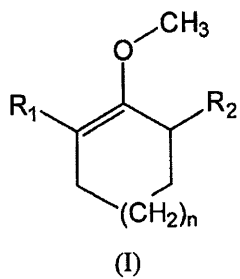
【化 19】



〔付記 1〕

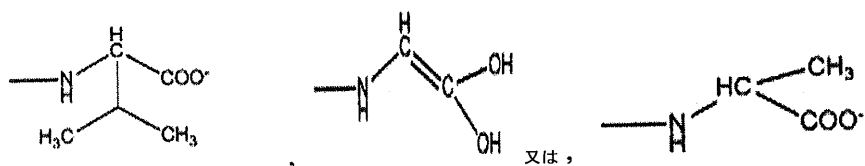
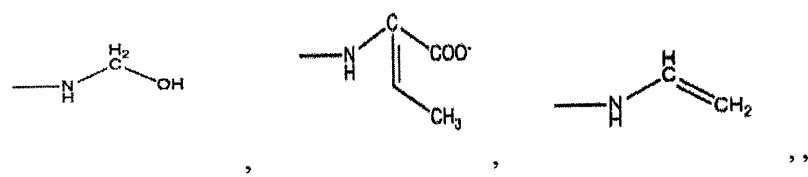
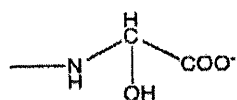
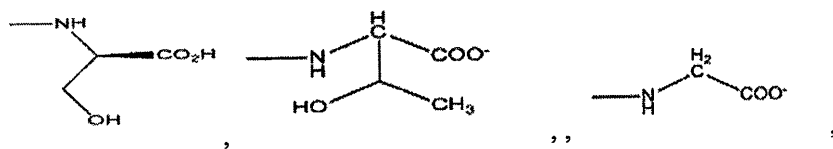
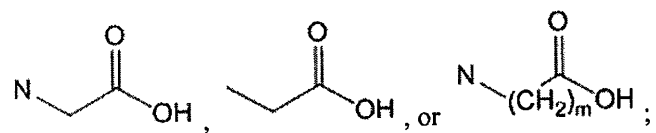
化学式 (I) の化合物であって、

【化 20】



$R_1$  は、 $=O$ 、又は  $-OH$ 、又は  $-NH$ 、又は  $-CH_2-COO^-$ 、又は  $-NH-CH_2-COO^-$ 、又は

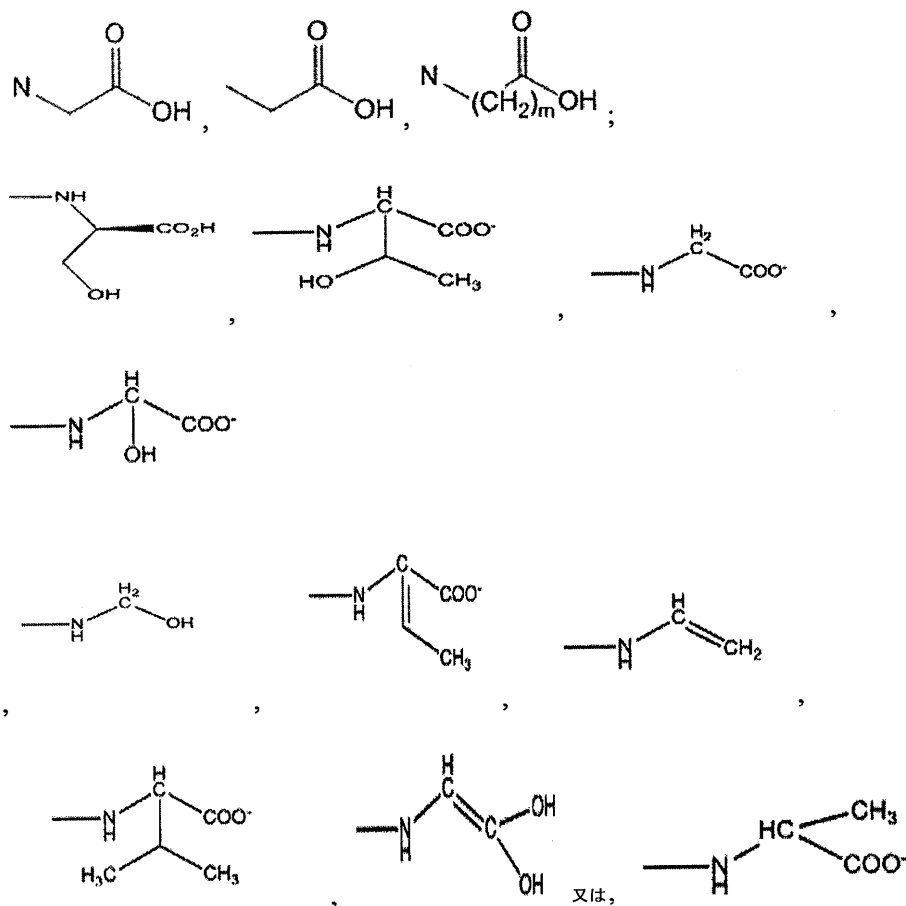
【化 2 1】



であり、

R<sub>2</sub> は、= O、又は - OH、又は - NH、又は - CH<sub>2</sub> - COO<sup>-</sup>、又は - NH - CH<sub>2</sub> - COO<sup>-</sup>、

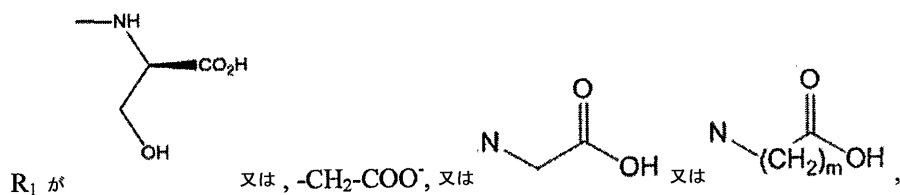
## 【化 2 2】



であり、

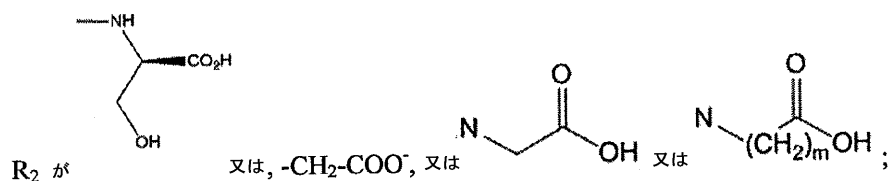
 $n = 1, 2, 3$ , 又は 4、並びに $m = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8$ , 又は 9 であり、並びに

