

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 96116061

※ 申請日期： 96.5.7

※IPC 分類：

C07D 251/54 (2006.01.01)
A61K 8/49 (2006.01.01)
A61Q 17/04 (2006.01.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

三吡啉衍生物

Triazine derivatives

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

汽巴特用化學品控股公司

CIBA SPECIALTY CHEMICALS HOLDING INC.

代表人：(中文/英文)

1. 漢斯-培特·威特林 / WITTLIN, HANS-PETER

2. 沛卓 庫菲爾 / QUERFELD, PETRA

住居所或營業所地址：(中文/英文)

瑞士，4057 巴賽爾城，克律貝街 141 號

Klybeckstrasse 141, 4057 Basel, SWITZERLAND

國 籍：(中文/英文)

瑞士 / Switzerland

三、發明人：(共 2 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 湯瑪斯 俄里斯 / EHLIS, THOMAS

2. 艾列克 波索 / BORSOS, ELEK

國 籍：(中文/英文)

1. 德國 / Germany

2. 瑞士 / Switzerland

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，
其事實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：
歐洲專利、2006.05.08、06113634.7

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

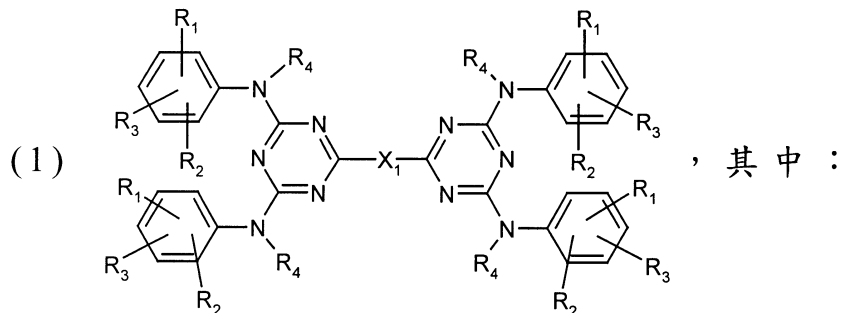
本發明係關於特定的三嘍衍生物、這些化合物之製備、新三嘍衍生物及包含這些三嘍衍生物之化粧品組成物的微粉化顆粒之製備。

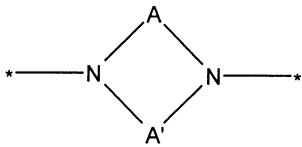
【先前技術】

無

【發明內容】

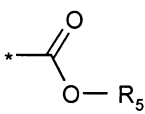
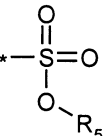
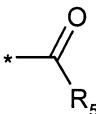
三嘍衍生物符合下式

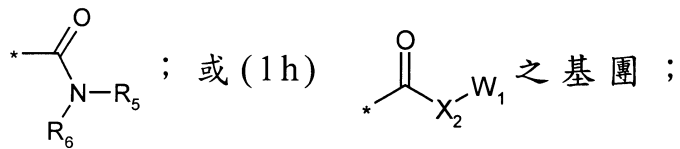


X_1 為式 (1a) $-NR_9-A-NR_9-$; (1b)  ; 或

(1c) $-O-A-O-$ 之二價基團；

A 及 A'彼此獨立地為未經取代或經取代的直鏈或支鏈 C_1-C_{12} 伸烷基，其視需要由 C_5-C_{12} 伸環烷基、N、O 或 S 中斷； C_5-C_{12} 伸環烷基；伸聯苯基； C_6-C_{10} 伸芳基；或 C_5-C_{10} 伸芳基- $(C_1-C_{12}$ 伸烷基)；

R_1 為式 (1d)  ; (1e)  ; (1f)  ; (1g)



R_2 及 R_3 彼此獨立地為氫； C_1 - C_{12} 烷基； OR_7 ； NR_7R_8 ； C_6 - C_{10} 芳基；

X_2 為 O 或 NH；

W_1 為 C_1 - C_{20} 烷基；或 Sp-Sil 基團；

Sp 為直鏈或支鏈的飽和或單或多不飽和 C_3 - C_{12} 烴；

Sil 為矽烷；寡矽氧烷；或聚矽氧烷部分；及

R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 及 R_9 彼此獨立地為氫； C_1 - C_{12} 烷基；或 C_3 - C_{12} 環烷基。

C_1 - C_{12} 烷基為例如甲基、乙基、丙基、異丙基、正丁基、二級丁基、三級丁基、正戊基、2-戊基、3-戊基、2,2'-二甲基丙基、環戊基、環己基、正己基、正辛基、1,1',3,3'-四甲基丁基或 2-乙基己基、壬基、癸基、十一烷基或十二烷基。

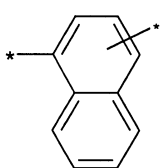
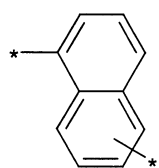
C_6 - C_{10} 芳基有例如萘基或較佳為苯基。

C_1 - C_{12} 伸烷基有例如亞甲基、伸乙基、伸丙基、伸異丙基、伸正丁基、伸二級丁基、伸三級丁基、伸正戊基、2-伸戊基、3-伸戊基、伸 2,2'-二甲基丙基、伸環戊基、伸環己基、伸正己基、伸正辛基、1,1',3,3'-四甲基伸丁基、2-乙基伸己基、伸壬基、伸癸基或伸十二烷基。

伸烷基可為直鏈、支鏈或 C_5 烷基以上的單環或多環，且可由雜原子諸如 O、S、-CO-、N、NH、 NR_x 、-OCO-、-CO(OR_x)-、-CONR_x-、-(R_x)NC(O)-中斷；例如 C_1 - C_{10} 伸烷

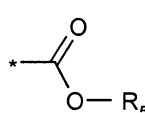
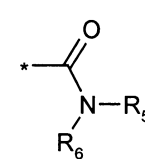
基可為二價基團，諸如： $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CH}(\text{N}(\text{CH}_3)_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{NCH}_3-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{COCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CO}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{NHCO}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CONH}-\text{CH}_3-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{NCH}_3\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CONCH}_3-\text{CH}_3-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NHCO}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{NHCO}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CONH}-\text{CH}_2-$ 或 $-\text{CH}_2-\text{CONH}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 。 R_x 為氫或 C_1-C_{12} 烷基。

C_5-C_{10} 伸環烷基有例如伸環戊基、伸環己基、伸環庚基或伸環辛基。

C_6-C_{10} 伸芳基有例如伸萘基，如  或 ，

或較佳為伸苯基。

較佳為式(1)之化合物，其中

R_1 為式(1d) ；或(1g)  的基團；其中

R_5 及 R_6 彼此獨立地為氫；或 C_1-C_5 烷基；及更佳的是，其中

R_5 為 C_1-C_5 烷基；或氫；及

R_6 為氫。

在式(1)中：

X_1 較佳為式(1b)之基團，其中

A 及 A' 為 C_1 - C_4 伸烷基；或其中

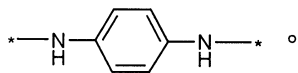
X_1 較佳為式(1a)之基團，其中

A 為 C_1 - C_5 伸烷基；或伸苯基；及

R_9 為氫。

最佳在式(1)中：

X_1 選自於 $-\text{NH}-(\text{CH}_2)_2-\text{NH}-$ ； $^*\text{NH}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{NH}-^*$ ； $-\text{N}(\text{CH}_2)_6-\text{N}-$ ；及

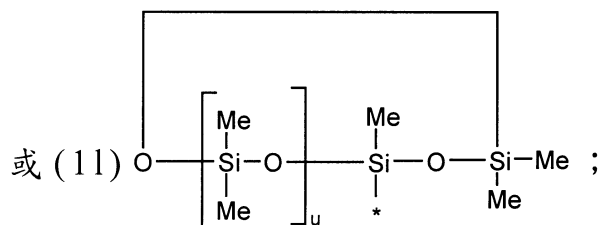
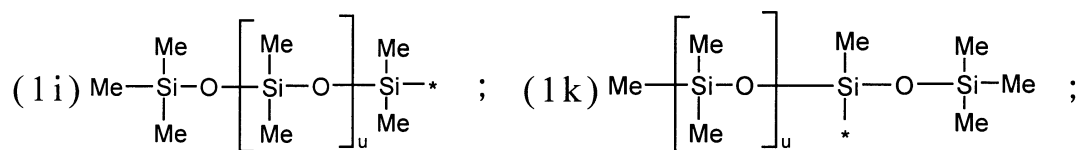


最佳為其中 R_2 、 R_3 及 R_4 為氫之式(1)的化合物。

亦較佳的式(1)之化合物有其中

Si1 為 $\text{SiR}_{10}\text{R}_{11}\text{R}_{12}$ 基團，其中

R_{10} 、 R_{11} 及 R_{12} 各獨立地為 C_1 - C_6 烷基； C_1 - C_6 烷氧基；或苯基；或式 $-\text{SiMe}_m(\text{OSiMe}_3)_n$ 之寡矽氧烷；或下式的寡矽氧烷：



其中

Me 為甲基；

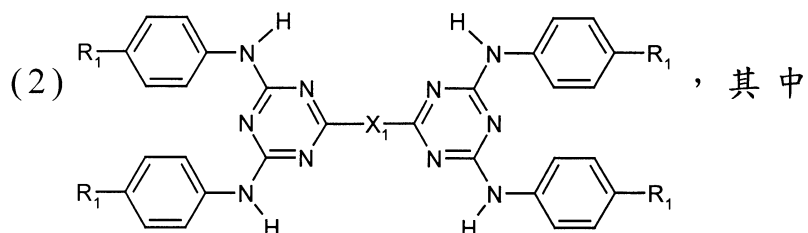
m 為 0 ; 1 ; 或 2 ;

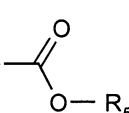
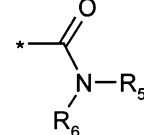
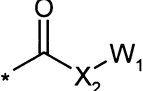
n 為 1 ; 2 ; 或 3 ;

m+n 為 3 ; 及

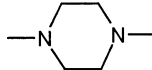
u 為 0 至 6 。

非常最佳為式(2)之化合物



R₁ 為式(1d)  ; (1g)  ; 或(1h)  之

基團 ;

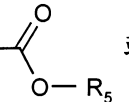
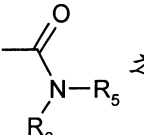
X₁ 為式(1a)-NR₉-A-NR₉- ; (1c)*-O-A-O-* ; 及  -

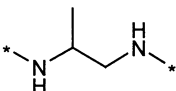
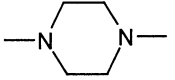
之基團 ;

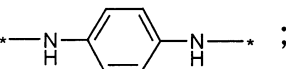
A、W₁、X₂ 及 R₉ 如在式(1)中所定義 ; 及

R₅ 及 R₆ 彼此獨立地為氫 ; 或 C₁-C₄ 烷基。

較佳為式(2)之化合物 , 其中

R₁ 為式(1d)  或(1g)  之基團 ;

X₁ 選自於 -NH-(CH₂)₂-NH- ;  ;  - ;

及  ; 及

R₅ 及 R₆ 彼此各自獨立地為氫 ; 或 C₁-C₄ 烷基。

式(1)之化合物的實例列在下表中：

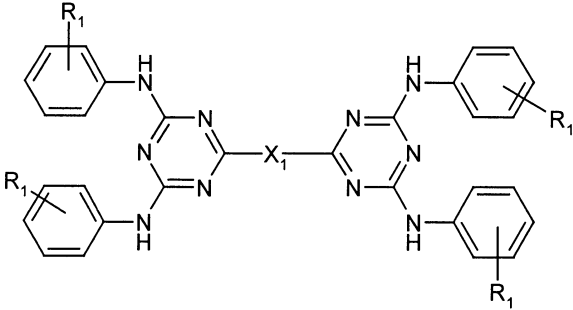
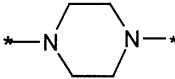
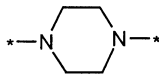
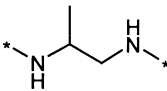
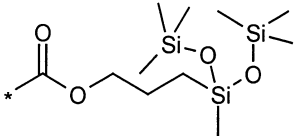
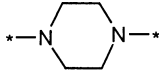
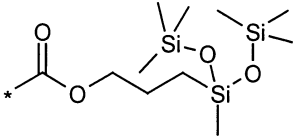
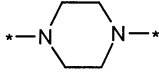
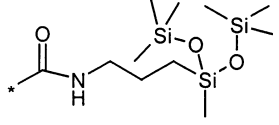
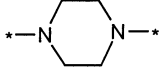
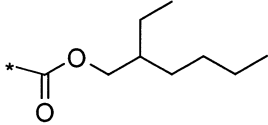
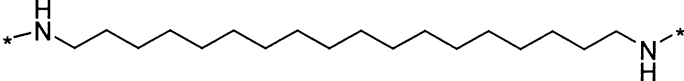
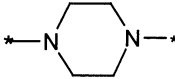
表 1：		
 T		
下列式之 化合物	R ₁	X ₁
(3)	-CO(O)-C ₂ H ₅	
(4)	-CO(O)-C ₂ H ₅	-NH-(CH ₂) ₂ -NH-
(5)	-CO(O)-C ₂ H ₅	
(6)	-CO-NH ₂	
(7)	-CO-NH ₂	-NH-(CH ₂) ₂ -NH-
(8)	-CO(O)-C ₂ H ₅	
(9)		
(10)		
(11)		
(12)		
(13)	-CO(O)-CH ₃	

