

【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18年4月20日(2006.4.20)

【公表番号】特表2005-520821(P2005-520821A)

【公表日】平成17年7月14日(2005.7.14)

【年通号数】公開・登録公報2005-027

【出願番号】特願2003-575716(P2003-575716)

【国際特許分類】

A 0 1 N 43/54 (2006.01)

A 0 1 N 43/60 (2006.01)

A 0 1 N 43/62 (2006.01)

A 0 1 N 43/78 (2006.01)

A 0 1 N 43/84 (2006.01)

A 6 1 K 8/49 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 31/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

C 0 7 D 239/42 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 9 D 5/14 (2006.01)

C 0 9 D 7/12 (2006.01)

C 0 9 D 11/00 (2006.01)

C 0 9 D 201/00 (2006.01)

C 1 1 D 3/28 (2006.01)

C 1 1 D 3/48 (2006.01)

【F I】

A 0 1 N 43/54 A

A 0 1 N 43/60

A 0 1 N 43/62

A 0 1 N 43/78 B

A 0 1 N 43/84 1 0 1

A 6 1 K 7/00 D

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 31/02

A 6 1 P 31/04
 C 0 7 D 239/42 Z
 C 0 7 D 401/04
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 403/04
 C 0 7 D 405/12
 C 0 7 D 405/14
 C 0 7 D 409/04
 C 0 7 D 417/04
 C 0 9 D 5/14
 C 0 9 D 7/12
 C 0 9 D 11/00
 C 0 9 D 201/00
 C 1 1 D 3/28
 C 1 1 D 3/48

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月6日(2006.3.6)

【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

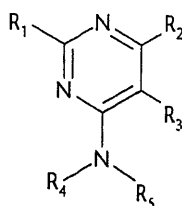
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

表面の抗菌処理における、式(1)：

【化1】



(式中、R₁は、水素；非置換又は1つ以上のハロゲン原子によって置換されたC₁~C₅アルキル；ビフェニル又は非置換若しくはハロゲン、C₁~C₅アルキル、C₁~C₅アルコキシ若しくはアミノによって置換されたC₆~C₁₀アリアル；ピロール、フラン、チオフェン、イミダゾール、ピラゾール、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾール、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、ピラン、チオピラン、1,4-ジオキサン、1,2-オキサジン、1,3-オキサジン、1,4-オキサジン、インドール、ベンゾチオフェン、ベンゾフラン、ピロリジン、ピベリジン、ピベラジン、モルホリン及びチオモルホリン基；又はシクロC₃~C₇アルキルであり；

R₂は、水素；非置換又は1つ以上のハロゲン原子によって置換されたC₁~C₅アルキル；ビフェニル又は非置換若しくはハロゲン、C₁~C₅アルキル、C₁~C₅アルコキシ若しくはアミノによって置換されたC₆~C₁₀アリアル；5ないし7員のヘテロアリアル基；又はシクロC₃~C₇アルキルであり；

R₃は、水素；フェニル又は非置換若しくは1つ以上のハロゲン原子によって置換されたC₁~C₅アルキルであり；

R₄は、水素；C₁～C₁₀アルキル；フェニル；又は5ないし7員のヘテロアリアル基であり；

R₅は、非置換又はヘテロ環基によって置換されたか、又は非中断若しくは1つ以上の - - 若しくは

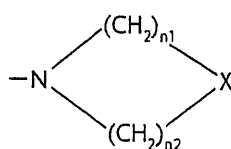
【化2】



基によって、若しくは2価のヘテロ環基によって中断されたNR R - C₁～C₂₀アルキル；シクロ-C₅～C₈アルキル；ヒドロキシC₁～C₂₀アルキル；あるいは

R₄及びR₅は、それらを結合している窒素原子と一緒に式(1a)：

【化4】



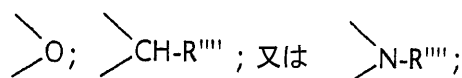
の基を形成し、

R は、水素；又はC₁～C₃アルキルであり；

R 及びR は、それぞれ他方から独立して、水素；C₁～C₅アルキル；又はヒドロキシ-C₁～C₅アルキルであり；

Xは、

【化5】



であり；

R は、水素；C₁～C₄アルキル；又はヘテロアリアル-C₁～C₄アルキルであり；そして

n₁及びn₂は、それぞれ他方から独立して、1～8である)

