

(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2010-539073

(P2010-539073A)

(43) 公表日 平成22年12月16日(2010.12.16)

| | | |
|-------------------------------------|---------------|-------------|
| (51) Int.Cl. | F I | テーマコード (参考) |
| A O 1 N 31/02 (2006.01) | A O 1 N 31/02 | 4 C O 5 8 |
| A 6 1 K 8/86 (2006.01) | A 6 1 K 8/86 | 4 C O 8 3 |
| A 6 1 Q 19/00 (2006.01) | A 6 1 Q 19/00 | 4 H O O 3 |
| A 6 1 Q 5/00 (2006.01) | A 6 1 Q 5/00 | 4 H O 1 1 |
| A 6 1 L 2/18 (2006.01) | A 6 1 L 2/18 | |
| 審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 47 頁) 最終頁に続く | | |

| | | | |
|---------------|------------------------------|----------|-------------------------------|
| (21) 出願番号 | 特願2010-523486 (P2010-523486) | (71) 出願人 | 508020155 |
| (86) (22) 出願日 | 平成20年9月1日 (2008.9.1) | | ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ |
| (85) 翻訳文提出日 | 平成22年4月27日 (2010.4.27) | | ア |
| (86) 国際出願番号 | PCT/EP2008/061462 | | B A S F S E |
| (87) 国際公開番号 | W02009/033970 | | ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし) |
| (87) 国際公開日 | 平成21年3月19日 (2009.3.19) | | D-67056 Ludwigshafen, Germany |
| (31) 優先権主張番号 | 60/993, 259 | (74) 代理人 | 100091096 |
| (32) 優先日 | 平成19年9月11日 (2007.9.11) | | 弁理士 平木 祐輔 |
| (33) 優先権主張国 | 米国 (US) | (74) 代理人 | 100096183 |
| (31) 優先権主張番号 | 61/062, 633 | | 弁理士 石井 貞次 |
| (32) 優先日 | 平成20年1月28日 (2008.1.28) | (74) 代理人 | 100118773 |
| (33) 優先権主張国 | 米国 (US) | | 弁理士 藤田 節 |
| | | 最終頁に続く | |

(54) 【発明の名称】 ポリグリセロール系抗微生物剤及び組成物

(57) 【要約】

ポリグリセロール系抗微生物剤及び組成物が提供される。この薬剤は、菌、グラム陽性菌及びグラム陰性菌を含めた様々な病原菌に対して効果があるだけでなく、一つにはその特質がポリマーであることにより、ヒトへの有害性が低いことが期待される。このポリグリセロール系抗微生物剤及び組成物の用途としては、化粧品、ヘアケア用製造品、布地防護剤及び植物体防護剤のような、ヒトとの接触、植物体との接触を伴うような用途、並びに、建築用プラスチック、建築用コーティング、建築用木材、建築用紙及び他の建築用材料のようなヒトとの接触がずっと少ない用途における用途が挙げられる。

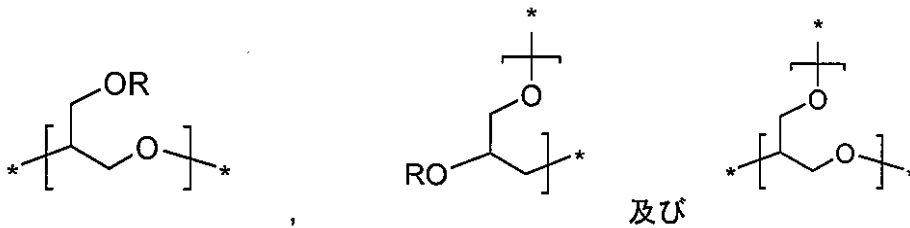
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ポリマー又はコポリマーの骨格中に

【化 1】



10

[式中、R は、独立して、H、又は置換もしくは非置換のアルキル、アルケニル、アルカノイル、アルケノイル、アリールもしくはヘテロ環である]

から選択されるグリセロール誘導部分構造を含む分岐ポリグリセロール系抗微生物ポリマー又はコポリマーを含んでいる、

ホームケア又はパーソナルケア処方品、植物体防護用処方品、天然又は合成高分子、建築用コーティング又は他の建築用材料中に組み込まれる抗微生物性組成物。

【請求項 2】

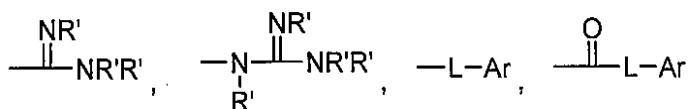
R が、

H ;

20

a) $C_{1 \sim 24}$ アルキル、 $C_{3 \sim 24}$ アルケニル、 $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニル又は $C_{3 \sim 24}$ アルケニルカルボニル (これらは分断されていないか又は 1 もしくは複数の -O-、-N(R')-、-CON(R')-、-SO- 又は -SO₂- によって 1 もしくは複数回分断され、置換されていないか又は 1 もしくは複数の $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、-OR'、-COOR'、-COOM、-SO₃M、-SO₃H、ホスホン酸、ハロゲン、-CONR'R'、-NR'R'、ホスホン酸塩、アンモニウム塩、式

【化 2】



30

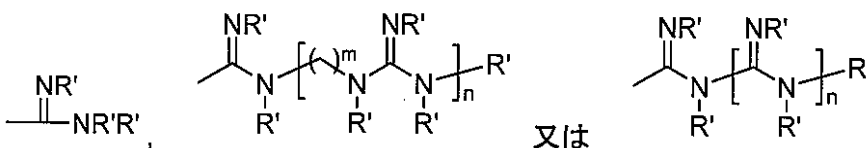
で表される基、もしくは基 -Si(G)₃ [式中、G は、それぞれ独立して、ヒドロキシル、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル又は $C_{1 \sim 4}$ アルコキシである] によって 1 もしくは複数回置換されている) ;

b) $C_{6 \sim 14}$ 芳香族又は $C_{1 \sim 9}$ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環 (これらは置換されていないか又は 1 もしくは複数の基 R'、-OR'、-COOR'、-COOM、-SO₃M、-SO₃H、ホスホン酸、ハロゲン、-CONR'R'、-NR'R'、ホスホン酸塩もしくはアンモニウム塩によって 1 もしくは複数回置換されている) ;

c) 式

【化 3】

40



[式中、m 及び n は、独立して、1 ~ 12 の数、好ましくは 1、2、3、4、5 又は 6 である]

で表される基 ;

[上記式中、

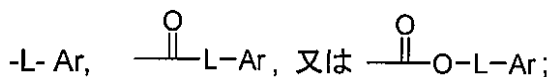
R' は、それぞれ、他のいずれの R' から独立して、

水素 ;

50

基

【化 4】

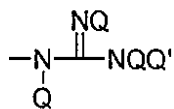


$C_{1 \sim 24}$ アルキル、 $C_{3 \sim 24}$ アルケニル、 $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル又は $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニル（これらは分断されていないか又は1もしくは複数の酸素原子、イオウ原子、カルボニル、 $-COO-$ 、 $-CONH-$ 、 $-NH-$ 、 $-CON(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})$ - もしくは $-N(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})$ - によって1もしくは複数回分断されていて、この非分断又は分断アルキル、アルケニル、シクロアルキル又はアルキルカルボニルは、置換されていないか又はハロゲン、 $-OH$ 、 $C_{2 \sim 24}$ アルキルカルボニル、 $C_{1 \sim 24}$ アルコキシ、 $C_{2 \sim 24}$ アルキルカルボキシ、 $-COOM$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CON(H)(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})$ 、 $-CON(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(H)(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_3M$ 、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、イミダゾール[ここで、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、それぞれ、置換されていないか又は1もしくは複数の $C_{1 \sim 12}$ アルキルによって置換されており、またこのプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、中性であるか又はイオンのに帯電されている]、フェニル、1又は複数の $C_{1 \sim 8}$ アルキルで1又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、1又は複数の $C_{1 \sim 8}$ アルキルで1又は複数回置換されているナフチル、アミジン、グアニジン、アンモニウム塩、ホスホン酸、ホスホン酸塩、及び基

10

20

【化 5】



[式中、Q又はQ'は、それぞれ独立して、水素、 $C_{1 \sim 12}$ アルキル、フェニル又はベンジルである]

から選択される1又は複数の基によって1又は複数回置換されている) ;

であり、

又は

2つのR'が窒素原子に結合している場合は、それらが結合している窒素原子と一緒に、分断されていないか又は $-O-$ 、 $-NH-$ もしくは $-N(C_{1 \sim 12} \text{ アルキル})$ - によって分断されている5員、6員もしくは7員環をそれらは形成していてもよく;

Lは、直接結合、 $C_{1 \sim 12}$ アルキレン（これは分断されていないか又は1もしくは複数の酸素原子、 $-NH-$ 、 $-N(C_{1 \sim 12} \text{ アルキル})$ もしくはフェニレンによって分断されている、及び/又は、置換されていないか又は1もしくは複数の $-OH$ 、 $C_{1 \sim 8}$ アルキル、 $C_{1 \sim 24}$ アルコキシ、 $C_{2 \sim 24}$ アルキルカルボキシ、 $-NH_2$ 、 $-N(H)(C_{1 \sim 8} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_{1 \sim 8} \text{ アルキル})_2$ もしくはアンモニウム塩によって1もしくは複数回置換されている) であり;

Arは、 $C_{6 \sim 10}$ 芳香族又は $C_{1 \sim 9}$ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環（この $C_{6 \sim 10}$ 芳香族又は $C_{1 \sim 9}$ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環は、置換されていないか又は1もしくは複数のハロゲン、 $-OH$ 、 $C_{1 \sim 24}$ アルコキシ、 $C_{2 \sim 24}$ アルキルカルボキシ、 $-COOQ'$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CON(H)(C_{1 \sim 8} \text{ アルキル})$ 、 $-CON(C_{1 \sim 8} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(H)(C_{1 \sim 8} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_{1 \sim 8} \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_3M$ 、 SO_3H 、アンモニウム塩、ホスホン酸、ホスホン酸塩、 $C_{1 \sim 24}$ アルキル、

30

40

(ハロゲン、フェニル、1又は複数の $C_{1 \sim 8}$ アルキルで1又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン及びイミダゾール[ここで、このプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは置換されていないか又は1もしくは複数の $C_{1 \sim 12}$ アルキルによって置換されており、また、このプリ