表 1：

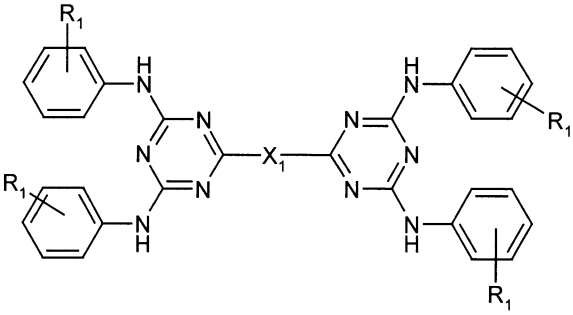
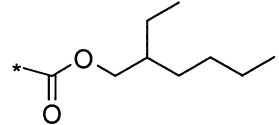
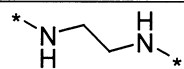
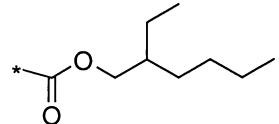
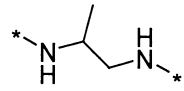
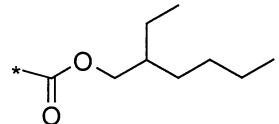
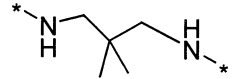
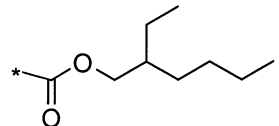
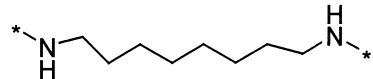
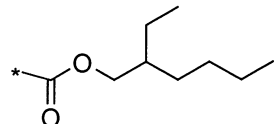
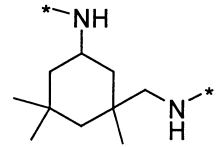
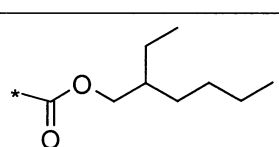
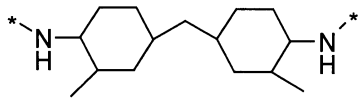
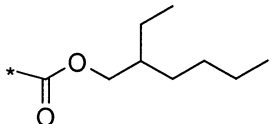
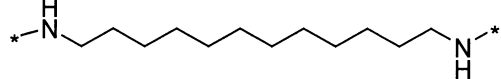
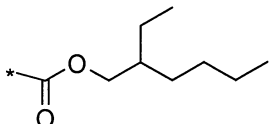
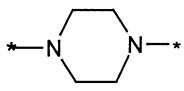
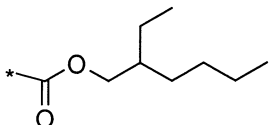
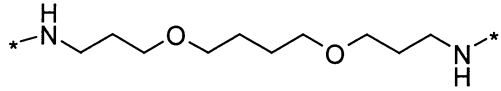
 T		
下列式之 化合物	R ₁	X ₁
(14)		
(15)		
(16)		
(17)		
(18)		
(19)		
(20)		
(21)		
(22)		

表 1：

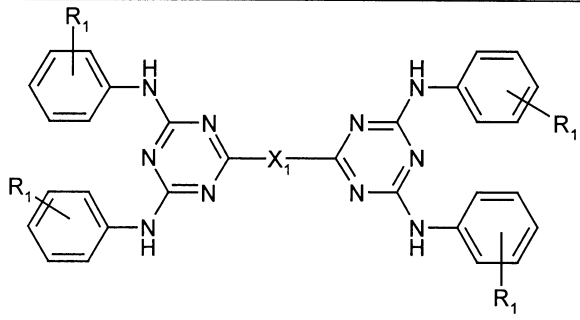
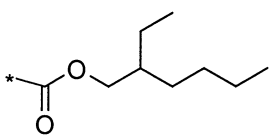
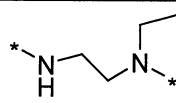
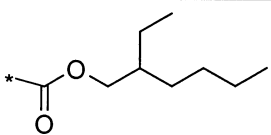
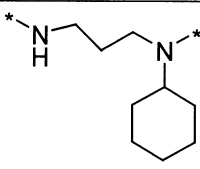
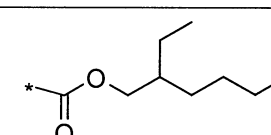
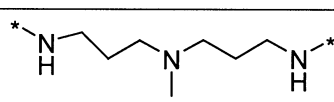
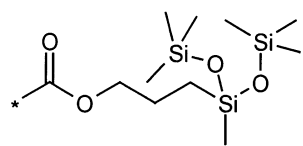
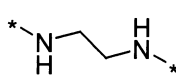
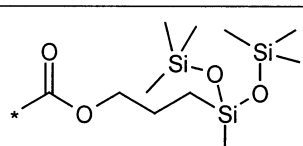
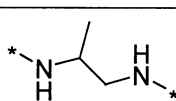
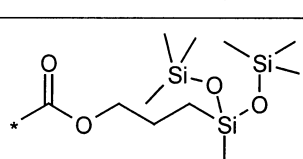
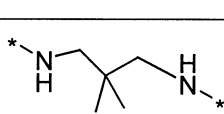
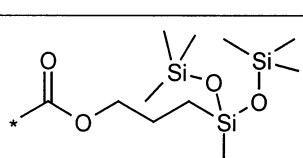
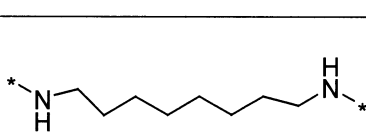
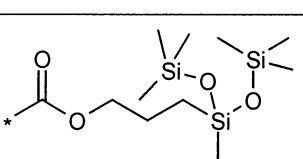
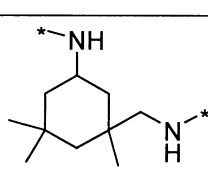
 T		
下列式之 化合物	R ₁	X ₁
(23)		
(24)		
(25)		
(26)		
(27)		
(28)		
(29)		
(30)		

表 1：

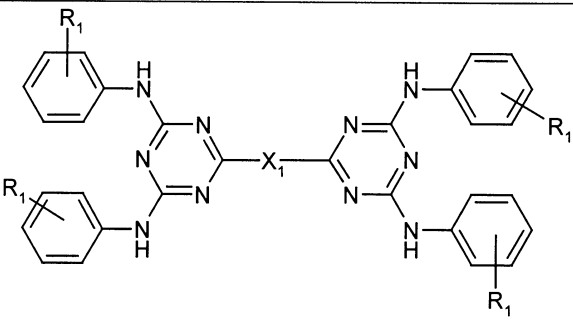
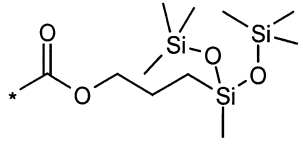
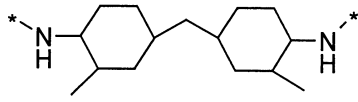
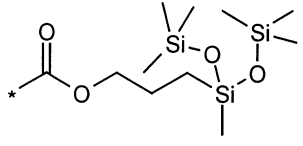
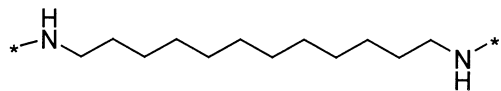
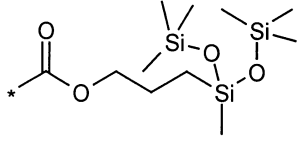
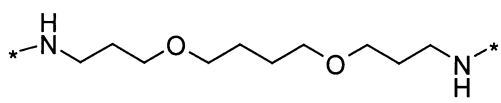
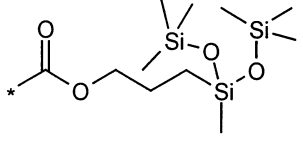
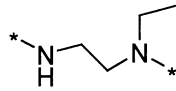
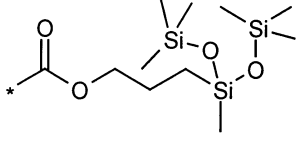
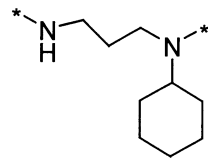
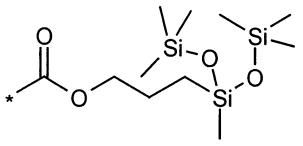
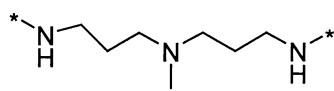
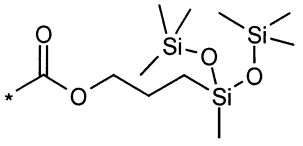
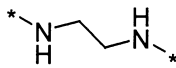
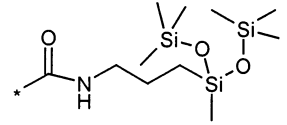
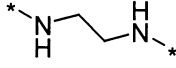
 T		
下列式之 化合物	R ₁	X ₁
(31)		
(32)		
(33)		
(34)		
(35)		
(36)		
(37)		
(38)		

表 1：

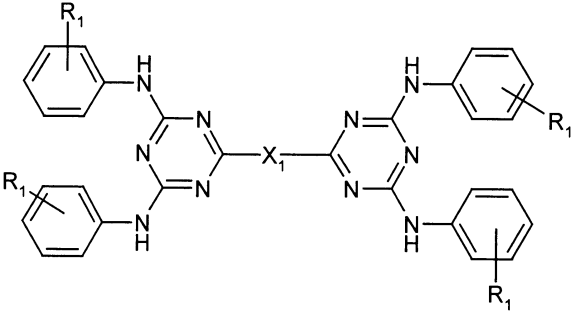
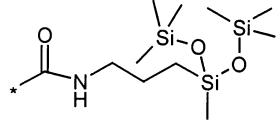
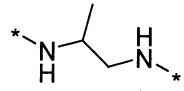
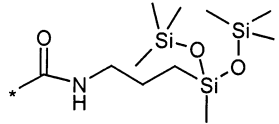
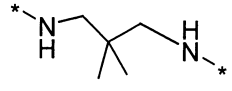
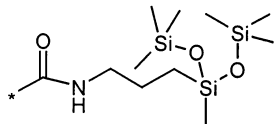
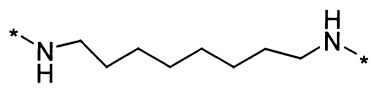
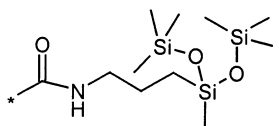
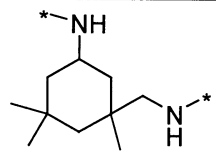
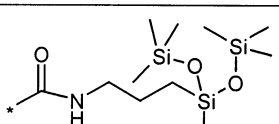
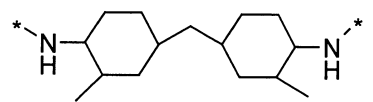
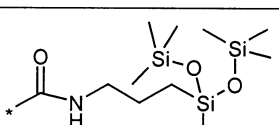
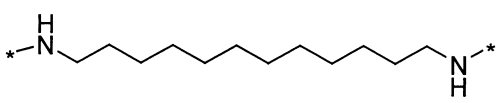
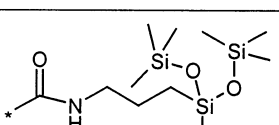
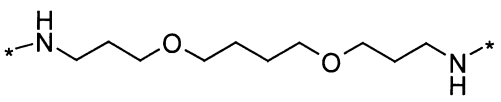
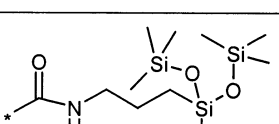
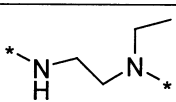
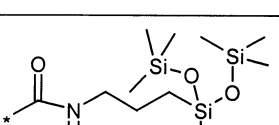
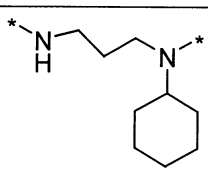
 T		
下列式之 化合物	R ₁	X ₁
(39)		
(40)		
(41)		
(42)		
(43)		
(44)		
(45)		
(46)		
(47)		