## 【化 2 3】



であり、

## 【化 2 4】



である場合、 $\text{R}_2$  の N と芳香環との間の結合は二重結合である、  
化合物。

## 〔付記 2〕

 $\text{R}_1$  と  $\text{R}_2$  は同じものである、付記 1 に記載の化合物。

## 〔付記 3〕

付記 1 に記載の化合物、化学的日焼け止め剤、物理的日焼け止め剤、薬学的に許容され

るキャリア、又はこれらの組み合わせを含む局所組成物。

〔付記 4〕

前記物理的日焼け止め剤は、酸化亜鉛又は酸化チタンのいずれかを含む、付記 3 に記載の局所組成物。

〔付記 5〕

前記化学的日焼け止め剤は、ベンゾトリアゾール、ベンゾフェノン、安息香酸 / P A B A、シンナメート、サリシレート、アボベンゾン、オキシベンゾン (ベンゾフェノン - 3)、タンニン酸、尿酸、キニーネ塩、ジヒドロキシナフトール酸、アンスラニレート、フェニルベンゾイミダゾールスルホン酸、及び P E G - 2 5 P A B A、を含み、更に、ジオキシベンゾン、シノキサート、エチル 4 - [ビス (ヒドロキシプロピル)] アミノベンゾエート、グリセリルアミノベンゾエート、ホモサレート、メンチルアントラニレート、オクトクリレン、オクチルメトキシシンナメート、オクチルサリシレート、パディメート A、パディメート O、赤色ワセリン、二酸化チタン、4 - メンチルベンジリデンカンファール、ベンゾフェノン - 1、ベンゾフェノン - 2、ベンゾフェノン - 4、ベンゾフェノン - 6、ベンゾフェノン - 1 2、イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、ゾトクリレン、D E A - メトキシシンナメート、ジガロイルトリオレエート、及び / 又は T E A - サリシレートなどの日焼け止め剤化合物を含む、付記 3 に記載の局所組成物。

〔付記 6〕

追加の UV フィルタを更に含み、前記追加 UV フィルタは、p - アミノ安息香酸、その塩及びその誘導体 (エチル、イソブチル、グリセリルエステル、p - ジメチルアミノ安息香酸)、アントラニレート (o - アミノベンゾエート、メチル、メンチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、リナリル、テルピニル、及びシクロヘキセニルエステル)、サリシレート (オクチル、アミル、フェニル、ベンジル、メンチル (ホモサレート)、グリセリル、及びジプロピレングリコールエステル)、桂皮酸誘導体 (メンチル及びベンジルエステル、- フェニルシンナモニトリル、ブチルシンナモイルビルバート)、ジヒドロキシ桂皮酸誘導体 (ウンベリフェロン、メチルウンベリフェロン、メチルアセト - ウンベリフェロン)、カンファール誘導体 (3 ベンジリデン、4 メチルベンジリデン、ポリアクリルアミドメチルベンジリデン、ベンザルコニウムメトスルフェート、ベンジリデンカンファールスルホン酸、及びテレフタリリデンジカンファールスルホン酸)、トリヒドロキシ桂皮酸誘導体 (エスクレチン、メチルクレチン、ダフネチン、並びにグルコサイド、エスクリン、及びダフニン)、炭化水素 (ジフェニルブタジエン、スチルベン)、ジベンザルアセトン、ベンザルアセトフェノン、ナフトールスルフォネート (2 - ナフトール - 3, 6 - ジスルホン酸のナトリウム塩、及び 2 - ナフトール - 6, 8 - ジスルホン酸のナトリウム塩)、ジヒドロキシ - ナフトエ酸及びその塩、o - 及び p - ヒドロキシジフェニルジスルフォネート、クマリン誘導体 (7 - ヒドロキシ、7 - メチル、3 - フェニル)、ジアゾール (2 - アセチル - 3 - プロモインダゾール、フェニルベンゾオキサゾール、メチルナフトオキサゾール、様々なアリルベンゾチアゾール)、キニーネ塩 (重硫酸塩、硫酸塩、塩化物、オレアート、及びタンニン酸塩)、キノリン誘導体 (8 - ヒドロキシキノリン塩、2 - フェニルキノリン)、ヒドロキシ - 又はメトキシ - 置換ベンゾフェノン、尿酸誘導体、吉草酸誘導体、タンニン酸及びその誘導体、ヒドロキノン、並びに、ベンゾフェノン (オキシベンゾン、スリソベンゾン、ジオキシベンゾン、ベンゾレゾルチノール、オクタベンゾン、4 - イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、エトクリレン、及び / 又は 4 - イソプロピル - ジベンゾイルメタン) を含む、付記 3 に記載の局所組成物。

〔付記 7〕

前記化合物は、水中油滴型又は油中水滴型のエマルションとして存在する、付記 3 に記載の局所組成物。

〔付記 8〕

最初の塗布時の前記組成物の日焼け防止指数 (S P F) が少なくとも 2、1 5、3 0、



50、又は60である、付記3に記載の局所組成物。

〔付記9〕

前記化合物は、約0.05wt%から60wt%の濃度で前記組成物中に存在する、付記3に記載の局所組成物。

〔付記10〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収するとともに、日焼け及び皮膚老化、皮膚損傷、及びDNA損傷に対する保護を行うことが可能である、第2の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記11〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、臨界波長値（吸光度の90%）の測定値が、単独で取得される各成分の臨界波長値より高くなる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記12〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、任意のUV曝露の前と後とで比UVA:UVBの差のパーセンテージが小さくなる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記13〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、任意のUV曝露の前と後とで比UVA:UVBの差のパーセンテージが小さくなる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記14〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、総吸光度が可視スペクトル（400nm）に向かってシフトする（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記15〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、総吸光度が増加し、単独で取得される各成分の吸光度値より高くなる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記16〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、製剤、キャリア、ローション、ゲル、又は噴霧液における、UVA及び/又はUVBを吸収する2つ以上の化合物の濃度を減らすことが可能になり、且つ、2より大きいSPF値が維持される第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記17〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、高いほうの耐水性値が、単独で取得される各成分の耐水性値より高い値になる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記18〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、UVBに対してUVAの値が高くなる第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

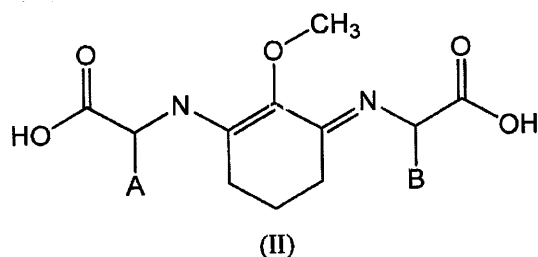
〔付記19〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、UV放射と人間の皮膚との接触が減る第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記3に記載の局所組成物。

〔付記20〕

化学式(II)の化合物であって、

## 【化 2 5】



A は H、 $\text{CH}_3$ 、又は  $\text{CH}(\text{R})\text{COOH}$  であり、R は H、又は 1 個、2 個、又は 3 個の炭素を含むアルキル基であり、

B は H、 $\text{CH}_3$ 、又は  $\text{CH}(\text{R})\text{COOH}$  であり、R は H、又は 1 個、2 個、又は 3 個の炭素を含むアルキル基である、

化合物。

〔付記 2 1〕

付記 2 0 に記載の化合物、化学的日焼け止め剤、物理的日焼け止め剤、薬学的に許容されるキャリア、又はこれらの組み合わせを含む局所組成物。

〔付記 2 2〕

前記物理的日焼け止め剤は、酸化亜鉛又は酸化チタンのいずれかを含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 2 3〕

前記化学的日焼け止め剤は、ベンゾトリアゾール、ベンゾフェノン、安息香酸 / P A B A、シンナメート、サリシレート、アボベンゾン、オキシベンゾン（ベンゾフェノン - 3）、タンニン酸、尿酸、キニーネ塩、ジヒドロキシナフトール酸、アンスラニレート、フェニルベンゾイミダゾールスルホン酸、及び P E G - 2 5 P A B A、を含み、更に、ジオキシベンゾン、シノキサート、エチル 4 - [ビス（ヒドロキシプロピル）] アミノベンゾエート、グリセリルアミノベンゾエート、ホモサレート、メンチルアントラニレート、オクトクリレン、オクチルメトキシシンナメート、オクチルサリシレート、パディメート A、パディメート O、赤色ワセリン、二酸化チタン、4 - メンチルベンジリデンカンファール、ベンゾフェノン - 1、ベンゾフェノン - 2、ベンゾフェノン - 4、ベンゾフェノン - 6、ベンゾフェノン - 1 2、イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、ゾトクリレン、D E A - メトキシシンナメート、ジガロイルトリオレエート、及び / 又は T E A - サリシレートなどの日焼け止め剤化合物を含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 2 4〕