50

ン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは中性であるか又はイオンのに帯電されている]から選択される1又は複数の基によって1又は複数回置換されている) $C_{1 \sim 24}$ アルキルもしくは $C_{2 \sim 24}$ アルキルカルボキシによって1もしくはは複数回置換されている)

[ここで、Q⁺は、水素、 $C_{1 \sim 24}$ アルキル、金属陽イオン、アンモニウム塩、グリコールエーテル、フェニルもしくはベンジル、又は1もしくはは複数のハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1 \sim 24}$ アルコキシもしくは $C_{1 \sim 12}$ アルキルによって1もしくはは複数回置換されているフェニルもしくはベンジルである]

であり;及び

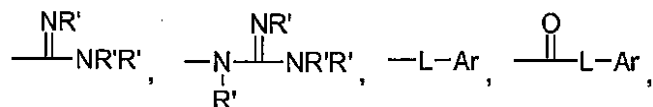
Mは、金属陽イオン又はアンモニウム陽イオンである]

から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項1に記載の抗微生物性組成物。

【請求項3】

Rが、H、 $C_{1 \sim 24}$ アルキル、 $C_{3 \sim 24}$ アルケニル、 $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニル又は $C_{3 \sim 24}$ アルケニルカルボニル(これらは分断されていないか又は1もしくはは複数の - O -、- N(R') -、- CON(R') -、- SO - もしくは - SO₂ - によって1もしくはは複数回分断され、また、置換されていないか又は1もしくはは複数の $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、- OR'、- COOR'、- COOM、- SO₃M、- SO₃H、ホスホン酸、ハロゲン、- CONR'R'、- NR'R'、ホスホン酸塩、アンモニウム塩、式

【化6】



で表される基、もしくは基 - Si(G)₃によって1もしくはは複数回置換されている)

から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項2に記載の抗微生物性組成物。

【請求項4】

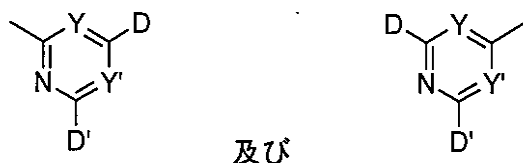
Rが、独立して、 $C_{6 \sim 14}$ 芳香族及び $C_{1 \sim 9}$ 飽和又は不飽和ヘテロ環(これらは置換されていないか又は1もしくはは複数の基 R'、- OR'、- COOR'、- COOM、- SO₃M、- SO₃H、ホスホン酸、ハロゲン、- CONR'R'、- NR'R'、ホスホン酸塩又はアンモニウム塩によって1もしくはは複数回置換されている)

から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項2に記載の抗微生物性組成物。

【請求項5】

Rが、

【化7】



[式中、Y及びY'は、独立してN、C-R'、C-OR'又はC-NR'R'であり、D及びD'は、独立してR'、- OR'又は- NR'R'である]

からなる群から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項4に記載の抗微生物性組成物。

【請求項6】

Rが、式

10

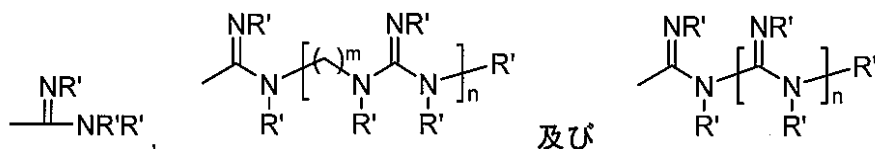
20

30

40

50

【化 8】



[式中、m 及び n は、独立して、1 ~ 12 の数、好ましくは 1、2、3、4、5 又は 6 である]

から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項 2 に記載の抗微生物性組成物。

10

【請求項 7】

R が、C₁ ~ 2₄ アルキル及び C₁ ~ 2₄ アルキルカルボニル（これらは分断されていないか又は - O -、- N (R') -、- C O N (R') - によって 1 もしくは複数回分断され、また、置換されていないか又は 1 もしくは複数の - N R' R'、ハロゲン、アンモニウム塩、- L - A r、

【化 9】



によって置換されている)

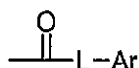
20

から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項 2 又は 3 に記載の抗微生物性組成物。

【請求項 8】

R が、C₁ ~ 2₄ アルキル及び C₁ ~ 2₄ アルキルカルボニル（これらは分断されていないか又は - O - によって 1 もしくは複数回分断されていて、1 もしくは複数の - N R' R'、ハロゲン、アンモニウム塩、- L - A r、

【化 10】

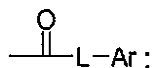


30

もしくは - O R' によって置換されている)

[式中、R' は、水素 ; - L - A r、

【化 11】



C₁ ~ 2₄ アルキル又は C₁ ~ 2₄ アルキルカルボニル（このアルキル又はアルキルカルボニルは、分断されていないか又は 1 もしくは複数の酸素原子、- C O O -、- C O N H -、- N H -、- C O N (C₁ ~ 2₄ アルキル) - もしくは - N (C₁ ~ 2₄ アルキル) - によって 1 もしくは複数回分断されており、この非分断又は分断アルキルもしくはアルキルカルボニルは、置換されていないか又はハロゲン、- O H、C₂ ~ 2₄ アルキルカルボニル、C₁ ~ 2₄ アルコキシ、C₂ ~ 2₄ アルキルカルボキシ、- C O O M、- C O N H₂、- C O N (H) (C₁ ~ 2₄ アルキル)、- C O N (C₁ ~ 2₄ アルキル)₂、- N H₂、- N (H) (C₁ ~ 2₄ アルキル)、- N (C₁ ~ 2₄ アルキル)₂、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、イミダゾール [ここで、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、それぞれ、置換されていないか又は 1 もしくは複数の C₁ ~ 1₂ アルキルによって置換されており、また、このプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、中性であるか又はイオンの帯電されている]、フェニル、1 もしくは複数の C₁ ~ 8 アルキルによって 1 もしくは複数回置換されているフェニル、ナフチル、1 もしくは複数の C₁ ~ 8 アルキルによって 1 もしくは複数回置換

40

50

されているナフチル、及びアンモニウム塩から選択される 1 又は複数の基によって 1 又は複数回置換されている)；

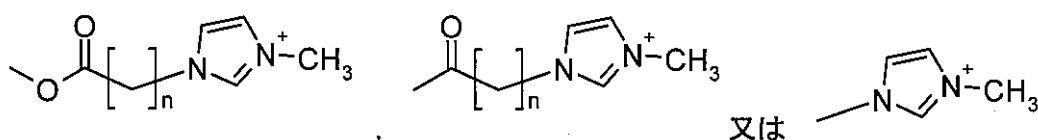
である]

から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項 2、3 及び 7 のいずれかに記載の抗微生物性組成物。

【請求項 9】

R が、 C_{1-24} アルキル；1 もしくは複数の $NR'R'$ 、ハロゲンもしくはアンモニウム塩によって 1 又は複数回置換されている C_{1-24} アルキル； C_{1-24} アルキルカルボニル；1 もしくは複数の $NR'R'$ 、ハロゲンもしくはアンモニウム塩によって 1 もしくは複数回置換されている C_{1-24} アルキルカルボニル；ベンジル、ベンゾイル（このベンジル又はベンゾイルは、1 又は複数のハロゲン、ヒドロキシル、 C_{1-12} アルキル、 C_{1-12} アルコキシ又は C_{1-12} アルキルカルボキシによって 1 又は複数回置換されていても良い）；及び

【化 12】



[式中、n は、1 ~ 12 の数、好ましくは 1、2、3、4、5 又は 6 である]

によって置換されている C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニル

から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項 2、3、7 及び 8 のいずれかに記載の抗微生物性組成物。

【請求項 10】

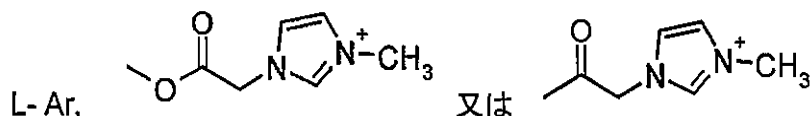
R が、

少なくとも 1 個の $NR'R'$ [式中、 R' は、それぞれ C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニルである] によって置換されている C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニル；

少なくとも 1 個の $NR'R'$ 、及び少なくとも 1 個のハロゲン、 $OR'SO_3M$ 、 SO_3H 、又は式 $L-Ar$ で表される基によって置換されている C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニル；及び

少なくとも 1 個の $NR'R'$ 、及び少なくとも 1 個のハロゲン、 OR' 又は式

【化 13】



で表される基によって置換された C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニルから選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項 2、3 及び 7 ~ 9 のいずれかに記載の抗微生物性組成物。

【請求項 11】

異なる R 基を有している少なくとも 2 種のグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している、請求項 2 ~ 10 のいずれかに記載の抗微生物性組成物。

【請求項 12】

請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載のポリマー又はコポリマーを含んでいる組成物の有効量を、プラスチック組成物、コーティング組成物、又はホームもしくはパーソナル用処方物に加えることを含む、プラスチック、コーティング、他の建築用材料、ホームケア又はパーソナルケア処方品、工業用処方品の防護方法、すなわち微生物の作用に対抗する技術的方法。

【請求項 13】

10

20

30

40

50

請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載のポリマー又はコポリマーの有効量を含んでいる調製物を適用することを含む、微生物の作用に対抗して皮膚、粘膜、皮膚付属器官並びに植物体を防護する方法。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載のポリマー又はコポリマーの有効量、あるいは請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載のポリマー又はコポリマーの有効量を含んでいる組成物を組み込む又は適用することを含む、微生物の作用に対抗して紙、木材、皮革又は布地材料を防護する方法。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載のポリマー又はコポリマーを含んでいる、パーソナルケア調製物、口腔用衛生処方物又は洗濯・洗浄処方物。

10

【請求項 16】

請求項 15 による、フケ防止組成物。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載のポリマー又はコポリマー、及び別の天然又は合成ポリマーを含む、組成物。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載のポリマー又はコポリマーを 2 種以上含んでいる、組成物。

20

【請求項 19】

織布もしくは不織布、紙製品、コーティング組成物又はプラスチック物品である、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載のポリマー又はコポリマーの有効量を含んでいる調製物を適用することを含む、硬表面の洗浄・消毒方法。