表 1：

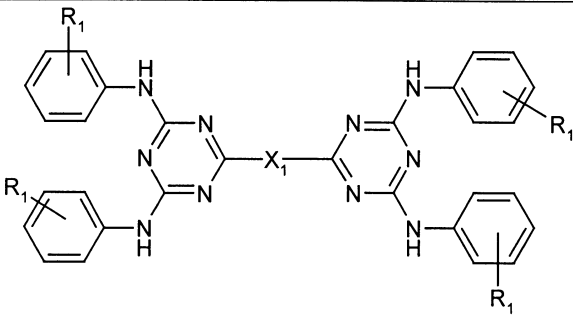
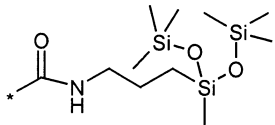
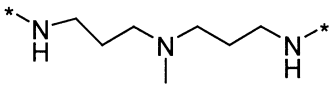
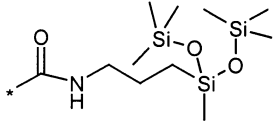
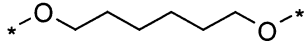
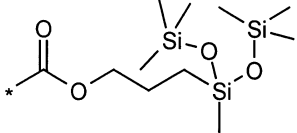
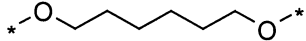
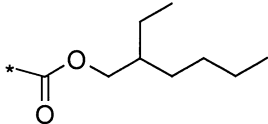
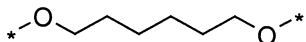
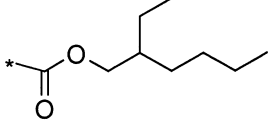
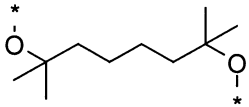
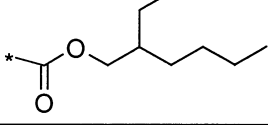
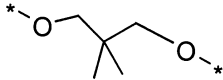
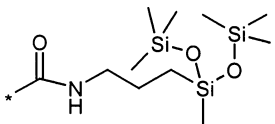
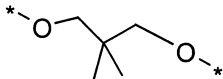
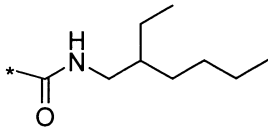
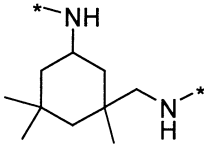
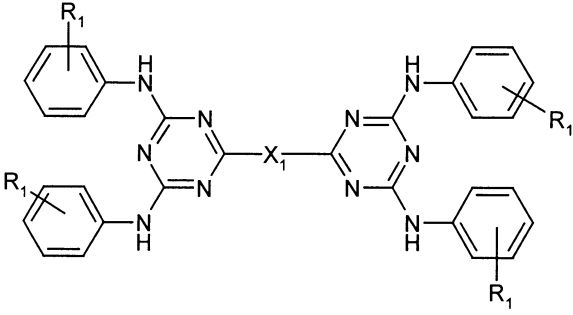
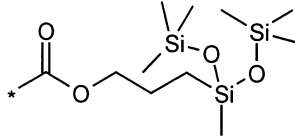
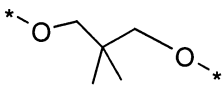
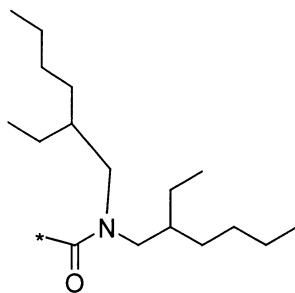
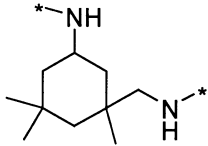
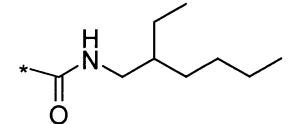
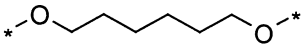
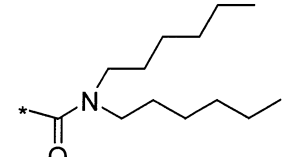
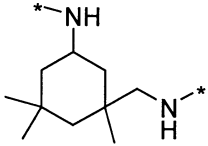
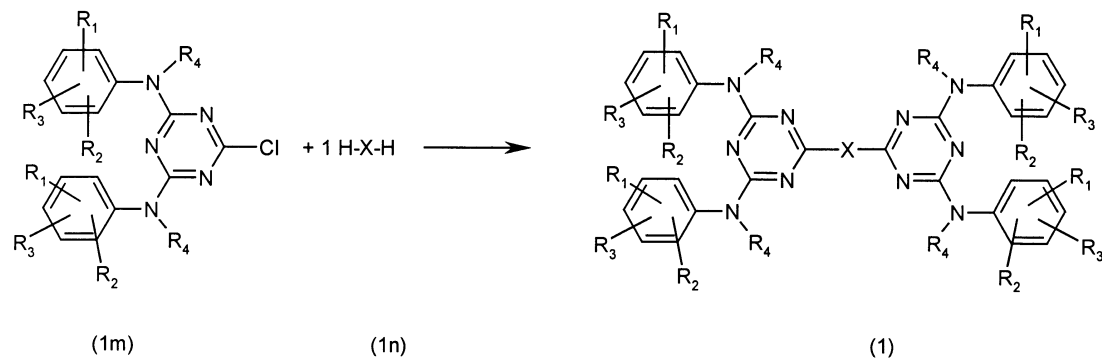
 T		
下列式之 化合物	R ₁	X ₁
(48)		
(49)		
(50)		
(51)		
(52)		
(53)		
(54)		
(55)	-CO(O)-CH ₃	-NH-(CH ₂) ₂ -NH-
(56)		

表 1：		
 T		
下列式之 化合物	R ₁	X ₁
(57)		
(58)		
(59)		
(60)		

式(1)之化合物利用從先前技術得知的方法來製備，如揭示例如在化學家機構期刊(inida)，6(5)，第 197 頁(1984)中；或在化學家機構期刊(inida)，57(6)，第 233 頁(1985)中；或在 EP 818 450 中。該方法通常包括根據下列反應方案，讓 2 莫耳式(1m)的鹵素三吡，較佳為氯三吡與 1 莫耳式(1n)之化合物反應，以獲得式(1)之化合物：



其中

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 及 X_1 如在式(1)中所定義。

此反應在雙極性非質子溶劑，如二甲基甲醯胺、二甲亞砜、環丁砜、N-甲基-吡咯烷酮；烴類，如二甲苯或甲苯、萘滿、石油、三甲基苯或苯；氫化的鹵烴，如氯苯或二氯苯中；或沒有溶劑而使用過量的鹼如四芳基胺類；或沒有任何溶劑及鹼而在“熔化方法”中進行較佳。

反應溫度較佳從 20 至 280，較佳為 30 至 200 及最佳為 40 至 150℃。

在本方法中所使用的較佳的鹼有三烷基胺類，如三乙基胺、乙基-異丙基胺；雜環胺類，如 DABCO 或 DBU；或無機鹼，如 NH_2CO_3 或 NaHCO_3 。

根據本發明的式(1)之化合物特別合適作為 UV 濾光劑，即，用來保護對紫外光敏感的有機物質，特別是人類及動物之皮膚及毛髮，不受 UV 輻射的有害影響。這些化合物因此合適作為在化粧品、醫藥及獸醫醫學製劑中的防曬劑。

根據本發明的式(1)之 UV 吸收劑，依 X_1 及 R_1 的定義而定，可以溶解狀態(可溶的有機濾光劑、溶解的有機濾光

劑)或以微粉化狀態(奈米規模有機濾光劑、微粒的有機濾光劑、UV 吸收劑顏料)使用。

任何已知合適於製備微粒子的方法可用來製備微粉化 UV 吸收劑，例如溼式研磨、溼式揉捏、從合適的溶劑噴霧乾燥、根據 RESS 方法(超臨界溶液之快速膨脹)的膨脹、藉由從合適的溶劑中再沉澱。

如此獲得之微粉化 UV 吸收劑通常具有從 0.02 至 2，較佳從 0.03 至 1.5 及更特別從 0.05 至 1.0 微米之平均顆粒大小。

製備式(1)之微粉化化合物的方法為本發明的另一個目標。

本發明的進一步目標為 UV 吸收劑分散液，其包含：

(a)式(1)之微粉化 UV 吸收劑，其各具有從 0.02 至 2 微米之顆粒大小；及

(b)合適的分散劑。

根據本發明之化粧品調配物或醫藥組成物可額外包含一種或多於一種進一步習知的 UV 濾光劑。

化粧品或醫藥製劑可例如為乳膏、凝膠、塗劑、酒精性及水性/酒精性溶液、乳液、蠟/脂肪組成物、棒狀製劑、粉末或軟膏。除了上述提及的 UV 濾光劑之外，化粧品或醫藥製劑可包含如描述在下列的進一步佐藥。

作為含水及含油乳液(例如 W/O、O/W、O/W/O 及 W/O/W 乳液或微乳液)，製劑包含例如以組成物之總重量為準從 0.1 至 30 重量%，較佳從 0.1 至 15 重量%及特別從 0.5 至 10

重量%之一或多種 UV 吸收劑；以組成物之總重量為準從 1 至 60 重量%，特別從 5 至 50 重量%及較佳從 10 至 35 重量%的至少一種油組分；以組成物之總重量為準從 0 至 30 重量%，特別從 1 至 30 重量%及較佳從 4 至 20 重量%的至少一種乳化劑；以組成物之總重量為準從 10 至 90 重量%，特別從 30 至 90 重量%的水；及從 0 至 88.9 重量%，特別從 1 至 50 重量%之進一步化妝可接受的佐藥。

化粧品或醫藥製劑可例如為乳膏、凝膠、塗劑、酒精性及水性/酒精性溶液、乳液、蠟/脂肪組成物、棒狀製劑、粉末或軟膏。除了上述所提及的 UV 濾光劑之外，化粧品或醫藥製劑可包含如描述在下列的進一步佐藥。

作為含水及含油乳液(例如 W/O、O/W、O/W/O 及 W/O/W 乳液或微乳液)，製劑包含例如以組成物之總重量為準從 0.1 至 30 重量%，較佳從 0.1 至 15 重量%及特別從 0.5 至 10 重量%之一或多種 UV 吸收劑；以組成物之總重量為準從 1 至 60 重量%，特別從 5 至 50 重量%及較佳從 10 至 35 重量%的至少一種油組分；以組成物之總重量為準從 0 至 30 重量%，特別從 1 至 30 重量%及較佳從 4 至 20 重量%的至少一種乳化劑；以組成物之總重量為準從 10 至 90 重量%，特別從 30 至 90 重量%的水；及從 0 至 88.9 重量%，特別從 1 至 50 重量%之進一步化妝可接受的佐藥。

根據本發明之化粧品或醫藥組成物/製劑亦可包括一種或多於一種其它化合物，如脂肪醇類、脂肪酸類的酯類、天然或合成的三酸甘油脂，包括甘油基酯類及衍生物，有

珍珠光彩的蠟：烴油類：聚矽氧類或矽氧烷類、經有機取代的過脂劑、界面活性劑、黏稠度調節劑/增稠劑及流變學改質劑、聚合物、生物源的活性成分、除臭活性成分、抗頭皮屑藥、抗氧化劑、增溶劑、防腐劑及細菌抑制劑、香料油類、著色劑、聚合珠粒或中空球作為 spf 促進劑。

化粧品或醫藥製劑

化粧品或醫藥調配物係被包含在廣泛多種的化粧品製劑中。特別考慮例如下列製劑：

- 皮膚保養製劑，例如呈錠劑形式或液體肥皂、無皂清潔劑或洗滌糊劑形式之皮膚洗滌及清潔製劑；

- 沐浴製劑，例如液體(泡泡浴劑、乳劑、淋浴製劑)或固體沐浴製劑，例如沐浴磚及沐浴鹽；

- 皮膚保養製劑，例如護膚乳液、多重乳液或護膚油；

- 化粧品個人保養製劑，例如呈日霜或粉霜、蜜粉(粉狀或餅狀)、唇膏或粉底液形式的面部化妝用品；眼部保養製劑，例如眼影製劑、睫毛膏、眼線筆、眼霜或眼部修護霜；唇部保養製劑，例如口紅、唇蜜、唇線筆；指甲保養製劑，諸如指甲油、指甲油清除劑、硬甲油或甲皮軟化劑；

- 足部保養製劑，例如足浴劑、足粉、足部乳霜或足部香脂，特別是除臭劑及止汗藥或老繭移除製劑；

- 防光製劑，諸如防曬乳、塗劑、乳膏或油類，防曬油或熱帶樹脂(tropicals)、曬黑前製劑或曬後製劑；

- 皮膚曬黑製劑，例如仿曬乳膏；

- 脫色製劑，例如漂白皮膚用製劑或亮膚製劑；

- 驅蟲劑，例如驅蟲油、塗劑、噴霧或棒；
- 除臭劑，諸如除臭噴霧、壓動噴霧、除臭凝膠、棒或滾珠；
- 止汗劑，例如止汗棒、乳膏或滾珠；
- 清潔及保養有癍痕皮膚用之製劑，例如合成清潔劑(固體或液體)、剝除或擦洗製劑或剝除面膜；
- 呈化學形式的除毛製劑(脫毛)，例如除毛粉末、液體除毛製劑、乳膏狀或糊形式之除毛製劑、呈凝膠形式或氣溶膠泡沫的除毛製劑；
- 刮鬍製劑，例如刮鬍皂、泡沫式刮鬍膏、非泡沫式刮鬍膏、泡沫及凝膠、乾式刮鬍子用之刮鬍前製劑、刮鬍後製劑或刮鬍後塗劑；
- 香味製劑，例如香料(古龍水、香水(eau de toilette)、香精水(eau de parfum)、淡香精(parfum de toilette)、香料)、香料油類或香料乳膏；
- 化粧毛髮處理製劑，例如呈洗髮精及潤髮乳形式的洗髮製劑；毛髮保養製劑，例如預處理製劑、養髮液、造型乳膏、造型凝膠、髮膏、潤絲精、專業修護包裝、深層毛髮處理劑；毛髮結構化(hair-structuring)製劑，例如電燙(熱燙、中性燙、冷燙)用之燙髮製劑、離子燙製劑、液體整髮製劑、頭髮定型泡沫、髮霧；漂白製劑，例如過氧化氫溶液、淡化洗髮精、漂白乳霜、漂白粉、漂白膏或油、臨時、半永久或永久染髮劑、包含自氧化染料的製劑；或天然染髮劑，諸如散沫花或甘菊。