追加の UV フィルタを更に含み、前記追加 UV フィルタは、p - アミノ安息香酸、その塩及びその誘導体（エチル、イソブチル、グリセリルエステル、p - ジメチルアミノ安息香酸）、アントラニレート（o - アミノベンゾエート、メチル、メンチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、リナリル、テルビニル、及びシクロヘキセニルエステル）、サリシレート（オクチル、アミル、フェニル、ベンジル、メンチル（ホモサレート）、グリセリル、及びジプロピレングリコールエステル）、桂皮酸誘導体（メンチル及びベンジルエステル、- フェニルシンナモニトリル、ブチルシンナモイルビルパート）、ジヒドロキシ桂皮酸誘導体（ウンベリフェロン、メチルウンベリフェロン、メチルアセト - ウンベリフェロン）、カンファール誘導体（3 ベンジリデン、4 メチルベンジリデン、ポリアクリルアミドメチルベンジリデン、ベンザルコニウムメトスルフェート、ベンジリデンカンファールスルホン酸、及びテレフタルリデンジカンファールスルホン酸）、トリヒドロキシ桂皮酸誘導体（エスクレチン、メチルクレチン、ダフネチン、並びにグルコサイド、エスクリン、及びダフニン）、炭化水素（ジフェニルブタジエン、スチルベン）、ジベンザルアセトン、ベンザルアセトフェノン、ナフトールスルフォネート（2 - ナフトール - 3, 6 - ジスルホン酸のナトリウム塩、及び 2 - ナフトール - 6, 8 - ジスルホン酸のナトリウム塩）、ジヒドロキシ - ナフトエ酸及びその塩、o - 及び p - ヒドロキシジフェニルジスル

フォネート、クマリン誘導体（7 - ヒドロキシ、7 - メチル、3 - フェニル）、ジアゾール（2 - アセチル - 3 - プロモインダゾール、フェニルベンゾオキサゾール、メチルナフトオキサゾール、様々なアリルベンゾチアゾール）、キニーネ塩（重硫酸塩、硫酸塩、塩化物、オレアート、及びタンニン酸塩）、キノリン誘導体（8 - ヒドロキシキノリン塩、2 - フェニルキノリン）、ヒドロキシ - 又はメトキシ - 置換ベンゾフェノン、尿酸誘導体、吉草酸誘導体、タンニン酸及びその誘導体、ヒドロキノン、並びに、ベンゾフェノン（オキシベンゾン、スリソベンゾン、ジオキシベンゾン、ベンゾレゾルチノール、オクタベンゾン、4 - イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、エトクリレン、及び / 又は 4 - イソプロピル - ジベンゾイルメタン）を含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 2 5〕

前記化合物は、水中油滴型又は油中水滴型のエマルジョンとして存在する、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 2 6〕

最初の塗布時の前記組成物の日焼け防止指数（SPF）が少なくとも 2、15、30、50、又は 60 である、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 2 7〕

前記化合物は、約 0.05 wt % から 60 wt % の濃度で前記組成物中に存在する、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 2 8〕

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収するとともに、日焼け、及び皮膚老化、皮膚損傷、及び DNA 損傷に対する保護を行うことが可能である、第 2 の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 2 9〕

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、臨界波長値（吸光度の 90 %）の測定値が、単独で取得される各成分の臨界波長値より高くなる（ラムダシフト）第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 3 0〕

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、任意の UV 曝露の前と後とで比 UVA : UVB の差のパーセンテージが小さくなる（ラムダシフト）第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 3 1〕

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、任意の UV 曝露の前と後とで比 UVA : UVB の差のパーセンテージが小さくなる（ラムダシフト）第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 3 2〕

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、総吸光度が可視スペクトル（400 nm）に向かってシフトする（ラムダシフト）第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 3 3〕

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、総吸光度が増加し、単独で取得される各成分の吸光度値より高くなる（ラムダシフト）第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 3 4〕

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、製剤、キャリア、ローション、ゲル、又は噴霧液における、UVA 及び / 又は UVB を吸収する 2 つ以上の化合物の濃度を減らすことが可能になり、且つ、2 より大きい SPF 値が維持される第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 3 5〕

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、高いほうの耐水性値が、単独で

取得される各成分の耐水性値より高い値になる（ラムダシフト）第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 3 6〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V B に対して U V A の値が高くなる第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

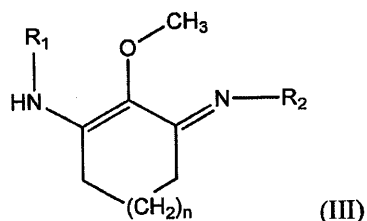
〔付記 3 7〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V 放射と人間の皮膚との接触が減る第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 2 1 に記載の局所組成物。

〔付記 3 8〕

化学式 ( I I I ) の化合物であって、

【化 2 6】



$n$  は 0、1、2、3、及び 4 から選択され、

$R_1$  及び  $R_2$  は、それぞれが独立に、 $-(CH_2)_m-COOH$  又は  $-(CH_2)_y-CH(A)-COOH$  であり、

$m$  は 1 から 9 の範囲の整数であり、

$y$  は 0 から 8 の範囲の整数であり、

$A$  は、C 1 - C 3 直鎖又は分鎖のアルキル基又はアルキニル基であり、これは、任意選択で、1 つ以上の炭素原子においてヒドロキシ又は  $-C(O)OR_3$  で置換され、 $R_3$  はエステル基であり、 $A$  とともに取得された C が二重結合を形成する場合、 $CH(A)$  中の H が欠落する、

化合物。

〔付記 3 9〕

$n$  は 1、2、3、又は 4 である、付記 3 8 に記載の化合物。

〔付記 4 0〕

$R_1$  及び  $R_2$  は、それぞれ独立に、 $-CH_2-COOH$ 、 $-(CH_2)_2-COOH$ 、 $-(CH_2)_3-COOH$ 、 $-(CH_2)_4-COOH$ 、 $-(CH_2)_5-COOH$ 、 $-(CH_2)_6-COOH$ 、 $-(CH_2)_7-COOH$ 、 $-(CH_2)_8-COOH$ 、及び  $-(CH_2)_9-COOH$  から選択される、付記 3 8 に記載の化合物。