【請求項 21】

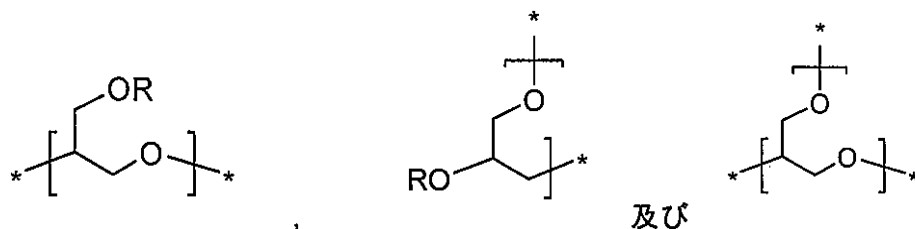
物品又は物品の表面に請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載の抗微生物性ポリマー又はコポリマーを組み込むことを含む、又はそのような面に抗微生物性ポリマー又はコポリマーを直接又はコーティングもしくは膜の一部として適用することによる、物品の生物汚損防止方法。

30

【請求項 22】

ポリマーの骨格中に

【化 14】

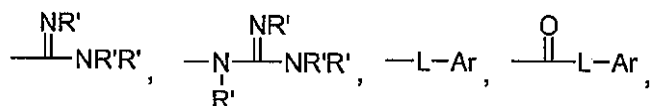


40

(式中、基 R は、

a) $C_{1 \sim 24}$ アルキル、 $C_{3 \sim 24}$ アルケニル、 $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニル又は $C_{3 \sim 24}$ アルケニルカルボニル (これらは 1 又は複数の $-\text{O}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}')-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')-$ 、 $-\text{SO}-$ 又は $-\text{SO}_2-$ によって 1 又は複数回分断され、及び / 又は、1 又は複数の $-\text{CONR}'\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{R}'$ 、アンモニウム塩、式

【化 15】



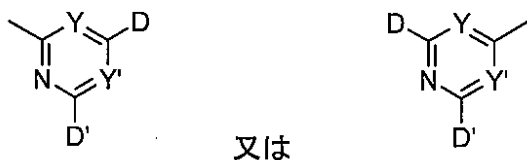
50

で表される基、又は基 - Si (G)₃ [式中、G は、それぞれ独立して、ヒドロキシル、C₁ ~ 4 アルキル又は C₁ ~ 4 アルコキシである] によって 1 又は複数回置換されている) ;

b) C₁ ~ 9 飽和又は不飽和ヘテロ環 (これらは置換されていないか又は 1 もしくは複数の基 R'、- OR'、- COOR'、- COOM、- SO₃M、- SO₃H、ホスホン酸、ハロゲン、- CONR' R'、- NR' R'、ホスホン酸塩もしくはアンモニウム塩によって 1 もしくは複数回置換されている) であって、

式

【化 1 6】



又は

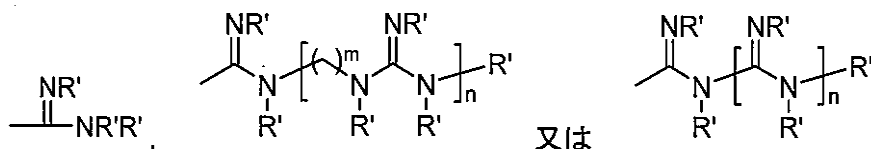
10

[式中、Y 及び Y' は、独立して N、C - R'、C - OR' 又は C - NR' R' であり、D 及び D' は、独立して R'、- OR' 又は - NR' R' である]

で表されるヘテロ環も含めた飽和又は不飽和ヘテロ環 ; 及び

c) 式

【化 1 7】



又は

20

[式中、m 及び n は、独立して、1 ~ 12 の数、好ましくは 1、2、3、4、5 又は 6 である]

で表される基 ;

[上記式中、

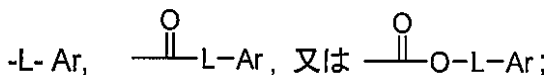
R' は、それぞれ他のいずれの R' から独立して、

30

水素 ;

基

【化 1 8】



C₁ ~ 24 アルキル、C₃ ~ 24 アルケニル、C₃ ~ 6 シクロアルキル又は C₁ ~ 24 アルキルカルボニル (これらは分断されていないか又は 1 もしくは複数の酸素原子、イオウ原子、カルボニル、- COO -、- CONH -、- NH -、- CON (C₁ ~ 24 アルキル) - 又は - N (C₁ ~ 24 アルキル) - によって 1 もしくは複数回分断され、

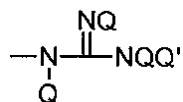
40

この非分断又は分断アルキル、アルケニル、シクロアルキル又はアルキルカルボニルは、置換されていないか又はハロゲン、- OH、C₂ ~ 24 アルキルカルボニル、C₁ ~ 24 アルコキシ、C₂ ~ 24 アルキルカルボキシ、- COOM、- CONH₂、- CON (H) (C₁ ~ 24 アルキル)、- CON (C₁ ~ 24 アルキル)₂、- NH₂、- N (H) (C₁ ~ 24 アルキル)、- N (C₁ ~ 24 アルキル)₂、- SO₃M、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、イミダゾール [ここで、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、それぞれ置換されていないか又は 1 もしくは複数の C₁ ~ 12 アルキルによって置換されており、また、このプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、中性であるか又はイオンの帯電されている]、フェニル、1 又は複数の C₁ ~ 8 アルキルによって 1 又は複数回置換されているフェニル、ナフチ

50

ル、1又は複数の $C_1 \sim 8$ アルキルによって1又は複数回置換されているナフチル、アミジン、グアニジン、アンモニウム塩、ホスホン酸、ホスホン酸塩、及び基

【化19】



[式中、Q又はQ'は、それぞれ独立して、水素、 $C_1 \sim 12$ アルキル、フェニル又はベンジルである]

から選択される1又は複数の基によって1又は複数回置換されている)；

であり、

又は

2つのR'が窒素原子に結合している場合は、それらが結合している窒素原子と一緒に、分断されていないか又は-O-、-NH-もしくは-N($C_1 \sim 12$ アルキル)-によって分断されている5員、6員もしくは7員環をそれらは形成していてもよく；

Lは、直接結合、 $C_1 \sim 12$ アルキレン(これは分断されていないか又は1もしくは複数の酸素原子、-NH-、-N($C_1 \sim 12$ アルキル)又はフェニレンによって分断されている、及び/又は、置換されていないか又は1もしくは複数の-OH、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_1 \sim 24$ アルコキシ、 $C_2 \sim 24$ アルキルカルボキシ、-NH₂、-N(H)($C_1 \sim 8$ アルキル)、-N($C_1 \sim 8$ アルキル)₂もしくはアンモニウム塩によって1もしくは複数回置換されている)であり；

Arは、 $C_6 \sim 10$ 芳香族又は $C_1 \sim 9$ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環(この $C_6 \sim 10$ 芳香族又は $C_1 \sim 9$ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環は、置換されていないか又は1もしくは複数のハロゲン、-OH、 $C_1 \sim 24$ アルコキシ、 $C_2 \sim 24$ アルキルカルボキシ、-COOQ'、-CONH₂、-CON(H)($C_1 \sim 8$ アルキル)、-CON($C_1 \sim 8$ アルキル)₂、-NH₂、-N(H)($C_1 \sim 8$ アルキル)、-N($C_1 \sim 8$ アルキル)₂、-SO₃M、SO₃H、アンモニウム塩、ホスホン酸、ホスホン酸塩、 $C_1 \sim 24$ アルキル、

(ハロゲン、フェニル、1もしくは複数の $C_1 \sim 8$ アルキルによって1又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン及びイミダゾール[ここで、このプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、置換されていないか又は1もしくは複数の $C_1 \sim 12$ アルキルによって置換されており、また、このプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、中性であるか又はイオンのように帯電されている]から選択される1もしくは複数の基によって1もしくは複数回置換されている) $C_1 \sim 24$ アルキル又は $C_2 \sim 24$ アルキルカルボキシによって1又は複数回置換されている)

[ここで、Q'は、水素、 $C_1 \sim 24$ アルキル、金属陽イオン、アンモニウム塩、グリコールエーテル、フェニルもしくはベンジル、又は1もしくは複数のハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 24$ アルコキシもしくは $C_1 \sim 12$ アルキルによって1もしくは複数回置換されているフェニルもしくはベンジルである]

であり；

Mは、金属陽イオン又はアンモニウム陽イオンである]

から選択される)

から選択されるグリセロール誘導部分構造を含んでいる、高分岐ポリマー又は dendrimer。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

ポリグリセロール系抗微生物剤含有組成物の調製及び使用が提供される。この薬剤は様々な病原菌に対して効果があると同時にヒトに対する有害性が低いと考えられ、化粧品、ヘアケア用製造品及び布地のようなヒトとの接触を伴う用途並びにコーティングのような

10

20

30

40

50

ヒトとの接触がずっと少ない用途にも有用である。

【背景技術】

【0002】

抗微生物化合物は、多くの製造物及び材料の一部として広く用いられており、また許容もされている。抗菌石鹸、抗菌植物体トリートメント剤、治療用局所トリートメント剤、抗汚損コーティング及び消毒性洗浄剤は抗微生物物質のほんのいくつかの一般的な用途である。

【0003】

抗微生物化合物を用いる際の明らかなジレンマは、そのような化合物は生物に対して活性でなければならないが、ヒト、動物又は好ましい植物に対しては有害であってはならないことである。本明細書に開示されるのは、様々な有害微生物に対して効果があって、ヒトに対しては、一つには本発明の化合物の特質がポリマーであることにより、多くの他の抗微生物化合物よりも有害性が低いことが期待される化合物である。

10

【0004】

米国特許第6,090,772号明細書(特許文献1);米国特許第5,955,408号明細書(特許文献2);米国特許第6,071,866号明細書(特許文献3);米国特許第6,358,906号明細書(特許文献4)[参照によりこれらの全体を本明細書に組み込む]、及び国際公開第96/06152号パンフレット(特許文献5)には、抗微生物剤としてトリクロサンを含んでいる、パーソナルケア用途に有用な組成物が開示されている。

20

【0005】

米国特許第5,635,462号明細書(特許文献6)[参照によりその全体を本明細書に組み込む]にも抗菌剤を含んでいる組成物が開示されている。

【0006】

国際公開第98/55096号パンフレット(特許文献7)には、多孔質シートに活性抗微生物剤含有抗菌組成物が含浸された抗微生物性拭き取り材(wipes)が開示されている。

【0007】

米国特許第6,861,397号明細書(特許文献8)[参照によりその全体を本明細書に組み込む]には、局所性活性化合物含有抗菌剤の付着性が向上されているパーソナルケア・洗浄組成物が開示されている。