表現形式

所表列的最後調配物可以廣泛多種表現形式存在，例如：

-呈液體製劑形式，如 W/O、O/W、O/W/O、W/O/W 或 PIT 乳液及全部種類的微乳液；

-呈凝膠形式；

-呈油、乳膏、乳劑或塗劑形式；

-呈粉末、漆、錠劑或化妝品形式；

-呈棒狀物形式；

-呈噴霧(以推進氣體噴霧或壓動噴霧)或氣溶膠形式；

-呈泡沫形式；或

-呈糊狀形式。

作為皮膚用化粧品製劑，特別重要的有防光製劑，諸如防曬乳、塗劑、乳膏、油類、防曬油或熱帶樹脂、預曬製劑或曬後製劑；同樣有皮膚曬黑製劑，例如仿曬乳膏。特別有興趣的是防曬乳膏、防曬塗劑、防曬乳劑及呈噴霧形式的防曬製劑。

作為毛髮用之化粧品製劑，特別重要的有上述提及之毛髮處理製劑，特別有呈洗髮精、潤髮乳形式的洗髮製劑；毛髮保養製劑，例如預處理製劑、養髮液、造型乳膏、造型凝膠、髮油、潤絲精、專業修護包裝、深層毛髮處理劑、離子燙製劑、液體整髮製劑、頭髮定型泡沫及髮霧。特別有興趣的為呈洗髮精形式之洗髮製劑。

洗髮精具有例如下列組成：從 0.01 至 5 重量%根據本

發明之 UV 吸收劑、12.0 重量%的月桂醇聚氧乙烯醚-2-硫酸鈉、4.0 重量%的椰油醯胺丙基甜菜鹼、3.0 重量%的氯化鈉及加至 100%的水。

在此調配物中的其它典型成分有防腐劑、殺菌劑及細菌抑制劑、香料、染料、顏料、增稠劑、潤溼劑、保濕劑、脂肪類、油類、蠟或化粧品及個人護理調配物的其它典型成分，諸如醇類、多元醇類、聚合物、電解質、有機溶劑、矽衍生物、潤膚劑、乳化劑或乳化界面活性劑、界面活性劑、分散劑、抗氧化劑、抗刺激藥及抗發炎藥等等。

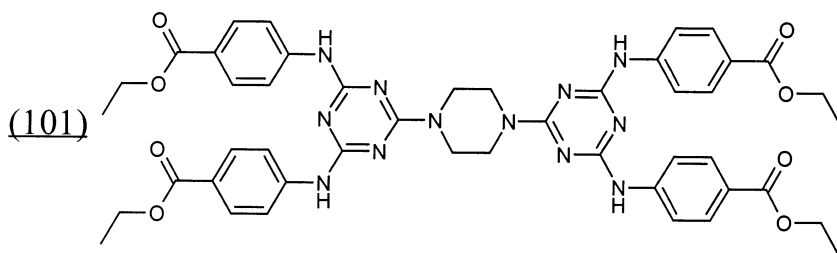
根據本發明之化粧品製劑特色在於優良的保護人類皮膚對抗日光損害效應。

根據本發明之化粧品製劑特色在於優良的保護人類皮膚對抗日光損傷效應來辨別。

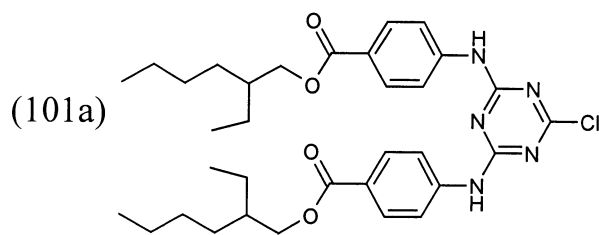
【實施方式】

A. 製備實施例

實施例 A1：式(101)之化合物的製備



將 1.8 克(0.021 莫耳)的哌啶加至 4.4 克(0.01 莫耳) 式(101a)之單氯三吡在 50 毫升二甲基甲醯胺中的溶液，



及在 75°C 下攪拌 2 小時。

將此反應溶液傾倒在 100 毫升的水上及攪拌。

過濾出粗產物，以水清洗，在丙酮中攪拌，過濾出及在 80°C 真空中乾燥。

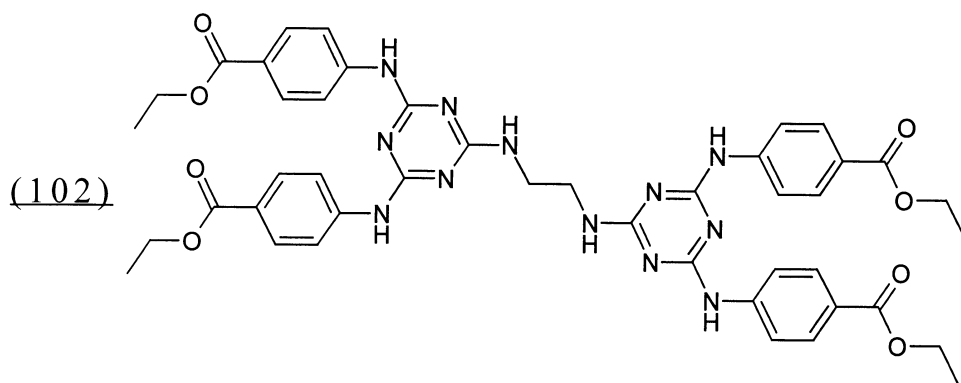
獲得白色產物。

產率：2.0 克 (44.6%) 無色結晶；Fp=287-290°C

NMR：

^{13}C NMR (90 MHz): δ = 14.61 (CH_3), 60.63. (CH_2), 119.35 (CH), 122.99 (Cq), 130.35 (CH), 145.02 (Cq), 164.38 (Cq), 164.98 (Cq), 165.88 (Cq).

實施例 A2：式(102)之化合物的製備



將 0.3 克乙二胺(0.005 莫耳)及 1.1 克三乙基胺(0.011 莫耳)加至 4.4 克(0.01 莫耳)式(101a)之單氯三吡在 50 毫升二甲基甲醯胺中的溶液，且在 75°C 下攪拌 2 小時。

以旋轉蒸發器來濃縮反應溶液直到乾掉，收集在水中

及以氫氯酸(1N)弱酸化。

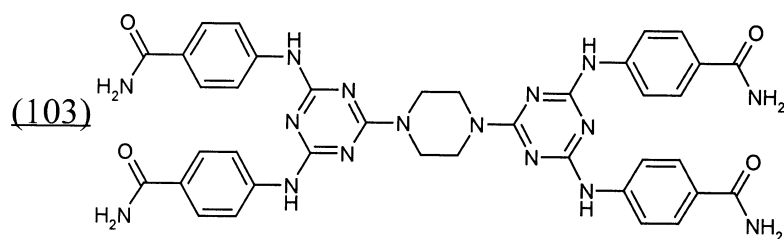
過濾出粗產物及清洗至中性。

在丙酮中煎煮之後，獲得白色產物。

產率：2.7 克(62.0%)；Fp=213-215℃。

^{13}C NMR (90 MHz,): δ = 14.55 (CH_3), 14.58 (CH_3), 60.52 (CH_2), 60.55 (CH_2), 119.20 (CH), 122.73 (CH), 122.82 (CH), 130.15 (CH), 145.13 (Cq), 145.29 (Cq), 164.22 (Cq), 164.41 (Cq), 165.87 (Cq), 166.16 (Cq).

實施例 A3：式(103)之化合物的製備

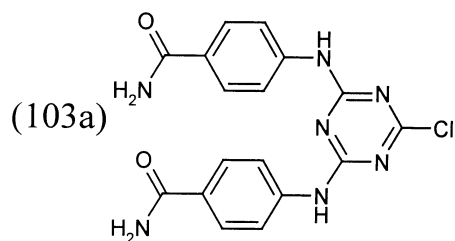


將 34.7 克(0.255 莫耳) 4-胺基苯醯胺在 100 毫升甲基-2-吡咯烷酮中的溶液加至 46.1 克氰尿醯氯(0.25 莫耳)在 800 毫升二噁烷/水混合物(9:1)中於 5℃ 及 pH 3.5 下的溶液。

然後，加入 34.7 克 4-胺基苯醯胺(0.255 莫耳)在 100 毫升甲基吡咯烷酮中於 60-90℃ 及 pH 8.5 下的溶液。

在 60℃ 下稀釋懸浮液，趁溫過濾及以二噁烷與水清洗。

在二甲基甲醯胺與丙酮中煎煮之後，獲得式(103a)的白色產物。



將 0.432 克(0.005 莫耳)哌啶及 1.1 克三乙基胺(0.01 莫耳)加至 3.84 克(0.01 莫耳)式(103a)之單氯三吡啶在二甲基甲醯胺中的溶液。

在 75°C 下攪拌反應混合物 6 小時，然後在 90°C 下 1 小時。

在以旋轉蒸發器來濃縮直到乾掉之後，將殘餘物收集在水中，以氫氯酸弱酸化，過濾出及以水清洗至中性。

在從 1-甲基-2-吡咯烷酮中再結晶及在甲醇中煎煮之後，獲得白色產物。

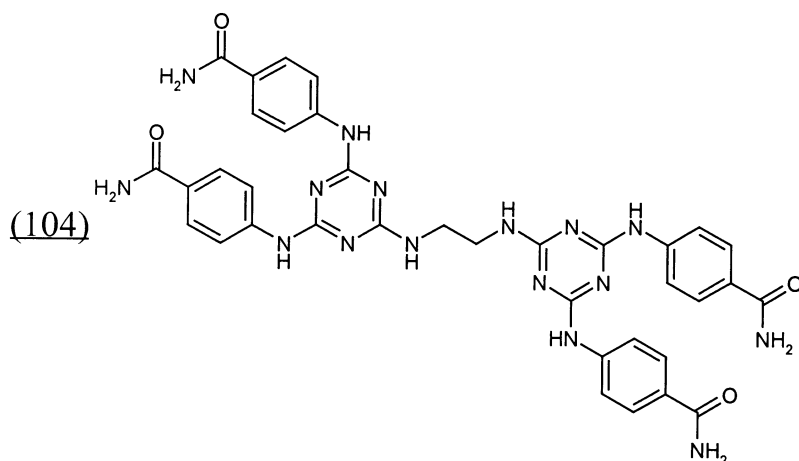
產率：1.95 克(49.9%)

熔點：在 260°C 下開始分解

式(103)之化合物的元素分析：

	C	H	N
計算值	58.45	4.65	28.70
實測值	58.07	4.93	28.13

實施例 A4：式(104)之化合物的製備



將 0.30 克(0.005 莫耳)乙二胺及 1.1 克三乙基胺(0.01 莫耳)加至 3.84 克(0.01 莫耳)式(103a)之單氯三吡啶在 50 毫

升二甲基甲醯胺中的溶液，且在 75°C 下攪拌 5.5 小時。

以旋轉蒸發器來濃縮此透明溶液直到乾掉，收集在水中，以氫氯酸弱酸化，過濾出及以水清洗至中性。

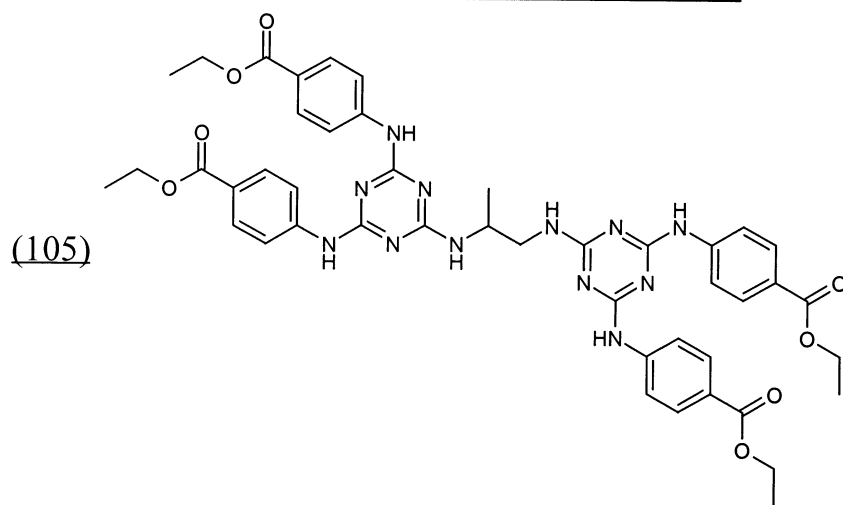
在從二甲基甲醯胺/水混合物 (4 : 6) 中再結晶及在丙酮中煎煮之後，獲得白色產物。

產率：0.8 克 (21.2%)

NMR：

^{13}C NMR (90 MHz): δ = 31.14, 36.14, 119.26 (CH), 127.72 (Cq), 128.51 (CH), 128.69, 143.09 (Cq), 162.70 (Cq), 163.35 (CH), 163.90 (Cq), 165.13 (Cq), 168.03 (Cq).

實施例 A5：式 (105) 之化合物的製備



將 0.37 克 (0.005 莫耳) 丙二胺及 1.1 克 (0.01 莫耳) 三乙基胺加至 4.4 克 (0.01 莫耳) 式 (101a) 之單氯三吡啶在 50 毫升二甲基甲醯胺中的溶液，且在 75°C 下攪拌 4 小時。

在以旋轉蒸發器來濃縮直到乾掉之後，殘餘物收集在水中及過濾出。

在溶解於三級丁基甲基醚中之後，將有機相與鹽水溶

液(5%)震盪出來，在硫酸鈉上脫水及濃縮直到乾掉。

利用管柱層析法純化獲得白色產物。

產率：2.3 克(52%)

NMR：

^{13}C NMR (90 MHz): δ = 14.53 (CH_3), 14.58 (CH_3), 19.04 (CH_3), 46.03. (CH_2), 46.68. (CH), 60.54 (CH_2), 119.22 (CH), 122.73 (Cq), 122.85 (Cq), 130.13 (CH), 145.11 (Cq), 145.25 (Cq), 145.32 (Cq), 164.25 (Cq), 164.38 (Cq), 165.75 (Cq), 165.84 (Cq), 165.87 (Cq), 166.26 (Cq).