で示される4-アミノピリミジンの使用。

【請求項2】

R₅が、非中断又は1つ以上の - - 若しくは

【化6】



基によって、若しくは2価のヘテロ環基によって中断されたR R N - C₁～C₂₀アルキルであり；

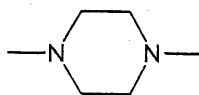
R が、水素；又はC₁～C₅アルキルであり；

R 及びR が、それぞれ他方から独立して、水素；又はメチルであり；そして

R₁、R₂、R₃及びR₄が請求項1に定義されたとおりである、請求項1記載の使用。

【請求項3】

R₅が、非中断又は
【化7】



によって中断された R R N - C₁ ~ C₂₀アルキルである、請求項1記載の使用。
【請求項4】

R₅が、非中断又は1つ以上の - - 若しくは
【化8】



基によって中断された R R N - C₅ ~ C₂₀アルキルであり；

R が、水素；又はC₁ ~ C₅アルキルであり；そして

R 及びR が、それぞれ他方から独立して、水素；又はメチルである、請求項1記載の使用。

【請求項5】

R₅が、R R N - C₅ ~ C₂₀アルキルであり；そして

R 及びR が、それぞれ他方から独立して、水素；又はメチルである、請求項4記載の使用。

【請求項6】

式(1a)中において、R が、水素；又はピリジル - C₁ ~ C₃アルキルであり；そして

n₁及びn₂が、それぞれの場合において2である、請求項1記載の使用。

【請求項7】

R₁が、水素；C₁ ~ C₅アルキル；非置換又はハロゲン、C₁ ~ C₅アルキル、C₁ ~ C₅アルコキシ若しくはアミノによって置換されたフェニル；ピフェニル；シクロ - C₃ ~ C₇アルキル；2 - チオフェニル；3 - チオフェニル；又はチアゾリルである、

R₂が、水素；C₁ ~ C₅アルキル；非置換又はハロゲン、C₁ ~ C₅アルキル、C₁ ~ C₅アルコキシ若しくはアミノによって置換されたフェニル；ピフェニル；シクロ - C₃ ~ C₇アルキル；3 - ピリジル；4 - ピリジル；2 - チオフェニル；3 - チオフェニル；又はチアゾリルである、請求項1 ~ 6のいずれか一項記載の使用。

【請求項8】

R₃が、水素；又はフェニルである、請求項1記載の使用。

【請求項9】

R₄が、水素である、請求項1 ~ 7のいずれか一項記載の使用。

【請求項10】

式(2)：

【化 9】



(式中、Xは、 - - ; 又は

【化 10】



であり ;

R は、水素 ; 又は C₁ ~ C₃アルキルであり ;

n は、 1 ~ 3 であり ; 及び

m は、 1 ~ 3 であり ; そして

R₁、 R₂ 及び R₃ は、 請求項 1 で定義されたとおりである)

で示される化合物に関する、 請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 1】

式 (1) の化合物が、 抗菌処理、 脱臭並びに肌、 粘膜及び毛髪 of 殺菌に用いられる、 請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 2】

式 (1) の化合物が、 織物用繊維材料の処理に用いられる、 請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 3】

式 (1) の化合物が、 保存に用いられる、 請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 4】

式 (1) の化合物が、 洗濯及び洗浄配合物に用いられる、 請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 5】