30

【0008】

米国特許第6,872,241号明細書(特許文献9)[参照によりその全体を本明細書に組み込む]には、感染性浮遊微生物に対して防護機能がある抗病原菌空気濾過媒体及び空気清浄装置が開示されている。

【0009】

米国特許出願公開第2007/0265267号明細書(特許文献10)[参照によりその全体を本明細書に組み込む]には、殺菌相乗作用性組成物、及び、有用な植物体又はその繁殖物の植物病原菌性疾病の防除方法が開示されている。該方法は、有用な植物体、その所在場所、又はその繁殖物に殺菌相乗作用性組成物を適用することを含む。

40

【0010】

同時係属の米国特許出願第11/656,863号[参照によりその全体を本明細書に組み込む]には、抗微生物剤として効果がある置換ポリエチレンイミンが開示されている。

【0011】

抗微生物化合物(例えば、抗菌組成物や抗細菌組成物中に見られるような抗微生物化合物)が、十分に広いスペクトルの微生物個体数低下を、迅速且つ毒性や皮膚刺激の問題を伴うことなくもたらすことは重要なことである。

【0012】

抗微生物溶液剤の現行技術はカクテル法であり、この方法は、2種以上の抗微生物化合

50

物を混合することによって抗微生物活性の広いスペクトルをもたらすものである。抗微生物化合物の物理特性及び化学特性には差があるため（例えば、異なる安定性、溶解性及び溶出速度）、この方法には、通常、相溶性の問題が伴う。抗微生物ポリマーの一つの利点は、異なる官能性基を同じポリマー鎖中に組み合わせることによって抗微生物活性の広いスペクトルが相溶性の問題をなんら発生することなく達成され得ることである。官能性基は、抗微生物ポリマーの物理特性及び化学特性を目的のものに合わせるためにも、したがって、施用時のその性能を高めるためにも導入され得るものであり、例えば、ポリマー鎖に適切な官能性基を導入すると、抗微生物ポリマーの水及び／又はグリコールへの溶解性がその抗微生物活性になんら影響を及ぼすことなく増大され得る。

【 0 0 1 3 】

Frey, et.al., Advanced Materials, vol 12, 2, 2000 p 235-239 (非特許文献 1) には、アリル又はフェニルグリシジルエーテルのようなグリシドール及び／又はグリシドール誘導体から得られる高分岐ポリエーテルポリオールポリマー及びコポリマーの調製が開示されている。Rokicki, et. al., Journal of Green Chemistry 2005, 7, p529-539 (非特許文献 2) には、4 - (ヒドロキシメチル) - 1, 3 - ジオキサランから出発する、このポリマーの別の合成が開示されている。このポリオールの遊離ヒドロキシル基は、重合後に、標準的な有機反応を経て誘導体化され得るものである。

【 0 0 1 4 】

これらの高分岐ポリエーテルポリオールポリマー及びコポリマー並びにそれらの誘導体は、菌、グラム陽性菌及びグラム陰性菌を含めた広い範囲の微生物に対して有効な抗微生物化合物であることが見出されている。これらのポリマー及びコポリマーは、多くの一般的な菌、例えば、ヒトの皮膚及び頭皮さらには多くの植物体に影響を及ぼす菌に対して非常に効果があり、例えば、このポリマーは、有効なフケ防止剤、植物体防護剤である。

【 先行技術文献 】

【 特許文献 】

【 0 0 1 5 】

【 特許文献 1 】 米国特許第 6 , 0 9 0 , 7 7 2 号明細書

【 特許文献 2 】 米国特許第 5 , 9 5 5 , 4 0 8 号明細書

【 特許文献 3 】 米国特許第 6 , 0 7 1 , 8 6 6 号明細書

【 特許文献 4 】 米国特許第 6 , 3 5 8 , 9 0 6 号明細書

【 特許文献 5 】 国際公開第 9 6 / 0 6 1 5 2 号パンフレット

【 特許文献 6 】 米国特許第 5 , 6 3 5 , 4 6 2 号明細書

【 特許文献 7 】 国際公開第 9 8 / 5 5 0 9 6 号パンフレット

【 特許文献 8 】 米国特許第 6 , 8 6 1 , 3 9 7 号明細書

【 特許文献 9 】 米国特許第 6 , 8 7 2 , 2 4 1 号明細書

【 特許文献 1 0 】 米国公開特許出願第 2 0 0 7 / 0 2 6 5 2 6 7 号明細書

【 非特許文献 】

【 0 0 1 6 】

【 非特許文献 1 】 Frey, et.al., Advanced Materials, vol 12, 2, 2000 p 235-239

【 非特許文献 2 】 Rokicki, et. al., Journal of Green Chemistry 2005, 7, p529-539

【 発明の概要 】

【 発明が解決しようとする課題 】

【 0 0 1 7 】

本発明は、ポリグリセロール系抗微生物剤を含んでいる抗微生物性組成物及びその使用方法を提供するものである。また新規なポリグリセロール化合物及びその調製方法も開示される。ポリグリセロール系抗微生物剤は、一つには、そのサイズ、及び特質がポリマーであることにより、それらが意図に反して除去されるのをより起こり難くするので、接触すると微生物に対してきわめて活性があつて、長期間に亘って活性であり続ける。ポリグリセロール系抗微生物剤は、消毒用途、及び微生物感染からの物質の防護及び保存におけるように接触で微生物を死滅させるのに用いられ得る。この化合物は、また、ヒトと接触

10

20

30

40

50

しても、皮膚からより容易に吸収されるつまりより容易に周囲環境に分散されることでバイオアベイラブルとなる他の化合物よりも有害性がより低いことが期待される。抗微生物剤としてのそのようなポリグリセロールは、これまで、知られていない。

【0018】

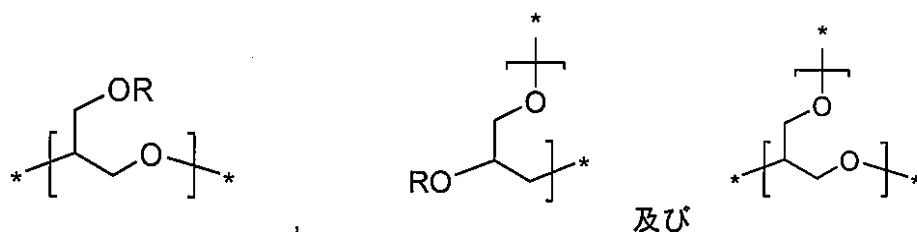
本発明のポリグリセロール系抗微生物剤は、グリシジル繰り返し単位含有ポリマー又はコポリマーである。本明細書でポリマー又はコポリマーという場合は、すべてを包含する用語「ポリマー」が、ポリマーとコポリマーのいずれをも包含するために用いられることがある。

【課題を解決するための手段】

【0019】

本発明の組成物は、ポリマーの骨格中に

【化1】



10

【0020】

[式中、R は、独立して、H、又は置換又は非置換アルキル、アルケニル、アルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、アリールもしくはヘテロ環である]

から選択されるグリセロール誘導部分構造を含む高分岐ポリマー、高分岐コポリマー及びデンドリマーのポリグリセロール系抗微生物剤を含んでおり、この組成物は、ホームケア又はパーソナルケア処方品、植物体防護用処方品、天然又は合成高分子、建築用コーティング又は他の建築用材料中に組み込まれるものである。

20

【0021】

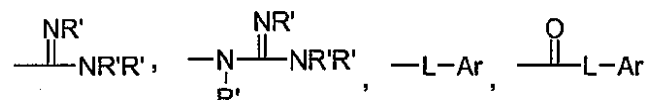
例えば、R は、

H ;

a) (分断されていないか又は1もしくは複数の - O - 、 - N (R ') - 、 - C O N (R ') - 、 - S O - 又は - S O ₂ - によって1又は複数回分断されていて、置換されていないか又は1もしくは複数の C ₃ ~ ₆ シクロアルキル、 - O R ' 、 - C O O R ' 、 - C O O M 、 - S O ₃ M 、 - S O ₃ H 、ホスホン酸、ハロゲン、 - C O N R ' R ' 、 - N R ' R ' 、ホスホン酸塩、アンモニウム塩、式

30

【化2】



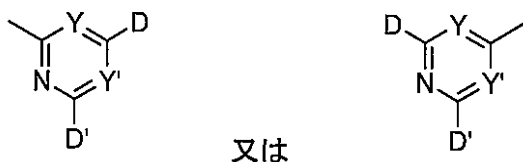
で表される基、又は基 - S i (G) ₃ [式中、G は、それぞれ独立して、ヒドロキシル、C ₁ ~ ₄ アルキル又はC ₁ ~ ₄ アルコキシである] によって1又は複数回置換されている) C ₁ ~ _{2 4} アルキル、C ₃ ~ _{2 4} アルケニル、C ₁ ~ _{2 4} アルキルカルボニル又はC ₃ ~ _{2 4} アルケニルカルボニル ;

40

b) (置換されていないか又は1もしくは複数の基 R ' 、 - O R ' 、 - C O O R ' 、 - C O O M 、 - S O ₃ M 、 - S O ₃ H 、ホスホン酸、ハロゲン、 - C O N R ' R ' 、 - N R ' R ' 、ホスホン酸塩又はアンモニウム塩によって1又は複数回置換されている) C ₆ ~ _{1 4} 芳香族又はC ₁ ~ ₉ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環であって、

式

【化 3】



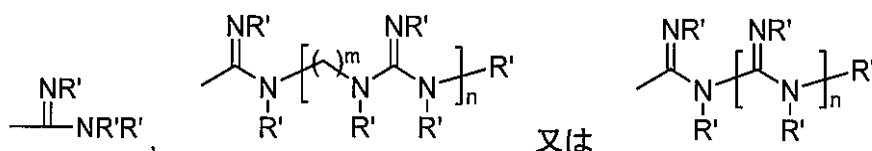
【 0 0 2 2 】

[式中、Y 及び Y' は、独立して、N、C - R'、C - OR' 又は C - NR' R' であり、D 及び D' は、独立して、R'、- OR' 又は - NR' R' である]