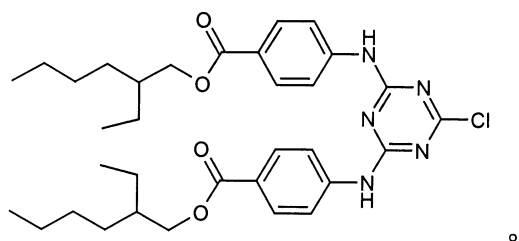
實施例 A6：

根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(5)之化合物(表 1)。以對伸苯基-二胺置換哌咛。

實施例 A7：

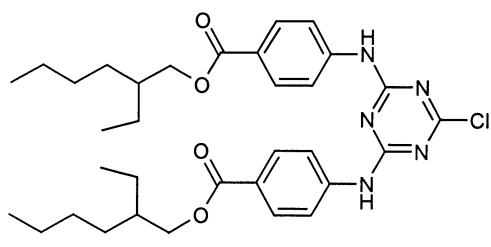
根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(18)之化合物(表 1)。以異佛爾酮-二胺(CAS 編號 2855-13-2)置換哌咛。

以下化合物置換式(101a)之化合物



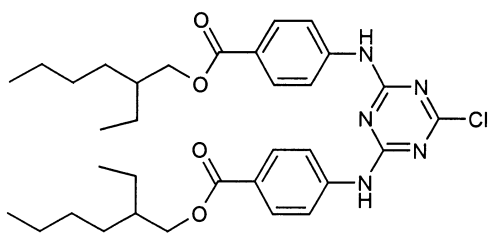
實施例 A8：

根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(19)之化合物(表 1)。以 4,4'-二胺基-3,3'-二甲基二環己基甲烷置換哌咛。以下化合物置換式(101a)之化合物



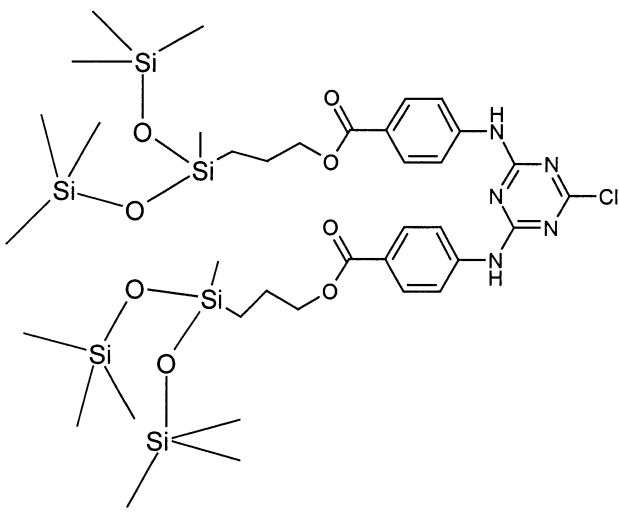
實施例 A9：

根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(20)之化合物(表 1)。以十二烷-1,12-二胺置換嘧啶。以下化合物置換式(101a)之化合物



實施例 A10：

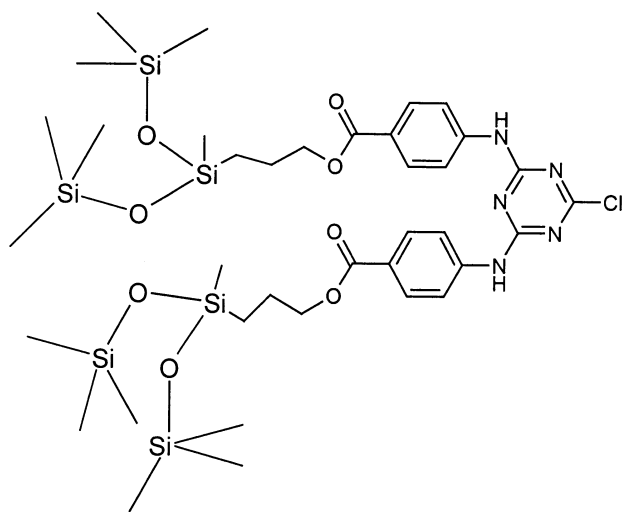
根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(30)之化合物(表 1)。以異佛爾酮-二胺置換嘧啶。以下化合物置換式(101a)之化合物



實施例 A11：

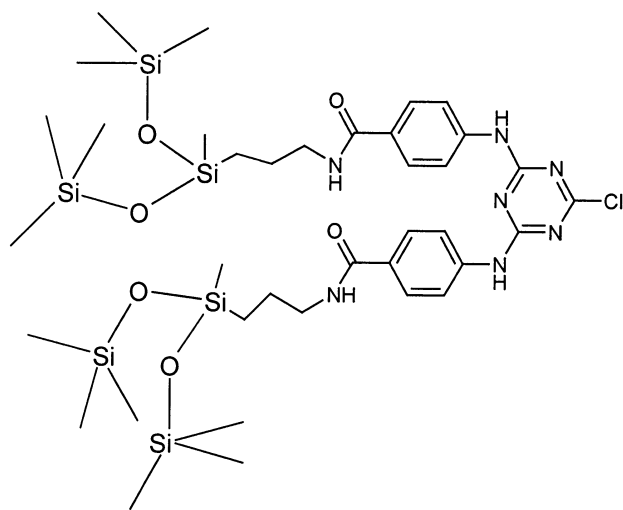
根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(32)之化合物

物(表 1)。以十二烷-1,12-二胺置換哌咩。以下化合物置換式(101a)之化合物



實施例 A12：

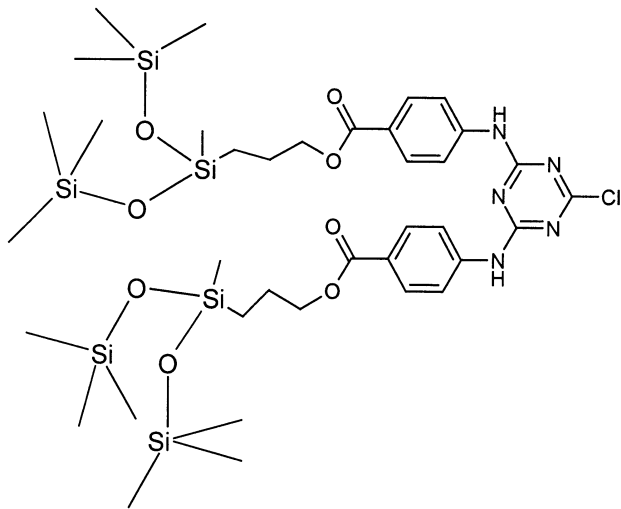
根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(43)之化合物(表 1)。以 4,4'-二胺基-3,3'-二甲基二環己基甲烷置換哌咩。以下化合物置換式(101a)之化合物



實施例 A13：

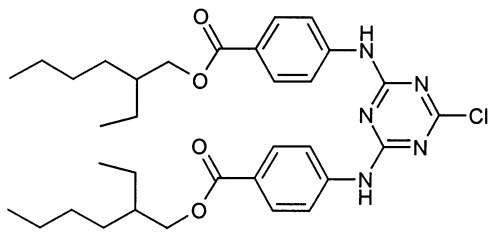
根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(31)之化合物(表 1)。以 4,4'-二胺基-3,3'-二甲基二環己基甲烷置換哌

吡。以下化合物置換式(101a)之化合物



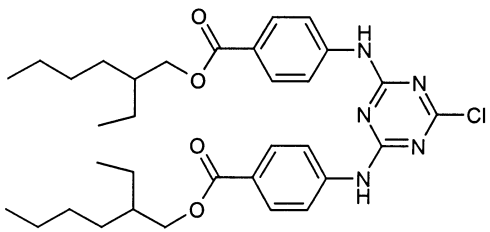
實施例 A14：

根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(51)之化合物(表 1)。以 1,6-己二醇置換吡。以下化合物置換式(101a)之化合物



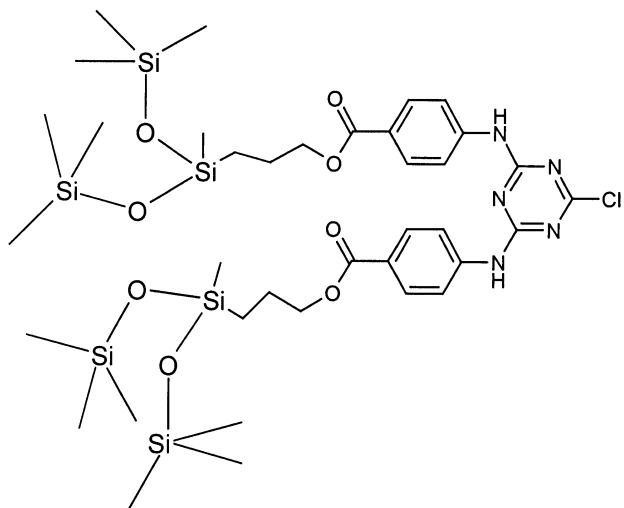
實施例 A15：

根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(53)之化合物(表 1)。以新戊二醇(CAS 編號 126-30-7)置換吡。以下化合物置換式(101a)之化合物



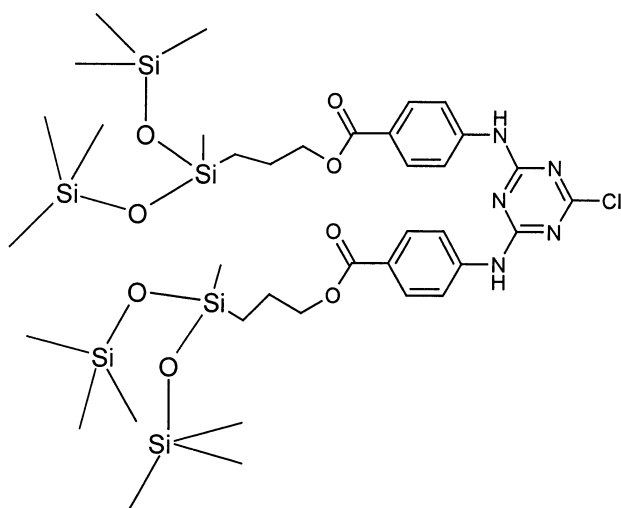
實施例 A16：

根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(57)之化合物(表 1)。以新戊二醇置換哌咩。以下化合物置換式(101a)之化合物



實施例 A17：

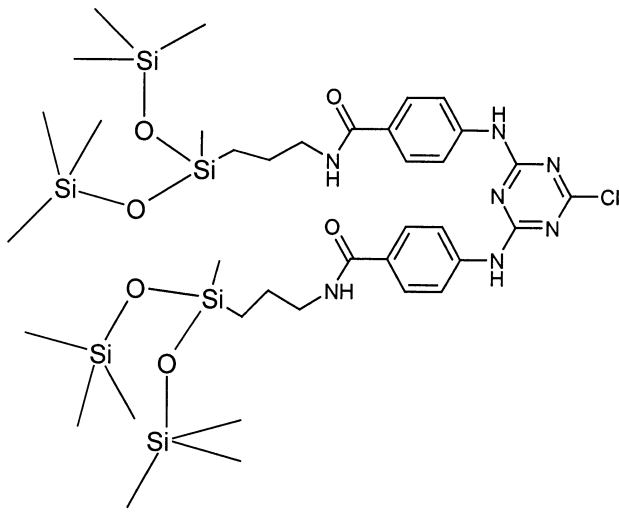
根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(50)之化合物(表 1)。以 1,6-己二醇置換哌咩。以下化合物置換式(101a)之化合物



實施例 A18：

根據如在實施例 1 中所描述的方法製備式(49)之化合

物(表 1)。以 1,6-己二醇置換哌咩。以下化合物置換式(101a)之化合物



B. 應用實施例

實施例 B1：	A	B	C	D	E	F	G
INCI-名稱	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%
甲氧基桂皮酸乙基己酯	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8
環美矽酮(cyclomethicone)	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0	7.0
十八烯/MA 共聚物(及)乙醯基蓖麻油酸甲酯(及)己二酸二-甲基庚酯		3.0					
C30-38 烯烴/順丁烯二酸異丙酯/MA 共聚物			2.0				
氫化二聚物二亞油醯基/二甲基碳酸酯共聚物				3.0			
環戊矽氧烷(及)丙烯酸酯類/聚三甲基矽氧基甲基丙烯酸酯共聚物					7.0		
異十二烷(及)丙烯酸酯類/聚三甲基矽氧基甲基丙烯酸酯共聚物						8.0	
聚(己二酸二醇酯)/雙-羥基乙氧基丙基二美矽酮(dimethicone)共聚物							5.0
棕櫚酸乙基己酯	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
雙-乙基己氧基酚甲氧基苯基三咩	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
二硬脂酸新戊四醇酯		1.5					3.0
二山箭酸甘油酯(及)山箭酸甲酯(及)山箭酸甘油酯			2.0		4.0		
硬脂酸甘油酯	1.5			1.5		1.5	