〔付記 4 1〕

$y$  は 0 又は 1 である、付記 3 8 に記載の化合物。

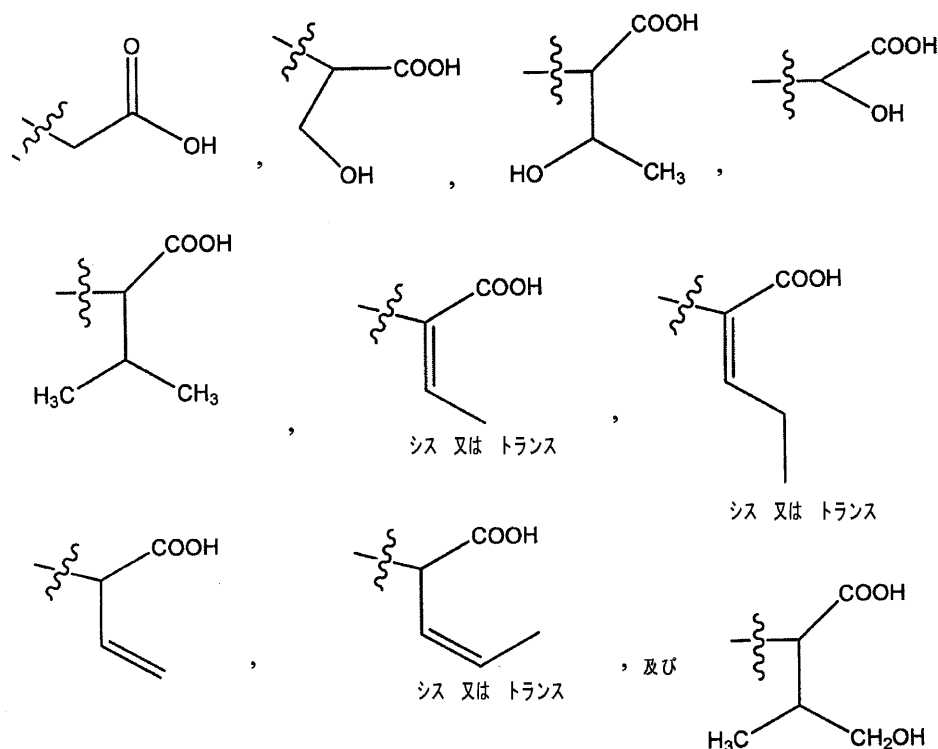
〔付記 4 2〕

$A$  は、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CHCH_3OH$  からなる群から選択される、付記 3 8 に記載の化合物。

〔付記 4 3〕

$R_1$  及び  $R_2$  は、それぞれ独立に、

## 【化 2 7】



からなる群から選択される、付記 3 8 に記載の化合物。

〔付記 4 4〕

$R_1$  と  $R_2$  は同じものである、付記 3 8 に記載の化合物。

〔付記 4 5〕

$R_1$  と  $R_2$  は異なるものである、付記 3 8 に記載の化合物。

〔付記 4 6〕

付記 3 8 に記載の化合物、化学的日焼け止め剤、物理的日焼け止め剤、薬学的に許容されるキャリア、又はこれらの組み合わせを含む局所組成物。

〔付記 4 7〕

前記物理的日焼け止め剤は、酸化亜鉛又は酸化チタンのいずれかを含む、付記 4 6 に記載の局所組成物。

〔付記 4 8〕

前記化学的日焼け止め剤は、ベンゾトリアゾール、ベンゾフェノン、安息香酸 / P A B A、シンナメート、サリシレート、アボベンゾン、オキシベンゾン（ベンゾフェノン - 3）、タンニン酸、尿酸、キニーネ塩、ジヒドロキシナフトール酸、アンスラニレート、フェニルベンゾイミダゾールスルホン酸、及び P E G - 2 5 P A B A、を含み、更に、ジオキシベンゾン、シノキサート、エチル 4 - [ビス（ヒドロキシプロピル）] アミノベンゾエート、グリセリルアミノベンゾエート、ホモサレート、メンチルアントラニレート、オクトクリレン、オクチルメトキシシンナメート、オクチルサリシレート、パディメート A、パディメート O、赤色ワセリン、二酸化チタン、4 - メンチルベンジリデンカンファール、ベンゾフェノン - 1、ベンゾフェノン - 2、ベンゾフェノン - 4、ベンゾフェノン - 6、ベンゾフェノン - 1 2、イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、ゾトクリレン、D E A - メトキシシンナメート、ジガロイルトリオレエート、及び / 又は T E A - サリシレートなどの日焼け止め剤化合物を含む、付記 4 6 に記載の局所組成物。

〔付記 4 9〕

追加の U V フィルタを更に含み、前記追加 U V フィルタは、p - アミノ安息香酸、その塩及びその誘導体（エチル、イソブチル、グリセリルエステル、p - ジメチルアミノ安息

香酸)、アントラニレート(o-アミノベンゾエート、メチル、メンチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、リナリル、テルピニル、及びシクロヘキセニルエステル)、サリシレート(オクチル、アミル、フェニル、ベンジル、メンチル(ホモサレート)、グリセリル、及びジプロピレングリコールエステル)、桂皮酸誘導体(メンチル及びベンジルエステル、-フェニルシンナモニトリル、ブチルシンナモイルビルバート)、ジヒドロキシ桂皮酸誘導体(ウンベリフェロン、メチルウンベリフェロン、メチルアセト-ウンベリフェロン)、カンファ-誘導体(3ベンジリデン、4メチルベンジリデン、ポリアクリルアミドメチルベンジリデン、ベンザルコニウムメトスルフェート、ベンジリデンカンファ-スルホン酸、及びテレフタリリデンジカンファ-スルホン酸)、トリヒドロキシ桂皮酸誘導体(エスクレチン、メチルクレチン、ダフネチン、並びにグルコサイド、エスクリン、及びダフニン)、炭化水素(ジフェニルブタジエン、スチルベン)、ジベンザルアセトン、ベンザルアセトフェノン、ナフトールスルフォネート(2-ナフトール-3,6-ジスルホン酸のナトリウム塩、及び2-ナフトール-6,8-ジスルホン酸のナトリウム塩)、ジヒドロキシ-ナフトエ酸及びその塩、o-及びp-ヒドロキシジフェニルジスルフォネート、クマリン誘導体(7-ヒドロキシ、7-メチル、3-フェニル)、ジアゾール(2-アセチル-3-プロモインダゾール、フェニルベンゾオキサゾール、メチルナフトオキサゾール、様々なアリルベンゾチアゾール)、キニーネ塩(重硫酸塩、硫酸塩、塩化物、オレアート、及びタンニン酸塩)、キノリン誘導体(8-ヒドロキシキノリン塩、2-フェニルキノリン)、ヒドロキシ-又はメトキシ-置換ベンゾフェノン、尿酸誘導体、吉草酸誘導体、タンニン酸及びその誘導体、ヒドロキノン、並びに、ベンゾフェノン(オキシベンゾン、スリソベンゾン、ジオキシベンゾン、ベンゾレゾルチノール、オクタベンゾン、4-イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、エトクリレン、及び/又は4-イソプロピル-ジベンゾイルメタン)を含む、付記46に記載の局所組成物。

[付記50]

前記化合物は、水中油滴型又は油中水滴型のエマルジョンとして存在する、付記46に記載の局所組成物。

[付記51]

最初の塗布時の前記組成物の日焼け防止指数(SPF)が少なくとも2、15、30、50、又は60である、付記46に記載の局所組成物。

[付記52]

前記化合物は、約0.05wt%から60wt%の濃度で前記組成物中に存在する、付記46に記載の局所組成物。

[付記53]

UVA及び/又はUVBの放射を吸収するとともに、日焼け、及び皮膚老化、皮膚損傷、及びDNA損傷に対する保護を行うことが可能である、第2の化合物を更を含む、付記46に記載の局所組成物。

[付記54]

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、臨界波長値(吸光度の90%)の測定値が、単独で取得される各成分の臨界波長値より高くなる(ラムダシフト)第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更を含む、付記46に記載の局所組成物。

[付記55]

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、任意のUV曝露の前と後とで比UVA:UVBの差のパーセンテージが小さくなる(ラムダシフト)第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更を含む、付記46に記載の局所組成物。

[付記56]