で表されるヘテロ環も含めた C₆ - 1₄ 芳香族又は C₁ - 9 飽和もしくは不飽和ヘテロ環；及び

c) 式

【化 4】



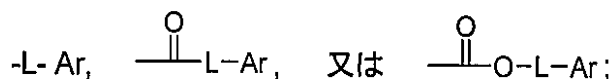
【 0 0 2 3 】

[式中、m 及び n は、独立して、1 ~ 12 の数、好ましくは 1、2、3、4、5 又は 6 である] で表される基；

[上記式中、R' は、それぞれ、他のいずれの R' から独立して、水素；

基

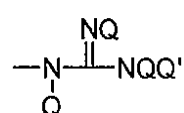
【化 5】



【 0 0 2 4 】

C₁ - 2₄ アルキル、C₃ - 2₄ アルケニル、C₃ - 6 シクロアルキル又は C₁ - 2₄ アルキルカルボニル（これらは分断されていないか又は 1 もしくは複数の酸素原子、イオウ原子、カルボニル、- COO -、- CONH -、- NH -、- CON (C₁ - 2₄ アルキル) - 又は - N (C₁ - 2₄ アルキル) - によって 1 又は複数回分断されていて、この非分断又は分断アルキル、アルケニル、シクロアルキル又はアルキルカルボニルは置換されていないか又はハロゲン、- OH、C₂ - 2₄ アルキルカルボニル、C₁ - 2₄ アルコキシ、C₂ - 2₄ アルキルカルボキシ、- COOM、- CONH₂、- CON (H) (C₁ - 2₄ アルキル)、- CON (C₁ - 2₄ アルキル)₂、- NH₂、- N (H) (C₁ - 2₄ アルキル)、- N (C₁ - 2₄ アルキル)₂、- SO₃ M、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、イミダゾール、[式中、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、それぞれ、置換されていないか又は 1 もしくは複数の C₁ - 1₂ アルキルによって置換されており、またこのプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは中性であるか又はイオンの帯電されている]、フェニル、1 又は複数の C₁ - 8 アルキルによって 1 又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、1 又は複数の C₁ - 8 アルキルによって 1 又は複数回置換されているナフチル、アミジン、グアニジン、アンモニウム塩、ホスホン酸、ホスホン酸塩、及び基

【化 6】



【 0 0 2 5 】

10

20

30

40

50

[式中、Q 又は Q' は、独立して、水素、C₁ ~ C₁₂ アルキル、フェニル又はベンジルである] から選択される 1 又は複数の基によって 1 又は複数回置換されている) ; であり、又は

2 つの R' が窒素原子に結合している場合は、それらが結合している窒素原子と一緒に、分断されていないか又は - O - 、 - NH - 又は - N (C₁ ~ C₁₂ アルキル) - によって分断されている 5 員、6 員もしくは 7 員環をそれらは形成してよく ;

L は、直接結合、C₁ ~ C₁₂ アルキレン (これは分断されていないか又は 1 もしくは複数の酸素原子、- NH - 、- N (C₁ ~ C₁₂ アルキル) 又はフェニレンによって分断されている、及び / 又は、置換されていないか又は 1 もしくは複数の - OH、C₁ ~ C₈ アルキル、C₁ ~ C₂₄ アルコキシ、C₂ ~ C₂₄ アルキルカルボキシ、- NH₂、- N (H) (C₁ ~ C₈ アルキル)、- N (C₁ ~ C₈ アルキル)₂ 又はアンモニウム塩によって 1 又は複数回置換されている) であり ;

Ar は、C₆ ~ C₁₀ 芳香族又は C₁ ~ C₉ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環 (この C₆ ~ C₁₀ 芳香族又は C₁ ~ C₉ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環は置換されていないか又は 1 もしくは複数のハロゲン、- OH、C₁ ~ C₂₄ アルコキシ、C₂ ~ C₂₄ アルキルカルボキシ、- COOQ'、- CONH₂、- CON (H) (C₁ ~ C₈ アルキル)、- CON (C₁ ~ C₈ アルキル)₂、- NH₂、- N (H) (C₁ ~ C₈ アルキル)、- N (C₁ ~ C₈ アルキル)₂、- SO₃M、SO₃H、アンモニウム塩、ホスホン酸、ホスホン酸塩、C₁ ~ C₂₄ アルキル、

(ハロゲン、フェニル、1 又は複数の C₁ ~ C₈ アルキルによって 1 又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン及びイミダゾール [式中、このプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、置換されていないか又は 1 もしくは複数の C₁ ~ C₁₂ アルキルによって置換されており、またこのプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、中性であるか又はイオンのように帯電されている] から選択される 1 又は複数の基によって 1 又は複数回置換されている) C₁ ~ C₂₄ アルキル又は C₂ ~ C₂₄ アルキルカルボキシによって 1 又は複数回置換されている)

[式中、Q' は、水素、C₁ ~ C₂₄ アルキル、金属陽イオン、アンモニウム塩、グリコールエーテル、フェニルもしくはベンジル、又は 1 もしくは複数のハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ C₂₄ アルコキシ又は C₁ ~ C₁₂ アルキルによって 1 又は複数回置換されているフェニルもしくはベンジルである]

であり ;
M は、金属陽イオン又はアンモニウム陽イオンである] から独立に選択される。

【 0026 】

1 ~ 9 個の炭素原子含有 C₁ ~ C₉ 飽和又は不飽和ヘテロ環は少なくとも 3 原子のモノ環式又はポリ環式環であり、このヘテロ環はイオンのように帯電されていても良い。

【 0027 】

例えば、C₁ ~ C₉ 飽和又は不飽和ヘテロ環は、1、2 又は 3 個の窒素原子含有 5 員、6 員、又は 7 員環であり、これは、別の炭環又はヘテロ環式環に縮合されていてよく ;

【 0028 】

例えば、C₁ ~ C₉ 飽和又は不飽和ヘテロ環は、1、2 又は 3 個の窒素原子含有 5 員、6 員、又は 7 員環であり、これは、ベンゼン環に縮合されていてよく ;

【 0029 】

例えば、C₁ ~ C₉ 飽和又は不飽和ヘテロ環は、プリン、イミダゾール、ピリジン、ピラミジン又はトリアゾール環であり ;

【 0030 】

ヘテロ環は先に記載されているように置換されていてよく、ヘテロ環はイオンのように帯電されていていても良い。

【 0031 】

10

20

30

40

50

アルキルは、指定された数の炭素原子からなる線状又は分岐状鎖であり、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ヘキシル、*n*-オクチル、2-エチルヘキシル、*n*-ノニル、*n*-デシル、*n*-ウンデシル、*n*-ドデシル、*n*-トリデシル、*n*-テトラデシル、*n*-ヘキサデシル、*n*-オクタデシル又はドコサニル等である。

【0032】

アルケニルは、指定された数の炭素原子からなる、1以上の炭素-炭素二重結合含有の線状又は分岐状鎖であり、例えば、*n*-プロペニル、*n*-ブテニル、*sec*-ブテニル、*n*-ヘキセニル、*n*-オクテニル、*n*-ヘキサジエニル、*n*-オクタジエニル、2-エチルヘキセニル、*n*-ノネニル、*n*-デセニル、*n*-ウンデセニル、*n*-ドデセニル、*n*-トリデセニル、*n*-テトラデセニル、*n*-ヘキサデセニル、*n*-オクタデセニル、*n*-ドデカジエニル、*n*-テトラデカジエニル、*n*-ヘキサデカジエニル、*n*-ヘキサデカトリエニル、*n*-オクタデカジエニル、*n*-オクタデカトリエニルである。

10

【0033】

アルキルカルボニルつまりアルカノイルは、結合の位置にカルボニルを有している指定された数の炭素原子からなる線状又は分岐状鎖である。

【0034】

アンモニウム塩は、例えば、非置換アンモニウム、(1又は複数の酸素原子、カルボニル、カルボキシ又は C_{6-10} アリーレンによって分断された) C_{6-10} アリール、 C_{1-24} アルキル、 C_{1-24} 分岐アルキル、 C_{1-24} アルキル及び分岐アルキル、並びにアルキル、アリール、OH、Oアルキル、Oアシルによって置換されたそのようなアリール、アルキル、分岐アルキル、分断アルキル及び分断分岐アルキル；さらには対応の対陰イオンから選択される1又は複数の基によって1、2又は3回置換されたアンモニウムである。

20

【0035】

アンモニウム塩は環又は多環を含んでいてもよく、この環又は多環は置換されていても良い。

【0036】

例えば、アンモニウム塩は、トリスベンジルアンモニウム又はモノ-、ジ-、又はトリ- C_{1-24} アルキルアンモニウム[式中、アルキル基は、それぞれ、同じであっても又は異なっても良い]、モノ-、ジ-、又はトリ-ベンジルアンモニウム、モノ-、ジ-、又はトリ- C_{1-24} ヒドロキシアリルアンモニウム[式中、アルキル基は、それぞれ、同じであっても又は異なっても良い]である。

30

【0037】

例えば、アンモニウム塩は、各置換基が C_{1-24} アルキル、ベンジル及び C_{1-24} ヒドロキシアリルから独立に選択される2-又は3-置換アンモニウムである。

【0038】

置換アンモニウム塩の C_{1-24} アルキル、ベンジル及び C_{1-24} ヒドロキシアリル基は、1又は複数の C_{1-8} アルキルもしくは分岐アルキル、ヒドロキシ、 C_{1-24} カルボキシエステル、 C_{1-24} アルキルオキシ、 C_{1-24} アシルオキシ又はハロゲンによって置換されていても良い。

40

【0039】

Mがアンモニウム陽イオンである場合は、それは、例えば、非置換アンモニウム、 C_{1-24} アルキル、 C_{1-24} 分岐アルキル、1又は複数の酸素原子によって分断されたそのようなアルキル及び分岐アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{7-9} アラリル、並びにアルキル、OH、OC C_{1-24} アルキル、OC C_{1-24} アシルによって置換されたそのようなアルキル、分岐アルキル、分断アルキル及び分断分岐アルキルさらにはアリールから選択される1又は複数の基によって1又は複数回置換されたアンモニウムである。

【0040】

本発明による抗微生物性組成物は、好ましくは、異なるR基を有している少なくとも2

50

種のグリシドール誘導部分構造を含むポリマーを含有している。

【 0 0 4 1 】

本発明の抗微生物性組成物は、すべてのグリシドール誘導部分構造が同じ R を有している、例えば、すべての R 基が H 又はアルキルであるポリマーを含み得るが、より一般的には、このポリマーは、一部の基 R が H となっており、残りのものが先に記載した 1 又は複数の基となっているグリシドール誘導部分構造を含むものである。H となっていない基 R は、単一状の置換基であってよく、例えば、基 R の一部が H となっていて残りのものがアルキルカルボニルとなっていて良い。多くの場合、H となっていない残りの R 基は、先に記載した基の混合となっている。