磷酸 C20-22 烷酯(及)C20-22 醇類		3.0				2.5	
燭木/荷荷巴/米糠聚甘油基-3 酯類(及)硬脂酸甘油酯(及)十六硬脂醇(cetearyl alcohol)(及)乳醯酸硬脂醯鈉			6.0				4.0
檸檬酸油酸甘油酯(及)辛酸/癸酸三酸甘油酯				5.0			
磷酸鯨蠟酯鉀	1.8				1.8		
VP/二十烯共聚物	0.6				0.6		
水	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100
亞甲基雙-苯并三唑基四甲基丁基酚	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
PVP/二甲基辛二烯基丙烯酸酯(dimethylconylacrylate)/聚胺甲醯基/聚二醇酯							
聚酯-5							
丙烯酸酯類/棕櫚醇聚氧乙烯醚(Palmeth)-25 丙烯酸酯共聚物	0.3						
二硬脂醇聚氧乙烯醚(distareth)-75 IPDI		0.3	3.0				
二硬脂醇聚氧乙烯醚-100 IPDI				0.3	3.0		
丙烯酸酯類/新癸酸乙烯酯交聯聚合物						1.5	5.0
式(56)或(3)或(12)或(17)或(18)或(19)或(20)或(24)或(30)或(31)或(32)或(35)或(41)或(42)或(43)或(44)或(50)或(51)或(53)之化合物	2.0	4.0	6.0	8.0	10.0	12.0	14.0
微粉化 2,4,6-三(對-聯苯基)-s-三吡[CAS 編號 31274-51-8]	5.0	9.0	3.0	1.0	7.0	2.0	15.0
甘油	6.0	6.0	6.0	6.0	6.0	6.0	6.0
EDTA 二鈉	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
苯氧基乙醇(及)對羥苯甲酸甲酯(及)對羥苯甲酸乙酯(及)對羥苯甲酸丁酯(及)對羥苯甲酸丙酯(及)對羥苯甲酸異丁酯	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7
醋酸生育酚酯	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3

實施例 B2	A	B	C	D	E	F	G
INCI-名稱	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%
苯甲酸 C12-15 烷酯	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0
丁基甲氧基二苄醯基甲烷	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
氰雙苯丙烯酸辛酯	7.5	7.5	7.5	7.5	7.5	7.5	7.5

異十六烷	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
環戊矽氧烷	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0
對亞酞基二樟腦磺酸	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3
二氧化鈦顆粒大小 10 至 100 奈米	1.7	1.7	1.7	1.7	1.7	1.7	1.7
TiO ₂ (及)異癸醇聚氧乙烯醚(isodeceth)-6(及)油醇聚氧乙烯醚(oleth)-10(及)氧化鋁(及)二甲基矽油(Simethicone)		1.5					1.0
塗佈氧化鋁的 TiO ₂			2.0		4.0		
TiO ₂ (及)異月桂醇聚氧乙烯醚(isolaureth)-4 磷酸酯(及)乙烯基丁醇聚氧乙烯醚(vinylbuteth)-25/順-丁烯二酸鈉共聚物	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
TiO ₂ (及)二乙基己基碳酸酯(及)聚甘油基-6 聚羥基硬脂酸酯	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
TiO ₂ (及)氫氧化鋁(及)二美矽酮醇(dimethiconol)美矽酮(methicone)共聚物		3.0					
TiO ₂ (及)氫氧化鋁(及)二美矽酮醇美矽酮共聚物			2.0				
塗佈二氧化矽的 TiO ₂				3.0			
TiO ₂ (及)氫氧化鋁(及)異硬脂酸					7.0		
經錳改質的 TiO ₂						8.0	
ZnO 顆粒大小 10 至 100 奈米	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
二硬脂酸新戊四醇酯		1.5					1.0
二山萣酸甘油酯(及)山萣酸甲酯(及)山萣酸甘油酯			2.0		4.0		
硬脂酸	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
PEG-100 硬脂酸酯(及)硬脂酸甘油酯	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
十八烯/MA 共聚物(及)乙醯基蓖麻油酸甲酯(及)己二酸二-甲基庚酯		3.0					
C30-38 烯烴/順丁烯二酸異丙酯/MA 共聚物			2.0				
氫化二聚物二亞油醯基/二甲基碳酸酯共聚物				3.0			
環戊矽氧烷(及)丙烯酸酯類/聚三甲基矽氧基甲基丙烯酸酯共聚物					7.0		

異十二烷(及)丙烯酸酯類/聚三甲基矽氧基甲基丙烯酸酯共聚物						8.0	
聚(己二酸二醇酯)/雙-羥基乙氧基丙基二美矽酮共聚物							5.0
磷酸 C20-22 烷酯(及)C20-22 醇類		2.5				3.0	
燭木/荷荷巴/米糠聚甘油基-3 酯類(及)硬脂酸甘油酯(及)十六硬脂醇(及)乳醯酸硬脂醯鈉			5.0				6.0
檸檬酸油酸甘油酯(及)辛酸/癸酸三酸甘油酯				4.0			
磷酸鯨蠟酯鉀	1.3				1.3		
PVP/二十烯共聚物	1.0						
水	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100
甘油	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0
式(56)或(3)或(12)或(17)或(18)或(19)或(20)或(24)或(30)或(31)或(32)或(35)或(41)或(42)或(43)或(44)或(50)或(51)或(53)之化合物	2.0	4.0	6.0	8.0	10.0	12.0	14.0
微粉化 2,4,6-三(對-聯苯基)-s-三吡[CAS 編號 31274-51-8]	5.0	9.0	3.0	1.0	7.0	2.0	15.0
丙二醇	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
黃原膠	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
PVP/二甲基辛二烯基丙烯酸酯/聚胺甲醯基/聚乙二醇酯							
聚酯-5							
二硬脂醇聚氧乙烯醚-75 IPDI		0.3	3.0				
二硬脂醇聚氧乙烯醚-100 IPDI				0.3	3.0		
丙烯酸酯類/新癸酸乙烯酯交聯聚合物						1.5	5.0
丙烯酸酯類/丙烯酸 C10-30 烷酯交聯聚合物	0.2						
EDTA 二鈉	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
三乙醇胺	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
二美矽酮	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4
苯氧基乙醇(及)對羥苯甲酸甲酯(及)對羥苯酸乙酯(及)對羥苯甲酸丁酯(及)對羥苯甲酸丙酯(及)對羥苯甲酸異丁	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7

酯							
醋酸生育酚酯	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9

<u>實施例 B3</u>	<u>A</u>	<u>B</u>	<u>C</u>	<u>D</u>	<u>E</u>	<u>F</u>	<u>G</u>
INCI-名稱	w/w %	w/w %	w/w %	w/w %	w/w %	w/w %	w/w %
合成蜂蠟	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
甲氧基桂皮酸乙基己酯(藉由 摻入聚合物中安定化)	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8
對-甲氧基桂皮酸異戊酯	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
水楊酸乙基己酯	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
丁基甲氧基二苄醯基甲烷(藉 由摻入聚合物中安定化)	4.0	4.0	5.0	4.0	4.0	4.0	3.0
4-甲基亞苄基樟腦	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0
雙-乙基基氧基酚甲氧基苯基 三吡	2.0	3.0	2.0	1.0	1.0	1.0	1.0
十八烯/MA 共聚物(及)乙醯 基蓖麻油酸甲酯(及)己二酸 二-甲基庚酯		3.0					
C30-38 烯烴/順丁烯二酸異 丙酯/MA 共聚物			2.0				
氫化二聚物二亞油醯基/二甲 基碳酸酯共聚物				3.0			
環戊矽氧烷(及)丙烯酸酯類/ 聚三甲基矽氧基甲基丙烯酸 酯共聚物					7.0		
異十二烷(及)丙烯酸酯類/聚 三甲基矽氧基甲基丙烯酸酯 共聚物						8.0	
聚(己二酸二醇酯)/雙-羥基乙 氧基丙基二美矽酮共聚物							5.0
二美矽酮	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5
磷酸 C20-22 烷酯(及)C20-22 醇類		3.0				3.0	
燭木/荷荷巴/米糠聚甘油基-3 酯類(及)硬脂酸甘油酯(及)十 六硬脂醇(及)乳醯酸硬脂醯 鈉			4.0				4.0
檸檬酸油酸甘油酯(及)辛酸/ 癸酸三酸甘油酯				6.0			
十六硬脂醇(及)磷酸二鯨蠟 醇酯(及)鯨蠟醇聚氧乙烯醚- 10 磷酸酯	4.5				4.5		
蓖麻油酸鯨蠟酯	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
二硬脂酸新戊四醇酯		1.5					3.0

二山萆酸甘油酯(及)山萆酸甲酯(及)山萆酸甘油酯			2.0		4.0		
羥丙基二美矽酮山萆酸酯	2.2	1.0		2.2		2.2	0.5
椰酸癸酯	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
水	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100
丙二醇	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
式(56)或(3)或(12)或(17)或(18)或(19)或(20)或(24)或(30)或(31)或(32)或(35)或(41)或(42)或(43)或(44)或(50)或(51)或(53)之化合物	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
1,1'-(1,4-哌咻二基)雙[1-[2-[4-(二乙基胺基)-2-羥基苄醯基]苯基]-甲酮(CAS 編號 919803-06-8)	2.0	3.0	1.0	8.0	4.0	3.0	1.0
癸基糖苷	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
丙烯酸酯類/新癸酸乙烯酯交聯聚合物							
丙烯醯基二甲基牛磺酸銨/VP 共聚物	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3
PVP/二甲基辛二烯基丙烯酸酯/聚胺甲醯基/聚二醇醚							
聚酯-5							
苯基苯并咪唑磺酸	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
二硬脂醇聚氧乙烯醚-75 IPDI		0.3	3.0				
二硬脂醇聚氧乙烯醚-100 IPDI				0.3	3.0		
丙烯酸酯類/新癸酸乙烯酯交聯聚合物						1.5	5.0
丙烯酸酯類/丙烯酸 C10-30 烷酯交聯聚合物	0.2						
EDTA 二鈉	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
亞甲基雙-苯并三唑基四甲基丁基酚	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
緩血酸胺(tromethamine)	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
環己矽氧烷(及)環戊矽氧烷	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
苯氧基乙醇(及)對羥苯甲酸甲酯(及)對羥苯甲酸乙酯(及)對羥苯甲酸丁酯(及)對羥苯甲酸丙酯(及)對羥苯甲酸異丁酯	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
醋酸生育酚酯	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4
CAS 登記編號 88122-99-0 ,	2.0	1.5	2.0		1.0		

乙基己基三吡啶酮(辛基三吡啶酮；Uvinul T 150)							
CAS 登記編號 6197-30-4， 氰雙苯丙烯酸辛酯	3.0	4.0	5.0			1.0	5.0
CAS 登記編號 180898-37-7， 苯基二苯并咪唑四磺酸二鈉 Neo Heliopan AP 或 Neo Heliopan APC	3.0	4.0	5.0	3.0			
CAS 登記編號 302776-68-7， Uvinul A Plus	4.0		5.0				
CAS 登記編號 444811-29-4， 丙二酸，[(4-羥基-3,5-二甲氧 基苯基)亞甲基]-，雙(2-乙基 己基)酯(Oxynex ST)	3.0		1.0				
CAS 登記編號 477844-93-2， 八萘(Octofluorene)		3.0	1.0				
2-苯基乙基苯甲酸酯		1.0	1.0				
CAS 登記編號 68890-66-4， 羥甲辛吡酮	2.0			3.0	1.0		
Tinogard TT (INCI 四二丁基 新戊四醇基羥基-氫桂皮酸 酯)	1.0		1.0	1.0	3.0		
Tinogard HS (INCI 苯并三唑 基丁基酚磺酸鈉)		2.0	3.0			3.0	
Tinogard TL (INCI 苯并三唑 基十二烷基對-甲酚)	2.0		1.0	1.0		1.0	3.0
酚，2-(2H-苯并三唑-2-基)-6- 十二烷基-4-甲基-，支鏈及 直鏈		2.0			3.0		
Cibafast H 液(INCI 苯并三唑 基丁基酚磺酸鈉，丁醇聚氧 乙烯醚(Buteth)-3，檸檬酸三 丁酯)	1.0						
Tinogard AS (INCI 布美三唑 (Bumetrizole))	2.0		1.0				
三(四甲基羥基吡啶醇)檸檬 酸酯(Tinogard Q)	1.0		1.0				
220410-74-24-吡啶醇，1-羥 基-2,2,6,6-四甲基-，2-羥基- 1,2,3-丙烷三羧酸酯(3:1)(鹽)			1.0				1.0
CAS 登記編號 1750-49-8， N-(2-羥丙基)脲		5.0				10.0	
CAS 登記編號 2078-71-9， N-(2-羥乙基)脲			10.0		10.0		
正丁基酞醯亞胺與異丙基酞	0.5			5.0			

