

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2007-514709

(P2007-514709A)

(43) 公表日 平成19年6月7日(2007.6.7)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 8/41 (2006.01)	A 6 1 K 8/41	4 C 0 8 3
A 6 1 K 8/49 (2006.01)	A 6 1 K 8/49	4 H 0 0 6
A 6 1 Q 17/04 (2006.01)	A 6 1 Q 17/04	
A 6 1 P 17/16 (2006.01)	A 6 1 P 17/16	
C 0 7 D 295/10 (2006.01)	C 0 7 D 295/10 C S P A	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 56 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2006-544416 (P2006-544416)	(71) 出願人	396023948 チバ スペシャルティ ケミカルズ ホールディング インコーポレーテッド Ciba Specialty Chemicals Holding Inc. スイス国, 4057 バーゼル, クリベツクシュトラーセ 141
(86) (22) 出願日	平成16年12月8日 (2004.12.8)	(74) 代理人	100068618 弁理士 粵 経夫
(85) 翻訳文提出日	平成18年6月16日 (2006.6.16)	(74) 代理人	100104145 弁理士 宮崎 嘉夫
(86) 国際出願番号	PCT/EP2004/053327	(74) 代理人	100080908 弁理士 館石 光雄
(87) 国際公開番号	W02005/058269	(74) 代理人	100093193 弁理士 中村 壽夫
(87) 国際公開日	平成17年6月30日 (2005.6.30)		
(31) 優先権主張番号	03104746.7		
(32) 優先日	平成15年12月17日 (2003.12.17)		
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		
(31) 優先権主張番号	04102155.1		
(32) 優先日	平成16年5月17日 (2004.5.17)		
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		

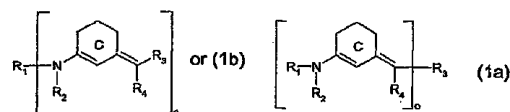
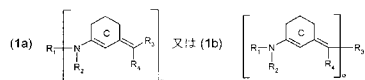
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 化粧品用メロシアン誘導体

(57) 【要約】

【課題】 化粧品用メロシアン誘導体の提供。

【解決手段】 式



(式中、n及びoは、2ないし4の整数を表わす。) で表わされるメロシアン誘導体及びアミノシクロヘキサノン中間体を開示する。それらは、紫外線からのヒト及び動物の毛及び肌の保護において使用される。

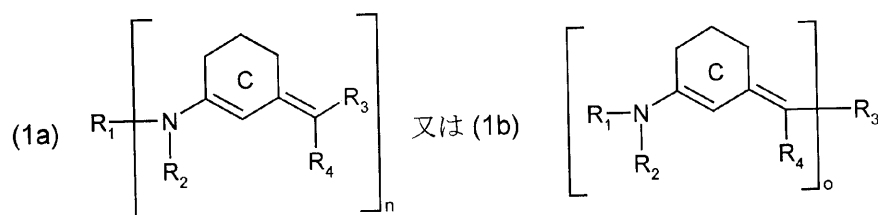
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

紫外線からのヒト及び動物の毛及び肌の保護における、
式

【化 1】



10

(式中、

R_2 は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基、又はシアノ基を表わし、

R_4 は、シアノ基又は $-\text{Q}_1 - \text{R}_5$ を表わし、

Q_1 は、 $-\text{COO}-$ 、 $-\text{CONH}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 又は $-\text{CONR}_6-$ を表わし、

20

R_5 は、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基又は未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基を表わし、

R_6 は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基を表わし、

シクロヘキセン基 C は、未置換であるが、又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基で置換され、

n は、2 ないし 4 を表わし、

o は、2 ないし 4 を表わし、

30

$n = 2$ の場合、式 (1a) において、

R_1 は、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、同時に、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を形成し、

R_3 は、シアノ基又は $-\text{Q}_1 - \text{R}_5$ を表わすか、又は、 R_3 及び R_4 は、一緒になって、 $-\text{O}-$ 又は $-\text{NR}_7-$ によって任意に中断される 5 ないし 7 員の単環式の炭素環を形成し、

$o = 2$ の場合、式 (1b) において、

R_3 は、炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基、炭素原子数 1 ないし 4 のアルコキシ基、 $-\text{COR}_6$ 、 $-\text{COOR}_6$ 又は $-\text{CONHR}_6$ によって任意に置換されるアルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を表わし、

R_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基を表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒に、 $-\text{O}-$ によって又は $-\text{NR}_7-$ によって任意に中断される $-(\text{CH}_2)_m$ - 環を形成し、

40

R_7 は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基を表わし、

m は、3 ないし 7 の数を表わし、

$n = 3$ の場合、式 (1a) において、

R_1 は、1 つ以上の $-\text{O}-$ 又は $-\text{NR}_7-$ 基によって任意に中断される 3 価のアルキル基

50

を表わし、

R_3 は、シアノ基又は $-Q_1 - R_5$ を表わすか、又は R_3 及び R_4 は、一緒になって、5 ないし 7 員の単環式の炭素環を形成し、

$n = 3$ の場合、式 (1 b) において、

R_3 は、アルキリデン基、シクロアルキリデン基又はフェニリデン基を表わし、

R_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリール基を表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によって又は $-NR_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m-$ 環を形成し、

10

$n = 4$ の場合、式 (1 a) において、

R_1 は、4 価のアルキル基を表わし、

R_3 は、シアノ基又は $-Q_1 - R_5$ を表わすか、又は、 R_3 及び R_4 は、一緒になって、5 ないし 7 員の単環式の炭素環を形成し、

$n = 4$ の場合、式 (1 b) において、

R_3 は、4 価のアルキル基を表わし、

R_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリール基を表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によって又は $-NR_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m-$ 環を形成する。) で表わされる化合物の使用。

20

【請求項 2】

式 (1 a) において、

R_1 が、請求項 1 記載の式 (1 a) で定義した通りであり、

R_2 が、水素原子を表わし、

R_3 が、シアノ基を表わし、

R_4 が、 $-CONHR_5$ を表わし、

R_5 が、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基又は炭素原子数 6 ないし 20 のアリール基を表わす、請求項 1 に記載の使用。

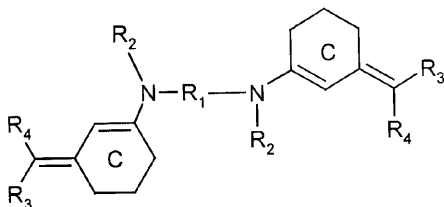
30

【請求項 3】

$n = 2$ の場合、

式 (1 c)

【化 2】

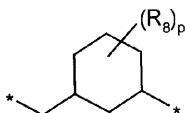


40

(式中、

R_1 は、未置換の又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 の基で置換された $*(CH_2)_m$ - * 基、式 (1 a₁)

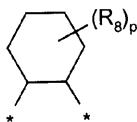
【化 3】



で表わされる 2 価の基、式 (1 a₂)

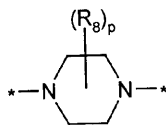
50

【化 4】



で表わされる 2 価の基を表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、2 つの結合している窒素原子と一緒にあって、式 (1 a₃)

【化 5】



10

で表わされる 2 価の基を形成し、

R_8 は、水素原子又は炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

R_3 は、シアノ基又は $-Q_1-R_5$ を表わし、

p は、0 ないし 3 の数を表わし、

シクロヘキセン基 C は、未置換であるか、又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基で置換され、

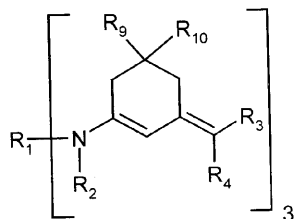
R_2 、 R_4 、 R_5 、 Q_1 及び m は、請求項 1 で定義した通りである。) で表わされる化合物が使用される、請求項 1 に記載の使用。

20

【請求項 4】

式 (1 d)

【化 6】

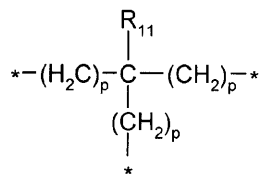


30

(式中、

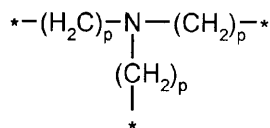
R_1 は、式 (1 d₁)

【化 7】



又は、式 (1 d₂)

【化 8】



40

で表わされる 3 価の基を表わし、

R_2 は、水素原子又は炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

R_3 及び R_4 は、互いに独立して、シアノ基又は $-Q_1-R_5$ を表わし、

Q_1 は、 $-COO-$ 、 $-CONH-$ 、 $-CO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CONR_{12}-$ を表わし、

R_5 は、炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

R_9 及び R_{10} は、互いに独立して、炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基を表わし、

50

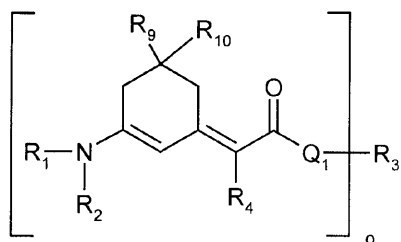
R_{11} 及び R_{12} は、互いに独立して、水素原子又は炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

p は、0 ないし 5 の数を表わす。) で表わされる化合物が使用される、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 5】

式 (1e)

【化 9】



10

(式中、

R_1 及び R_2 は、それぞれ互いに独立して、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基又はシアノ基を表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒に、 $-O-$ によって又は $-NR_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m-$ 環を形成し、

R_4 は、シアノ基又は $-Q_1-R_5$ を表わし、

20

o は、3 又は 4 を表わし、

$o = 3$ の場合、

R_2 は、3 価のアルキル基を表わし、

$o = 4$ の場合、

R_2 は、4 価のアルキル基を表わし、

R_5 、 R_7 、 Q_1 及び m は、請求項 1 で定義した通りであり、

R_9 及び R_{10} は、請求項 4 で定義した通りである。) で表わされる化合物が使用される、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 6】

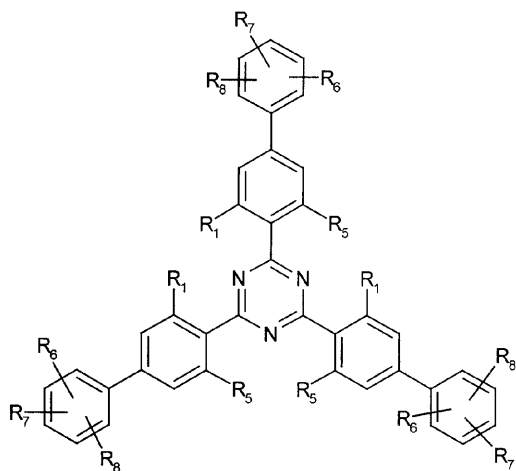
更なる紫外線吸収剤が使用される、請求項 1 ないし 5 のいずれか 1 項に記載の使用。

30

【請求項 7】

前記更なる紫外線吸収剤が、式 (t₂1)

【化 10】



40

(式中、

R_1 及び R_5 は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 18 のアルキル基又は炭素原子数 6 ないし 12 のアリアル基を表わし、

R_6 、 R_7 及び R_8 は、互いに独立して、水素原子、ヒドロキシ基、ハロゲン原子、炭素

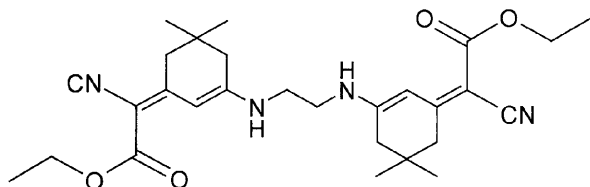
50

原子数 1 ないし 18 のアルキル基、炭素原子数 1 ないし 18 のアルコキシ基、炭素原子数 6 ないし 12 のアリール基、ビフェニル基、炭素原子数 6 ないし 12 のアリールオキシ基、炭素原子数 1 ないし 18 のアルキルチオ基、カルボキシ基、 $-COOM$ 、炭素原子数 1 ないし 18 のアルキルカルボキシル基、アミノカルボニル基、又は、モノ - 又はジ - 炭素原子数 1 ないし 18 のアルキルアミノ基、炭素原子数 1 ないし 10 のアシルアミノ基又は $-COOH$ を表わす。) で表わされるトリアジン化合物から選択される、請求項 6 に記載の使用。

【請求項 8】

(t_3) 式 (MC02)

【化 1 1】



10

で表わされる化合物、及び、

(t_4) 1, 3, 5 - トリアジン, 2, 4, 6 - トリス [1, 1' - ビフェニル] - 4 - イル - (9C1)

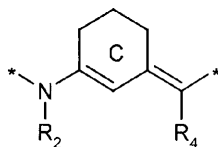
を含む紫外線フィルターの組み合わせが使用される、請求項 6 又は 7 に記載の使用。

20

【請求項 9】

紫外線からヒト及び動物の毛及び肌を保護するための紫外線発色団としての、式 (2)

【化 1 2】



(式中、

少なくとも 1 つの星印の基は、モノマー状、オリゴマー状又はポリマー状の基に結合され得り、

シクロヘキセン基 C は、未置換であるか、又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基によって置換され、

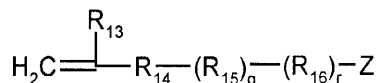
R_2 及び R_4 は、請求項 1 で定義した通りである。) で表わされる構造要素を含むモノマー状、オリゴマー状又はポリマー状化合物の使用。

30

【請求項 10】

前記モノマー状、オリゴマー状又はポリマー状化合物が、式 (3)

【化 1 3】



40

(式中、

Z は、請求項 9 記載の式 (2) で表わされる基を表わし、

R_{13} は、水素原子、ハロゲン原子又は炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

R_{14} は、 $-CONH-$ 、 $-COO-$ 又はフェニレン基を表わし、

R_{15} は、炭素原子数 1 ないし 20 のアルキレン基又は炭素原子数 6 ないし 20 のアリーレン基を表わし、

R_{16} は、 $-COO-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CONH-$ 、 $-NH-CO-O-$ 、 $-NH-CO-$ 、 $-SO_2NH-$ 、 $-NH-SO_2-$ 、 $-SO_2-$ 又は $-O-$ を表わし、

50

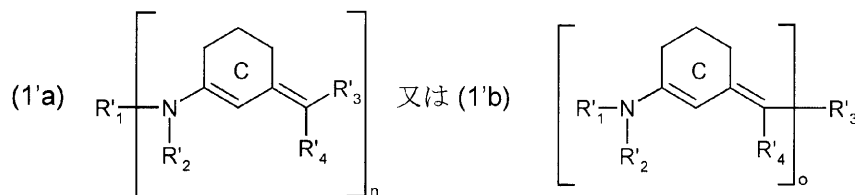
q は、0 又は整数を表わし、

r は、0 又は整数を表わす。) に対応する請求項 9 に記載の使用。

【請求項 11】

式

【化 14】



10

(式中、

R'2 は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリール基、又はシアノ基を表わすか、又は R'1 及び R'2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、-O- によって又は -NR'7- によって任意に中断される -(CH2)m- 環を形成し、

R'4 は、-Q'1-R'5 を表わし、

Q'1 は、-COO-、-CONH-、-CO-、-SO2- 又は -CONR'6- を表わし、

20

R'5 は、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基又は未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリール基を表わし、

R'6 は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリール基を表わし、

R'7 は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリール基を表わし、

シクロヘキセン基 C は、未置換であるか、又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基で置換され、

30

m は、3 ないし 7 を表わし、

n は、2 ないし 4 を表わし、

o は、2 ないし 4 を表わし、

n = 2 の場合、式 (1'a) において、

R'1 は、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を表わすか、又は、R'1 及び R'2 は、同時に、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を形成し、