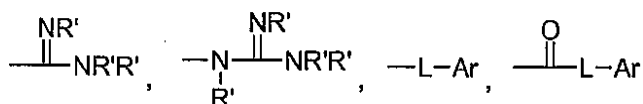
【 0 0 4 2 】

多くのケースでは、水素となっている基 R の割合は、90%以下、例えば80%以下、例えば50%以下、25%以下又は10%以下である。

【 0 0 4 3 】

例えば、ポリグリセロール系抗微生物剤は、R が、H、(分断されていないか又は1もしくは複数の - O -、- N (R ') -、- C O N (R ') -、- S O - 又は - S O ₂ - によって1又は複数回分断されていて、置換されていないか又は1もしくは複数の C₃ - ₆ シクロアルキル、- O R '、- C O O R '、- C O O M、- S O₃ M、- S O₃ H、ホスホン酸、ハロゲン、- C O N R ' R '、- N R ' R '、ホスホン酸塩、アンモニウム塩、式

【 化 7 】



で表される基、又は基 - S i (G)₃ によって1又は複数回置換されている) C₁ - ₂₄ アルキル、C₃ - ₂₄ アルケニル、C₁ - ₂₄ アルキルカルボニル及び C₃ - ₂₄ アルケニルカルボニルから選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーである。

【 0 0 4 4 】

例えば、ポリグリセロール系抗微生物剤は、R が、(置換されていないか又は1もしくは複数の基 R '、- O R '、- C O O R '、- C O O M、- S O₃ M、- S O₃ H、ホスホン酸、ハロゲン、- C O N R ' R '、- N R ' R '、ホスホン酸塩又はアンモニウム塩によって1又は複数回置換されている) C₆ - ₁₄ 芳香族又は C₁ - ₉ 飽和もしくは不飽和ヘテロ環であるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーである。

【 0 0 4 5 】

例えば、ポリグリセロール系抗微生物剤は、R が、

【 化 8 】



【 0 0 4 6 】

[式中、Y 及び Y ' は、独立して、N、C - R '、C - O R ' 又は C - N R ' R ' であり、D 及び D ' は、独立して、R '、- O R ' 又は - N R ' R ' である] からなる群から選択されるヘテロ環であるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーである。

【 0 0 4 7 】

例えば、ポリグリセロール系抗微生物剤は、R が、式

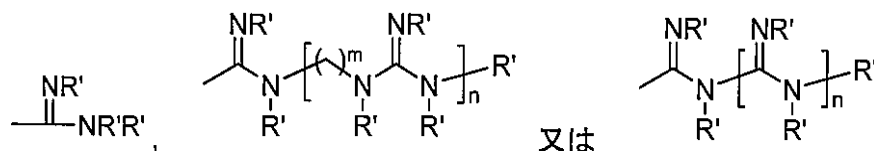
10

20

30

40

【化 9】



【0048】

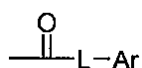
[式中、m及びnは、独立して、1～12の数、好ましくは1、2、3、4、5又は6である] で表される基であるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーである。

【0049】

例えば、ポリグリセロール系抗微生物剤は、Rが、(分断されていないか又は - O - 、 - N (R ') - 、 - CON (R ') - によって1又は複数回分断されていて、置換されていないか又は1もしくは複数の - NR ' R ' 、ハロゲン、アンモニウム塩、 - L - Ar 、

10

【化10】



【0050】

又は - OR ' によって置換されている) C₁ ~ 2₄ アルキル又は C₁ ~ 2₄ アルキルカルボニル

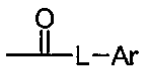
であるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーである。

20

【0051】

例えば、Rは、(分断されていないか又は - O - によって1又は複数回分断されていて、1又は複数の - NR ' R ' 、ハロゲン、アンモニウム塩、 - L - Ar 、

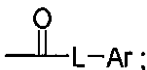
【化11】



【0052】

又は - OR ' [式中、R ' は、水素 ; - L - Ar 、

【化12】



30

【0053】

C₁ ~ 2₄ アルキル又は C₁ ~ 2₄ アルキルカルボニル (このアルキル又はアルキルカルボニルは、分断されていないか又は1もしくは複数の酸素原子、 - COO - 、 - CONH - 、 - NH - 、 - CON (C₁ ~ 2₄ アルキル) - 又は - N (C₁ ~ 2₄ アルキル) - によって1又は複数回分断されていて、この非分断又は分断アルキル又はアルキルカルボニルは、置換されていないか又はハロゲン、 - OH、C₂ ~ 2₄ アルキルカルボニル、C₁ ~ 2₄ アルコキシ、C₂ ~ 2₄ アルキルカルボキシ、 - COOM、 - CONH₂、 - CON (H) (C₁ ~ 2₄ アルキル)、 - CON (C₁ ~ 2₄ アルキル)₂、 - NH₂、 - N (H) (C₁ ~ 2₄ アルキル)、 - N (C₁ ~ 2₄ アルキル)₂、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、イミダゾール、[式中、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、それぞれ、置換されていないか又は1もしくは複数の C₁ ~ 1₂ アルキルによって置換されており、またこのプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、中性であるか又はイオンのに帯電されている]、フェニル、1又は複数の C₁ ~ 8 アルキルによって1又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、1又は複数の C₁ ~ 8 アルキルによって1又は複数回置換されているナフチル、及びアンモニウム塩から選択される1又は複数の基によって1又は複数回置換されている) C₁ ~ 2₄ アルキル及び C₁ ~ 2₄ アルキルカルボニルから選

40

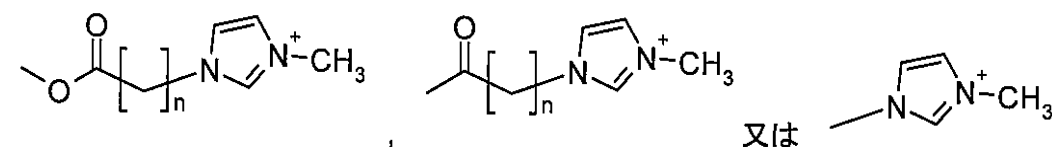
50

択される。

【0054】

例えば、Rが、 $C_{1 \sim 24}$ アルキル、(1又は複数の $NR'R'$ 、ハロゲン又はアンモニウム塩によって1又は複数回置換された) $C_{1 \sim 24}$ アルキル； $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニル、(1又は複数の $NR'R'$ 、ハロゲン又はアンモニウム塩によって1又は複数回置換された) $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニル；ベンジル、ベンゾイル(このベンジル又はベンゾイルは、1又は複数のハロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1 \sim 12}$ アルキル、 $C_{1 \sim 12}$ アルコキシ又は $C_{1 \sim 12}$ アルキルカルボキシによって1又は複数回置換されていて良い)；さらには

【化13】



10

【0055】

[式中、nは、1～12の数、好ましくは1、2、3、4、5又は6である]によって置換された $C_{1 \sim 24}$ アルキル又は $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニルから選択されるグリシドール誘導部分構造を含む抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマー。

【0056】

例えば、ポリグリセロール系抗微生物剤は、Rが、

20

【化14】

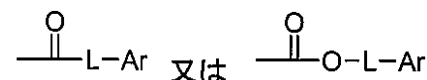


【0057】

(式中、D及びD'は、独立して、 R' 、 OR' 又は $NR'R'$ [式中、 R' は、それぞれ、他のいずれの R' からも独立して、水素、アンモニウム塩、 $C_{1 \sim 24}$ アルキル、 $C_{1 \sim 24}$ アルカノイル(これらは置換されていないか又は1もしくは複数のハロゲン、ヒドロキシル又はアンモニウム塩によって1又は複数回置換されている)である]である)；-L-Ar、

30

【化15】



【0058】

[式中、Lは、直接結合又は $C_{1 \sim 12}$ アルキレンであり、

【0059】

Arは、フェニル、又は(1又は複数のハロゲン、-OH、 $C_{1 \sim 24}$ アルコキシ、 $C_{2 \sim 24}$ アルキルカルボキシ、-COOH、-COOM、-CONH₂、-CON(H)($C_{1 \sim 12}$ アルキル)、-CON($C_{1 \sim 12}$ アルキル)₂、-NH₂、-N(H)($C_{1 \sim 12}$ アルキル)、-N($C_{1 \sim 12}$ アルキル)₂、アンモニウム塩、 $C_{1 \sim 12}$ アルキル、又は(1又は複数のハロゲンによって1又は複数回置換された) $C_{1 \sim 12}$ アルキルによって1又は複数回置換された)フェニルである]から選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーである。

40

【0060】

例えば、少なくとも一部の基Rは、 $C_{1 \sim 24}$ アルキル又は $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニルから選択される。

【0061】

50

例えば、ポリグリセロール系抗微生物剤は、R が、（少なくとも 1 個の $\text{NR}'\text{R}'$ [式中、 R' は、それぞれ、 C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニルである] によって置換されている) C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニルから選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーである。

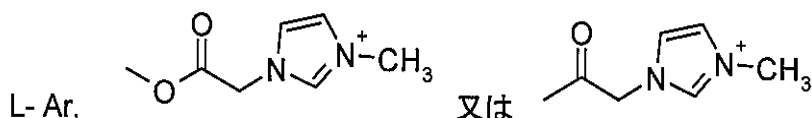
【0062】

例えば、ポリグリセロール系抗微生物剤は、R が、（少なくとも 1 個の $\text{NR}'\text{R}'$ 及び少なくとも 1 個のハロゲン、 $\text{OR}'\text{SO}_3\text{M}$ 、 SO_3H 、又は式 $\text{L}-\text{Ar}$ で表される基によって置換されている) C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニル、又は

【0063】

例えば、少なくとも 1 個の $\text{NR}'\text{R}'$ 及び少なくとも 1 個のハロゲン、 OR' 又は式
【化 16】

10



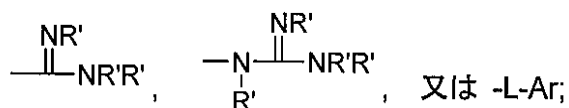
で表される基によって置換された C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニルから選択されるグリシドール誘導部分構造を含むポリマーである。

【0064】

例えば、R 基は、1 又は複数の酸素原子、イオウ原子、 $-\text{SO}-$ 又は $-\text{SO}_2-$ によって 1 又は複数回分断され、置換されていないか又は 1 もしくは複数のハロゲン、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{COOR}'$ 、 $-\text{COOM}$ 、 $-\text{CONR}'\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_3\text{M}$ 、 $-\text{SO}_3\text{H}$ 、ホスホン酸、ホスホン酸塩、アンモニウム塩又は式