醯亞胺之混合物							
CAS 登記編號 872424-70-9	2.0				1.0		
CAS 登記編號 872424-71-0		2.0				1.0	
CAS 登記編號 872424-72-1			2.0				1.0
CAS 登記編號 872424-73-2				2.0			
糖基甘油酯或 2-O-β-吡喃葡萄糖基-sn-甘油之混合物	3.0				2.0		
二胺基苯并咪唑	0.1						
二羥基丙酮		2.0	4.0	2.0			2.0
肉毒鹼	3.0		1.0			1.0	
托酚酮	0.3				0.2		
CAS 登記編號 130603-71-3 , α-葡萄糖基芸香苷	0.5	0.1		1.0			
CAS 登記編號 425371-14-8							
CAS 登記編號 425371-15-9							
CAS 登記編號 261356-13-2							2.0
CAS 登記編號 425371-03-5						2.0	
CAS 登記編號 425371-04-6					2.0		
CAS 登記編號 25371-05-7				2.0			
CAS 登記編號 425371-06-8					2.0		
CAS 登記編號 425371-07-9							2.0
CAS 登記編號 425371-08-0							
CAS 登記編號 425371-09-1							
CAS 登記編號 425371-10-4							
CAS 登記編號 425371-11-5						2.0	
CAS 登記編號 494198-67-3							
CAS 登記編號 803699-05-0							
CAS 登記編號 803699-07-2							2.0
CAS 登記編號 803699-09-4						2.0	
CAS 登記編號 803699-11-8					2.0		
CAS 登記編號 803699-14-1				2.0			
CAS 登記編號 803699-15-2					2.0		
CAS 登記編號 803699-17-4							2.0
CAS 登記編號 803699-18-5							
CAS 登記編號 88137-31-9				3.0			
CAS 登記編號 101220-33-1						2.0	
CAS 登記編號 875878-17-4							
CAS 登記編號 875878-18-5							
CAS 登記編號 916463-32-6							2.0
CAS 登記編號 880761-99-9					2.0		
CAS 登記編號 880761-95-5				2.0			

實施例 B4	A	B	C	D	E	F	G
--------	---	---	---	---	---	---	---

INCI-名稱	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%
苯甲酸 C12-15 烷酯	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
丁基甲氧基二苄醯基甲烷	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
氯雙苯丙烯酸辛酯	7.5	7.5	7.5	7.5	7.5	7.5	7.5
二庚酸新戊二醇酯	6.0		5.0				
二苯甲酸丙二醇酯	4.0						
聚酯-7 及二庚酸新戊二醇酯					8.0		
亞丁香基丙二酸二乙基己酯		6.0					
聚酯 8			4.0				
蘋果酸二乙基己酯				7.0			
PPG-3 肉豆蔻基醚新庚酸酯						6.0	
苯甲酸苯乙酯							8.0
異丙基 PPG-2 異癸醇聚氧乙 烯醚-7 羧酸酯							
異丙基 C12-15-鏈烷醇聚氧 乙醚(pareth)-9 羧酸酯							
鯨蠟基 PPG-2 異癸醇聚氧乙 烯醚-7 羧酸酯							
異十六烷	1.5	1.5	1.5	1.5	1.5	1.5	1.5
環戊矽氧烷	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
對亞酞基二樟腦磺酸	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3
二氧化鈦顆粒大小 10 至 100 奈米	1.7	1.7	1.7	1.7	1.7	1.7	1.7
硬脂酸	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
PEG-100 硬脂酸酯(及)硬脂 酸甘油酯	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
磷酸鯨蠟酯鉀	1.3	1.3	1.3	1.3	1.3	1.3	1.3
PVP/二十烯共聚物	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
水	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100
甘油	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0
式(56)或(3)或(12)或(17)或 (18)或(19)或(20)或(24)或(30) 或(31)或(32)或(35)或(41)或 (42)或(43)或(44)或(50)或(51) 或(53)之化合物	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0
1,1'-(1,4-哌啶二基)雙[1-[2- [4-(二乙基胺基)-2-羥基苄醯 基]苯基]-甲酮(CAS 編號 919803-06-8)	2.0	4.0	3.0	4.0	2.0	1.0	4.0
微粉化 2,4,6-三(對-聯苯基)- s-三吡[CAS 編號 31274-51-8]	5.0	9.0	3.0	1.0	7.0	2.0	15.0
丙二醇	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
黃原膠	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
丙烯酸酯類/丙烯酸 C ₁₀ -30 烷	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2

酯交聯聚合物							
EDTA 二鈉	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
三乙醇胺	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
二美矽酮	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4
苯氧基乙醇(及)對羥苯甲酸甲酯(及)對羥苯甲酸乙酯(及)對羥苯甲酸丁酯(及)對羥苯甲酸丙酯(及)對羥苯甲酸異丁酯	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7
醋酸生育酚酯	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9

實施例 B5	A	B	C	D	E	F	G
INCI-名稱	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%	w/w%
合成蜂蠟	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
甲氧基桂皮酸乙基己酯	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8	9.8
對-甲氧基桂皮酸異戊酯	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
水楊酸乙基己酯	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
丁基甲氧基二苄醯基甲烷	2.8	2.8	2.8	2.8	2.8	2.8	2.8
4-甲基亞苄基樟腦	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0
雙-乙基己氧基酚甲氧基苯基三吡	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
二美矽酮	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5
十六硬脂醇(及)磷酸二鯨蠟酯(及)鯨蠟醇聚氧乙烯醚-10 磷酸酯	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5	4.5
蓖麻油酸鯨蠟酯	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
椰酸丁二醇酯	4.0	6.0	4.0	3.0	2.0	1.0	2.5
羥丙基二美矽酮山萸醣酯	2.2	2.2	2.2	2.2	2.2	2.2	2.2
椰酸癸酯	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
水	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100	適量至 100
丙二醇	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
微粉化 2,4,6-三(對-聯苯基)-s-三吡[CAS 編號 31274-51-8]	1.0	3.0	2.0	2.0	1.0	0.5	1.0
微粉化 1,1'-(1,4-吡啶二基)雙[1-[2-[4-(二乙基胺基)-2-羥基苄醯基]苯基]-甲酮(CAS 編號 919803-06-8)	3.0	1.0	1.0	4.0	2.0	1.0	3.0
式(56)或(3)或(12)或(17)或(18)或(19)或(20)或(24)或(30)或(31)或(32)或(35)或(41)或(42)或(43)或(44)或(50)或(51)或(53)之化合物	4.0	3.0	2.0	1.0	3.0	5.0	3.0
氯雙苯丙烯酸辛酯	2.0	4.0	6.0	8.0	10.0	10.0	8.0
癸基糖苷	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5

丙烯鹽基二甲基牛磺酸銨/VP 共聚物	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3
苯基苯并咪唑磺酸	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0
丙烯酸酯類/丙烯酸 C ₁₀ -30 烷酯交聯聚合物	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
EDTA 二鈉	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
亞甲基雙-苯并三唑基四甲基丁基酚	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
緩血酸胺	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
苯乙烯/丙烯酸酯類共聚物	5.0					3.0	
PEG-6 異硬脂酸酯(及)橙皮素月桂酸酯		3.0				1.0	4.0
聚丙烯酸酯-15(及)聚丙烯酸酯-17			4.0				
紅花(Carthus tinctorius)油質體				5.0			
PTFE					4.0		
環己矽氧烷(及)環戊矽氧烷	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
苯氧基乙醇(及)對羥苯甲酸甲酯(及)對羥苯甲酸乙酯(及)對羥苯甲酸丁酯(及)對羥苯甲酸丙酯(及)對羥苯甲酸異丁酯	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
醋酸生育酚酯	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4	0.4

【圖式簡單說明】

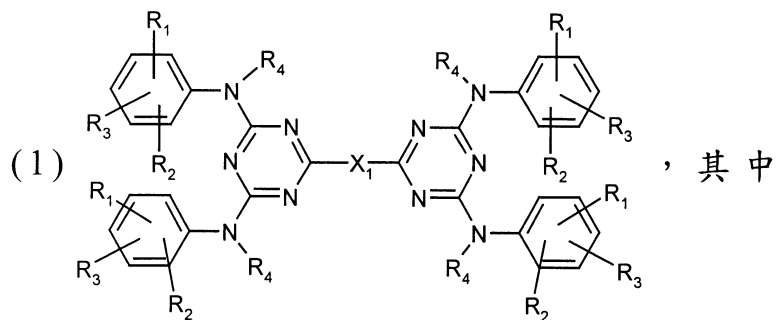
無

【主要元件符號說明】

無

五、中文發明摘要：

本發明揭示式(1)之三吡衍生物



X_1 為式 (1a) $-NR_9-A-NR_9-$ ； (1b) $^*-N \begin{array}{c} \diagup A \diagdown \\ \diagdown A' \diagup \end{array} N^*$ ； 或

(1c) $^*-O-A-O^*$ 之二價基團 ；

A 及 A'彼此獨立地為未經取代或經取代的直鏈或支鏈 C_1-C_{12} 伸烷基，其視需要被 C_5-C_{12} 伸環烷基、N、O 或 S 中斷； C_5-C_{12} 伸環烷基；伸聯苯基； C_6-C_{10} 伸芳基；或 C_5-C_{10} 伸芳基- $(C_1-C_{12}$ 伸烷基)；

R_1 為式 (1d) $^*-\overset{\text{O}}{\parallel}{C}-O-R_5$ ； (1e) $^*-\overset{\text{O}}{\parallel}{S}(=O)-O-R_5$ ； (1f) $^*-\overset{\text{O}}{\parallel}{C}-R_5$ ；

(1g) $^*-\overset{\text{O}}{\parallel}{C}-N(R_5)R_6$ ； 或 (1h) $^*-\overset{\text{O}}{\parallel}{C}-X_2-W_1$ 之基團 ；

R_2 及 R_3 彼此獨立地為氫； C_1-C_{12} 烷基； OR_7 ； NR_7R_8 ； C_6-C_{10} 芳基；

X_2 為 O 或 NH ；

W_1 為 C_1-C_{20} 烷基；或 Sp-Sil 基團 ；

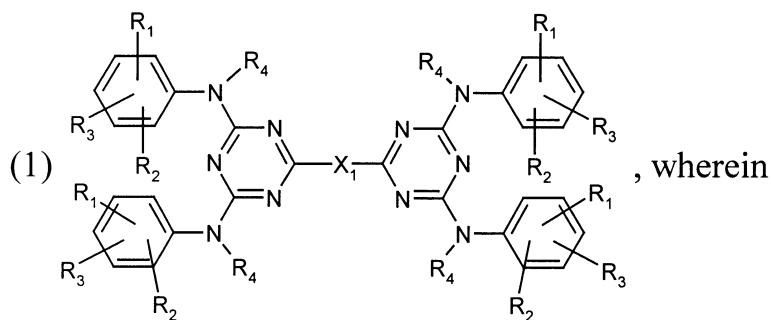
Sp 為直鏈或支鏈之飽和或單或多不飽和的 C_3-C_{12} 烴 ；

Si1 為矽烷；寡矽氧烷；或聚矽氧烷部分；及

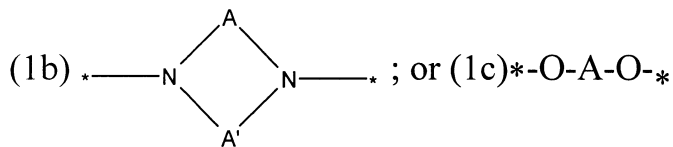
R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 及 R_9 彼此獨立地為氫； C_1 - C_{12} 烷基；或 C_3 - C_{12} 環烷基。

六、英文發明摘要：

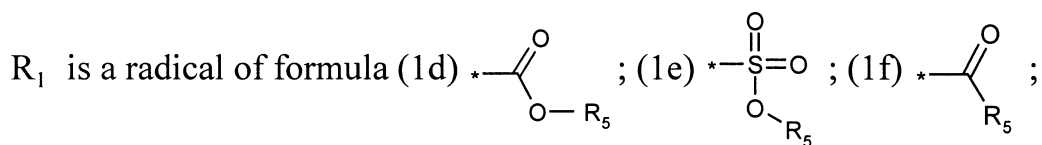
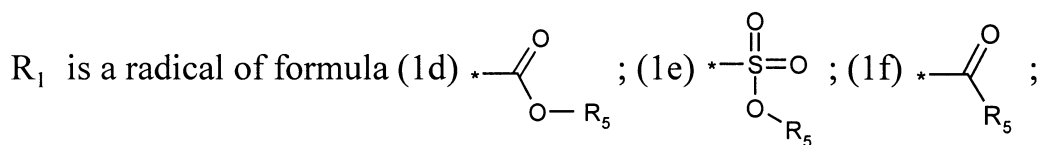
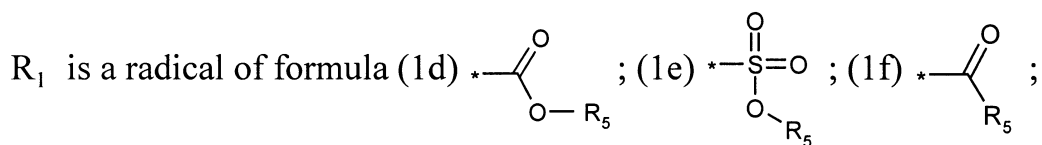
Disclosed are triazine derivatives of formula

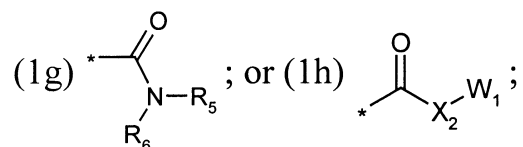


X_1 is a bivalent radical of formula(1a)- NR_9 -A- NR_9 ;



A and A' independently from each other are unsubstituted or substituted, straight-chain or branched C_1 - C_{12} alkylene, which is optionally interrupted by C_5 - C_{12} cycloalkylene, N, O or S; C_5 - C_{12} cycloalkylene; biphenylene; C_6 - C_{10} arylene; or C_5 - C_{10} arylene-(C_1 - C_{12} alkylene);

R_1 is a radical of formula (1d) ; (1e) ; (1f) 



R_2 and R_3 independently from each other are hydrogen; C_1 - C_{12} alkyl; OR_7 ;

NR_7R_8 ; C_6 - C_{10} aryl;

X_2 is O, or NH;

W_1 is C_1 - C_{20} alkyl; or a group Sp-Sil;

Sp is a straight-chain or branched saturated or single or multiple unsaturated C₃-C₁₂ hydrocarbon;

Sil is a silane; an oligosiloxane; or a polysiloxane moiety;

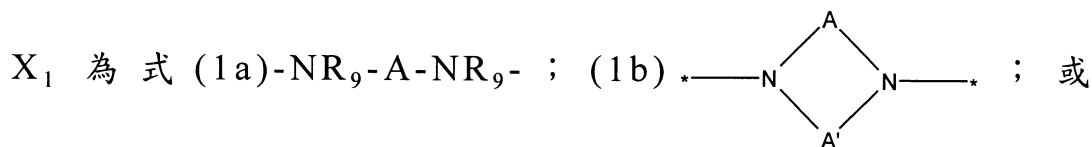
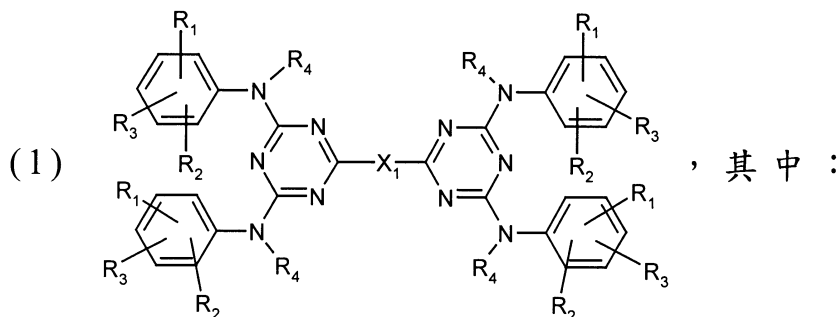
and

R₄, R₅, R₆, R₇, R₈ and R₉ independently from each other are hydrogen;

C₁-C₁₂alkyl; or C₃-C₁₂cycloalkyl.