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、任意のUV曝露の前と後とで比UVA:UVBの差のパーセンテージが小さくなる(ラムダシフト)第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更を含む、付記46に記載の局所組成物。

[付記57]

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、総吸光度が可視スペクトル ( 4 0 0 n m ) に向かってシフトする ( ラムダシフト ) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 4 6 に記載の局所組成物。

〔付記 5 8 〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、総吸光度が増加し、単独で取得される各成分の吸光度値より高くなる ( ラムダシフト ) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 4 6 に記載の局所組成物。

〔付記 5 9 〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、製剤、キャリア、ローション、ゲル、又は噴霧液における、U V A 及び / 又は U V B を吸収する 2 つ以上の化合物の濃度を減らすことが可能になり、且つ、2 より大きい S P F 値が維持される第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 4 6 に記載の局所組成物。

〔付記 6 0 〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、高いほうの耐水性値が、単独で取得される各成分の耐水性値より高い値になる ( ラムダシフト ) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 4 6 に記載の局所組成物。

〔付記 6 1 〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V B に対して U V A の値が高くなる第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 4 6 に記載の局所組成物。

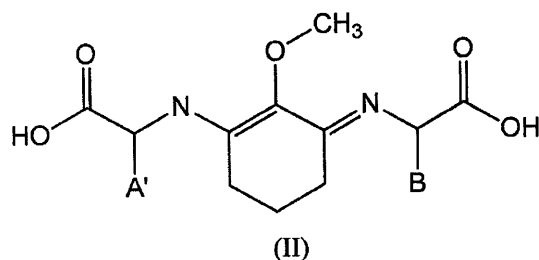
〔付記 6 2 〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V 放射と人間の皮膚との接触が減る第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 4 6 に記載の局所組成物。

〔付記 6 3 〕

化学式 ( I I ) の化合物であって、

【化 2 8 〕



A ' 及び B は、それぞれ独立に、H、C H <sub>3</sub>、及び C H ( R ) C O O H からなる群から選択され、R は H 又は C 1 - C 3 アルキル基である、

化合物。

〔付記 6 4 〕

付記 6 3 に記載の化合物、化学的日焼け止め剤、物理的日焼け止め剤、薬学的に許容されるキャリア、又はこれらの組み合わせを含む局所組成物。

〔付記 6 5 〕

前記物理的日焼け止め剤は、酸化亜鉛又は酸化チタンのいずれかを含有、付記 6 4 に記載の局所組成物。

〔付記 6 6 〕

前記化学的日焼け止め剤は、ベンゾトリアゾール、ベンゾフェノン、安息香酸 / P A B A、シンナメート、サリシレート、アボベンゾン、オキシベンゾン ( ベンゾフェノン - 3 )、タンニン酸、尿酸、キニーネ塩、ジヒドロキシナフトール酸、アンスラニレート、フェニルベンゾイミダゾールスルホン酸、及び P E G - 2 5 P A B A、を含み、更に、ジオキシベンゾン、シノキサート、エチル 4 - [ ビス ( ヒドロキシプロピル ) ] アミノベンゾエート、グリセリルアミノベンゾエート、ホモサレート、メンチルアントラニレート、オクトクリレン、オクチルメトキシシンナメート、オクチルサリシレート、パディメート

A、パディメートO、赤色ワセリン、二酸化チタン、4-メンチルベンジリデンカンファ-、ベンゾフェノン-1、ベンゾフェノン-2、ベンゾフェノン-4、ベンゾフェノン-6、ベンゾフェノン-12、イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、ゾトクリレン、DEA-メトキシシナメート、ジガロイルトリオレート、及び/又はTEA-サリシレートなどの日焼け止め剤化合物を含む、付記64に記載の局所組成物。

〔付記67〕

追加のUVフィルタを更に含み、前記追加UVフィルタは、p-アミノ安息香酸、その塩及びその誘導体（エチル、イソブチル、グリセリルエステル、p-ジメチルアミノ安息香酸）、アントラニレート（o-アミノベンゾエート、メチル、メンチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、リナリル、テルピニル、及びシクロヘキセニルエステル）、サリシレート（オクチル、アミル、フェニル、ベンジル、メンチル（ホモサレート）、グリセリル、及びジプロピレングリコールエステル）、桂皮酸誘導体（メンチル及びベンジルエステル、-フェニルシナモニトリル、ブチルシナモイルビルバート）、ジヒドロキシ桂皮酸誘導体（ウンベリフェロン、メチルウンベリフェロン、メチルアセト-ウンベリフェロン）、カンファ-誘導体（3ベンジリデン、4メチルベンジリデン、ポリアクリルアミドメチルベンジリデン、ベンザルコニウムメトスルフェート、ベンジリデンカンファ-スルホン酸、及びテレフタリリデンジカンファ-スルホン酸）、トリヒドロキシ桂皮酸誘導体（エスクレチン、メチルクレチン、ダフネチン、並びにグルコサイド、エスクリン、及びダフニン）、炭化水素（ジフェニルブタジエン、スチルベン）、ジベンザルアセトン、ベンザルアセトフェノン、ナフトールスルフォネート（2-ナフトール-3,6-ジスルホン酸のナトリウム塩、及び2-ナフトール-6,8-ジスルホン酸のナトリウム塩）、ジヒドロキシ-ナフトエ酸及びその塩、o-及びp-ヒドロキシジフェニルジスルフォネート、クマリン誘導体（7-ヒドロキシ、7-メチル、3-フェニル）、ジアゾール（2-アセチル-3-プロモインダゾール、フェニルベンゾオキサゾール、メチルナフトオキサゾール、様々なアリルベンゾチアゾール）、キニーネ塩（重硫酸塩、硫酸塩、塩化物、オレアート、及びタンニン酸塩）、キノリン誘導体（8-ヒドロキシキノリン塩、2-フェニルキノリン）、ヒドロキシ-又はメトキシ-置換ベンゾフェノン、尿酸誘導体、吉草酸誘導体、タンニン酸及びその誘導体、ヒドロキノン、並びに、ベンゾフェノン（オキシベンゾン、スリソベンゾン、ジオキシベンゾン、ベンゾレゾルチノール、オクタベンゾン、4-イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、エトクリレン、及び/又は4-イソプロピル-ジベンゾイルメタン）を含む、付記64に記載の局所組成物。

〔付記68〕

前記化合物は、水中油滴型又は油中水滴型のエマルションとして存在する、付記64に記載の局所組成物。

〔付記69〕

最初の塗布時の前記組成物の日焼け防止指数（SPF）が少なくとも2、15、30、50、又は60である、付記64に記載の局所組成物。

〔付記70〕

前記化合物は、約0.05wt%から60wt%の濃度で前記組成物中に存在する、付記64に記載の局所組成物。

〔付記71〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収するとともに、日焼け、及び皮膚老化、皮膚損傷、及びDNA損傷に対する保護を行うことが可能である、第2の化合物を更に含む、付記64に記載の局所組成物。

〔付記72〕

UVA及び/又はUVBの放射を吸収することにより、臨界波長値（吸光度の90%）の測定値が、単独で取得される各成分の臨界波長値より高くなる（ラムダシフト）第2の化合物、又は2つ以上の化合物を更に含む、付記64に記載の局所組成物。



〔付記 7 3〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、任意の U V 曝露の前と後とで比 U V A : U V B の差のパーセンテージが小さくなる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 6 4 に記載の局所組成物。

〔付記 7 4〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、任意の U V 曝露の前と後とで比 U V A : U V B の差のパーセンテージが小さくなる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 6 4 に記載の局所組成物。

