

【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】令和7年7月1日(2025.7.1)

【公開番号】特開2024-770(P2024-770A)

【公開日】令和6年1月9日(2024.1.9)

【年通号数】公開公報(特許)2024-003

【出願番号】特願2022-99661(P2022-99661)

【国際特許分類】

A 6 1 K 8/49(2006.01)

A 6 1 Q 19/02(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 8/49

A 6 1 Q 19/02

【手続補正書】

【提出日】令和7年6月23日(2025.6.23)

【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

20

【補正方法】変更

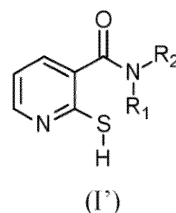
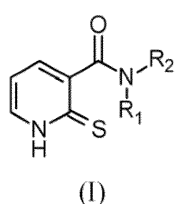
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

(1)以下の式(I)の化合物、以下の式(I')の互変異性体、これらの塩、これらの水和物等の溶媒和物、これらの光学異性体、これらのラセミ体、及びこれらの混合物から選択される少なくとも1種の化合物:

【化1】



30

(式中、

R₁は、

a)水素原子、並びに

b)飽和直鎖状C₁~C₁₀又は分枝状C₃~C₁₀アルキル基であり、同一であっても異なっているとしてもよく、

40

i)-O-R₃及び

ii)-S-R₃

から選択される1つ以上の基で任意選択により置換されている、飽和直鎖状C₁~C₁₀又は分枝状C₃~C₁₀アルキル基

から選択される基を示し、

R₂は、

a)水素原子と、

b)飽和直鎖状C₁~C₁₂又は分枝状C₃~C₁₂又は環状C₃~C₈炭化水素基であり、同一であっても異なっているとしてもよく、

i)-O-R₃、

50

ii)-S-R₃、

iii)-C(O)-O-R₃、並びに

iv)1つ以上のヒドロキシル及び/若しくは1つ以上のC₁~C₈アルコキシ基で任意選択により置換されている、C₅~C₁₂アリール基から選択される1つ以上の基で任意選択により置換されている、飽和直鎖状C₁~C₁₂又は分枝状C₃~C₁₂又は環状C₃~C₈炭化水素基と、

c)1つ以上のヒドロキシル及び/又は1つ以上のC₁~C₈アルコキシ基で任意選択により置換されている、C₅~C₁₂アリール基とから選択される基を示し、

R₃は、

a)水素原子、及び

b)飽和直鎖状C₁~C₁₀又は分枝状C₃~C₁₀アルキル基から選択される基を示す)、

(2)少なくとも1種のpH調節剤、並びに

(3)水

を含み、

pHが、4.5から6.5、好ましくは5から6である、組成物、好ましくは化粧品組成物。

【請求項2】

式(I)及び(I')のR₁が、水素原子を表すか、

又は

式(I)及び(I')のR₁が、直鎖状(C₁~C₁₀)アルキル基若しくは分枝状(C₃~C₁₀)アルキル基、特に直鎖状(C₁~C₆)アルキル基若しくは分枝状(C₃~C₆)アルキル基、例えばメチル、エチル、n-ペンチル、n-ノニル、イソブチル、より好ましくはエチルを表し、特にR₁の前記アルキル基が置換されていない、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

式(I)及び(I')のR₂が、水素原子を表すか、

又は

式(I)及び(I')のR₂が、直鎖状(C₁~C₁₀)アルキル基若しくは分枝状(C₃~C₁₀)アルキル基、特に直鎖状(C₁~C₆)アルキル基若しくは分枝状(C₃~C₆)アルキル基、例えばメチル、エチル、n-ペンチル、n-ノニル、イソブチル、より好ましくはメチル若しくはエチル基を表し、R₂の前記アルキル基が置換されていない、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

式(I)及び(I')のR₂が、直鎖状(C₁~C₁₀)アルキル基又は分枝状(C₃~C₁₀)アルキル基、特に直鎖状(C₁~C₆)アルキル基又は分枝状(C₃~C₆)アルキル基、例えばメチル、エチル、n-ペンチル、n-ノニル、イソブチル、より好ましくはメチル又はエチルを表し、前記アルキル基が、上記のi)、ii)、iii)及びiv)から選択される1つ以上の基で置換されており、好ましくは前記アルキル基が、i)、ii)及びiii)から選択される1つ又は2つの基で置換されており、より好ましくはi)及びiii)から選択される1つ又は2つの基で置換されており、より良好にはカルボキシとしての1つの基iii)で置換されている、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