式 (1) の化合物が、 プラスチック、 紙、 不織布、 木材又は皮革に対する抗菌性の付与及び保存に用いられる、 請求項 1 記載の使用。

【請求項 1 6】

工業製品、 特にデンプン又はセルロース誘導体の印刷増粘剤、 表面塗布剤及び塗料に対する抗菌性の付与及び保存における、 式 (1) の化合物の使用。

【請求項 1 7】

工業製法における殺生剤としての式 (1) の化合物の使用。

【請求項 1 8】

組成物の全重量に対して、 0 . 0 1 ~ 1 5 重量 % の式 (1) の化合物及び化粧用に許容されるアジュバンドを含むパーソナルケア製剤。

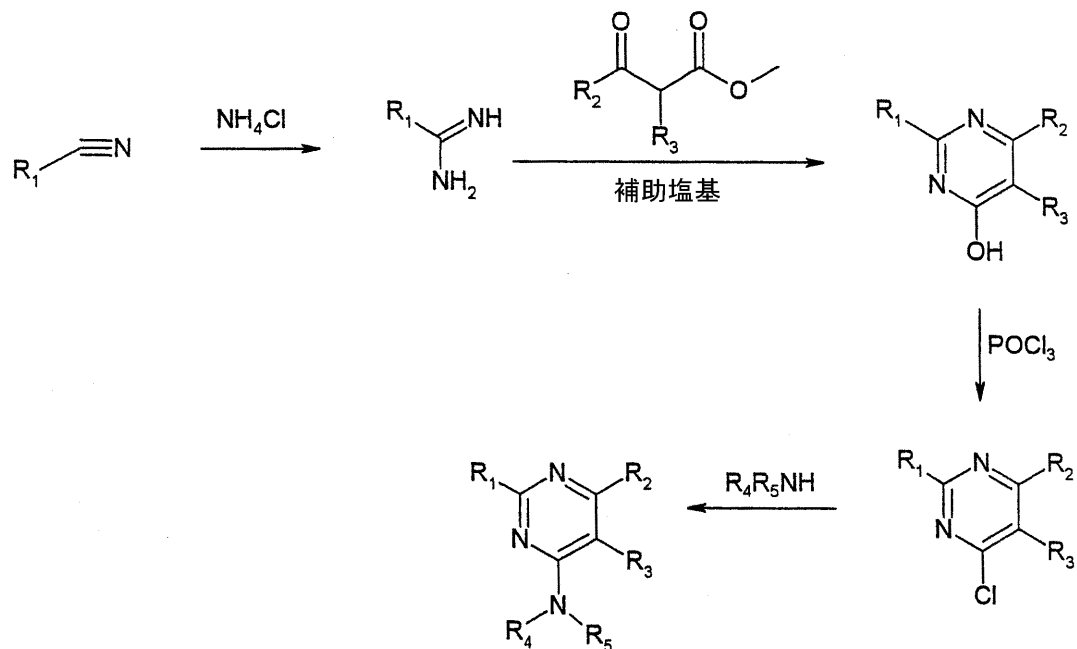
【請求項 1 9】

組成物の全重量に対して、 0 . 0 1 ~ 1 5 重量 % の式 (1) の化合物及び経口的に許容されるアジュバンドを含む経口組成物。

【請求項 2 0】

2 - アミジノピリジンを、 適切な溶媒中で補助的な塩基を用いてケトエステルと、 下記のスキーム :