〔付記 7 5〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、総吸光度が可視スペクトル (400 nm) に向かってシフトする (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 6 4 に記載の局所組成物。

〔付記 7 6〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、総吸光度が増加し、単独で取得される各成分の吸光度値より高くなる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 6 4 に記載の局所組成物。

〔付記 7 7〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、製剤、キャリア、ローション、ゲル、又は噴霧液における、U V A 及び / 又は U V B を吸収する 2 つ以上の化合物の濃度を減らすことが可能になり、且つ、2 より大きい S P F 値が維持される第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 6 4 に記載の局所組成物。

〔付記 7 8〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、高いほうの耐水性値が、単独で取得される各成分の耐水性値より高い値になる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 6 4 に記載の局所組成物。

〔付記 7 9〕

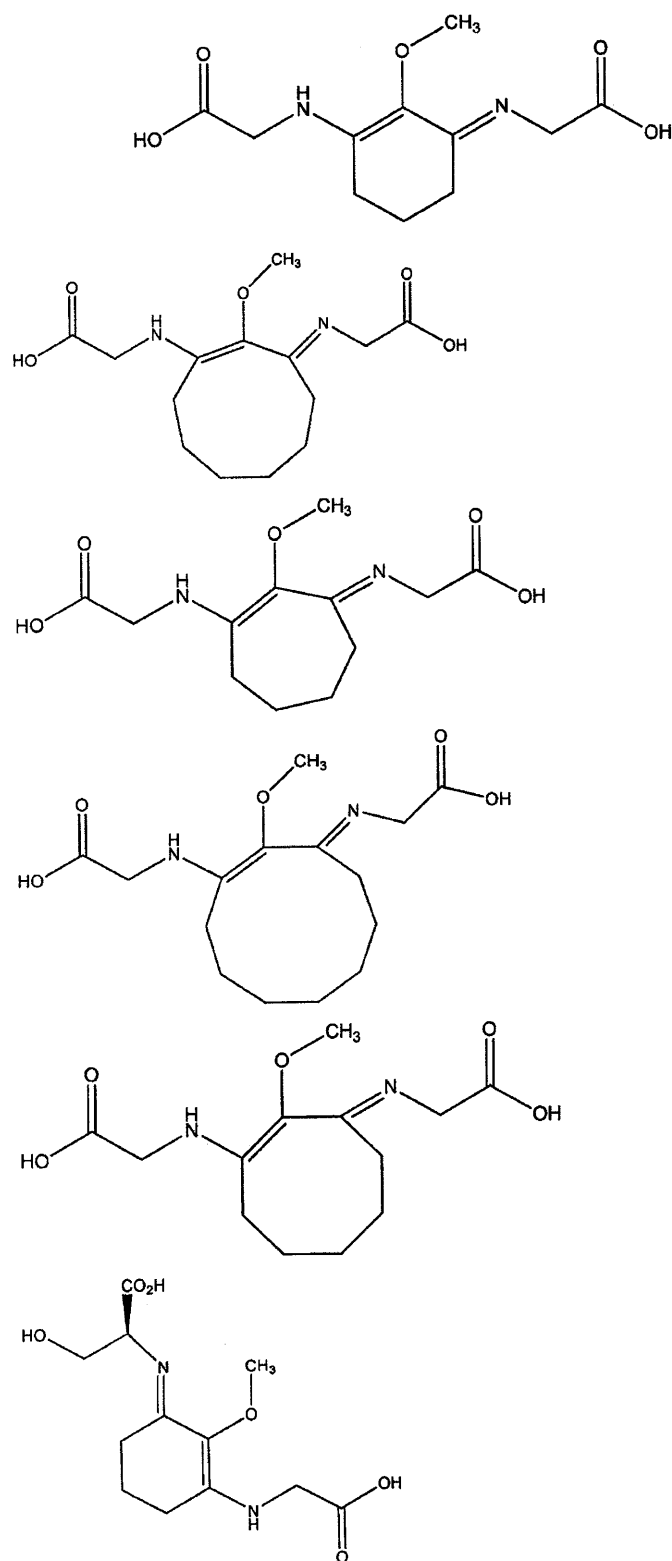
U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V B に対して U V A の値が高くなる第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 5 4 に記載の局所組成物。

〔付記 8 0〕

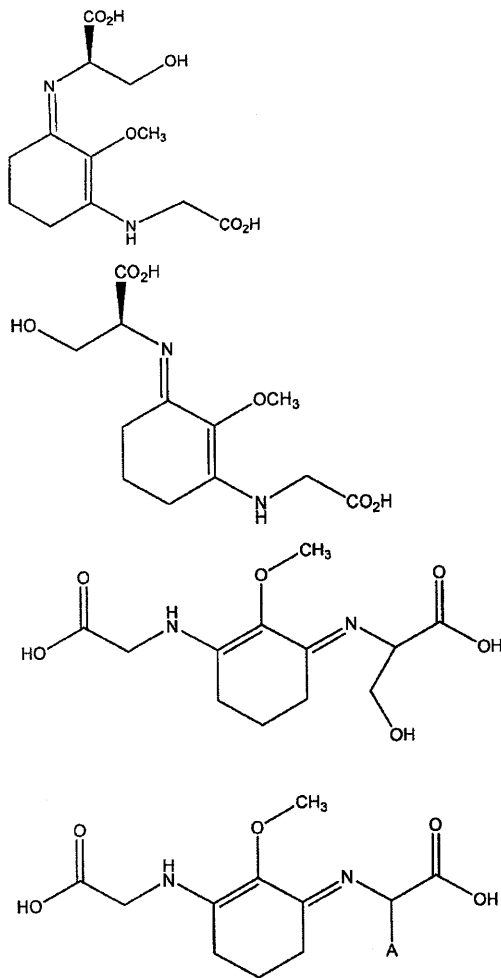
U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V 放射と人間の皮膚との接触が減る第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 6 4 に記載の局所組成物。

〔付記 8 1〕

【化 2 9】



## 【化 3 0】



からなる群から選択される化合物であって、Aは付記1において定義されたとおりである

、

化合物。

〔付記82〕

付記81に記載の化合物、化学的日焼け止め剤、物理的日焼け止め剤、薬学的に許容されるキャリア、又はこれらの組み合わせを含む局所組成物。

〔付記83〕

前記物理的日焼け止め剤は、酸化亜鉛又は酸化チタンのいずれかを含む、付記82に記載の局所組成物。

〔付記84〕

前記化学的日焼け止め剤は、ベンゾトリアゾール、ベンゾフェノン、安息香酸 / P A B A、シンナメート、サリシレート、アボベンゾン、オキシベンゾン（ベンゾフェノン - 3）、タンニン酸、尿酸、キニーネ塩、ジヒドロキシナフトール酸、アンスラニレート、フェニルベンゾイミダゾールスルホン酸、及び P E G - 2 5 P A B A、を含み、更に、ジオキシベンゾン、シノキサート、エチル 4 - [ビス（ヒドロキシプロピル）] アミノベンゾエート、グリセリルアミノベンゾエート、ホモサレート、メンチルアントラニレート、オクトクリレン、オクチルメトキシシンナメート、オクチルサリシレート、パディメート A、パディメート O、赤色ワセリン、二酸化チタン、4 - メンチルベンジリデンカンファール、ベンゾフェノン - 1、ベンゾフェノン - 2、ベンゾフェノン - 4、ベンゾフェノン - 6、ベンゾフェノン - 1 2、イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、ゾトクリレン、D E A - メトキシシンナメート、ジガロイルトリオレエート