R'3 は、シアノ基又は -Q'1-R'5 を表わすか、又は、R'3 及び R'4 は、一緒になって、5 ないし 7 員の単環式の炭素環を形成し、

40

o = 2 の場合、式 (1'b) において、

R'3 は、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を表わし、

R'1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリール基を表わすか、又は、R'1 及び R'2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、-O- によって又は -NR'7- によって任意に中断される -(CH2)m- 環を形成し、

n = 3 の場合、式 (1'a) において、

R'1 は、1 つ以上の -O- 又は -NR'7- 基によって任意に中断される 3 価のアルキル基を表わし、

50

R'₃は、シアノ基又は - Q'₁ - R'₅ を表わすか、又は R'₃ 及び R'₄ は、一緒にな
って、5 ないし 7 員の単環式の炭素環を形成し、

o = 3 の場合、式 (1' b) において、

R'₃は、アルキリデン基、シクロアルキリデン基又はフェニリデン基を表わし、

R'₁は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素
原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は
炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基
を表わすか、又は、R'₁ 及び R'₂ は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、- O
- によって又は - NR'₇ - によって任意に中断される - (CH₂)ₘ - 環を形成し、

n = 4 の場合、式 (1' a) において、

R'₁は、4 価のアルキル基を表わし、

R'₃は、シアノ基又は - Q'₁ - R'₅ を表わすか、又は、R'₃ 及び R'₄ は、一緒にな
って、5 ないし 7 員の単環式の炭素環を形成し、

o = 4 の場合、式 (1' b) において、

R'₃は、4 価のアルキル基を表わし、

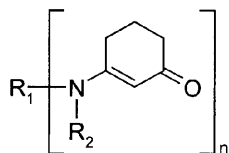
R'₁は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素
原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は
炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基
を表わすか、又は、R'₁ 及び R'₂ は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、- O
- によって又は - NR'₇ - によって任意に中断される - (CH₂)ₘ - 環を形成する。) 20

で表わされる化合物。

【請求項 12】

式 (4)

【化 15】



(式中、

R₂は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ない
し 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1
ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基を表わすか、
又は R₁ 及び R₂ は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、- O - によって又は - N
R₃ - によって任意に中断される - (CH₂)ₘ - 環を形成し、

R₃は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ない
し 8 のアルキル基、又は、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で置換された
炭素原子数 6 ないし 20 のアリアル基を表わし、

m は、3 ないし 7 を表わし、

n は、2 ないし 4 を表わし、

シクロヘキセン基 C は、未置換であるか、又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 のアル
キル基で置換され、

n = 2 の場合、

R₁ 及び R₂ は、同時に、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を形成し

n = 3 の場合、

R₁ は、1 つ以上の - O - 又は - NR₃ - 基によって任意に中断される 3 価のアルキル基
を表わし、

n = 4 の場合、

R₁ は、1 つ以上の - O - 又は - NR₃ - 基によって任意に中断される 4 価のアルキル基

10

20

30

40

50

を表わす。) で表わされる化合物。

【請求項 1 3】

紫外線からのヒト及び動物の毛及び肌の保護における紫外線 B (UV - B) 吸収剤としての、請求項 1 2 に記載の式 (4) で表わされる化合物の使用。

【請求項 1 4】

紫外線吸収剤の製造のための中間体としての、請求項 1 2 に記載の式 (4) で表わされる化合物の使用。

【請求項 1 5】

化粧品的に許容可能な担体又は補助剤と共に請求項 1 又は 1 2 に記載の式 (1 a)、(1 b) 又は (4) で表わされる化合物を少なくとも 1 つ以上含む化粧品。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、紫外線からのヒト及び動物の毛及び肌の保護におけるメロシアニン誘導体の使用及びこのような化合物を含む化粧品組成物に関する。

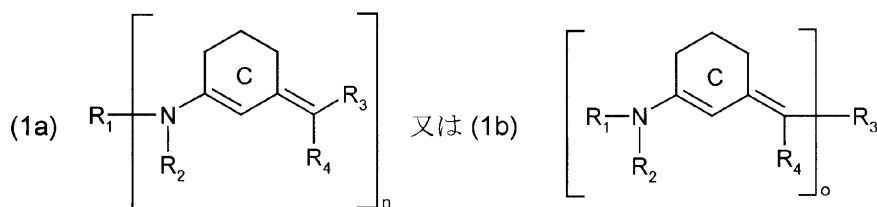
【発明の開示】

【0002】

本発明に従った用途のための化合物は、式

【化 1】

20



(式中、

R₂は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 2 2 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 2 0 のアリール基、又はシアノ基を表わし、

30

R₄は、シアノ基又は - Q₁ - R₅を表わし、

Q₁は、- COO -、- CONH -、- CO -、- SO₂ - 又は - CONR₆ - を表わし、

R₅は、炭素原子数 1 ないし 2 2 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基又は未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で置換された炭素原子数 6 ないし 2 0 のアリール基を表わし、

R₆は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 2 2 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 2 0 のアリール基を表わし、

40

シクロヘキセン基 C は、未置換であるか、又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基で置換され、

n は、2 ないし 4 を表わし、

o は、2 ないし 4 を表わし、

n = 2 の場合、式 (1 a) において、

R₁は、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を表わすか、又は、R₁及び R₂は、同時に、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を形成し、

R₃は、シアノ基又は - Q₁ - R₅を表わすか、又は、R₃及び R₄は、一緒になって、- O - 又は - NR₇ - によって任意に中断される 5 ないし 7 員の単環式の炭素環を形成し、

o = 2 の場合、式 (1 b) において、

50

R_3 は、炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基、炭素原子数 1 ないし 4 のアルコキシ基、
 $-COR_6$ 、 $-COOR_6$ 又は $-CONHR_6$ によって任意に置換されるアルキレン基、シ
クロナルキレン基又はフェニレン基を表わし、

R_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 2 2 のアルキル基、シクロ - 炭素原
子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭
素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 2 0 のアリアル基を
表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によ
って又は $-NR_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m$ -環を形成し、

R_7 は、水素原子、炭素原子数 1 ないし 2 2 のアルキル基、シクロ - 炭素原子数 3 ない
し 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭素原子数 1
ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 2 0 のアリアル基を表わし、
 m は、3 ないし 7 の数を表わし、

$n = 3$ の場合、式 (1 a) において、

R_1 は、1 つ以上の $-O-$ 又は $-NR_7-$ 基によって任意に中断される 3 価のアルキル基
を表わし、

R_3 は、シアノ基又は $-Q_1-R_5$ を表わすか、又は R_3 及び R_4 は、一緒にあって、5 ない
し 7 員の単環式の炭素環を形成し、

$o = 3$ の場合、式 (1 b) において、

R_3 は、アルキリデン基、シクロアルキリデン基又はフェニリデン基を表わし、

R_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 2 2 のアルキル基、シクロ - 炭素原
子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭
素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 2 0 のアリアル基を
表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によ
って又は $-NR_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m$ -環を形成し、

$n = 4$ の場合、式 (1 a) において、

R_1 は、4 価のアルキル基を表わし、

R_3 は、シアノ基又は $-Q_1-R_5$ を表わすか、又は、 R_3 及び R_4 は、一緒にあって、5
ないし 7 員の単環式の炭素環を形成し、

$o = 4$ の場合、式 (1 b) において、

R_3 は、4 価のアルキル基を表わし、

R_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数 1 ないし 2 2 のアルキル基、シクロ - 炭素原
子数 3 ないし 8 のアルキル基、未置換の又は炭素原子数 1 ないし 6 のアルキル基で又は炭
素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基で置換された炭素原子数 6 ないし 2 0 のアリアル基を
表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によ
って又は $-NR_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m$ -環を形成する。)に対応す
る。

【0003】

炭素原子数 1 ないし 2 2 のアルキル基は、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、
イソプロピル基、 n -ブチル基、 n -ヘキシル基、シクロヘキシル基、 n -デシル基、 n
-ドデシル基、 n -オクタデシル基、エイコシル基、メトキシエチル基、エトキシプロピ
ル基、2-エチルヘキシル基、ヒドロキシエチル基、クロロプロピル基、 N, N -ジエチ
ルアミノプロピル基、シアノエチル基、フェネチル基、ベンジル基、 p -第三ブチルフェ
ネチル基、 p -第三オクチルフェノキシエチル基、3-(2, 4-ジ-第三アミルフェノ
キシ)-プロピル基、エトキシカルボニルメチル-2-(2-ヒドロキシエトキシ)エチ
ル基又は2-フリルエチル基等の直鎖の又は枝分かれした、未置換の又は置換されたアル
キル基を示す。

【0004】

炭素原子数 1 ないし 6 のアルコキシ基は、メトキシ基、エトキシ基、 n -プロポキシ基
、イソプロポキシ基、 n -ブトキシ基、第二ブトキシ基、第三ブトキシ基、アミルオキシ
基、イソアミルオキシ基又は第三アミルオキシ基を示す。

10

20

30

40

50

【 0 0 0 5 】

炭素原子数 6 ないし 10 のアリール基は、例えば、フェニル基、トリル基、アニシル基、メシチル基、クロロフェニル基、2, 4 - ジ - 第三アミルフェニル基及びナフチル基を示す。

【 0 0 0 6 】

複素環式基は、1つ、2つ、3つ又は4つの同じ又は異なる環ヘテロ原子を含む。特に好ましいものは、1つ、2つ又は3つ、特に1つ又は2つの同じ又は異なるヘテロ原子を含む複素環である。複素環は、単環又は多環、例えば、単環、2環又は3環であり得る。それらは、好ましくは、単環又は2環、特に単環である。環は、好ましくは、5、6又は7個の環原子を含む。式(1a)及び(1b)で表わされる化合物に存在する基が誘導され得る単環及び2環の複素環系の例は、例えば、ピロール基、フラン基、チオフェン基、イミダゾール基、ピラゾール基、1, 2, 3 - トリアゾール基、1, 2, 4 - トリアゾール基、ピリジン基、ピリダジン基、ピリミジン基、ピラジン基、ピラン基、チオピラン基、1, 4 - ジオキサソ基、1, 2 - オキサジン基、1, 3 - オキサジン基、1, 4 - オキサジン基、インドール基、ベンゾチオフェン基、ベンゾフラン基、ピロリジン基、ピペリジン基、ピペラジン基、モルホリン基及びチオモルホリン基である。

10

【 0 0 0 7 】

R_5 及び R_6 が、一緒になって、5ないし7員の単環式の炭素環又は複素環を形成する場合、該環は、例えば、ジメドン環、1, 3 - ジオキソ - 5, 5 - ジエチルシクロヘキサン環等の1, 3 - ジオキソシクロヘキサン環、例えば、バルビツール酸環、1, 3 - ジメチルバルビツール酸環、1 - フェニルバルビツール酸環、1 - メチル - 3 - オクチルバルビツール酸環、1 - エチル - 3 - オクチルオキシカルボニルエチルバルビツール酸環等の1, 3 - ジアザ - 2, 4, 6 - トリオキソシクロヘキサン環、例えば、1, 2 - ジアザ - 1, 2 - ジメチル - 3, 5 - ジオキソシクロペンタン環、1, 2 - ジアザ - 1, 2 - ジフェニル - 3, 5 - ジオキソシクロペンタン環等の1, 2 - ジアザ - 3, 5 - ジオキソシクロペンタン環、又は、例えば、2, 4 - ジアザ - 1 - エトキシ - 4 - エチル - 3, 5 - ジオキソシクロヘキセン環、2, 4 - ジアザ - 1 - エトキシ - 4 - [3 - (2, 4 - ジ - 第三アミルフェノキシ)プロピル] - 3, 5 - ジオキソシクロヘキセン環等の2, 4 - ジアザ - 1 - アルコキシ - 3, 5 - ジオキソシクロヘキセン環等である。

20

【 0 0 0 8 】

好ましいものはまた、

R_1 が、式(1a)で定義した通りであり、

R_2 が、水素原子を表わし、

R_3 が、シアノ基を表わし、

R_4 が、-CONHR₅を表わし、

R_5 が、炭素原子数1ないし22のアルキル基又は炭素原子数6ないし20のアリール基を表わす、式(1a)で表わされる化合物である。

30

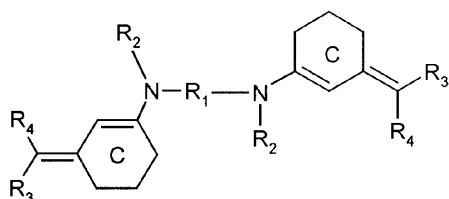
【 0 0 0 9 】

式(1a)において、 $n = 2$ の場合、

好ましいのは、更に、式(1c)

40

【 化 2 】

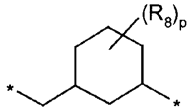


(式中、

R_1 は、未置換の又は1つ以上の炭素原子数1ないし5の基で置換された* - (CH₂)_m - *基、式(1a₁)

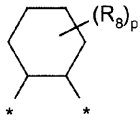
50

【化 3】



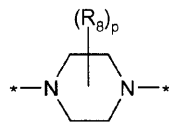
で表わされる 2 価の基、式 (1 a₂)

【化 4】



で表わされる 2 価の基を表わすか、又は、R₁ 及び R₂ は、2 つの結合している窒素原子と一緒に、式 (1 a₃)

【化 5】



で表わされる 2 価の基を形成し、

R₈ は、水素原子又は炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

R₃ は、シアノ基又は - Q₁ - R₅ を表わし、

p は、0 ないし 3 の数を表わし、

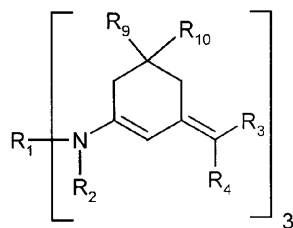
シクロヘキセン基 C は、未置換であるか、又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基で置換され、

R₂、R₄、R₅、Q₁ 及び m は、式 (1 a) 及び (1 b) で定義した通りである。) で表わされる化合物の使用である。

【0010】

好ましいのは、更に、式 (1 d)

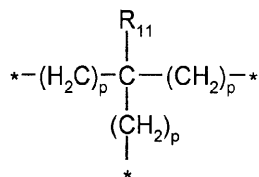
【化 6】



(式中、

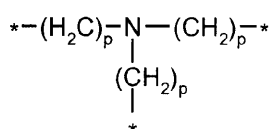
R₁ は、式 (1 d₁)

【化 7】



又は、式 (1 d₂)

【化 8】



10

20

30

40

50

で表わされる 3 価の基を表わし、

R_2 は、水素原子又は炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

R_3 及び R_4 は、互いに独立して、シアノ基又は $-Q_1-R_5$ を表わし、

Q_1 は、 $-COO-$ 、 $-CONH-$ 、 $-CO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CONR_{12}-$ を表わし、

R_5 は、炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

R_9 及び R_{10} は、互いに独立して、炭素原子数 1 ないし 4 のアルキル基を表わし、

R_{11} 及び R_{12} は、互いに独立して、水素原子又は炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基を表わし、

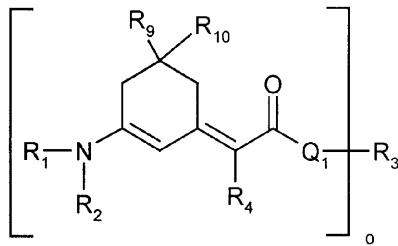
p は、0 ないし 5 の数を表わす。) で表わされる化合物の使用である。

【0011】

10

好ましいのは、更に、式 (1e)