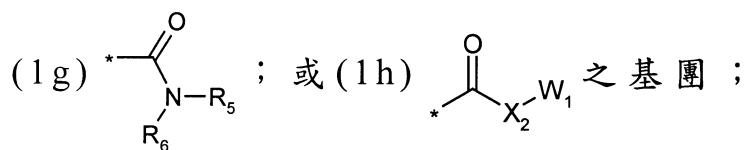
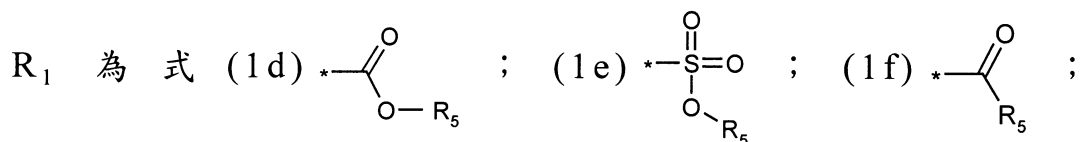
十、申請專利範圍：

1. 一種式(1)之化合物



(1c) $-O-A-O-*$ 之二價基團；

A 及 A'彼此獨立地為未經取代或經取代的直鏈或支鏈 C_1-C_{12} 伸烷基，其視需要由 C_5-C_{12} 伸環烷基、N、O 或 S 中斷； C_5-C_{12} 伸環烷基；伸聯苯基； C_6-C_{10} 伸芳基；或 C_5-C_{10} 伸芳基- $(C_1-C_{12}$ 伸烷基)；



R_2 及 R_3 彼此獨立地為氫； C_1-C_{12} 烷基； OR_7 ； NR_7R_8 ； C_6-C_{10} 芳基；

X_2 為 O 或 NH；

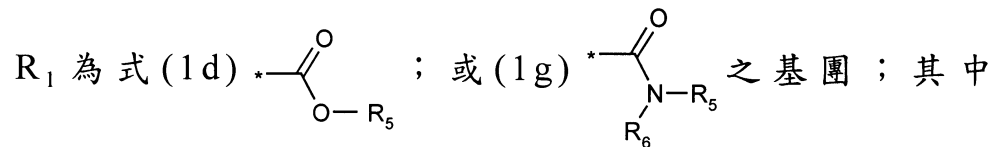
W_1 為 C_1-C_{20} 烷基；或 Sp-Sil 基團；

Sp 為直鏈或支鏈之飽和或單或多不飽和 C_3-C_{12} 烴；

Sil 為矽烷；寡矽氧烷；或聚矽氧烷部分；及

R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 及 R_9 彼此各自獨立地為氫； C_1 - C_{12} 烷基；或 C_3 - C_{12} 環烷基。

2. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中：



R_5 及 R_6 彼此獨立地為氫；或 C_1 - C_5 烷基。

3. 如申請專利範圍第 2 項之化合物，其中：

R_5 為 C_1 - C_5 烷基；或氫；及

R_6 為氫。

4. 如申請專利範圍第 1 至 3 項之任一項的化合物，其中：

X_1 為式 (1b) 之基團，其中

A_1 及 A_2 為 C_1 - C_4 伸烷基。

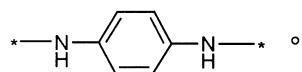
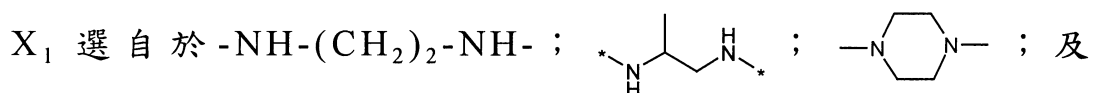
5. 如申請專利範圍第 1 至 3 項之任一項的化合物，其中：

X_1 為式 (1a) 之基團，其中

A_1 為 C_1 - C_5 伸烷基；或伸苯基；及

R_9 為氫；

6. 如申請專利範圍第 1 至 5 項之任一項的化合物，其中：

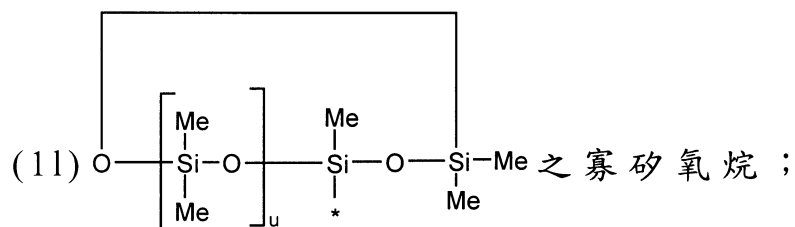
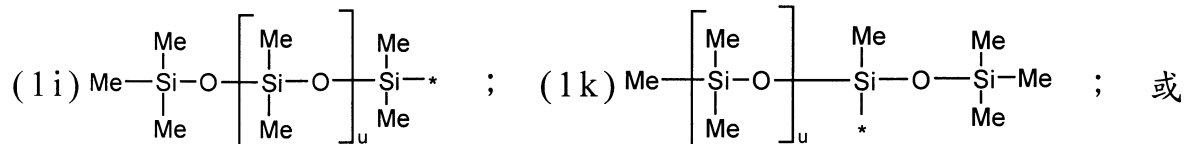


7. 如申請專利範圍第 1 至 6 項之任一項的化合物，其

中 R_2 、 R_3 及 R_4 為氫。

8.如申請專利範圍第 1 至 7 項之任一項的化合物，其中 $Si1$ 為 $SiR_{10}R_{11}R_{12}$ 基團，其中：

R_{10} 、 R_{11} 及 R_{12} 各獨立地為 C_1 - C_6 烷基； C_1 - C_6 烷氧基；或苯基；或式 $-SiMe_m(OSiMe_3)_n$ 之寡矽氧烷；或式



其中

Me 為甲基；

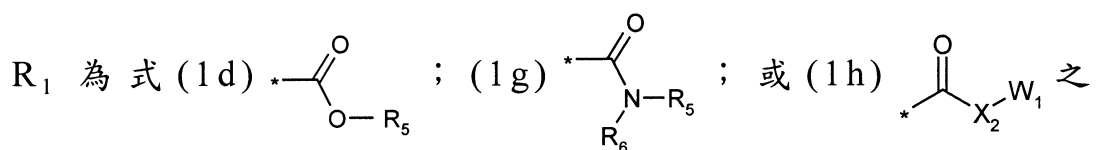
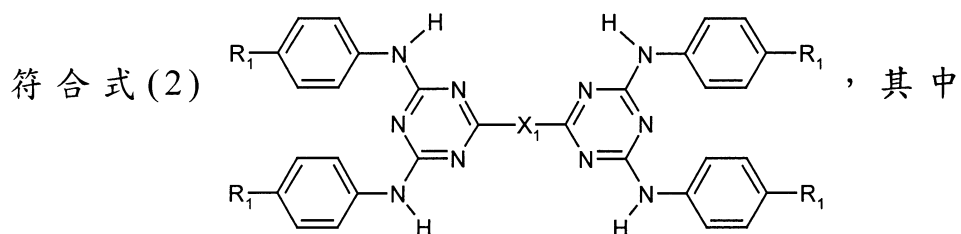
m 為 0；1；或 2；

n 為 1；2；或 3；

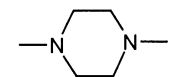
m+n 為 3；及

u 為 0 至 6。

9.如申請專利範圍第 1 至 8 項之任一項的化合物，其



基團；

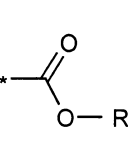
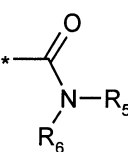
X_1 為式 (1a)- NR_9-A-NR_9- ；(1c)*-O-A-O-*；及 -

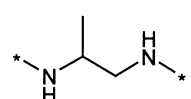
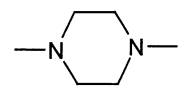
之基團；

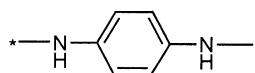
A、 W_1 、 X_2 及 R_9 如在式 (1) 中所定義；及

R_5 及 R_6 彼此各自獨立地為氫；或 C_1-C_4 烷基。

10. 如申請專利範圍第 9 項之化合物，其中

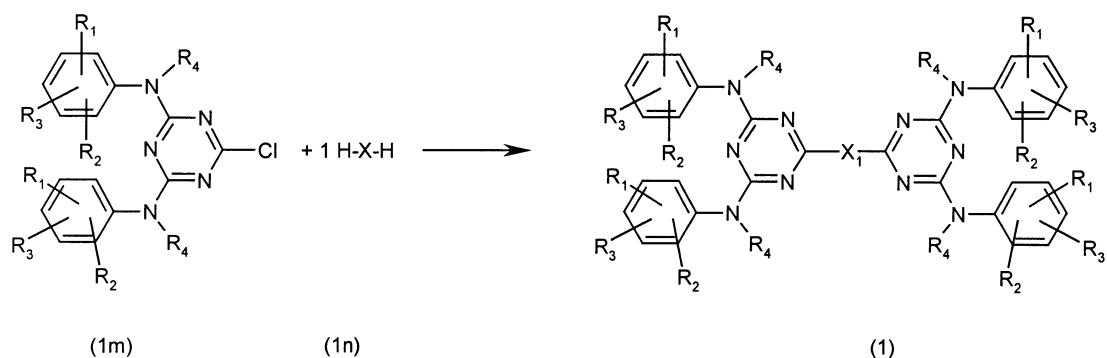
R_1 為式 (1d)  或 (1g)  之基團；

X_1 選自於 $-NH-(CH_2)_2-NH-$ ；；；

及 ；及

R_5 及 R_6 彼此獨立地為氫；或 C_1-C_4 烷基。

11. 一種製備式 (1) 化合物的方法，其包括根據下反應方案，讓 2 莫耳式 (1m) 的氯三吡與 1 莫耳式 (1n) 之化合物反應：



其中

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 及 X_1 如在申請專利範圍第 1 項中所

定義。

12.一種製備式(1)之微粉化化合物的方法，其包括溼式研磨、溼式揉捏、從合適的溶劑噴霧乾燥、根據 RESS 方法膨脹或藉由從合適的溶劑中再沉澱式(1)之化合物，以獲得平均顆粒大小從 0.02 至 2 微米的微粒子。

13.一種化粧品組成物，其包含至少一種如申請專利範圍第 1 項的式(1)化合物與化妝上可容忍的載劑或佐藥。

14.如申請專利範圍第 13 項之化粧品組成物，其中式(1)之化合物以微粉化狀態存在於該組成物中。

15.一種 UV 吸收劑分散液，其包含：

(a)至少一種式(1)之微粉化 UV 吸收劑，其具有從 0.02 至 2 微米之顆粒大小；及

(b)合適的分散劑。

十一、圖式：

無

定義。

12.一種製備式(1)之微粉化化合物的方法，其包括溼式研磨、溼式揉捏、從合適的溶劑噴霧乾燥、根據 RESS 方法膨脹或藉由從合適的溶劑中再沉澱式(1)之化合物，以獲得平均顆粒大小從 0.02 至 2 微米的微粒子。

13.一種化粧品組成物，其包含至少一種如申請專利範圍第 1 項的式(1)化合物與化妝上可容忍的載劑或佐藥。

14.如申請專利範圍第 13 項之化粧品組成物，其中式(1)之化合物以微粉化狀態存在於該組成物中。

15.一種 UV 吸收劑分散液，其包含：

(a)至少一種式(1)之微粉化 UV 吸收劑，其具有從 0.02 至 2 微米之顆粒大小；及

(b)合適的分散劑。

十一、圖式：

無

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（ 無 ）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：