式(I)及び(I')のR₂が、(C₃~C₈)シクロアルキル基、好ましくは(C₅~C₇)シクロアルキル基、例えばシクロヘキシルを表すか、

又は

式(I)及び(I')のR₂が、1つ以上のヒドロキシル及び/若しくは1つ以上のC₁~C₈アルコキシ基で任意選択により置換されているC₅~C₁₂アリール基、好ましくは特に置換されていないフェニル基を表す、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

式(I)及び(I')のR₃が、水素原子を表すか、

又は

10

20

30

40

50

式(I)及び(I')の R_3 が、飽和直鎖状 $C_1 \sim C_{10}$ 若しくは分枝状 $C_3 \sim C_{10}$ アルキル基、特に直鎖状($C_1 \sim C_6$)アルキル基若しくは分枝状($C_3 \sim C_6$)アルキル基、好ましくは($C_1 \sim C_4$)アルキル基、例えばメチル基を表す、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

式(I)及び(I')の R_1 が、

a)水素原子、並びに

b)飽和直鎖状 $C_1 \sim C_6$ 又は分枝状 $C_3 \sim C_6$ アルキル基であり、同一であっても異なってもよく、

i)-O- R_3 及び

ii)-S- R_3

から選択される1つ以上の基で任意選択により置換されている、好ましくは1つ以上の基i

)で任意選択により置換されている、飽和直鎖状 $C_1 \sim C_6$ 又は分枝状 $C_3 \sim C_6$ アルキル基

から選択される基を表し、

式(I)及び(I')の R_2 が、

a)水素原子と、

b)飽和直鎖状 $C_1 \sim C_{10}$ 又は分枝状 $C_3 \sim C_{10}$ 又は環状 $C_3 \sim C_8$ 、例えば $C_5 \sim C_6$ 炭化水素基であり、同一であっても異なってもよく、

i)-O- R_3 、

ii)-S- R_3 、

iii)-C(O)-O- R_3 、並びに

iv)1つ以上のヒドロキシル及び/若しくは1つ以上の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、例えばメトキシで任意選択により置換されているフェニル基、

から選択される1つ以上の基で任意選択により置換されている、好ましくはi)及びiii)か

ら選択される1つ以上の基、好ましくはiii)カルボキシ等で置換されている、飽和直鎖状 $C_1 \sim C_{10}$ 又は分枝状 $C_3 \sim C_{10}$ 又は環状 $C_3 \sim C_8$ 、例えば $C_5 \sim C_6$ 炭化水素基と

から選択される基を表し、

式(I)及び(I')の R_3 が、

a)水素原子、及び

b)飽和直鎖状 $C_1 \sim C_6$ 又は $C_3 \sim C_6$ アルキル基

から選択される基を表し、

優先的には、式(I)の化合物及び互変異性体(I')、これらの塩、これらの水和物等の溶媒和物、これらの光学異性体、これらのラセミ体、及びこれらの混合物において、以下の意味を有する：

式(I)及び(I')の R_1 が、

a)水素原子、及び

b)飽和直鎖状 $C_1 \sim C_4$ 又は分枝状 $C_3 \sim C_4$ アルキル基であり、同一であっても異なってもよく、i)-OR₃から選択される1つ以上の基で任意選択により置換されている、より

好ましくは置換されていない、飽和直鎖状 $C_1 \sim C_4$ 又は分枝状 $C_3 \sim C_4$ アルキル基

から選択される基を表し、

式(I)及び(I')の R_2 が、

a)水素原子と、

b)飽和直鎖状 $C_1 \sim C_{10}$ 又は分枝状 $C_3 \sim C_{10}$ 又は環状 $C_3 \sim C_8$ 、例えば $C_5 \sim C_6$ 炭化水素基であり、同一であっても異なってもよく、

i)-O- R_3 、

iii)-C(O)-O- R_3 、並びに

iv)1つ以上のヒドロキシル及び/若しくは1つ以上の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基で任意選択により置換されている $C_5 \sim C_{12}$ アリール基