【化9】



20

(式中、

R_1 及び R_2 は、それぞれ互いに独立して、炭素原子数 1 ないし 22 のアルキル基又はシアノ基を表わすか、又は、 R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によって又は $-NR_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m$ - 環を形成し、

R_4 は、シアノ基又は $-Q_1-R_5$ を表わし、

o は、3 又は 4 を表わし、

$o = 3$ の場合、

R_3 は、3 価のアルキル基を表わし、

$o = 4$ の場合、

R_3 は、4 価のアルキル基を表わし、

30

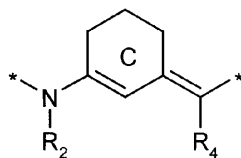
R_5 、 R_7 、 R_9 、 R_{10} 、 Q_1 及び m は、式 (1b) で定義した通りである。) で表わされる化合物の使用である。

【0012】

更に、好ましいのは、紫外線発色団としての、

式 (2)

【化10】



40

(式中、

少なくとも 1 つの星印の基は、モノマー状、オリゴマー状又はポリマー状の基に結合され得り、

シクロヘキセン基 C は、未置換であるか、又は 1 つ以上の炭素原子数 1 ないし 5 のアルキル基によって置換され、

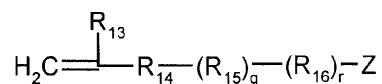
R_2 及び R_4 は、式 (1a) 及び (1b) で定義した通りである。) で表わされる構造要素を含むモノマー状、オリゴマー状又はポリマー状化合物の使用である。

【0013】

好ましくは、モノマー状、オリゴマー状又はポリマー状化合物は、式 (3)

50

【化 1 1】



(式中、

Zは、式(2)で表わされる基を表わし、

R₁₃は、水素原子、ハロゲン原子又は炭素原子数1ないし5のアルキル基を表わし、R₁₄は、-CONH-、-COO-又はフェニレン基を表わし、R₁₅は、炭素原子数1ないし20のアルキレン基又は炭素原子数6ないし20のアリーレン基を表わし、R₁₆は、-COO-、-OCO-、-CONH-、-NH-CO-O-、-NH-CO-、-SO₂NH-、-NH-SO₂-、-SO₂-又は-O-を表わし、

qは、0又は整数を表わし、

rは、0又は整数を表わす。)に対応する。

【0014】

式(2)で表わされる構造要素を有する化合物は、既知であり、例えば、米国特許第4,749,643号明細書に開示され、これらの化合物の典型例は、該文献の11-13欄、例3.1-3.7に記載されるものである。

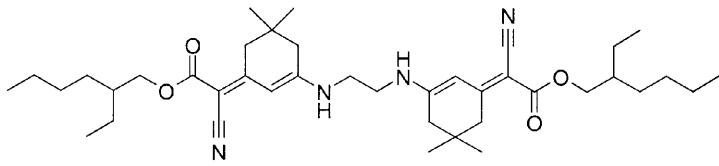
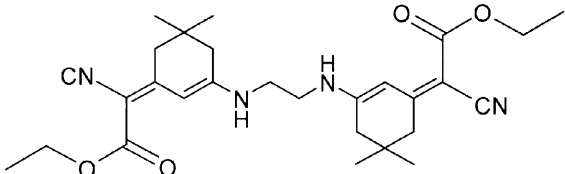
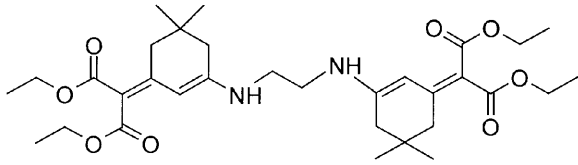
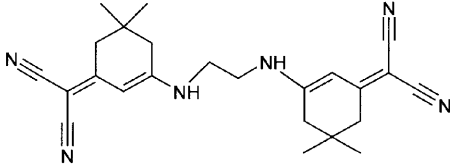
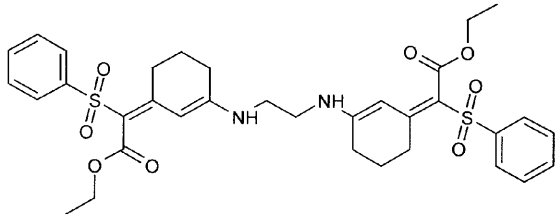
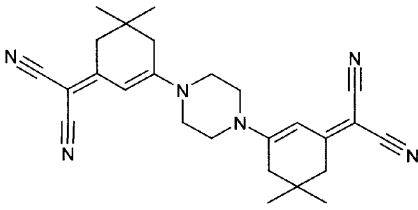
【0015】

式(3)で表わされる構造要素を有するこれらの化合物の典型例は、上記文献の11-13欄、例2.1-2.9に記載されるものである。

【0016】

本発明に従った用途のための更なる化合物を、以下の表MC1に列挙する。

【表 1】

表 MC1		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{\max} [nm]
MC01		366, 398 (EtOH)
MC02		366, 398 (EtOH)
MC03		383 (EtOH)
MC04		
MC05		
MC06		

10

20

30

40

【表 2】

表 MC1		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{\max} [nm]
MC07		406 (EtOH)
MC08		373 (EtOH)
MC09		
MC10		384 (EtOH)

10

20

30

【表 3】

表 MC1		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{\max} [nm]
MC11		10
MC12		20
MC13		30
MC14		40
MC15		
MC16		

【表 4】

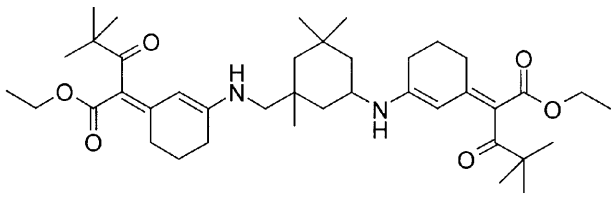
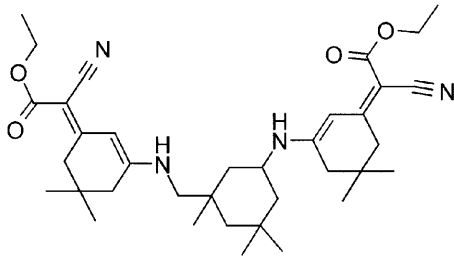
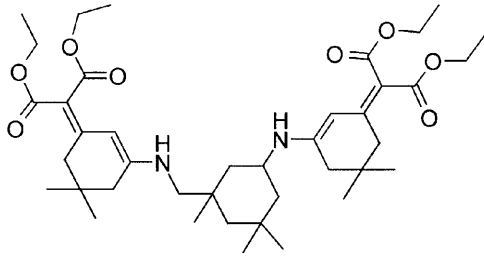
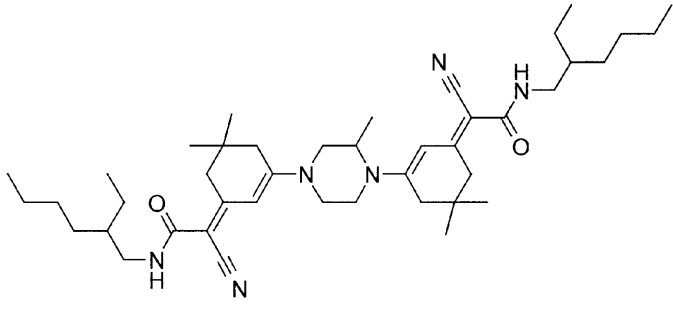
表 MC1		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{\max} [nm]
MC17		
MC18		388 (EtOH)
MC19		370 (EtOH)
MC21		
MC21		
MC22		

10

20

30

【表 5】

表 MC1		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{max} [nm]
MC23		
MC24		391 (EtOH)
MC25		378 (EtOH)
MC26		

10

20

30

【表 6】

表 MC1		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{max} [nm]
MC27		10
MC28		20
MC29		30
MC30		40

【表 7】

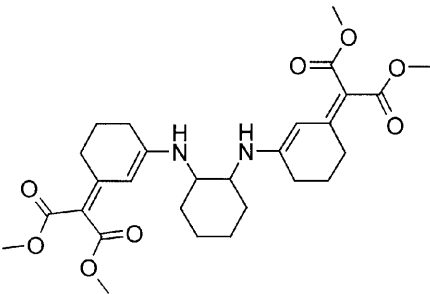
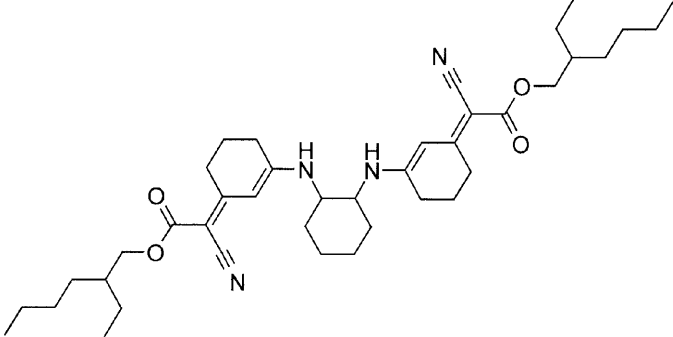
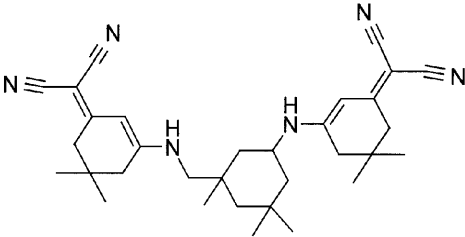
表 MC1		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{\max} [nm]
MC31		
MC32		
MC33		
MC34		357/388 (EtOH)

10

20

30

【表 8】

表 MC1		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{\max} [nm]
MC35		389 (EtOH)
MC36		401 (EtOH)
MC37		383 (アセトニトリル)

10

20

30

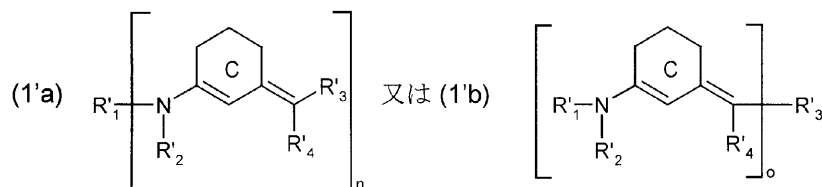
【0017】

本発明に従って使用される式(1a)及び(1b)で表わされるメロシアニン化合物は、場合によっては既知の化合物であるが、新規化合物も含む。

【0018】

新規化合物は、式

【化12】



40

(式中、

R'_2 は、水素原子、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基、未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で又は炭素原子数1ないし6のアルコキシ基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基、又はシアノ基を表わすか、又は R'_1 及び R'_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒に、 $-\text{O}-$ によって又は $-\text{NR}'_7-$ によって任意に中断される $-(\text{CH}_2)_m-$ 環を形成し、 R'_4 は、 $-\text{Q}'_1-\text{R}'_5$ を表わし、

50

Q'_{1} は、 $-COO-$ 、 $-CONH-$ 、 $-CO-$ 、 $-SO_2-$ 又は $-CONR'_6-$ を表わし、

R'_5 は、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基又は未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基を表わし、

R'_6 は、水素原子、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基、未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で又は炭素原子数1ないし6のアルコキシ基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基を表わし、

R'_7 は、水素原子、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基、未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で又は炭素原子数1ないし6のアルコキシ基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基を表わし、

シクロヘキセン基Cは、未置換であるか、又は1つ以上の炭素原子数1ないし5のアルキル基で置換され、

mは、3ないし7を表わし、

nは、2ないし4を表わし、

oは、2ないし4を表わし、

n = 2の場合、式(1'a)において、

R'_1 は、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を表わすか、又は、 R'_1 及び R'_2 は、同時に、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を形成し、

R'_3 は、シアノ基又は $-Q'_{1}-R'_5$ を表わすか、又は、 R'_3 及び R'_4 は、一緒になって、5ないし7員の単環式の炭素環を形成し、

o = 2の場合、式(1'b)において、

R'_3 は、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を表わし、

R'_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基、未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で又は炭素原子数1ないし6のアルコキシ基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基を表わすか、又は、 R'_1 及び R'_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によって又は $-NR'_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m-$ 環を形成し、

n = 3の場合、式(1'a)において、

R'_1 は、1つ以上の $-O-$ 又は $-NR'_7-$ 基によって任意に中断される3価のアルキル基を表わし、

R'_3 は、シアノ基又は $-Q'_{1}-R'_5$ を表わすか、又は R'_3 及び R'_4 は、一緒になって、5ないし7員の単環式の炭素環を形成し、

o = 3の場合、式(1'b)において、

R'_3 は、アルキリデン基、シクロアルキリデン基又はフェニリデン基を表わし、

R'_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基、未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で又は炭素原子数1ないし6のアルコキシ基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基を表わすか、又は、 R'_1 及び R'_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によって又は $-NR'_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m-$ 環を形成し、

n = 4の場合、式(1'a)において、

R'_1 は、4価のアルキル基を表わし、

R'_3 は、シアノ基又は $-Q'_{1}-R'_5$ を表わすか、又は、 R'_3 及び R'_4 は、一緒になって、5ないし7員の単環式の炭素環を形成し、

o = 4の場合、式(1'b)において、

R'_3 は、4価のアルキル基を表わし、

R'_1 は、水素原子、シアノ基、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基、未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で又は炭素原子数1ないし6のアルコキシ基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基

10

20

30

40

50

を表わすか、又は、 R'_1 及び R'_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によって又は $-NR'_7-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m-$ 環を形成する。)に対応する。

【0019】

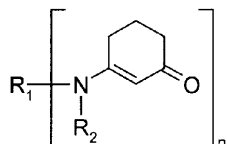
式(1a)及び(1b)で表わされる化合物の製造は、例えば、米国特許第4,749,643号明細書、13欄第66行ないし14欄第57行に記載されるような従来技術で既知の方法によって行われ得り、該文献を、ここに引用する。

【0020】

式(1a)で表わされる化合物は、ジヒドロキシレゾルシンと第一級又は第二級アミン化合物の縮合による、一般式(3)

10

【化13】



(式中、 R_1 、 R_2 及び n は、式(1a)で定義した通りである。)で表わされる1-アミノシクロヘキサノン-3から出発して製造され得る。ジメチル硫酸又はジエチル硫酸等の他の適当なアルキル化剤を用いてアルキル化した後、適当なメチレン活性化合物と反応させることにより、式(1a)で表わされる化合物は得られる。

20

【0021】

式(3)で表わされる出発化合物とジメチル硫酸等の適当なアルキル化剤のアルキル化反応は、適当な溶媒、好ましくは、ジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドン、ジメチルホルムアミド又はジメチルアセトアミド中で行われ得る。メタノール、エタノール、イソブタノール、第三ブタノール又はイソプロパノール等のプロトン性溶媒もまた適当である。反応はまた、ヘキサン、トルエン又はキシロール等の脂肪族又は芳香族溶媒中でも行われ得る。ジエチルエーテル及びテトラヒドロフラン等のエーテル化合物又はクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化溶媒並びにこれら溶媒の混合物もまた適当な溶媒である。

【0022】

反応は、 -80 ないし反応混合物の沸点の温度、好ましくは 60 ないし 120 で行われ得る。

30

【0023】

R_2 が、水素原子、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基、未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で又は炭素原子数1ないし6のアルコキシ基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基を表わすか、又は R_1 及び R_2 は、それらを結合する窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ によって又は $-NR_3-$ によって任意に中断される $-(CH_2)_m-$ 環を形成し、

R_3 が、水素原子、炭素原子数1ないし22のアルキル基、シクロ-炭素原子数3ないし8のアルキル基、又は、未置換の又は炭素原子数1ないし6のアルキル基で置換された炭素原子数6ないし20のアリール基を表わし、