20

【化 17】



で表される基によって 1 又は複数回置換されている C_{2-24} アルキル、 C_{2-24} アルキルカルボニル、 C_{3-24} アルケニル、及び C_{3-24} アルケニルカルボニル；

【0065】

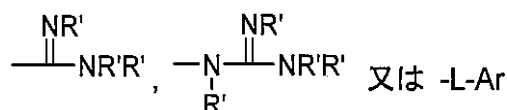
30

例えば置換されていないか又は 1 もしくは複数のハロゲン、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{COOR}'$ 、 $-\text{COOM}$ 、 $\text{CONR}'\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{R}'$ 、アンモニウム塩又は $-\text{L}-\text{Ar}$ によって 1 又は複数回置換されたそのような分断アルキル又はアルキルカルボニル；

【0066】

例えば 1 又は複数のハロゲン、 $-\text{OR}$ 、 $\text{CONR}'\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{R}'$ 、アンモニウム塩又は式

【化 18】



40

で表される基によって 1 又は複数回置換されたそのような分断アルキル又はアルキルカルボニル；から選択される。

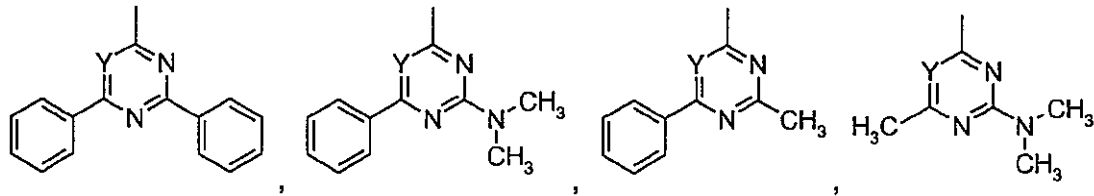
【0067】

例えば R は、ベンジル、F、Cl、Br もしくは I、又は F、Cl、Br 又は I の任意の組み合わせによって 1 ~ 5 回置換されたベンジル；

【0068】

以下の式

【化 19】



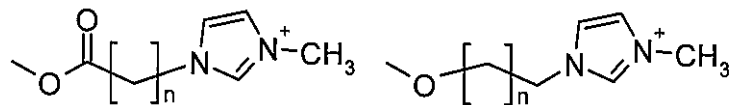
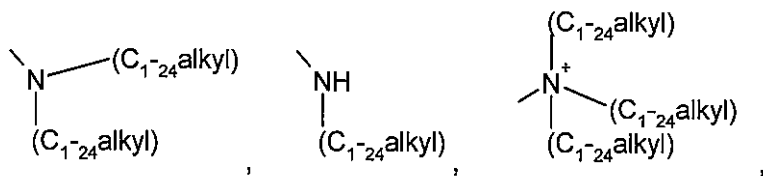
【0069】

〔ここで、Yは、CR'又はNである〕で表されるピラミジン又はトリアジンによって置換されたアルキル及びアルカノイル；

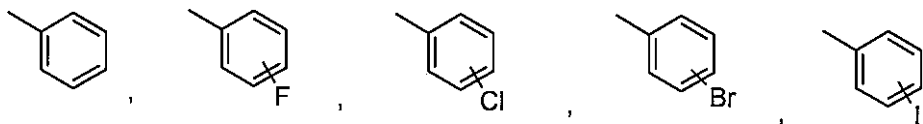
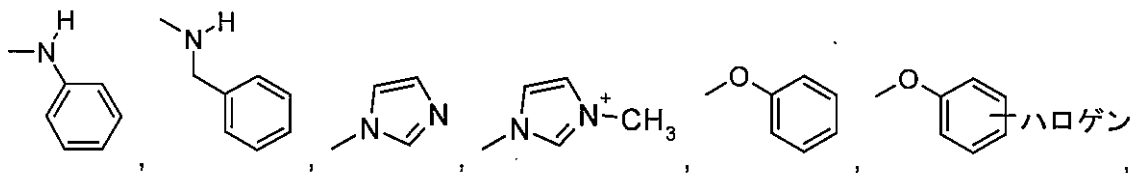
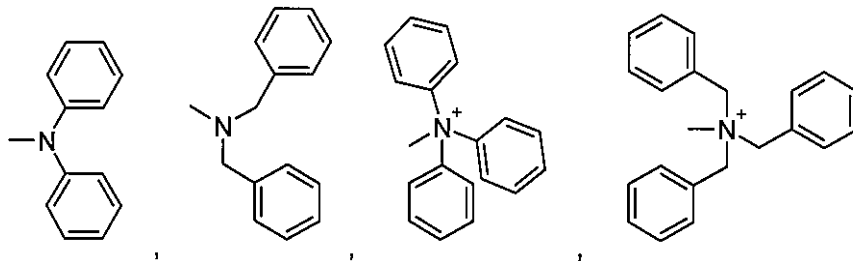
【0070】

1又は複数のNH₂、

【化 20】



ここでnは1~6である、



によって置換されたアルキル及びアルキルカルボニル；からなる群から選択され得る。

【0071】

例えば、Rは、以下の式

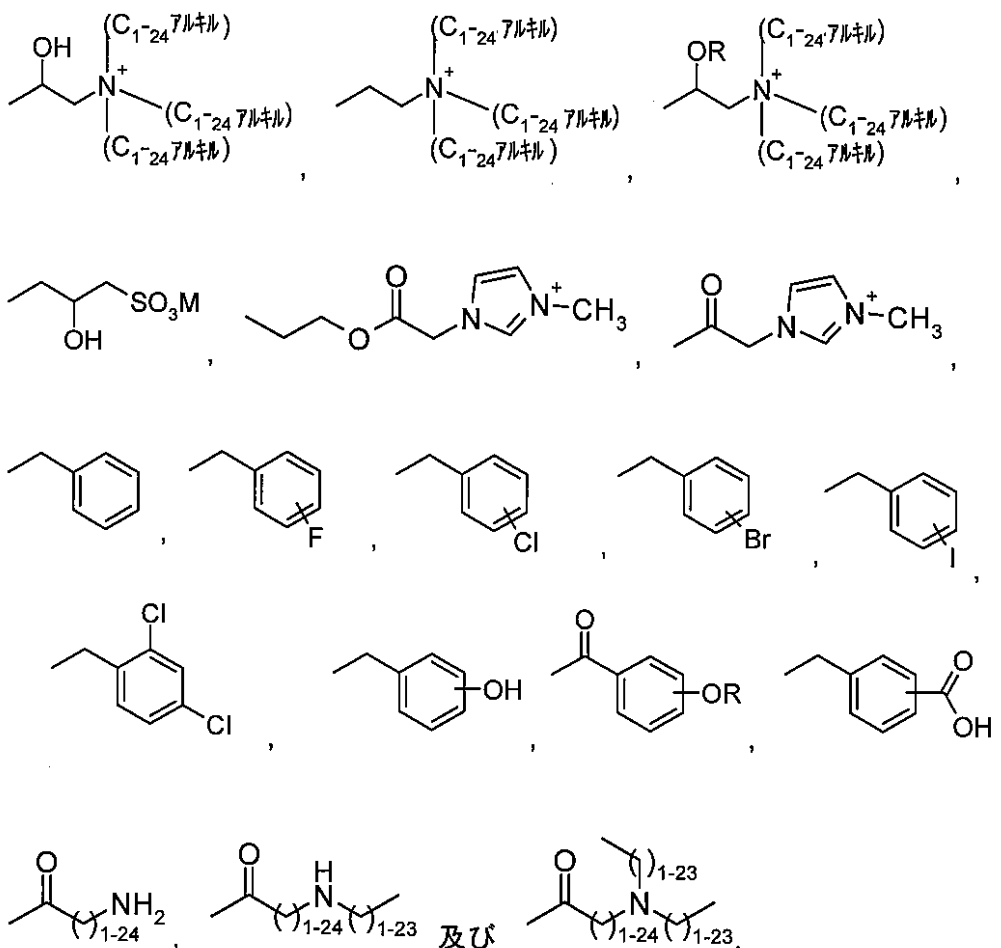
10

20

30

40

【化 2 1】



10

20

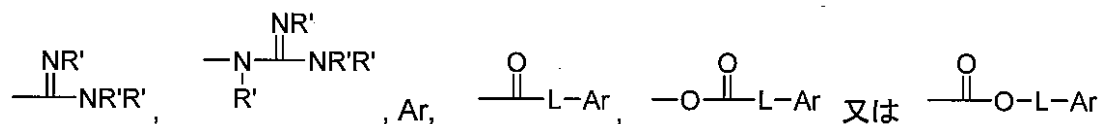
のもの、その異性体、並びにそのような式のものの同族体及びそのような異性体の同族体から選択され得る。

【0072】

30

本発明の一実施形態では、抗微生物ポリマーは、Rが、OR'、COOM、ハロゲン、CONR'R'、NR'R'、SO₃M、SO₃H、ホスホン酸、ホスホン酸塩、アンモニウム塩又は式

【化 2 2】



で表される基から選択される少なくとも2種の異なる基によって置換されているアルキル又はアルキルカルボニル基であるグリシドール誘導部分構造を含む。

40

【0073】

ポリグリセロール系抗微生物剤は、異なる部分構造によって置換されていることによって異なる活性がもたらされ得る。例えば、ポリグリセロールポリマーは、ポリマーを抗菌性にする置換基、及び、ポリマーを抗菌性にする他の置換基を有し得る。

【0074】

本発明の一実施形態では、単一ポリグリセロール抗微生物ポリマー又はコポリマーは、異なる基Rを有する少なくとも2種のグリコール誘導部分構造を含んでおり、一実施形態では、この異なる基は、異なる抗微生物活性をもたらす。

【0075】

別の実施形態では、単一R基は多官能性であり、例えば、アルカリ基が2種の部分構造

50

によって置換されており、一方の部分構造が抗細菌活性を付与し、他方の部分構造が抗菌活性を付与し得る。

【 0 0 7 6 】

別の実施形態では、少なくとも2種の異なる本発明ポリグリセロール抗微生物ポリマー又はコポリマーがブレンドされる。

【 0 0 7 7 】

別の実施形態では、本発明ポリグリセロール抗微生物ポリマー又はコポリマーは、別の抗微生物化合物とブレンドされる。

【 0 0 7 8 】

これらのグリセロール誘導部分構造は、対応するモノマーの重合又は共重合を経て、又はRがHとなっているグリセロール誘導部分構造を、それが標準化学によってポリマー骨格中に組み込まれた後に誘導体化して選択されたR基を導入することによってポリマー骨格中に組み込まれる。