から選択される1つ以上の基で任意選択により置換されている、飽和直鎖状 $C_1 \sim C_{10}$ 又は

分枝状 $C_3 \sim C_{10}$ 又は環状 $C_3 \sim C_8$ 、例えば $C_5 \sim C_6$ 炭化水素基と

から選択される基を表し、

10

20

30

40

50

式(1)及び(1')のR₃が、

- a) 水素原子、
- b) 飽和直鎖状C₁~C₄又は分枝状C₃~C₄アルキル基、例えばメチル又はエチルから選択される基を表す、請求項1に記載の組成物。

【請求項8】

(1)化合物が、以下の化合物1から24、これらの互変異性体、これらの塩、これらの水和物等の溶媒和物、これらの光学異性体、これらのラセミ体、及びこれらの混合物から、特に化合物1、2、4、6、7、9、11、12、14、15、16、17、18、19、20、又は21から、より特定すると化合物1、9、16、18、19、20、又は21から、好ましくは化合物18、19、20、又は21から選択される、より好ましくは化合物20である、請求項1

10

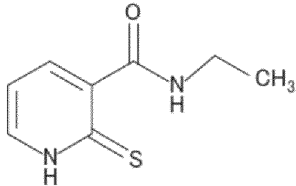
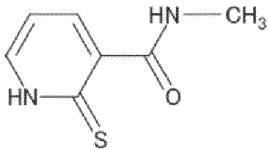
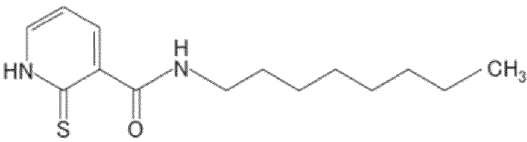
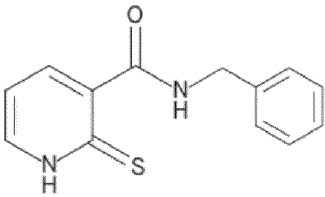
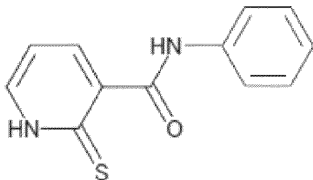
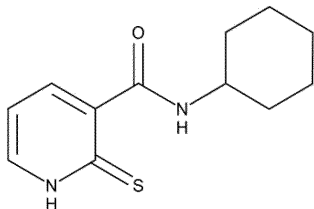
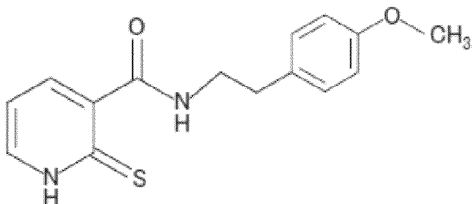
20

30

40

50

【表 1 A】

No.	構造	化学名
1		N-エチル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
2		N-メチル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
3		N-オクチル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
4		N-ベンジル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
5		N-フェニル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
6		N-シクロヘキシル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
7		N-[2-(4-メトキシフェニル)エチル]-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

10

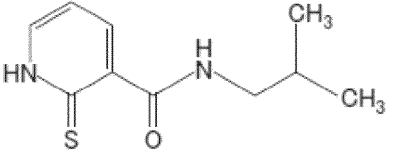
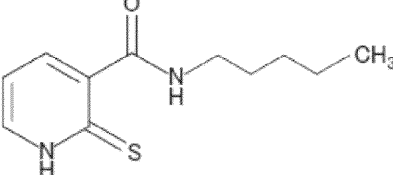
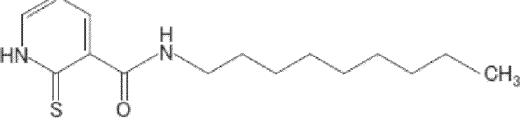
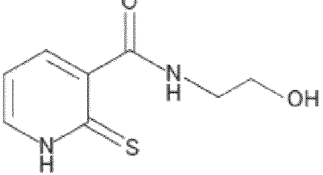
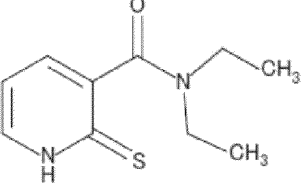
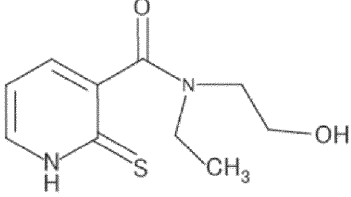
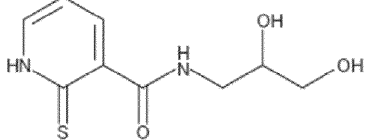
20