40

m が、3ないし7を表わし、

n が、2ないし4を表わし、

シクロヘキセン基Cが、未置換であるか、又は1つ以上の炭素原子数1ないし5のアルキル基で置換され、

$n = 2$ の場合、

R_1 及び R_2 が、同時に、アルキレン基、シクロアルキレン基又はフェニレン基を形成し、

$n = 3$ の場合、

R_1 が、1つ以上の $-O-$ 又は $-NR_3-$ 基によって任意に中断される3価のアルキル基

50

を表わし、

$n = 4$ の場合、

R_1 が、1つ以上の - O - 又は - NR_3 - 基によって任意に中断される4価のアルキル基を表わす、式(3)で表わされる中間体は新規であり、本発明の更なる対象物である。

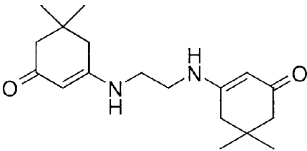
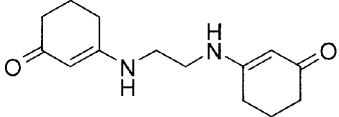
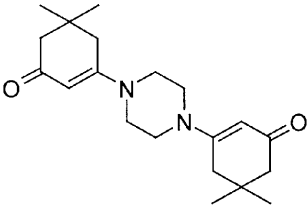
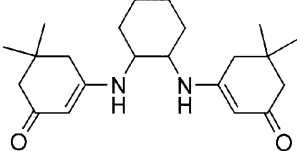
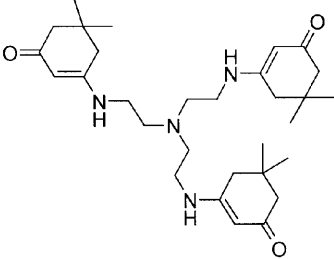
【0024】

それらは、紫外線吸収剤の製造のために有用な中間体であり、それら自身、紫外線からヒト及び動物の毛及び肌を保護するための紫外線B(UV-B)吸収剤に相当する。

【0025】

本発明に従った使用のための更なる化合物を以下の表MC1aに列挙する。

【表9】

表 MC1a		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{max} [nm]
MC01a		296 (EtOH)
MC04a		
MC06a		309 (EtOH)
MC08a		295 (7:1:1:1:1:1)
MC11a		

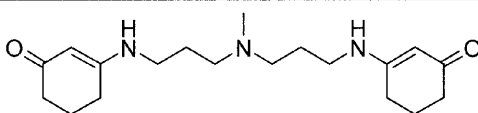
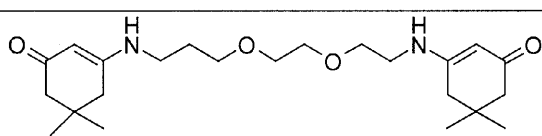
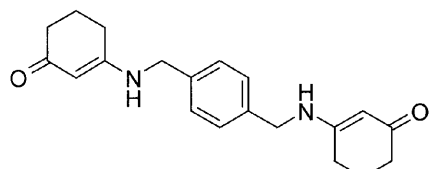
10

20

30

40

【表 10】

表 MC1a		
以下の式で表わされる化合物	構造	λ_{\max} [nm]
MC12a		
MC13a		
MC14a		

10

【0026】

20

本発明に従った式(1a)及び(1b)で表わされる化合物は、紫外線フィルターとして、即ち、紫外線の有害な影響から、紫外線に敏感な有機材料、特に、ヒト及び動物の肌及び毛を保護するために特に適当である。それ故、これらの化合物は、化粧品、医薬品及び獣医薬製品中の日焼け止め剤として適当である。これらの化合物は、溶解形態及び超微粉状態で使用され得る。

【0027】

本発明に従った紫外線吸収剤は、溶解状態(可溶性の有機フィルター、可溶化有機フィルター)で、又は超微粉状態(ナノスケールの有機フィルター、粒子状有機フィルター、紫外線吸収顔料)で使用され得る。

【0028】

30

アルキル置換基を有さないか又は低級アルキル置換基しか有さない式(1a)及び(1b)で表わされるメロシアン誘導体は、低い油溶性及び高い融点を特徴とする。それ故、それらは、超微粉状態における紫外線吸収剤として特に適当である。

【0029】

超微粉粒子の調製のために適当なあらゆる既知の方法としては、例えば、以下の方法が、超微粉紫外線吸収剤の製造のために使用され得る：湿潤微粉砕、湿潤混練、適当な溶媒からの噴霧乾燥、RESS法(超臨界流体急速膨張法(Rapid Expansion of Supercritical Solution))に従った膨張によって、超臨界流体を含む適当な溶媒からの再沈殿によって(GASR法=ガス抗溶媒再沈殿(Gas Anti-Solvent Recrystallisation)/PCA法=圧縮抗溶媒を用いた沈殿(Precipitation with Compressed Anti-Solvent))。

40

【0030】

このようにして得られた超微粉紫外線吸収剤は、通常、0.02ないし2 μ m、好ましくは0.03ないし1.5 μ m、より特には0.05ないし1.0 μ mの平均粒子サイズを有する。

【0031】

本発明に従った紫外線吸収剤はまた、粉末形態において乾燥物質として使用され得る。

【0032】

本発明に従った紫外線吸収剤はまた、化粧品のための特定の担体中、例えば、固体脂質

50

ナノ粒子 (S L N) 中又は紫外線吸収剤がカプセル化される不活性ゾル - ゲルマイクロカプセル (P h a r m a z i e , 2 0 0 1 (5 6) , 7 8 3 - 7 8 6 頁) 中にも使用され得る。

【 0 0 3 3 】

本発明に従った化粧品配合物又は医薬品組成物は、更に、1つ以上の更なる紫外線フィルターも含み得る。

【 0 0 3 4 】

化粧品又は医薬品は、慣用の方法を使用して、紫外線吸収剤と補助剤を物理的に混合することによって、例えば、個々の成分と一緒に単純に攪拌することによって、特に、既知の化粧品の紫外線吸収剤、例えば、オクチルメトキシシナメート、サリチル酸イソオクチルエステル等の溶解性を使用することによって製造され得る。紫外線吸収剤は、例えば、更なる処理なしに、又は超微粉状態で、もしくは粉末形態で使用され得る。

【 0 0 3 5 】

化粧品又は医薬品は、組成物の総質量に基づき、1つの紫外線吸収剤又は紫外線吸収剤混合物を 0 . 0 5 質量% ないし 4 0 質量% 含む。

【 0 0 3 6 】

好ましいのは、質量に基づき 1 : 9 9 ないし 9 9 : 1、好ましくは 1 : 9 5 ないし 9 5 : 1、最も好ましくは 1 0 : 9 0 ないし 9 0 : 1 0 の、本発明に従った式 (1 a) 及び (1 b) で表わされる紫外線吸収剤と所望の更なる光保護剤の混合比の使用である。特に興味深いのは、2 0 : 8 0 ないし 8 0 : 2 0、好ましくは 4 0 : 6 0 ないし 6 0 : 4 0、最も好ましくは約 5 0 : 5 0 の混合比である。このような混合物は、とりわけ、溶解性を改善するため又は紫外線吸収を増加させるために使用され得る。

【 0 0 3 7 】

更に、本発明に従った紫外線吸収剤と共に使用され得る適当な紫外線フィルター物質は、例えば、p - アミノ安息香酸誘導体、例えば、4 - ジメチルアミノ安息香酸 2 - エチルヘキシルエステル；サリチル酸誘導体、例えば、サリチル酸 2 - エチルヘキシルエステル；ベンゾフェノン誘導体、例えば、2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシベンゾフェノン及びその 5 - スルホン酸誘導体；ジベンゾイルメタン誘導体、例えば、1 - (4 - 第三ブチルフェニル) - 3 - (4 - メトキシフェニル) プロパン - 1 , 3 - ジオン；ジフェニルアクリレート、例えば、2 - エチルヘキシル 2 - シアノ - 3 , 3 - ジフェニルアクリレート及び 3 - (ベンゾフラニル) 2 - シアノアクリレート；3 - イミダゾリ - 4 - イルアクリル酸及びエステル；ベンゾフラン誘導体、特に、欧州特許出願公開第 5 8 2 1 8 9 号明細書、米国特許第 5 3 3 8 5 3 9 号明細書、米国特許第 5 5 1 8 7 1 3 号明細書及び欧州特許出願公開第 6 1 3 8 9 3 号明細書に記載される 2 - (p - アミノフェニル) ベンゾフラン誘導体；ポリマー状紫外線吸収剤、例えば、欧州特許出願公開第 7 0 9 0 8 0 号明細書に記載されるベンジリデンマロネート誘導体；桂皮酸誘導体、例えば、4 - メトキシ桂皮酸 2 - エチルヘキシルエステル及びイソアミルエステル又は米国特許第 5 6 0 1 8 1 1 号明細書及び国際公開第 9 7 / 0 0 8 5 1 号パンフレットに記載される桂皮酸誘導体；カンファー誘導体、例えば、3 - (4 ' - メチル) ベンジリデン - ボルナノ - 2 - オン、3 - ベンジリデンボルナノ - 2 - オン、N - [2 (及び 4) - 2 - オキシボルニ - 3 - イリデン - メチル) - ベンジル] アクリルアミドポリマー、3 - (4 ' - トリメチルアンモニウム) - ベンジリデン - ボルナノ - 2 - オンメチルスルフェート、3 , 3 ' - (1 , 4 - フェレンジメチン) - ビス (7 , 7 - ジメチル - 2 - オキソ - ビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプタン - 1 - メタンスルホン酸) 及び塩、3 - (4 ' - スルホ) ベンジリデン - ボルナノ - 2 - オン及び塩；カンファーベンズアルコニウムメトスルフェート；ヒドロキシフェニルトリアジン化合物、例えば、2 - (4 ' - メトキシフェニル) - 4 , 6 - ビス (2 ' - ヒドロキシ - 4 ' - n - オクチルオキシフェニル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン；2 , 4 - ビス { [4 - (3 - (2 - プロピルオキシ) - 2 - ヒドロキシ - プロピルオキシ) - 2 - ヒドロキシ] - フェニル } - 6 - (4 - メトキシフェニル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン；2 , 4 - ビス { [4 - (2 - エチルヘキシルオキシ) - 2 - ヒドロキシ] - フェニル } - 6 -

10

20

30

40

50

[4 - (2 - メトキシエチル - カルボキシル) - フェニルアミノ] - 1 , 3 , 5 - トリアジン ; 2 , 4 - ビス { [4 - (トリス (トリメチルシリルオキシ - シリルプロピルオキシ) - 2 - ヒドロキシ] - フェニル } - 6 - (4 - メトキシフェニル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン ; 2 , 4 - ビス { [4 - (2 ' ' - メチルプロベニルオキシ) - 2 - ヒドロキシ] - フェニル } - 6 - (4 - メトキシフェニル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン ; 2 , 4 - ビス { [4 - (1 ' , 1 ' , 1 ' , 3 ' , 5 ' , 5 ' , 5 ' - ヘプタメチルトリシリル - 2 ' ' - メチル - プロピルオキシ) - 2 - ヒドロキシ] - フェニル } - 6 - (4 - メトキシフェニル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン ; 2 , 4 - ビス { [4 - (3 - (2 - プロピルオキシ) - 2 - ヒドロキシ - プロピルオキシ) - 2 - ヒドロキシ] - フェニル } - 6 - [4 - エチルカルボキシ) - フェニルアミノ] - 1 , 3 , 5 - トリアジン ; ベンゾトリアゾール化合物、例えば、2 , 2 ' - メチレン - ビス (6 - (2 H - ベンゾトリアゾリ - 2 - イル) - 4 - (1 , 1 , 3 , 3 - テトラメチルブチル) - フェノール ; トリアニリン - s - トリアジン誘導体、例えば、2 , 4 , 6 - トリアニリン - (p - カルボ - 2 ' - エチル - 1 ' - オキシ) - 1 , 3 , 5 - トリアジン及び米国特許第 5 3 3 2 5 6 8 号明細書、欧州特許出願公開第 5 1 7 1 0 4 号明細書、欧州特許出願公開第 5 0 7 6 9 1 号明細書、国際公開第 9 3 / 1 7 0 0 0 2 号パンフレット及び欧州特許出願公開第 5 7 0 8 3 8 号明細書に開示される紫外線吸収剤 ; 2 - フェニルベンズイミダゾール - 5 - スルホン酸及びその塩 ; メチル o - アミノベンゾエート ; 被覆された又はされていない、二酸化チタン、酸化亜鉛、酸化鉄、雲母、MnO、Fe₂O₃、Ce₂O₃、Al₂O₃、ZrO₂等の天然の日焼け止め (表面コーティング : ポリメチルメタクリレート、メチコン (CAS 9 0 0 4 - 7 3 - 3 に記載されるメチル水素ポリシロキサン)、ジメチコン、イソプロピルチタントリイソステアレート (CAS 6 1 4 1 7 - 4 9 - 0 に記載される)、ステアリン酸マグネシウム (CAS 4 0 8 6 - 7 0 - 8 に記載される) 等の金属せっけん、炭素原子数 9 ないし 1 5 のフルオロアルコールホスフェート (CAS 7 4 4 9 9 - 4 4 - 8 ; 特開平 5 - 8 6 9 8 4 号公報、特開平 4 - 3 3 0 0 0 7 号公報に記載されるような) 等のペルフルオロアルコールホスフェート) である。

【 0 0 3 8 】

一次粒子サイズは、平均 1 5 n m - 3 5 n m であり、分散液中の粒子サイズは、1 0 0 n m - 3 0 0 n m の範囲内である。独国特許第 1 0 0 1 1 3 1 7 号明細書、欧州特許第 1 1 3 3 9 8 0 号明細書及び欧州特許第 1 0 4 6 3 9 1 号明細書に開示されるアミノヒドロキシ - ベンゾフェノン誘導体、欧州特許第 1 1 6 7 3 5 8 号明細書に開示されるフェニル - ベンズイミダゾール誘導体、' ' S u n s c r e e n s ' ' , N . J . ロウイ編 , N . A . シャース , マルセル デッカー インコーポレーテッド , ニューヨーク及びバーゼル又は C o s m e t i c s & T o i l e t r i e s (1 0 7) , 5 0 f f (1 9 9 2) に記載される紫外線吸収剤もまた、更なる紫外線保護物質として使用され得る。

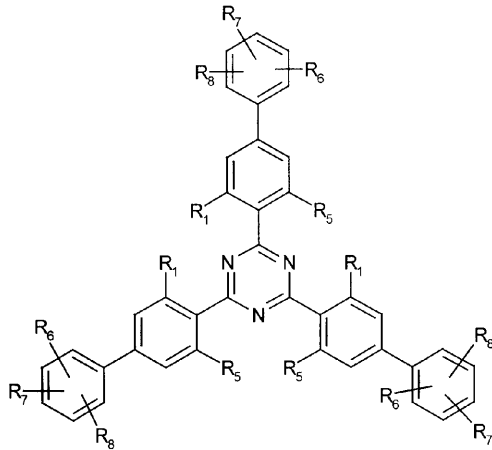
【 0 0 3 9 】

好ましくは、以下の紫外線フィルターの組合せが特に興味深い :

(t₁) 少なくとも 1 種の式 (1 a) 又は (1 b) で表わされるメロシアニン誘導体 ; 及び、

(t₂) 式 (t₂ 1)