【化 1 1】

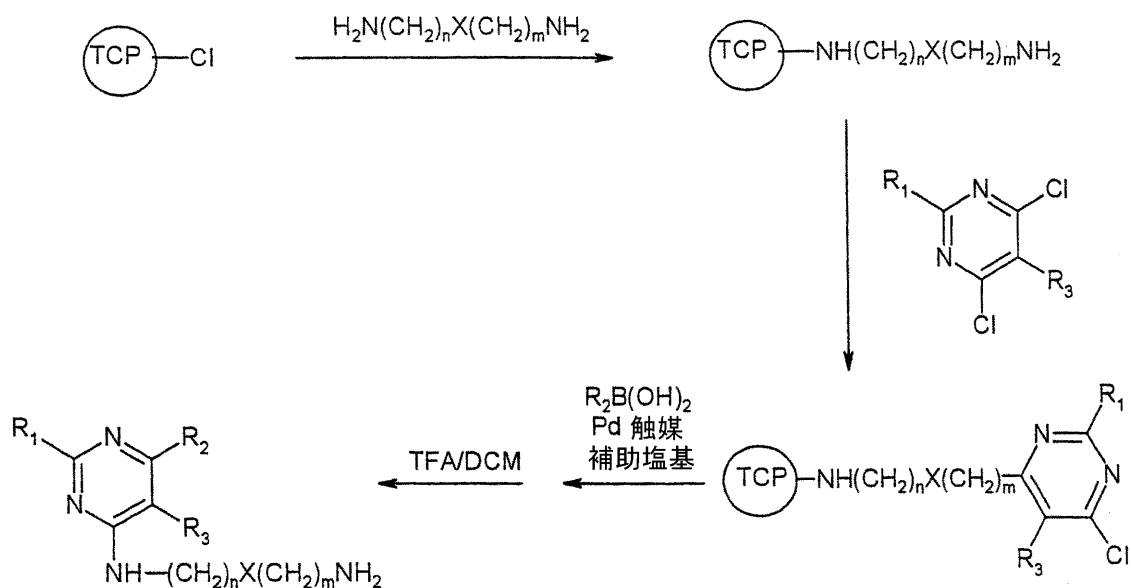


(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は、請求項1に定義されたとおりである)に従って反応させることを含む、式(1)の化合物の調製方法。

【請求項21】

下記のスキーム：

【化 1 2】

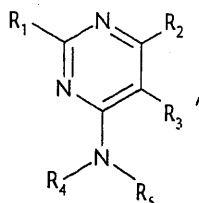


(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 X 、 m 及び n は、請求項10に定義されたとおりである)に従って、トリチル(TCP)樹脂を用いて、固相合成において化合物を調製することを含む、式(2)の化合物の調製方法。

【請求項22】

式(1)：

【化 1 3】



(式中、R₁及びR₂は、それぞれ他方から独立して、水素；非置換又は1つ以上のハロゲン原子によって置換されたC₁～C₅アルキル；ビフェニル又は非置換若しくはハロゲン、C₁～C₅アルキル、C₁～C₅アルコキシ若しくはアミノによって置換されたC₆～C₁₀アリール；5ないし7員のヘテロアリール基；又はシクロC₃～C₇アルキルであり；

R₃は、水素；フェニル又は非置換若しくは1つ以上のハロゲン原子によって置換されたC₁～C₅アルキルであり；

R₄は、水素；C₁～C₁₀アルキル；フェニル；又は5ないし7員のヘテロアリール基であり；

R₅は、非置換又は1つ以上のハロゲン原子によって、若しくはヘテロ環基によって置換されたか、又は1つ以上の - - 若しくは

【化 1 4】



基によって、若しくは2価のヘテロ環基によって中断されたC₁～C₂₀アルキル基；非置換又はヘテロ環基によって置換されたか、又は1つ以上の - - 若しくは

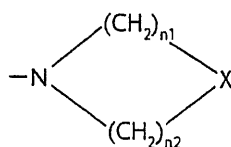
【化 1 5】



基によって、若しくは2価のヘテロ環基によって中断されたNR - C₁～C₂₀アルキル；シクロ - C₅～C₈アルキル；ヒドロキシC₁～C₂₀アルキル；フェニルC₁～C₃アルキル；ヘテロ環基であるか；あるいは

R₄及びR₅は、それらを結合している窒素原子と一緒に式(1a)；

【化 1 6】



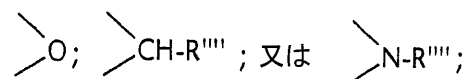
の基を形成し、

R は、水素；又はC₁～C₅アルキルであり；

R 及びR は、それぞれ他方から独立して、水素；C₁～C₅アルキル；又はヒドロキシ - C₁～C₅アルキルであり；

Xは、

【化 17】



であり；

R'''' は、水素；C₁～C₄アルキル；又はヘテロアリール - C₁～C₄アルキルであり；
そして

n₁及びn₂は、それぞれ他方から独立して、1～8であるが、

ここで、同時にR₁が、C₆～C₁₀アリール；又はC₁～C₄アルキルであり、R₅が、C₁～C₇アルキルである式(1)の化合物を含まない)
で示される化合物。