30

40

50

【表 1 B】

8		N-(2-メチルプロピル)-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
9		N-ペンチル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
10		N-ノニル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
11		N-(2-ヒドロキシエチル)-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
12		N,N-ジエチル 2-メルカプトニコチンアミド
13		N-エチル-N-(2-ヒドロキシエチル)-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
14		N-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

10

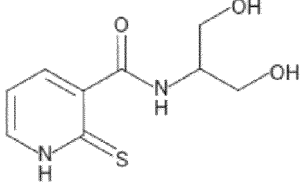
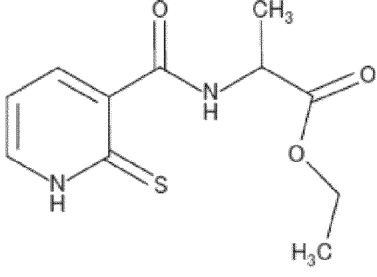
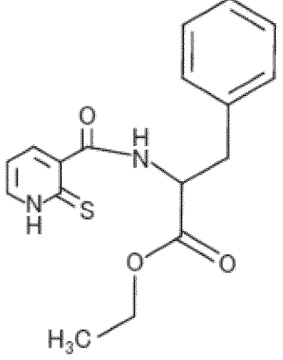
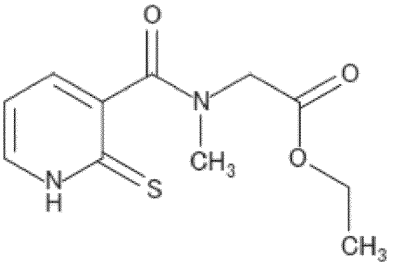
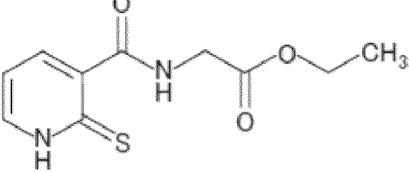
20

30

40

50

【表 1 C】

15		N-(1,3-ジヒドロキシプロパン-2-イル)-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
16		エチル N-[(2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)カルボニル]アラニネート
17		エチル N-[(2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)カルボニル]フェニルアラニネート
18		エチル N-メチル-N-[(2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)カルボニル]グリシネート
19		エチル N-[(2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)カルボニル]グリシネート

10

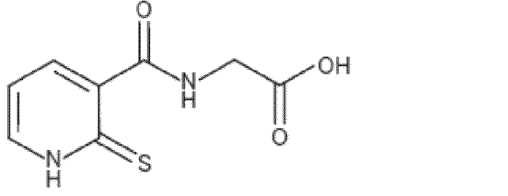
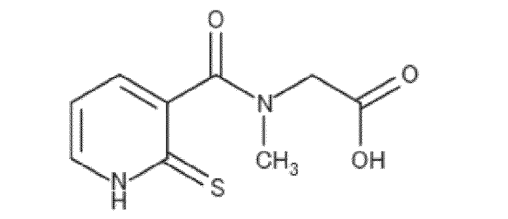
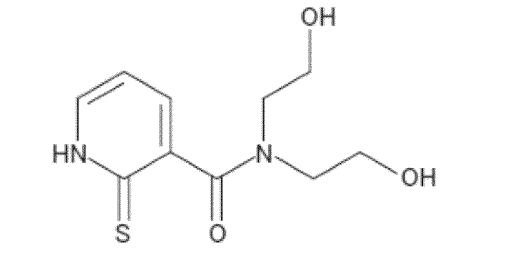
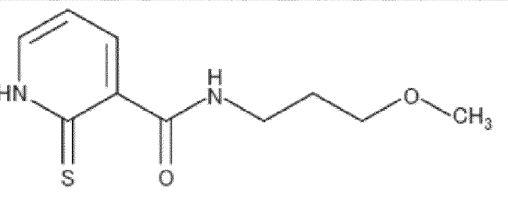
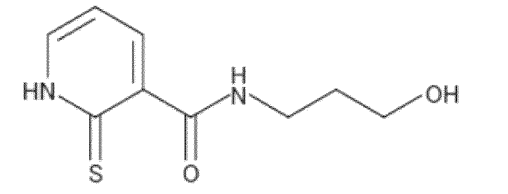
20