【化 1 4】



10

(式中、

R_1 及び R_5 は、水素原子、炭素原子数1ないし18のアルキル基又は炭素原子数6ないし12のアリール基を表わし、

R_6 、 R_7 及び R_8 は、互いに独立して、水素原子、ヒドロキシ基、ハロゲン原子、炭素原子数1ないし18のアルキル基、炭素原子数1ないし18のアルコキシ基、炭素原子数6ないし12のアリール基、ピフェニル基、炭素原子数6ないし12のアリールオキシ基、炭素原子数1ないし18のアルキルチオ基、カルボキシ基、 $-COOM$ 、炭素原子数1ないし18のアルキルカルボキシル基、アミノカルボニル基、又は、モノ-又はジ-炭素原子数1ないし18のアルキルアミノ基、炭素原子数1ないし10のアシルアミノ基又は $-COOH$ を表わす。)で表わされるトリアジン化合物

20

を含む紫外線フィルターの組み合わせ(T)。

【0040】

最も好ましいのは、

(t_3)式(MC02)で表わされる化合物、及び、

(t_4)1,3,5-トリアジン,2,4,6-トリス[1,1'-ピフェニル]-4-イル-(9C1)

30

を含む紫外線フィルターの組み合わせである。

【0041】

式(1a)及び(1b)で表わされる化合物はまた、シワ取り知覚改善剤(anti-wrinkle perception modifier)としても使用され得る。

【0042】

化粧品又は医薬品は、例えば、クリーム、ゲル、ローション、アルコール性及び水性/アルコール性溶液、エマルジョン、ワックス/脂肪組成物、スティック製品、粉末又は軟膏であり得る。上記で言及した紫外線フィルターに加えて、化粧品又は医薬品は、以下に記載する更なる補助剤を含み得る。

【0043】

水-及びオイル-含有エマルジョン(例えば、W/O、O/W、O/W/O及びW/O/Wエマルジョン又はマイクロエマルジョン)として、製品は、例えば、組成物の総質量に基づき、0.1ないし30質量%、好ましくは0.1ないし15質量%、特に0.5ないし10質量%の1種以上の紫外線吸収剤、組成物の総質量に基づき、1ないし60質量%、特に5ないし50質量%、好ましくは10ないし35質量%の少なくとも1種のオイル成分、組成物の総質量に基づき、0ないし30質量%、特に1ないし30質量%、好ましくは4ないし20質量%の少なくとも1種の乳濁剤、組成物の総質量に基づき、10ないし90質量%、特に30ないし90質量%の水、及び0ないし88.9質量%、特に1ないし50質量%の更なる化粧品的に許容可能な補助剤を含む。

40

【0044】

50

本発明に従った化粧品又は医薬品組成物／化粧品又は医薬品はまた、脂肪アルコール、脂肪酸のエステル、グリセリルエステル及び誘導体を含む天然又は合成トリグリセリド、真珠箔ワックス、炭化水素油、シリコン又はシロキサン（有機置換ポリシロキサン）、フッ素化又は過フッ素化油、乳濁剤、過脂肪剤、界面活性剤、稠度調節剤／増粘剤、及びレオロジー調節剤、ポリマー、生体活性成分、脱臭活性成分、ふけ止め剤、抗酸化剤、ヒドロトロブ剤、防腐剤及び細菌抑制剤、香油、着色剤、ポリマー状ビーズもしくはSPF強化剤のような中空球等の更なる化合物を1種以上含み得る。

【0045】

化粧品又は医薬品

化粧品又は医薬品配合物は、様々な種類の化粧品に含まれる。例えば、特に以下の製品が考慮される：スキンケア製品、浴用製品、化粧品的な個人ケア用製品、フットケア製品、光保護製品、肌日焼け製品、脱色製品、脱臭剤、発汗抑制剤、汚れた肌を清浄及び保護するための製品、シェービング製品、芳香性調製品、化粧品毛髪用調製品。

【0046】

肌用化粧品として特に重要なものは、サンミルク、ローション、クリーム、オイル、サンブロッカー又は熱帯用日焼け止め剤、日焼け前製品又は日焼け後製品のような光保護製品、又は肌日焼け製品、例えば、セルフタンニングクリームである。特に興味深いものは、太陽光保護クリーム、太陽光保護ローション、太陽光保護ミルク及びスプレー形態の太陽光保護製品である。

【0047】

本発明に従った化粧品は、日光の損傷効果に対するヒトの肌の優れた保護を特徴とする。

【実施例】

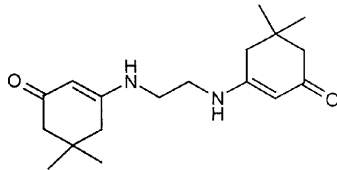
【0048】

製造実施例

実施例1：化合物MC20の製造：

1 a . 準備段階（化合物MC01a）の製造

【化15】

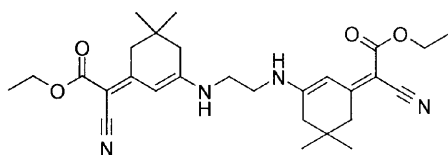


トルエン200 mL中エチレンジアミン6.04 g及びジメドン31.15 gの混合物を、水分離器を使用して還流条件下で3時間加熱した。混合物を冷却した後、生成物を濾去し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空下で80において乾燥させた。収量は、ほぼ定量的であった。

Mp . > 250

実施例1 b . 化合物MC2の製造

【化16】



化合物MC14a 7.61 gを、N-メチルピロリドン375 mL中に100において溶解し、ジメチル硫酸6.50 gを滴下添加し混合した。反応混合物を100において60分間攪拌した。80まで冷却した後、シアノ酢酸エチルエステル5.81 g、トリエチルアミン5.14 g及びイソプロパノール4.3 mLの混合物をゆっくりと滴下

10

20

30

40

50

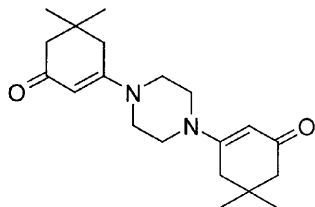
添加した。反応混合物を、100 の温度において90分間攪拌した。反応混合物の冷却後、粗生成物を濾去した。その後、シリカゲル上でトルエンとメタノールの混合物(6:4)を用いたカラムクロマトグラフィーによって、真空下で80 において乾燥された純粋な生成物1.28g(10% o. t h.)を得た。

λ_{\max} (アセトニトリル) = 389 nm

【0049】

実施例2a：化合物MC06aの製造

【化17】



10

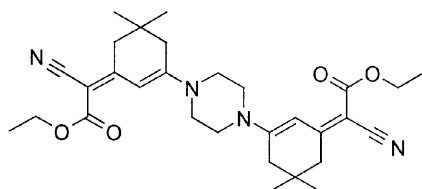
トルエン64mL中ジメドン9.06g及びピペラジン2.78gの混合物を、水分離器を使用して還流条件下で5時間加熱した。混合物を冷却した後、生成物を濾去し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空下で80 において乾燥させた。

収率：75%

実施例2b：化合物MC07の製造

20

【化18】



ジメチル硫酸3.34gを化合物MC06a(実施例2aで製造)4.33gへ滴下添加した。反応混合物を100 において60分間攪拌した。80 まで冷却した後、エチルシアノアセテート2.89g及びトリエチルアミン5.21gの混合物を滴下添加した。反応混合物を110 の温度において90分間攪拌した。冷却後、水300mLを添加し、粗生成物を濾去した。その後、シリカゲル上でトルエンとメタノールの混合物(6:4)を用いたカラムクロマトグラフィーによって、真空下で80 において乾燥された純粋な生成物4.5g(65% o. t h.)を得た。

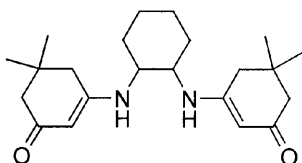
30

λ_{\max} (エタノール) = 406 nm

【0050】

実施例3a：化合物MC08aの製造

【化19】

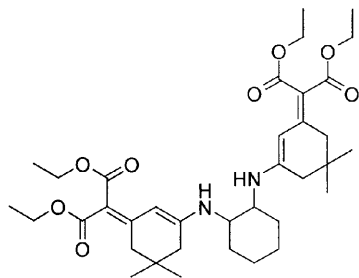


40

トルエン64mL中ジメドン9.06g及び1,2-ジアミノ-シクロヘキサン4.30gの混合物を、水分離器を使用して還流条件下で3時間加熱した。混合物を冷却した後、生成物を濾去し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空下で80 において乾燥させ、95%の収率で生成物を得た。

実施例3b：化合物MC10の製造

【化 2 0】

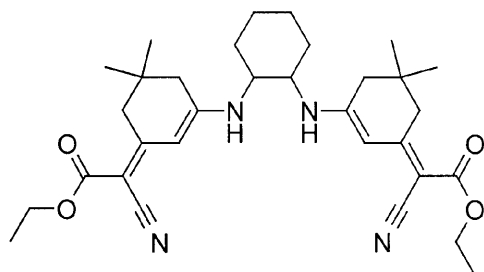


ジメチル硫酸 22.86 g を化合物 MC06a 16.99 g へ滴下添加した。反応混合物を 100 において 60 分間攪拌した。80 まで冷却した後、混合物をトリエチルアミン 13.50 g で処理し、10 分間攪拌した。その後、ジエチルマロネート 16.72 g 及び DBU 28.89 g の混合物をゆっくりと滴下添加した。反応混合物を 100 の温度において 90 分間攪拌した。冷却後、水 300 mL を添加し、粗生成物を濾去した。その後、シリカゲル上でトルエンとメタノールの混合物 (6 : 4) を用いたカラムクロマトグラフィーによって、真空下で 80 において乾燥された純粋な生成物 21.28 g (70% o. t h.) を得た。

$$\lambda_{\max} (\text{エタノール}) = 373 \text{ nm}$$

実施例 3 c : 化合物 MC09 の製造

【化 2 1】



MC09a 17.93 g (0.05 mol) をジメチル硫酸 30 mL と油浴中で 100 まで加熱し、該温度で 40 分間攪拌した。反応混合物を 60 まで冷却し、エタノール 50 mL 中のエチルシアノアセテート 11.93 g (0.103 mol) とナトリウムエタノレート 8.25 g (0.120 mol) の混合物を添加し、110 において 40 分間攪拌し、反応中、エタノールを、留去した。混合物を冷却し、化合物を H₂O で沈殿させ、吸引により抽出した。その後、トルエンとアセトンの 9 : 1 混合物を用いたカラムクロマトグラフィー (キーゼルゲル) によって、真空下で 80 において乾燥された純粋な生成物を得た。

収量 : 23.3 g (85% d. T h.)。

【0051】

実施例 4 : 超微粉紫外線吸収剤の製造

ボールミル中で、式 MC2 で表わされる化合物 100 部を、粉碎助剤としての珪酸ジルコニウムボール (直径 : 0.1 ないし 4 mm)、分散剤 (炭素原子数 8 ないし 16 のポリグルコシド 15 部) 及び水 (85 部) と共に粉碎し、 $d_{50} = 200 \text{ nm}$ の平均粒子サイズとした。この方法により、紫外線吸収剤の超微粉顔料分散液を得た。

【0052】

適用実施例

実施例 5 : 紫外線 A (UV - A) / 紫外線 B (UV - B) デイリーケア紫外線保護ローション

INCI 名

使用した質量 %
(w / w)

部分 A オレス - 3 ホスフェート

0.60

50

	セテアレス - 2 1	2 . 5 0	
	セテアレス - 2	1 . 0 0	
	セチルアルコール	0 . 8 0	
	ステアリルアルコール	1 . 5 0	
	トリベヘニン	0 . 8 0	
	イソヘキサデカン	8 . 0 0	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	5 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	グリセリン	2 . 0 0	10
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	3 . 0 0	
	E D T A ニナトリウム	0 . 1 0	
部分 C	水	2 0 . 0 0	
	ジアゾリジニルウレア (及び) ヨードプロピニルブチルカルバメート	0 . 1 5	
	プロピレングリコール	4 . 0 0	
部分 D	アクリル酸ナトリウムコポリマー (及び) 鉱物油 (及び)	1 . 5 0	
	P P G - 1 トリデセス - 6		
	シクロペンタシロキサン	4 . 5 0	
	P E G - 1 2 ジメチコン	2 . 0 0	20
	酢酸トコフェリル	0 . 4 5	
	水 (及び) クエン酸	適量	
部分 E	香水	適量	

【 0 0 5 3 】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を別々に 7 5 まで加熱した。連続的に攪拌しながら、部分 A を部分 B に注いだ。乳化直後に、部分 D のシクロペンタシロキサン及び P E G - 1 2 ジメチコンを混合物に配合した。その後、混合物を、ウルトラ トゥラックス (U l t r a T u r r a x) を使用して、1 1 0 0 0 r p m で 3 0 秒間均一化した。6 5 まで冷却した後、アクリル酸ナトリウムコポリマー (及び) 鉱物油 (及び) P P G - 1 トリデセス - 6 を配合した。部分 C を、< 5 0 の温度で添加した。3 5 の温度において、酢酸トコフェリルを配合し、その後、p H 値を、水及びクエン酸を使用して調整した。室温において、部分 E を添加した。

【 0 0 5 4 】

実施例 6：紫外線ディローション

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した</u>	
		<u>質量%</u>	
部分 A	セチルホスフェート	1 . 7 5	
	炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート	5 . 0 0	
	セテアリルアルコール / P E G - 2 0 ステアレート	2 . 0 0	40
	エトキシジグリコールオレエート	2 . 0 0	
	ステアリン酸	1 . 5 0	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	3 . 0 0	
	イソノニルイソノナノエート	2 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	キサンタンガム	0 . 3 5	
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	5 . 0 0	
	E D T A ニナトリウム	0 . 2 0	
	プロピレングリコール	2 . 0 0	50

	ジアゾリジニルウレア（及び）メチルパラベン（及び）	0.70	
	プロピルパラベン（及び）プロピレングリコール		
	グリセリン	1.50	
部分 C	シクロペンタシロキサン（及び）ジメチコノール	1.00	
	エトキシジグリコール	3.00	
	ジメチコン	2.00	
部分 D	トリエタノールアミン	適量	

【0055】

製造方法：

部分 A を、全ての成分を配合することによって調製し、その後、穏やかな速度下で攪拌し、75 まで加熱した。部分 B を調製し、75 まで加熱した。該温度において、連続的な攪拌速度下において、部分 B を部分 A に注いだ。その後、混合物を均一化した（30 秒、15000rpm）。55 の温度において、部分 C の成分を配合した。混合物を、穏やかな攪拌下で冷却し、その後、pH を確認し、トリエタノールアミンを用いて調整した。

【0056】

実施例 7：日焼け防止乳液

	<u>INCI 名</u>	<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	セテアリルアルコール（及び）ジセチルホスフェート （及び）セテス - 10 ホスフェート 炭素原子数 12 ないし 15 のアルキルベンゾエート ジカプリリルエーテル エトキシジグリコールオレエート ステアリン酸 エチルヘキシルメトキシシンナメート アクリル酸ナトリウムコポリマー（及び）大豆油（及び） PPG - 1 トリデセス - 6 スクアラン	4.75 2.00 3.00 2.00 1.00 3.00 0.30 3.50	20
部分 B	水	100 までの 適量	30
部分 C	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液 ジアゾリジニルウレア（及び）ヨードプロピニルブチル カルバメート プロピレングリコール 水	5.00 0.15 2.50 10.00	
部分 D	シクロペンタシロキサン、ジメチコノール エトキシジグリコール シクロペンタシロキサン（及び）ジメチコン / ビニル - ジメチコンクロスポリマー	2.00 5.00 2.00	40
部分 E	水酸化ナトリウム	0.10	