、及び／又はＴＥＡ－サリシレートなどの日焼け止め剤化合物を含む、付記８２に記載の局所組成物。

〔付記８５〕

追加のＵＶフィルタを更に含み、前記追加ＵＶフィルタは、p - アミノ安息香酸、その塩及びその誘導体（エチル、イソブチル、グリセリルエステル、p - ジメチルアミノ安息香酸）、アントラニレート（o - アミノベンゾエート、メチル、メンチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、リナリル、テルピニル、及びシクロヘキセニルエステル）、サリシレート（オクチル、アミル、フェニル、ベンジル、メンチル（ホモサレート）、グリセリル、及びジプロピレングリコールエステル）、桂皮酸誘導体（メンチル及びベンジルエステル、  
- フェニルシンナモニトリル、ブチルシンナモイルビルバート）、ジヒドロキシ桂皮酸誘導体（ウンベリフェロン、メチルウンベリフェロン、メチルアセト - ウンベリフェロン）、カンファー誘導体（3ベンジリデン、4メチルベンジリデン、ポリアクリルアミドメチルベンジリデン、ベンザルコニウムメトスルフェート、ベンジリデンカンファースルホン酸、及びテレフタリリデンジカンファースルホン酸）、トリヒドロキシ桂皮酸誘導体（エスクレチン、メチルクレチン、ダフネチン、並びにグルコサイド、エスクリン、及びダフニン）、炭化水素（ジフェニルブタジエン、スチルベン）、ジベンザルアセトン、ベンザルアセトフェノン、ナフトールスルフォネート（2 - ナフトール - 3, 6 - ジスルホン酸のナトリウム塩、及び2 - ナフトール - 6, 8 - ジスルホン酸のナトリウム塩）、ジヒドロキシ - ナフトエ酸及びその塩、o - 及びp - ヒドロキシジフェニルジスルフォネート、クマリン誘導体（7 - ヒドロキシ、7 - メチル、3 - フェニル）、ジアゾール（2 - アセチル - 3 - プロモインダゾール、フェニルベンゾオキサゾール、メチルナフトオキサゾール、様々なアリルベンゾチアゾール）、キニーネ塩（重硫酸塩、硫酸塩、塩化物、オレアート、及びタンニン酸塩）、キノリン誘導体（8 - ヒドロキシキノリン塩、2 - フェニルキノリン）、ヒドロキシ - 又はメトキシ - 置換ベンゾフェノン、尿酸誘導体、吉草酸誘導体、タンニン酸及びその誘導体、ヒドロキノン、並びに、ベンゾフェノン（オキシベンゾン、スリソベンゾン、ジオキシベンゾン、ベンゾレゾルチノール、オクタベンゾン、4 - イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、エトクリレン、及び／又は4 - イソプロピル - ジベンゾイルメタン）を含む、付記８２に記載の局所組成物。

〔付記８６〕

前記化合物は、水中油滴型又は油中水滴型のエマルジョンとして存在する、付記８２に記載の局所組成物。

〔付記８７〕

最初の塗布時の前記組成物の日焼け防止指数（ＳＰＦ）が少なくとも２、１５、３０、５０、又は６０である、付記８２に記載の局所組成物。

〔付記８８〕

前記化合物は、約０．０５ｗｔ％から６０ｗｔ％の濃度で前記組成物中に存在する、付記８２に記載の局所組成物。

〔付記８９〕

ＵＶＡ及び／又はＵＶＢの放射を吸収するとともに、日焼け、及び皮膚老化、皮膚損傷、及びＤＮＡ損傷に対する保護を行うことが可能である、第２の化合物を更に含む、付記８２に記載の局所組成物。

〔付記９０〕

ＵＶＡ及び／又はＵＶＢの放射を吸収することにより、臨界波長値（吸光度の９０％）の測定値が、単独で取得される各成分の臨界波長値より高くなる（ラムダシフト）第２の化合物、又は２つ以上の化合物を更に含む、付記８２に記載の局所組成物。

〔付記９１〕

ＵＶＡ及び／又はＵＶＢの放射を吸収することにより、任意のＵＶ曝露の前と後とで比ＵＶＡ：ＵＶＢの差のパーセンテージが小さくなる（ラムダシフト）第２の化合物、又は２つ以上の化合物を更に含む、付記８２に記載の局所組成物。

## 〔付記 9 2〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、任意の U V 曝露の前と後とで比 U V A : U V B の差のパーセンテージが小さくなる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 8 2 に記載の局所組成物。

## 〔付記 9 3〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、総吸光度が可視スペクトル ( 4 0 0 n m ) に向かってシフトする (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 8 2 に記載の局所組成物。

## 〔付記 9 4〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、総吸光度が増加し、単独で取得される各成分の吸光度値より高くなる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 8 2 に記載の局所組成物。

## 〔付記 9 5〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、製剤、キャリア、ローション、ゲル、又は噴霧液における、U V A 及び / 又は U V B を吸収する 2 つ以上の化合物の濃度を減らすことが可能になり、且つ、2 より大きい S P F 値が維持される第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 8 2 に記載の局所組成物。

## 〔付記 9 6〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、高いほうの耐水性値が、単独で取得される各成分の耐水性値より高い値になる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 8 2 に記載の局所組成物。

## 〔付記 9 7〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V B に対して U V A の値が高くなる第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 8 2 に記載の局所組成物。

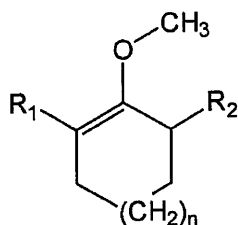
## 〔付記 9 8〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V 放射と人間の皮膚との接触が減る第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 8 2 に記載の局所組成物。

## 〔付記 9 9〕

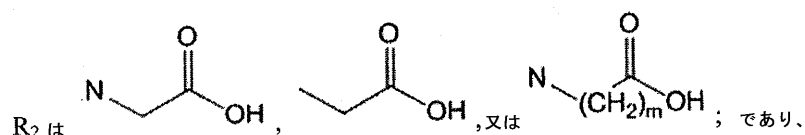
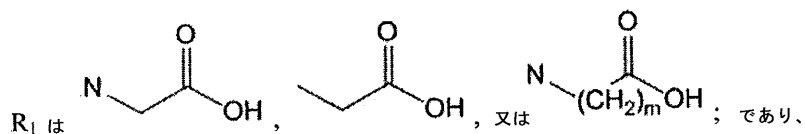
第 1 の化合物であって、前記第 1 の化合物は