30

40

50

【表 1 D】

20		N-[(2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)カルボニル]グリシン
21		N-メチル-N-[(2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)カルボニル]グリシン
22		N,N-ビス(2-ヒドロキシエチル)-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
23		N-(3-メトキシプロピル)-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド
24		N-ブチル-2-チオキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボキサミド

10

20

30

【請求項 9】

前記組成物中の(1)化合物の量が、前記組成物の総質量に対して、0.01質量%~10質量%、好ましくは0.05質量%~5質量%、より好ましくは0.1質量%~3質量%である、請求項1に記載の組成物。

【請求項 10】

(2)pH調節剤が、酸性化剤、塩基性化剤、及びこれらの混合物から選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項 11】

前記組成物中の(2)pH調節剤の量が、前記組成物の総質量に対して、0.01質量%~15質量%、好ましくは0.05質量%~10質量%、より好ましくは0.1質量%~5質量%である、請求項1に記載の組成物。

40

【請求項 12】

前記組成物中の(3)水の量が、前記組成物の総質量に対して、20質量%~99質量%、好ましくは30質量%~95質量%、より好ましくは40質量%~90質量%である、請求項1に記載の組成物。

【請求項 13】

ケラチン物質、好ましくは皮膚を白色化するためのものである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 14】

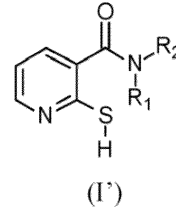
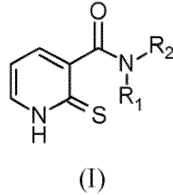
50

ケラチン物質、好ましくは皮膚のための美容方法、好ましくは白色化方法であって、請求項1から13のいずれか一項に記載の組成物を前記ケラチン物質に塗布する工程を含む、方法。

【請求項15】

(1)以下の式(I)の化合物、以下の式(I')の互変異性体、これらの塩、これらの水和物等の溶媒和物、これらの光学異性体、これらのラセミ体、及びこれらの混合物から選択される少なくとも1種の化合物:

【化2】



10

(式中、

R₁は、

a)水素原子、並びに

b)飽和直鎖状C₁~C₁₀又は分枝状C₃~C₁₀炭化水素基であり、同一であっても異なってもよく、

20

i)-O-R₃及び

ii)-S-R₃

から選択される1つ以上の基で任意選択により置換されている、飽和直鎖状C₁~C₁₂又は分枝状C₃~C₁₂炭化水素基

から選択される基を示し、

R₂は、

a)水素原子と、

b)飽和直鎖状C₁~C₁₂又は分枝状C₃~C₁₂又は環状C₃~C₈炭化水素基であり、同一であっても異なってもよく、

i)-O-R₃、

30

ii)-S-R₃、

iii)-C(O)-O-R₃、並びに

iv)1つ以上のヒドロキシル及び/若しくは1つ以上のC₁~C₈アルコキシ基で任意選択により置換されているC₅~C₁₂アリール基

から選択される1つ以上の基で任意選択により置換されている、飽和直鎖状C₁~C₁₂又は分枝状C₃~C₁₂又は環状C₃~C₈炭化水素基と、

c)1つ以上のヒドロキシル及び/又は1つ以上のC₁~C₈アルコキシ基で任意選択により置換されているC₅~C₁₂アリール基と

から選択される基を示し、

R₃は、

40

a)水素原子、及び

b)飽和直鎖状C₁~C₁₀又はC₃~C₁₀アルキル基から選択される基を示す)

を含む組成物中での(2)少なくとも1種のpH調節剤の使用であって、

組成物のpHを4.5から6.5に制御して(1)化合物を安定化するための、使用。

50