【0057】

製造方法：

部分 A を、全ての成分を配合することによって調製し、その後、穏やかな速度下で攪拌し、75 まで加熱した。部分 B を調製し、75 まで加熱した。該温度において、連続的な攪拌速度下において、部分 B を部分 A に注いだ。65 以下の温度で、部分 D の成分を個々に添加した。穏やかな攪拌下で 55 まで冷却した後、部分 C を添加した。その後、pH を確認し、水酸化ナトリウムを用いて調整した。混合物を、16000rpm で 30 秒間均一化した。

【0058】

実施例 8 : 常用 (Every Day) ローション

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	ステアリルホスフェート	5 . 0 0	
	トリコンタニル P V P	1 . 0 0	
	エトキシジグリコールオレエート	3 . 0 0	
	スクアラン	5 . 0 0	
	炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート	5 . 0 0	
	エチルヘキシルメトキシシナメート	3 . 0 0	
	グリセリルステアレート	2 . 0 0	10
	セチルアルコール	2 . 0 0	
部分 B	水	2 0 . 0 0	
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	3 . 0 0	
部分 C	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	0 . 5 0	
	グリセリン	2 . 5 0	
	ジアゾリジニルウレア (及び) ヨードプロピニルブチル カルバメート	0 . 1 5	
	ラウロイルグルタミン酸ナトリウム	0 . 7 0	20
	シクロペンタシロキサン (及び) ジメチコノール	1 . 5 0	
トリエタノールアミン	1 . 8 5		

【 0 0 5 9 】

製造方法 :

部分 A を、全ての成分を配合することによって調製し、その後、穏やかな速度下で攪拌し、75 まで加熱した。部分 C を調製し、75 まで加熱した。穏やかな攪拌下において、部分 C を部分 A に注いだ。乳化直後に、部分 B を添加し、その後、トリエタノールアミンの一部で中和した。混合物を、30 秒間均一化した。穏やかな攪拌下で冷却した後、シクロペンタシロキサン (及び) ジメチコノールを添加した。35 以下の温度において、pH を確認し、トリエタノールアミンを用いて調整した。

30

【 0 0 6 0 】

実施例 9 : 噴霧可能な日焼け止め乳液

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	セテアレス - 1 5 (及び) グリセリルステアレート	3 . 0 0	
	ステアリルアルコール	1 . 0 0	
	セチルリシノレエート	0 . 8 0	
	ジカプリリルエーテル	3 . 0 0	
	炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート	3 . 0 0	
	イソヘキサデカン	2 . 5 0	40
	ステアリルジメチコン	1 . 0 0	
	エチルヘキシルメトキシシナメート	4 . 0 0	
	セチルアルコール	0 . 8 0	
	ジ - 炭素原子数 1 2 ないし 1 3 のアルキルタートレート	3 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	0 . 4 5	
	P E G - 7 グリセリルココエート	2 . 5 0	
	グリセリン	2 . 0 0	
プロピレングリコール	3 . 0 0	50	

部分 C	ジアゾリジニルウレア (及び) ヨードプロピニルブチル カルバメート	0 . 1 5	
	水	2 0 . 0 0	
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	1 2 . 0 0	
	二酸化チタン (及び) シリカ (及び) ポリアクリル酸 ナトリウム	8 . 0 0	
部分 D	シクロペンタシロキサン (及び) ジメチコノール	0 . 8 5	
部分 E	水酸化ナトリウム (及び) 水	p H 6 . 5 ないし 7 . 0 0 までの適量	
部分 F	香水	適量	10

【 0 0 6 1 】

製造方法

部分 A 及び部分 B を 8 0 まで加熱した。攪拌下で、部分 A を部分 B にブレンドし、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 3 0 秒間均一化した。部分 C を 6 0 まで加熱し、乳濁液にゆっくりと添加した。4 0 まで冷却した後、部分 D を室温において添加し、部分 E を添加した。

【 0 0 6 2 】

実施例 1 0 : ディリーケアローションI N C I 名使用した
質量%

部分 A	ポリグリセリルメチルグルコースジステアレート	2 . 5 0	
	セテアリルアルコール	2 . 0 0	
	オクチルステアレート	3 . 0 0	
	カプリル / カプリントリグリセリド	4 . 0 0	
	イソヘキサデカン	4 . 0 0	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	2 . 7 0	
部分 B	水	6 4 . 8 0	
	グリセリン	5 . 0 0	
	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	0 . 5 0	
	ブチルパラベン (及び) エチルパラベン (及び)		30
	プロピルパラベン		
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	8 . 0 0	
部分 C	シクロメチコン (及び) ジメチコン	3 . 0 0	
部分 D	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	0 . 5 0	

【 0 0 6 3 】

製造方法:

部分 A 及び部分 B を 7 5 まで加熱した。連続攪拌下において、部分 A を部分 B に添加し、1 1 0 0 0 r p m で 1 分間均一化した。5 0 まで冷却した後、連続攪拌下において、部分 C を添加した。更に 3 0 まで冷却した後、部分 D を添加した。その後、p H を 6 . 0 0 ないし 6 . 5 0 に調整した。

【 0 0 6 4 】

実施例 1 1 : 紫外線保護用ディリーケアI N C I 名使用した
質量%

部分 A	グリセリルステアレート S E	3 . 0 0	
	グリセリルステアレート及び P E G - 1 0 0 ステアレート	3 . 5 0	
	セチルアルコール	1 . 5 0	
	ミリスチルミリステート	2 . 0 0	
	イソプロピルパルミテート	2 . 5 0	
	鉱物油	5 . 0 0	50

	オクチルジメチル P A B A	3 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	プロピレングリコール	7 . 5 0	
	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	1 . 0 0	
	ブチルパラベン (及び) エチルパラベン (及び)		
	プロピルパラベン		
部分 C	水	3 0 . 0 0	
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	1 0 . 0 0	
部分 D	アクリル酸ナトリウムコポリマー (及び)	2 . 0 0	10
	鉱物油 (及び) P P G - 1 トリデセス - 6		
部分 E	クエン酸	0 . 3 0	

【 0 0 6 5 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を、別々に 7 5 まで加熱した。部分 B を部分 A に添加した後、混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 1 分間均一化した。5 0 まで冷却した後、部分 C を添加した。その後、混合物を、1 6 0 0 0 r p m で 1 分間均一化した。 < 4 0 の温度において、部分 D を添加した。室温において、p H 値を、部分 E を用いて、6 . 0 0 ないし 6 . 5 0 に調整した。

【 0 0 6 6 】

実施例 1 2 : O / W 常用紫外線保護ローションI N C I 名使用した
質量 %

部分 A	グリセリルステアレート (及び)	5 . 0 0	
	P E G - 1 0 0 ステアレート		
	ステアリルアルコール	1 . 0 0	
	トリパルミチン	0 . 7 0	
	ジメチコン	2 . 0 0	
	炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート	5 . 0 0	
	イソプロピルパルミテート	5 . 0 0	30
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	3 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	ポリソルベート 6 0	0 . 5 0	
	グリセリン	3 . 0 0	
部分 C	水	1 0 . 0 0	
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	8 . 0 0	
部分 D	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	0 . 7 0	
	エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び)		
	プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン		40
	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	1 . 5 0	
部分 E	水 (及び) 水酸化ナトリウム	適量	
部分 F	香水	適量	

【 0 0 6 7 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を、別々に 7 5 まで加熱し、部分 C を 6 0 まで加熱した。その後、攪拌下で、部分 B を部分 A に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 3 0 秒間均一化し、部分 C を配合した。4 0 まで冷却した後、部分 D を添加した。室温において、p H 値を、水酸化ナトリウムを用いて、6 . 3 0 ないし 6 . 7 0 に調整し、部分 F を添加した。

【 0 0 6 8 】

実施例 1 3 : O / W 常用紫外線保護

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した</u> <u>質量%</u>	
部分 A	グリセリルステアレート (及び)	5 . 0 0	
	PEG - 1 0 0 ステアレート		
	ステアリルアルコール	1 . 0 0	
	トリパルミチン	0 . 7 0	
	ジメチコン	2 . 0 0	
	炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート	5 . 0 0	10
	イソプロピルパルミテート	5 . 0 0	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	3 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	ポリソルベート 6 0	0 . 5 0	
部分 C	グリセリン	3 . 0 0	
	水	1 0 . 0 0	
部分 D	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	8 . 0 0	
	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	0 . 7 0	
	エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び)		20
	プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン		
部分 E	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	1 . 5 0	
	水 (及び) 水酸化ナトリウム	適量	
部分 F	香水	適量	

【 0 0 6 9 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を、別々に 7 5 まで加熱し、部分 C を 6 0 まで加熱した。その後、攪拌下で、部分 B を部分 A に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 3 0 秒間均一化し、部分 C を配合した。4 0 まで冷却した後、部分 D を添加した。室温において、p H 値を、水酸化ナトリウムを用いて、6 . 3 0 ないし 6 . 7 0 に調整し、部分 F を添加した。

【 0 0 7 0 】

実施例 1 4 : 日焼け止めクリーム

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した</u> <u>質量%</u>	
部分 A	セテアリルアルコール (及び) ジセチルホスフェート	4 . 5 0	
	(及び) セテス - 1 0 ホスフェート		
	炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート	6 . 0 0	
	カプリル / カプリントリグリセリド	7 . 0 0	
	ペンタエリトリトールテトラステアレート	2 . 0 0	40
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	3 . 0 0	
	イソアミル p - メトキシシンナメート	2 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	グリセリン	2 . 0 0	
	プロピレングリコール	1 . 5 0	
部分 C	マグネシウムアルミニウムシリケート	1 . 2 0	
	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	0 . 5 0	
部分 D	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	1 2 . 0 0	
	フェニルトリメチコン	1 . 5 0	50

フェノキシエタノール（及び）メチルパラベン（及び）	0.70
ブチルパラベン（及び）エチルパラベン（及び）	
プロピルパラベン	
部分 E 水酸化ナトリウム	0.90

【0071】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を、別々に 75 まで加熱した。連続攪拌下で、部分 B を部分 A に添加し、その後、ウルトラ トゥラックスを使用して、11000rpm で 30 秒間均一化した。60 まで冷却した後、部分 C を添加した。40 において、部分 D を添加し、11000rpm で 15 秒間均一化した。室温において、pH 値を、部分 E を用いて調整した。

【0072】

実施例 15：紫外線 A / 紫外線 B ディリーケアローション（O/W 型）

	<u>INCI 名</u>	<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	グリセリルステアレート（及び）PEG-100 ステアレート	5.00	
	ステアリルアルコール	1.00	
	トリバルミチン	0.70	
	鉱油	15.00	20
部分 B	水	100 までの適量	
	ポリソルベート 60	0.50	
	グリセリン	3.00	
部分 C	水	10.00	
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	8.00	
部分 D	ステアレス-10 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	1.50	
	フェノキシエタノール（及び）メチルパラベン（及び）	0.70	
	エチルパラベン（及び）ブチルパラベン（及び）		
	プロピルパラベン（及び）イソブチルパラベン		30
部分 E	水（及び）水酸化ナトリウム	適量	
部分 F	香水	適量	

【0073】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を、別々に 75 まで加熱し、部分 C を 60 まで加熱した。攪拌下で、部分 B を部分 A に注いだ。11000rpm における 1 分間の均一化の後、部分 C を A / B の混合物へ添加した。40 まで冷却した後、部分 D を配合した。室温において、pH 値を、部分 E を用いて、6.3 ないし 7.0 に調整した。最後に、部分 F を添加した。

【0074】

実施例 16：紫外線 A / 紫外線 B ディリーケアローション（O/W 型）

	<u>INCI 名</u>	<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	オレス-3 ホスフェート	0.60	
	ステアレス-21	2.50	
	ステアレス-2	1.00	
	セチルアルコール	0.80	
	ステアリルアルコール	1.50	
	トリベヘニン	0.80	
	イソヘキサデカン	8.00	50

部分 B	水	100 まで の適量	
	グリセリン	2.00	
	E D T A 二ナトリウム	0.10	
部分 C	シクロペンタシロキサン	4.50	
	P E G - 12ジメチコン	2.00	
部分 D	アクリル酸ナトリウムコポリマー（及び）鉱油（及び）	1.50	
	P P G - 1トリデセス - 6		
部分 E	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	10.00	
部分 F	酢酸トコフェリル	0.45	10
	D M D M ヒダントイン（及び）	0.85	
	ヨードプロピニルブチルカルバメート（及び）水（及び）		
	ブチレングリコール		
部分 G	水及びクエン酸	適量	
	香水	適量	

【0075】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を別々に 75 まで加熱した。攪拌下で、部分 A を部分 B に注いだ。乳化直後に、部分 C を混合物に添加し、ウルトラ トゥラックスを使用して、11000 rpm で 30 秒間均一化した。65 まで冷却した後、アクリル酸ナトリウムコポリマー（及び）鉱油（及び）P P G - 1 トリデセス - 6 を、50 において、ゆっくりと紫外線吸収剤分散液に添加した。約 3.0 ないし 3.5 において、部分 F を配合した。p H を、部分 G を使用して、5.5 ないし 6.5 に調整した。

【0076】

実施例 17：紫外線 A / 紫外線 B 常用保護ローション（O / W）

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	グリセリルジラウレート	2.00	
	エチルヘキシルパルミテート	6.00	
	セチルアルコール	1.00	30
	グリセリルステアレート	2.00	
	ラウレス - 23	1.00	
	イソプロピルパルミテート	2.00	
	トリベヘニン	0.80	
	蜜ろう	1.50	
	ラノリン油	1.00	
部分 B	水	100 まで の適量	
	プロピレングリコール	4.00	
	水（及び）二酸化チタン（及び）アルミナ（及び）	4.00	40
	メタリン酸ナトリウム（及び）フェノキシエタノール（及び）		
	メチルパラベンナトリウム		
部分 C	ステアレス - 10 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	1.00	
部分 D	フェノキシエタノール（及び）メチルパラベン（及び）	1.00	
	エチルパラベン（及び）ブチルパラベン（及び）		
	プロピルパラベン（及び）イソブチルパラベン		
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	8.00	
部分 E	水（及び）水酸化ナトリウム	適量	

【0077】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を別々に 80 まで加熱した。攪拌下で、部分 A を部分 B に注ぎ、ウルトラ トゥラックスを使用して、11000 rpm で 30 秒間均一化した。60 まで冷却した後、部分 C を添加した。連続攪拌下で、40 において、部分 D をゆっくりと添加した。pH を、部分 E を使用して、6.50 ないし 7.00 に調整した。

【0078】

実施例 18：噴霧可能な日焼け止めローション

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した</u>	
		<u>質量%</u>	
部分 A	セチルリン酸カリウム	0.20	
	イソヘキサデカン	7.00	10
	V P / エイコセンコポリマー	1.50	
	ジ - 炭素原子数 12 ないし 13 のアルキルタートレート	6.00	
	エチルヘキシルトリアゾン	2.50	
	炭素原子数 12 ないし 15 のアルキルベンゾエート	4.50	
部分 B	水	100 まで	
		の適量	
	ソルベス - 30	2.00	
	ソルビタンステアレート (及び) スクロースココエート	4.00	
	二酸化チタン (及び) アルミナ (及び) シリカ (及び)	2.50	
	ポリアクリル酸ナトリウム		20
部分 C	水	30.00	
	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	12.00	
部分 D	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	0.70	
	エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び)		
	プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン		
部分 E	水 (及び) クエン酸	適量	