## 【化 3 1】



を含み、

## 【化 3 2】

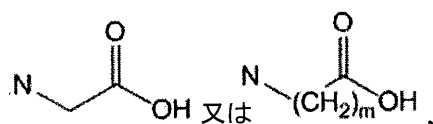


$n = 1, 2, 3$  , 又は 4、並びに

$m = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8$  , 又は 9 であり、

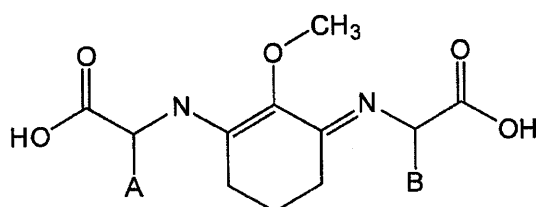
$R_1$  又は  $R_2$  が

## 【化 3 3】



である場合、Nと芳香環との間の結合は二重結合である、前記第1の化合物と、  
第2の化合物であって、前記第2の化合物は

## 【化 3 4】



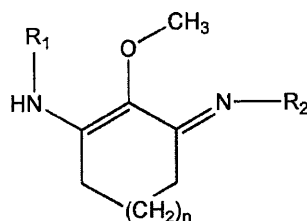
を含み、

AはH、CH<sub>3</sub>、又はCH(R)COOHであり、RはH、又は1個、2個、又は3  
個の炭素を含むアルキル基であり、

BはH、CH<sub>3</sub>、又はCH(R)COOHであり、RはH、又は1個、2個、又は3  
個の炭素を含むアルキル基である、前記第2の化合物と、

第3の化合物であって、前記第3の化合物は

## 【化 3 5】



を含み、

nは0、1、2、3、及び4から選択され、

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は、それぞれが独立に、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-COOH又は-(CH<sub>2</sub>)<sub>y</sub>-  
-CH(A)-COOHであり、

mは1から9の範囲の整数であり、

yは0から8の範囲の整数であり、

Aは、C1-C3直鎖又は分鎖のアルキル基又はアルキニル基であり、これは、任意  
選択で、1つ以上の炭素原子においてヒドロキシ又は-C(O)OR<sub>3</sub>で置換され、R<sub>3</sub>  
はエステル基であり、Aとともに取得されたCが二重結合を形成する場合、CH(A)中  
のHが欠落する、前記第3の化合物と、

物理的日焼け止め剤と、

化学的日焼け止め剤と、

薬学的に許容されるキャリアと、

のうちの少なくとも1つ、又はこれらの組み合わせを含む局所組成物。

## 〔付記100〕

前記物理的日焼け止め剤は、酸化亜鉛又は酸化チタンを含む、付記99に記載の局所組  
成物。

## 〔付記101〕

前記化学的日焼け止め剤は、ベンゾトリアゾール、ベンゾフェノン、安息香酸/PABA、  
シンナメート、サリシレート、アボベンゾン、オキシベンゾン(ベンゾフェノン-3  
)、タンニン酸、尿酸、キニーネ塩、ジヒドロキシナフトール酸、アンスラニレート、フ  
ェニルベンゾイミダゾールスルホン酸、及びPEG-25 PABA、を含み、更に、ジ

オキシベンゾン、シノキサート、エチル 4 - [ビス(ヒドロキシプロピル)] アミノベンゾエート、グリセリルアミノベンゾエート、ホモサレート、メンチルアントラニレート、オクトクリレン、オクチルメトキシシンナメート、オクチルサリシレート、パディメート A、パディメート O、赤色ワセリン、二酸化チタン、4 - メンチルベンジリデンカンファール、ベンゾフェノン - 1、ベンゾフェノン - 2、ベンゾフェノン - 4、ベンゾフェノン - 6、ベンゾフェノン - 12、イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、ゾトクリレン、DEA - メトキシシンナメート、ジガロイルトリオレエート、及び / 又は TEA - サリシレートなどの日焼け止め剤化合物を含む、付記 99 に記載の局所組成物。

[付記 102]

UV フィルタを更に含み、前記 UV フィルタは、p - アミノ安息香酸、その塩及びその誘導体(エチル、イソブチル、グリセリルエステル、p - ジメチルアミノ安息香酸)、アントラニレート(o - アミノベンゾエート、メチル、メンチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、リナリル、テルピニル、及びシクロヘキセニルエステル)、サリシレート(オクチル、アミル、フェニル、ベンジル、メンチル(ホモサレート)、グリセリル、及びジプロピレングリコールエステル)、桂皮酸誘導体(メンチル及びベンジルエステル、フェニルシンナモニトリル、ブチルシンナモイルビルバート)、ジヒドロキシ桂皮酸誘導体(ウンベリフェロン、メチルウンベリフェロン、メチルアセト - ウンベリフェロン)、カンファール誘導体(3 ベンジリデン、4 メチルベンジリデン、ポリアクリルアミドメチルベンジリデン、ベンザルコニウムメトスルフェート、ベンジリデンカンファールスルホン酸、及びテレフタリリデンジカンファールスルホン酸)、トリヒドロキシ桂皮酸誘導体(エスクレチン、メチルクレチン、ダフネチン、並びにグルコサイド、エスクリン、及びダフニン)、炭化水素(ジフェニルブタジエン、スチルベン)、ジベンザルアセトン、ベンザルアセトフェノン、ナフトールスルフォネート(2 - ナフトール - 3, 6 - ジスルホン酸のナトリウム塩、及び 2 - ナフトール - 6, 8 - ジスルホン酸のナトリウム塩)、ジヒドロキシ - ナフトエ酸及びその塩、o - 及び p - ヒドロキシジフェニルジスルフォネート、クマリン誘導体(7 - ヒドロキシ、7 - メチル、3 - フェニル)、ジアゾール(2 - アセチル - 3 - プロモインダゾール、フェニルベンゾオキサゾール、メチルナフトオキサゾール、様々なアリルベンゾチアゾール)、キニーネ塩(重硫酸塩、硫酸塩、塩化物、オレアート、及びタンニン酸塩)、キノリン誘導体(8 - ヒドロキシキノリン塩、2 - フェニルキノリン)、ヒドロキシ - 又はメトキシ - 置換ベンゾフェノン、尿酸誘導体、吉草酸誘導体、タンニン酸及びその誘導体、ヒドロキノン、並びに、ベンゾフェノン(オキシベンゾン、スリソベンゾン、ジオキシベンゾン、ベンゾレゾルチノール、オクタベンゾン、4 - イソプロピルジベンゾイルメタン、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、エトクリレン、及び / 又は 4 - イソプロピル - ジベンゾイルメタン)を含む、付記 99 に記載の局所組成物。

[付記 103]

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、臨界波長値(吸光度の 90%)の測定値が、単独で取得される各成分の臨界波長値より高くなる(ラムダシフト)第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 99 に記載の局所組成物。

[付記 104]

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、任意の UV 曝露の前と後とで比 UVA : UVB の差のパーセンテージが小さくなる(ラムダシフト)第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 99 に記載の局所組成物。

[付記 105]

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、任意の UV 曝露の前と後とで比 UVA : UVB の差のパーセンテージが小さくなる(ラムダシフト)第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 99 に記載の局所組成物。

[付記 106]

UVA 及び / 又は UVB の放射を吸収することにより、総吸光度が可視スペクトル(4

0 0 n m ) に向かってシフトする (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 9 9 に記載の局所組成物。

〔付記 1 0 7〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、総吸光度が増加し、単独で取得される各成分の吸光度値より高くなる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 9 9 に記載の局所組成物。

〔付記 1 0 8〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、製剤、キャリア、ローション、ゲル、又は噴霧液における、U V A 及び / 又は U V B を吸収する 2 つ以上の化合物の濃度を減らすことが可能になり、且つ、2 より大きい S P F 値が維持される第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 9 9 に記載の局所組成物。

〔付記 1 0 9〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、高いほうの耐水性値が、単独で取得される各成分の耐水性値より高い値になる (ラムダシフト) 第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 9 9 に記載の局所組成物。

〔付記 1 1 0〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V B に対して U V A の値が高くなる第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 9 9 に記載の局所組成物。

〔付記 1 1 1〕

U V A 及び / 又は U V B の放射を吸収することにより、U V 放射と人間の皮膚との接触が減る第 2 の化合物、又は 2 つ以上の化合物を更に含む、付記 9 9 に記載の局所組成物。