【0079】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を別々に 80 まで加熱し、部分 C を 50 まで加熱した。部分 B を部分 A に注ぎ、ウルトラ トゥラックスを使用して、11000 rpm で 1 分間均一化した。50 まで冷却した後、連続攪拌下で、部分 C を添加した。40 において、部分 D を配合し、11000 rpm で 10 秒間均一化した。pH を、部分 E を使用して調整した。

【0080】

実施例 19：常用紫外線保護ローション (O/W)

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した</u>	
		<u>質量%</u>	
部分 A	グリセリルステアレート (及び) P E G - 100 ステアレート	5.00	
	ステアリルアルコール	1.00	40
	トリパルミチン	0.70	
	ジメチコン	2.00	
	カプリル / カプリントリグリセリド	5.00	
	イソプロピルパルミテート	5.00	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	3.00	
部分 B	水	100 まで	
		の適量	
	ポリソルベート 60	0.50	
	グリセリン	3.00	
部分 C	水	10.00	50

	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	8 . 0 0	
部分 D	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び) エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び) プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン	0 . 7 0	
	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	1 . 5 0	
部分 E	水 (及び) 水酸化ナトリウム	適量	
部分 F	香水	適量	

【 0 0 8 1 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を別々に 7 5 まで加熱し、部分 C を 6 0 まで加熱した。その後、
10 攪拌下で、部分 B を部分 A に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1
1 0 0 0 r p m で 1 分間均一化し、部分 C を配合した。4 0 まで冷却した後、部分 D を
添加した。室温において、p H 値を、水酸化ナトリウムを使用して、6 . 3 0 ないし 6 .
7 0 に調整し、部分 F を添加した。

【 0 0 8 2 】

実施例 2 0 : 耐水性日焼け止め乳液

	<u>I N C I 名</u>	<u>使用した 質量 %</u>	
部分 A	ポリグリセリル - 1 0 ペンタステアレート (及び) ベヘニルアルコール (及び) ステアロイル乳酸ナトリウム V P / エイコセンコポリマー ステアリルアルコール スクアラン 炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート オクトクリレン 4 - メチルベンジリデンカンファー エチルヘキシルメトキシシンナメート	2 . 5 0 1 . 5 0 1 . 5 0 4 . 0 0 7 . 5 0 1 . 5 0 3 . 0 0 2 . 0 0	20
部分 B	水 グリセリン ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	1 0 0 まで 1 . 8 0 0 . 8 0	30 の適量
部分 C	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	9 . 0 0	
部分 D	V P / ヘキサデカンコポリマー シクロメチコン フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び) エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び) プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン	2 . 7 0 1 . 5 0 0 . 7 0	
部分 E	水 (及び) 酢酸トコフェリル (及び) カプリル / カプリントリグリセリド (及び) ポリソルベート 8 0 (及び) レシチン	3 . 5 0	40
部分 F	香水 水 (及び) 水酸化ナトリウム	適量 適量	

【 0 0 8 3 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を別々に 8 0 まで加熱した。連続攪拌下で、部分 A を部分 B に注い
だ。その後、混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 1 分間
均一化した。6 0 まで冷却した後、部分 C を配合した。4 0 において、部分 D を添加
し、混合物を、再度、短時間均一化した。3 5 において、部分 E を添加し、室温におい
て、香水を添加した。最後に、p H を、水酸化ナトリウムを用いて調整した。

【 0 0 8 4 】

実施例 2 1 : 紫外線 A / 紫外線 B 太陽光保護ローション (O / W 型)

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	セチルリン酸カリウム	2 . 0 0	
	トリコンタニル P V P	1 . 0 0	
	カプリル / カプリントリグリセリド	5 . 0 0	
	炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート	5 . 0 0	
	セテアリルイソノナノエート	5 . 0 0	
	グリセリルステアレート	3 . 0 0	
	セチルアルコール	1 . 0 0	10
	ジメチコン	0 . 1 0	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	5 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	グリセリン	3 . 0 0	
部分 C	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	0 . 5 0	
部分 D	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	8 . 0 0	
部分 E	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び) エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び) プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン	1 . 0 0	20
部分 F	水 (及び) 水酸化ナトリウム	p H 7 . 0 までの適量	
部分 G	香水	適量	

【 0 0 8 5 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を別々に 8 0 まで加熱した。穏やかな攪拌下で、部分 B を部分 A に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 1 分間均一化した。7 0 まで冷却した後、部分 C を、攪拌下で配合した。更に 5 0 まで冷却した後、部分 D を、非常にゆっくりと配合した。4 0 において、部分 E を添加した。室温において、p H を、部分 F を用いて、7 . 0 0 に調整し、部分 G を添加した。

30

【 0 0 8 6 】

実施例 2 2 : 紫外線 A / 紫外線 B 太陽光保護ローション (O / W 型)

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	セチルリン酸カリウム	2 . 0 0	
	トリコンタニル P V P	1 . 0 0	
	カプリル / カプリントリグリセリド	5 . 0 0	
	炭素原子数 1 2 ないし 1 5 のアルキルベンゾエート	5 . 0 0	
	セテアリルイソノナノエート	5 . 0 0	
	グリセリルステアレート	3 . 0 0	40
	セチルアルコール	1 . 0 0	
	ジメチコン	0 . 1 0	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	5 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	グリセリン	3 . 0 0	
部分 C	ステアレス - 1 0 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	0 . 5 0	
部分 D	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	2 0 . 0 0	
部分 E	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び) エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び)	1 . 0 0	50

プロピルパラベン（及び）イソブチルパラベン
 部分 F 水（及び）水酸化ナトリウム pH 7.0
 までの適量
 部分 G 香水 適量

【0087】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を別々に 80 まで加熱した。穏やかな攪拌下で、部分 B を部分 A に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、11000rpm で 1 分間均一化した。70 まで冷却した後、部分 C を、攪拌下で添加した。更に 50 まで冷却した後、部分 D を、非常にゆっくりと配合した。40 において、部分 E を添加した。室温において、pH を、部分 F を用いて、7.00 に調整し、部分 G を添加した。 10

【0088】

実施例 23：日焼け止めローションINCI 名使用した質量%

部分 A	セテアリルアルコール（及び）ジセチルホスフェート （及び）セテス - 10 ホスフェート 炭素原子数 12 ないし 15 のアルキルベンゾエート ジカプリリルエーテル エトキシジグリコールオレエート ステアリン酸 エチルヘキシルメトキシシンナメート アクリル酸ナトリウムコポリマー（及び）大豆油（及び） PPG - 1 トリデセス - 6 スクアラン VP / エイコセンコポリマー	4.00 2.00 3.00 2.00 1.00 3.00 0.30 3.50 2.00	20
部分 B	水	100 まで の適量	
部分 C	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液 ジアゾリジニルウレア（及び） ヨードプロピニルブチルカルバメート プロピレングリコール 水	5.00 0.15 2.50 10.00	30
部分 D	シクロペンタシロキサン（及び）ジメチコノール エトキシジグリコール シクロペンタシロキサン（及び） ジメチコン / ビニルジメチコンクロスポリマー	2.00 5.00 2.00	
部分 E	水（及び）水酸化ナトリウム	適量	
部分 F	香水	適量	

【0089】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を、別々に、75 まで加熱した。連続的な攪拌速度下で、部分 B を部分 A に注いだ。< 65 の温度において、部分 D の成分を個々に添加した。55 まで冷却した後、穏やかな攪拌下で、部分 C を添加した。< 35 の温度において、pH を確認し、水酸化ナトリウムを用いて調整し、ウルトラ トゥラックスを使用して、11000rpm で 30 秒間均一化した。室温において、部分 F を添加した。

【0090】

実施例 24：日焼け止めローション（W/O）INCI 名使用した質量%

50

部分 A	PEG - 7 水素化ヒマシ油	3 . 0 0	
	ポリグリセリル - 3 ジイソステアレート	4 . 0 0	
	マイクロクリスタリンワックス	1 . 0 0	
	ステアリン酸マグネシウム	1 . 5 0	
	プロピルパラベン	0 . 1 0	
	鉱油	1 5 . 0 0	
	オクチルドデカノール	8 . 0 0	
	エチルヘキシルトリアゾン	1 . 0 0	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	2 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	10
		の適量	
	水 (及び) クエン酸	0 . 0 5	
	メチルパラベン	0 . 1 5	
	硫酸マグネシウム	0 . 5 0	
部分 C	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	9 . 0 0	
	香水	適量	

【 0 0 9 1 】

製造方法 :

攪拌しながら、部分 A を 8 0 まで加熱した。部分 B を部分 A に添加し、ウルトラ ト
ウラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 1 分間均一化した。3 0 まで冷却した後、
部分 C を配合した。 20

【 0 0 9 2 】

実施例 2 5 : 肌保護日焼け止めローション (W / O)I N C I 名使用した
質量 %

部分 A	ポリグリセリル - 2 ジポリヒドロキシステアレート	3 . 0 0	
	グリセリルオレエート	3 . 0 0	
	セテアリルイソノナノエート	7 . 0 0	
	ヘキシルラウレート	6 . 0 0	
	ジカプリリルエーテル	6 . 0 0	30
	プロピルパラベン	0 . 1 0	
	ヘキシルデカノール	3 . 0 0	
	ステアリン酸マグネシウム	1 . 0 0	
	蜜ろう	1 . 0 0	
	エチルヘキシルメトキシシンナメート	4 . 0 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	メチルパラベン	0 . 1 5	
	硫酸マグネシウム	1 . 0 0	
部分 C	実施例 4 に記載した紫外線吸収剤分散液	6 . 0 0	40

【 0 0 9 3 】

製造方法 :

穏やかな攪拌下で、部分 A を個々に 8 0 まで加熱した。部分 B を部分 A に添加し、1
1 0 0 0 r p m で 1 分間均一化した。3 0 まで冷却した後、連続攪拌下で、部分 C を添
加した。

【 0 0 9 4 】

実施例 2 6 : 乳液 (O / W)I N C I 名使用した
質量 %

部分 A	式 (M C 1 0) で表わされる紫外線吸収剤	3 g	50
------	----------------------------	-----	----

	ゴマ油	10 g	
	グリセリルステアレート	4 g	
	ステアリン酸	1 g	
	セチルアルコール	0.5 g	
	ポリソルベート 20	0.2 g	
部分 B	プロピレングリコール	4 g	
	プロピルパラベン	0.05 g	
	メチルパラベン	0.15 g	
	トリエタノールアミン	0.1 g	
	カルボマー 934	0.1 g	10
	水	100 mL	
		までの量	

【0095】

乳液の製造

相 (A) :

まず、紫外線吸収剤をゴマ油に溶解させた。他の (A) 成分をそこへ添加し、組み合わせた。

相 (B) :

プロピルパラベン及びメチルパラベンをプロピレングリコール中に溶解させた。その後、水 60 mL を添加し、70 まで加熱した後、カルボマー 934 をそこへ乳化させた。 20

乳液 :

機械的なエネルギーを激しく適用し、(A) をゆっくりと (B) へ添加した。水を添加することによって、体積を 100 mL に調整した。

【0096】

実施例 27 : ディリーケアクリーム (O/W 型)

	<u>I N C I 名</u>	<u>使用した 質量%</u>	
部分 A	グリセリルステアレート (及び) セテアリルアルコール (及び) セチルパルミテート (及び) ココグリセリド	4.0	
	セテアレス - 12	4.0	30
	セテアリルアルコール	2.0	
	ジカプリリルエーテル	4.5	
	エチルヘキシルステアレート	4.0	
	ヘキシルラウレート	3.5	
	エチルヘキシルトリアゾン	1.0	
	ベンジリデンマロネートポリシロキサン	2.0	
	HDI / トリメチロールヘキシル - ラクトン架橋ポリマー (及び) シリカ	5.0	
	ステアリルジメチコン	1.0	
	ジメチコン	2.0	40
	セチルアルコール	0.8	
	式 (MC10) で表わされる化合物	2.0	
部分 B	水	100 まで	
		の適量	
	水 (及び) スクレログルカン (及び) フェノキシエタノール	2.0	
	グリセロール	2.0	
部分 C	ステアレス - 10 アリルエーテル / アクリレートコポリマー	0.45	
	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	0.7	
	エチルパラベン (及び) プチルパラベン (及び)		
	プロピルパラベン (及び) イソプチルパラベン		50

部分 D	水 (及び) 酢酸トコフェリル (及び) カプリル / カプリン トリグリセリド (及び) ポリソルベート 80 (及び) レシチン	4 . 0	
部分 E	水 (及び) 水酸化ナトリウム 香水	適量 適量	

【 0 0 9 7 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を別々に 80 まで加熱した。連続的に攪拌しながら、部分 A を部分 B に注いだ。その後、混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、11000 rpm で 20 秒間均一化した。混合物を 60 まで冷却し、部分 C を添加した。30 以下の温度において、部分 D を添加し、pH 値を、水酸化ナトリウムを使用して 6.5 ないし 7.0 に調整した。最後に、香水を添加した。

【 0 0 9 8 】

実施例 28 : 太陽光保護クリーム (O/W 型)

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した</u>	
		<u>質量%</u>	
部分 A	ポリグリセリル - 3 メチルグルコースジステアレート	2 . 0	
	デシロレエート	5 . 7	
	イソプロピルパルミテート	5 . 8	
	カプリル / カプリントリグリセリド	6 . 5	
	式 (MC20) で表わされる化合物	2 . 0	20
	エチルヘキシルメトキシシナメート	5 . 0	
	セチルアルコール	0 . 7	
部分 B	グリセロール	3 . 0	
	カルボマー	0 . 3	
	水	100 まで	
		の適量	
部分 C	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	0 . 5	
	エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び)		
	プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン		
部分 D	メチレンビス - ベンゾトリアゾリルテトラメチルブチル	8 . 0	30
	フェノール (及び) 水 (及び) デシルグルコシド (及び)		
	プロピレングリコール (及び) キサンタンガム		
	水	20 . 0	
部分 E	水 (及び) 水酸化ナトリウム	適量	
	香水	適量	

【 0 0 9 9 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を別々に 75 まで加熱した。攪拌しながら、部分 A を部分 B に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、11000 rpm で 15 秒間均一化した。混合物を 60 まで冷却し、部分 C 及び部分 D を配合した。混合物を、再度、短時間均一化し (5 秒間 / 11000 rpm)、穏やかに攪拌しながら更に冷却した。室温において、pH を、水酸化ナトリウム溶液を使用して 5.5 ないし 6.0 に調整した。最後に、香水を添加した。

【 0 1 0 0 】

実施例 29 : ディリーケア紫外線保護ローション

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した</u>	
		<u>質量%</u>	
部分 A	オレス - 3 ホスフェート	0 . 6	
	ステアレス - 2 1	2 . 5	
	ステアレス - 2	1 . 0	50

	セチルアルコール	0 . 8	
	ステアリルアルコール	1 . 5	
	トリベヘニン	0 . 8	
	イソヘキサデカン	8 . 0	
	式 (M C 1 0) 又は (M C 3 7) で表わされる化合物	5 . 0	
部分 B	水	1 0 0 まで	
		の適量	
	グリセロール	2 . 0	
	メチレンビス - ベンゾトリアゾリルテトラメチルブチル	3 . 0	
	フェノール (及び) 水 (及び) デシルグルコシド (及び)		10
	プロピレングリコール (及び) キサンタンガム		
	E D T A ニナトリウム	0 . 1	
部分 C	水	2 0 . 0	
	ジアゾリジニルウレア (及び) ヨードプロピニルブチル	0 . 1 5	
	カルバメート		
	プロピレングリコール	4 . 0	
部分 D	アクリル酸ナトリウムコポリマー (及び) 液体パラフィン	1 . 5	
	(及び) P P G - 1 トリデセス - 6		
	シクロペンタシロキサン	4 . 5	
	P E G - 1 2 ジメチコン	2 . 0	20
	酢酸トコフェリル	0 . 4 5	
	水及びクエン酸	適量	
部分 E	香水	適量	

【 0 1 0 1 】

製造方法：

部分 A 及び部分 B を別々に 7 5 まで加熱した。連続的に攪拌しながら、部分 A を部分 B に注いだ。乳化直後に、混合物中に、部分 D からの S F 1 2 0 2 及び S F 1 2 8 8 を配合した。その後、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 3 0 秒間均一化した。6 5 まで冷却した後、サルケア S C 9 1 (登録商標：S A L C A R E) を配合した。5 0 以下の温度において、部分 C を添加した。3 5 以下において、酢酸ピタミン E を配合し、その後、p H 値を、クエン酸を使用して調整した。室温において、部分 E を添加した。

【 0 1 0 2 】

実施例 3 0 : 太陽光保護クリーム、O / W 型

I N C I 名

		使用した	
		質量%	
部分 A	ポリグリセリル - 3 メチルグルコースジステアレート	2 . 0	
	デシロレエート	5 . 7	
	イソプロピルパルミテート	5 . 8	
	カプリル / カプリントリグリセリド	6 . 5	40
	式 (M C 1 4) 又は (M C 3 7) で表わされる化合物	2 . 0	
	エチルヘキシルメトキシシナメート	5 . 0	
	セチルアルコール	0 . 7	
部分 B	グリセロール	3 . 0	
	カルボマー	0 . 3	
	水	1 0 0 まで	
		の適量	
部分 C	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	0 . 5	
	エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び)		
	プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン		50

部分 D	メチレンビス - ベンゾトリアゾリルテトラメチルブチル フェノール (及び) 水 (及び) デシルグルコシド (及び) プロピレングリコール (及び) キサンタンガム 水	8 . 0 2 0 . 0
部分 E	水 (及び) 水酸化ナトリウム 香水	適量 適量

【 0 1 0 3 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を別々に 7 5 まで加熱した。攪拌しながら、部分 A を部分 B に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 1 5 秒間均一化した。混合物を 6 0 まで冷却し、部分 C 及び部分 D を配合した。混合物を、再度、短時間均一化した (5 秒間 / 1 1 0 0 0 r p m) 。穏やかに攪拌しながら更に冷却した後、p H を、室温において、水酸化ナトリウムを使用して調整した。p H 5 . 5 0 ないし 6 . 0 0 の溶液を得た。最後に、香水を添加した。

【 0 1 0 4 】

実施例 3 1 : 太陽光保護クリーム (O / W 型)

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した 質量 %</u>	
部分 A	ポリグリセリル - 3 メチルグルコースジステアレート デシルオレエート イソプロピルパルミテート カプリル / カプリントリグリセリド 式 (M C 1 0) 又は (M C 3 7) で表わされる化合物 (5 0 %) とユビヌル A プラス (C A S 登録番号 : 3 0 2 7 7 6 - 6 8 - 7) (5 0 %) の混合物 エチルヘキシルメトキシシナメート セチルアルコール	2 . 0 5 . 7 5 . 8 6 . 5 2 . 0 5 . 0 0 . 7	20
部分 B	グリセロール カルボマー 水	3 . 0 0 . 3 1 0 0 まで の適量	30
部分 C	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び) エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び) プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン	0 . 5	
部分 D	メチレンビス - ベンゾトリアゾリルテトラメチルブチル フェノール (及び) 水 (及び) デシルグルコシド (及び) プロピレングリコール (及び) キサンタンガム 水	8 . 0 2 0 . 0	
部分 E	水 (及び) 水酸化ナトリウム 香水	適量 適量	40

【 0 1 0 5 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を別々に 7 5 まで加熱した。攪拌しながら、部分 A を部分 B に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 1 5 秒間均一化した。6 0 まで冷却した後、部分 C 及び部分 D を配合した。混合物を、再度、短時間均一化した (5 秒間 / 1 1 0 0 0 r p m) 。穏やかに攪拌しながら更に冷却した後、p H を、室温において、水酸化ナトリウム溶液を使用して、5 . 5 0 ないし 6 . 0 0 に調整した。最後に、香水を添加した。

【 0 1 0 6 】

実施例 3 2 : 太陽光保護クリーム (O / W 型)

<u>I N C I 名</u>		<u>使用した</u> <u>質量%</u>	
部分 A	ポリグリセリル - 3 メチルグルコースジステアレート	2 . 0	
	デシルオレエート	5 . 7	
	イソプロピルパルミテート	5 . 8	
	カプリル / カプリントリグリセリド	6 . 5	
	式 (M C 1 0) 又は (M C 3 7) で表わされる化合物 (5 0 %) とベンジリデンカンファー (C A S 登録番号 : 3 6 8 6 1 - 4 7 - 9) (5 0 %) の混合物	2 . 0	
	エチルヘキシルメトキシシナメート	5 . 0	10
	セチルアルコール	0 . 7	
部分 B	グリセロール	3 . 0	
	カルボマー	0 . 3	
	水	1 0 0 まで の適量	
部分 C	フェノキシエタノール (及び) メチルパラベン (及び)	0 . 5	
	エチルパラベン (及び) ブチルパラベン (及び)		
	プロピルパラベン (及び) イソブチルパラベン		
部分 D	メチレンビス - ベンゾトリアゾリルテトラメチルブチル フェノール (及び) 水 (及び) デシルグルコシド (及び)	8 . 0	20
	プロピレングリコール (及び) キサンタンガム		
	水	2 0 . 0	
	部分 E	水 (及び) 水酸化ナトリウム 香水	適量 適量

【 0 1 0 7 】

製造方法 :

部分 A 及び部分 B を別々に 7 5 まで加熱した。攪拌しながら、部分 A を部分 B に注いだ。混合物を、ウルトラ トゥラックスを使用して、1 1 0 0 0 r p m で 1 5 秒間均一化した。6 0 まで冷却した後、部分 C 及び部分 D を配合した。混合物を、再度、短時間均一化した (5 秒間 / 1 1 0 0 0 r p m) 。穏やかに攪拌しながら更に冷却した後、p H を、室温において、水酸化ナトリウムを使用して調整した。p H 5 . 5 0 ないし 6 . 0 0 の溶液を得た。最後に、香水を添加した。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No PCT/EP2004/053327
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 A61K7/42 C07C255/31 C07C229/46 C07C317/48 C07C225/20 C07D295/155 C07D295/116 C07D319/06 C07D295/185		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 A61K C07C C07D C08F C08G		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 2004/006878 A (CIBA SC HOLDING AG ; EHLIS THOMAS (DE); EICHIN KAI (DE); WAGNER BARBAR) 22 January 2004 (2004-01-22) claims 1,10,19 page 21 page 25, paragraph 3 compounds MC184-186	1, 6, 9, 11, 15
X	KONDRAT'EVA, G.V. ET AL.: BULL. ACAD. SCI. USSR DIV. CHEM. SCI., 1967, pages 609-614, XP001166946 * page 612, table I, compound XXI * ----- -/--	12
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents : *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the International filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. *&* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the International search report
1 March 2005		30/03/2005
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Krische, D

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
CT/EP2004/053327

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CHEMCATS ACS; 23 April 2003 (2003-04-23), XP002319526 retrieved from STN Database accession no. 2001:2069196/AN abstract	12
X	DATABASE REGISTRY ACS; 26 March 2003 (2003-03-26), XP002319527 retrieved from STN Database accession no. 500707-74-4/RN abstract	12
X	HAYS S J: "SYNTHESIS OF CARBON-14 LABELED CI-926 AND CI-927, NEW ANTIHYPERTENSIVES" JOURNAL OF LABELLED COMPOUNDS AND RADIOPHARMACEUTICALS, SUSSEX, GB, vol. 24, no. 4, 1986, pages 351-360, XP001154221 ISSN: 0362-4803 page 359	12
X	BERTOLASI, V. ET AL.: ACTA CRYSTALLOGRAPHICA SECTION B, vol. 54, no. 1, 1998, pages 50-65, XP001166947 * page 51, compound (9) *	12
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 62, no. 9, 1965, Columbus, Ohio, US; abstract no.: 10348b, XP002282571 abstract & NEILANDS, O.: LATVIJAS PSR ZINATNU AKAD. VESTIS, KIM. SER., no. 5, 1964, pages 577-588,	12
X	MCDUGALL, R.H. ET AL.: J. CHEM. SOC. C, 1969, pages 2044-2051, XP001189527 * pages 2048 and 2051, compound XIX *	12
X	DATABASE REGISTRY ACS; 28 August 2001 (2001-08-28), XP002319528 retrieved from STN Database accession no. 353268-63-0/RN abstract	12

-/--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/053327

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE REGISTRY ACS; 28 March 2003 (2003-03-28), XP002319529 retrieved from STN Database accession no. 500884-77-5/RN abstract	12
X	DATABASE REGISTRY ACS; 26 February 2002 (2002-02-26), XP002319530 retrieved from STN Database accession no. 395660-48-7/RN abstract	12
X	DATABASE REGISTRY ACS; 25 February 2002 (2002-02-25), XP002319531 retrieved from STN Database accession no. 395073-64-0/RN abstract	12
X	DATABASE REGISTRY ACS; 28 August 2001 (2001-08-28), XP002319532 retrieved from STN Database accession no. 353268-66-3/RN abstract	12
X	SUCROW, W. ET AL.: ZEITSCHRIFT FUER NATURFORSCHUNG TEIL B, vol. 36, no. 3, 1981, pages 339-344, XP001166948 * pages 339, 342, compounds 3a-c *	12
X	DE 24 02 695 A (HOECHST AG) 11 December 1975 (1975-12-11) examples 5,6; table 1	12
X	DATABASE REGISTRY ACS; 22 January 2002 (2002-01-22), XP002319533 retrieved from STN Database accession no. 385381-05-5/RN abstract	12
X	IYER, BALKRISHNA: J. INDIAN INST. SCI., SECT. A, vol. 21, 1938, pages 65-75, XP001166949 page 70, compound XXI	12

-/-

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/053327

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE REGISTRY ACS; 16 November 1984 (1984-11-16), XP002319534 retrieved from STN Database accession no. 20679-36-1/RN abstract -----	12
A	DE 35 31 383 A (AGFA GEVAERT AG) 5 March 1987 (1987-03-05) claims 8,9; tables 1-3 page 7, line 38 - page 11, line 26 -----	1-15
A	& US 4 749 643 A 7 June 1988 (1988-06-07) cited in the application -----	
A	DATABASE CHEMCATS ACS; 2001, XP002282574 retrieved from STN Database accession no. 2001:944037/AN abstract -----	1-4,11
A	EP 0 852 137 A (BASF AG) 8 July 1998 (1998-07-08) abstract -----	1
A	US 4 891 212 A (GOSCINIAK DONALD J ET AL) 2 January 1990 (1990-01-02) claim 1 column 2, line 62 - column 3, line 5 -----	1
A	WO 00/24369 A (KROL MARIANNA ; SARHAN FATHEY (CA); HUNER NORMAN (CA); IVANOV ALEXANDE) 4 May 2000 (2000-05-04) claims 1,8,9; figure 4 -----	12,13

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/053327

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2004006878	A	22-01-2004	WO 2004006878 A1	22-01-2004
DE 2402695	A	11-12-1975	DE 2402695 A1	11-12-1975
			BE 824612 A1	22-07-1975
			BR 7500406 A	04-11-1975
			CA 1064054 A1	09-10-1979
			CH 609315 A5	28-02-1979
			FR 2258370 A1	18-08-1975
			GB 1481573 A	03-08-1977
			IT 1028482 B	30-01-1979
			JP 1252653 C	26-02-1985
			JP 50101331 A	11-08-1975
			JP 59027329 B	05-07-1984
			NL 7500523 A	23-07-1975
			US 4212823 A	15-07-1980
			ZA 7500189 A	28-01-1976
DE 3531383	A	05-03-1987	DE 3531383 A1	05-03-1987
			DE 3678362 D1	02-05-1991
			EP 0213569 A2	11-03-1987
			JP 2566928 B2	25-12-1996
			JP 62056957 A	12-03-1987
			US 4749643 A	07-06-1988
US 4749643	A	07-06-1988	DE 3531383 A1	05-03-1987
			DE 3678362 D1	02-05-1991
			EP 0213569 A2	11-03-1987
			JP 2566928 B2	25-12-1996
			JP 62056957 A	12-03-1987
EP 0852137	A	08-07-1998	DE 19649381 A1	04-06-1998
			DE 19712033 A1	24-09-1998
			AU 745291 B2	21-03-2002
			AU 4540697 A	04-06-1998
			BR 9706035 A	18-05-1999
			CN 1183953 A	10-06-1998
			EP 0852137 A2	08-07-1998
			JP 10158140 A	16-06-1998
			US 6037487 A	14-03-2000
			US 6407247 B1	18-06-2002
			US 5945091 A	31-08-1999
US 4891212	A	02-01-1990	BR 8906841 A	18-09-1990
			CA 2006547 A1	28-06-1990
			EP 0376565 A2	04-07-1990
			JP 2229877 A	12-09-1990
			MX 163820 B	23-06-1992
			ZA 8908923 A	28-11-1990
WO 0024369	A	04-05-2000	CA 2251457 A1	23-04-2000
			AU 777305 B2	07-10-2004
			AU 6322199 A	15-05-2000
			CA 2350056 A1	04-05-2000
			WO 0024369 A1	04-05-2000
			CN 1346260 A	24-04-2002
			EP 1123083 A1	16-08-2001
			US 6787147 B1	07-09-2004

フロントページの続き

(51) Int. Cl. F I テーマコード (参考)
 C 0 7 C 255/28 (2006.01) C 0 7 C 255/28

(81) 指定国 AP (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(74) 代理人 100104385
 弁理士 加藤 勉

(74) 代理人 100109690
 弁理士 小野塚 薫

(74) 代理人 100131266
 弁理士 高 昌宏

(74) 代理人 100093414
 弁理士 村越 祐輔

(72) 発明者 ワグナー, バルバラ
 ドイツ国, 7 9 5 3 9 ローラッハ, イム ボゲルサング 1 0

(72) 発明者 エリス, トーマス
 ドイツ国, 7 9 1 0 0 フライブルグ, ハリエット - ストラウブ - ストラーセ 2 3

(72) 発明者 ミューラー, ステファン
 ドイツ国, 7 9 6 1 8 レインフェルデン, バリーストラーセ 1

F ターム (参考) 4C083 AA082 AA122 AB032 AB172 AB222 AB242 AB282 AB362 AB382 AC012
 AC022 AC072 AC092 AC122 AC172 AC182 AC242 AC302 AC342 AC352
 AC372 AC392 AC402 AC422 AC432 AC442 AC482 AC492 AC532 AC542
 AC551 AC552 AC662 AC851 AC852 AC902 AD072 AD092 AD152 AD162
 AD172 AD202 AD212 AD222 AD352 AD532 AD572 AD662 CC05 CC19
 DD23 DD27 DD31 DD32 DD33 EE07 EE09 EE17 EE29 FF01
 FF05
 4H006 AA03 AB12 AB20