10

【 0 0 7 9 】

ポリマー骨格中には他の基が含まれ得る。例えば、他のモノマーがコモノマーとして重合の際に組み込まれ得、例えば、アクリレート、スチレン、ビニルアルコール等との共重合である。また、本明細書に記載したグリセロール誘導部分構造と一緒に、別のR基を有している他のグリセロール誘導部分構造が存在して良い。

【 0 0 8 0 】

抗微生物性組成物のポリマー又はコポリマーの多くは、Frey, et.al., Advanced Materials, vol 12, 2, 2000 p235-239の方法により、グリシドール、グリシドールエーテル、グリシドールと1又は複数種のグリシドールエーテルとの混合物、又はグリシドールエーテル同士の混合物、及び、結果的にポリマー中に組み込まれる開始剤、例えば、ポリ-ヒドロキシアルコール、アミン、エナミン、ヒドロキシアルキルアミンから調製される。他のモノマーも本発明のコポリマーの調製に用いられ得、例えばエチレンオキシド、プロピレンオキシド又は他のエポキシ化合物も用いられ得る。

20

【 0 0 8 1 】

Rokicki, et. al., Journal of Green Chemistry 2005, 7, p 529-539には、4 - (ヒドロキシメチル) - 1, 3 - ジオキサランから出発するこのポリマーの別の合成が開示されている。遊離ヒドロキシル基をそのまま残す又はそれを公知の化学を用いて誘導体化することによって、例えば、本発明のペンダントエーテル、エステル、カルボナート、尿素基が作出され得る。このようにして導入されたペンダント基のさらなる改変が行われても良い。

30

【 0 0 8 2 】

例えば、ヒドロキシ基は、典型的には塩基の存在下に、適切な条件下でアルキルハロゲン化物、スルホナート、エポキシド等と反応させることによってアルキル化され得る。アルキル化は、ビニルエステル、アミド、ニトリル、スルホン等との反応におけるように、二重結合への付加によっても起こる。ヒドロキシ基は、酸ハロゲン化物、エステル、無水物、カルボン酸等と反応させることによってアシル化され得る。H e c k 反応やS u z u k i 反応のような各種の金属触媒反応もアミンを誘導体化することが知られている。

40

【 0 0 8 3 】

先行ポリマー又はコポリマーは、300 ~ 50,000 (例えば1,000 ~ 10,000) の分子量を有している。

【 0 0 8 4 】

工程のいずれの並べ替えによっても、先に記載した様々なR基置換基を有している様々なポリグリセロールポリマー及びコポリマーがもたらされ得る。例えば、グリシドールの重合により、多数の遊離ヒドロキシル基を有している分岐ポリマーが作出される。グリシドールと1又は複数種のグリシドールエーテルとの共重合により、ヒドロキシ基とペンダントエーテル基のいずれをも含有する分岐ポリマーが作出される。このようなポリマーのいずれかからの遊離ヒドロキシル基の一部は、この後、例えばアシルハライド (又はア

50

シルハライドの混合物)でアシル化され得る。残りの遊離ヒドロキシルはこの後にさらなる官能化によってアシル化又はアルキル化され得る。

【0085】

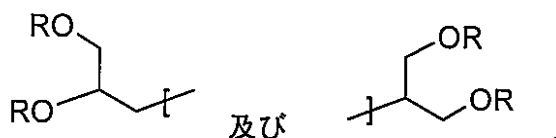
反応条件は、当然、生成した、誘導体化されたヒドロキシル基の量を決めることになる。例えば、ヒドロキシル基をアルキル化する場合、アルキルメシラート、すなわち反応に用いるアルキルメシラートの量は、組み込まれ得るアルキル化剤の量の上限を表すことになる。

【0086】

先に示したポリマー骨格のグリセロール誘導部分構造及び場合により存在する他のコモノマー又は開始剤に加えて、ポリマーは、

10

【化23】



のような、グリセロール誘導部分構造である末端基も含むことになる。

【0087】

本発明のポリマー及びコポリマーは、例えば、病原性グラム陽性菌及びグラム陰性菌に対して、皮膚叢の細菌に対して、さらには酵母及びカビに対しても明確な抗微生物作用を呈する。本発明のポリマー及びコポリマーは、したがって、皮膚及び粘膜、さらには皮膚付属器官(髪)の消毒、脱臭、さらには一般治療並びに抗微生物治療に適しており、例えば、手や傷の消毒に適している。

20

【0088】

本発明のポリマー及びコポリマーは、したがって、パーソナルケア調製品、例えば、シャンプー、入浴添加剤、ヘアケア調製品、液状石鹸及び固形石鹸(合成界面活性剤系、及び飽和及び/又は不飽和脂肪酸の塩)、ローション及びクリーム、デオドラント、他の水性又はアルコール性溶液(例えば肌用クレンジング液)、モイストクリーニングクロス、オイル、又はパウダー中の抗微生物活性物質及び防腐薬として適している。

【0089】

例えば、本発明のポリグリセロールポリマー及びコポリマーは、シャンプー中のフケ防止剤として効果がある。

30

【0090】

本発明は、したがって、少なくとも1種の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマーと、化粧品として許容される担体又は補佐剤とを含んでいるパーソナルケア調製物にも関する。

【0091】

本発明によるパーソナルケア調製物は、本発明組成物の全体重量を基準にして、0.01~15重量%(例えば、0.1~10重量%)のポリマー又はコポリマー、及び化粧品として許容される補佐剤を含有している。

40

【0092】

パーソナルケア調製物の剤形にもよるが、そのようなものは、抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマーに加えて、さらなる構成成分、例えば、金属イオン封鎖剤、着色剤、芳香オイル、増粘又は固形化剤(粘稠性調節剤)、皮膚軟化剤、UV吸収剤、皮膚保護剤、抗酸化剤、機械特性改善添加剤(例えば、ジカルボン酸、及び/又は $C_{14} \sim C_{22}$ 脂肪酸のアルミニウム塩、亜鉛塩、カルシウム塩又はマグネシウム塩)、さらには、場合によっては、防腐薬を含んでいる。

【0093】

本発明によるパーソナルケア調製物は、油中水型又は水中油型エマルジョン、アルコール性又はアルコール含有処方物、イオン性又は非イオン両親媒性リピドベシクルディスバ

50

ーション、ジェル、ソリッドスティック、又はエアロゾル処方物の形態であり得る。

【 0 0 9 4 】

油中水型又は水中油型エマルジョンとしては、化粧品として許容されるアジュバント（補佐剤）は、好ましくは、5～50%のオイル相、5～20%の乳化剤、及び30～90%の水を含有している。オイル相は、化粧品処方物に適するいずれのオイル、例えば、1又は複数種の炭化水素オイル、ワックス、天然オイル、シリコンオイル、脂肪酸エステル、又は脂肪アルコールを含み得る。好ましいモノ-又はポリオールは、エタノール、イソプロパノール、プロピレングリコール、ヘキシレングリコール、グリセリン及びソルビトールである。

【 0 0 9 5 】

本発明による化粧品処方物はいろいろな分野で使われる。例えば、以下の調製品：

- ・ スキンケア調製品、例えば、タブレット状石鹸又は液状石鹸の形態にあるスキン洗浄
- ・ クレンジング調製品、合成洗剤、又は洗浄ペースト剤；
- ・ 入浴用調製品、例えば、液状調製品（入浴用フォーム剤、乳液、シャワー用調製品）又は固形入浴用調製品（例えば、バスキューブ、バスソルト）；
- ・ スキンケア調製品、例えば、スキンエマルジョン、マルチエマルジョン又はスキンオイル；
- ・ 化粧用パーソナルケア調製品、例えば、デイクリーム又はパウダークリームの形態にあるフェイシャルメイクアップ、フェイスパウダー（ルーズ（粉状）又はプレスト（固形状））、ルージュ又はメイクアップクリーム；アイケア調製品、例えば、アイシャドー調製品、マスカラ、アイライナー、アイクリーム又はアイフィックスクリーム；リップケア調製品、例えば、リップスティック、リップグロス、リップコントロールペンシル；ネイルケア調製品、例えばネイルヴァーニッシュ、ネイルヴァーニッシュリムーバー、ネイルハードナー、又はキューティクルリムーバー；
- ・ 秘部衛生調製品、例えば、秘部洗浄ローション又は秘部スプレー；
- ・ フットケア調製品、例えば、フットバス（足湯用入浴剤）、フットパウダー、フットクリーム又はフットパルサム；特殊デオドラント及びアンティパースピラント（発汗抑制剤）又はカルス（たこ）除去調製品；
- ・ 光防護用調製品（例えば、サンミルク、サンローション、サンクリーム又はサンオイル）、サンブロック又はトロピカル調製品、プレタニング用調製品又はアフターサン用調製品；
- ・ スキンタンニング用調製品、例えば、セルフタンニング用クリーム；
- ・ デピグメンティング（脱色）用調製品、例えば、スキンプリーチ用調製品又はスキンライトニング（美白）用調製品；
- ・ 虫除け剤、例えば、虫除けオイル、ローション、スプレー又はスティック；
- ・ デオドラント、例えば、デオドラントスプレー、ポンプ動作式デオドラントスプレー、デオドラントジェル、デオドラントスティック又はデオドラントロールオン；
- ・ アンティパースピラント（発汗抑制剤）、例えば、アンティパースピラントスティック、クリーム又はロールオン；
- ・ 染み肌クレンジング・ケア調製品、例えば、合成洗浄剤（固形又は液状）、ピーリング又はスクラブ調製品、又はピーリングマスク；
- ・ 化学薬品形態の脱毛調製品（脱毛剤）、例えば、脱毛パウダー、液状脱毛調製品、クリーム-又はペースト-形態の脱毛調製品、ジェル形態又はエアロゾルフォームの脱毛調製品；
- ・ シェービング調製品、例えば、シェービング石鹸、泡状シェービングクリーム、非泡状シェービングクリーム、フォーム及びジェル、ドライシェービング用プリシェイブ調製品、アフターシェイブ調製品、又はアフターシェイブローション；
- ・ フレグランス（芳香）調製品、例えば、フレグランス（オーデコロン、オードトワレ、オードパルファム、パルファムドトワレ、パルファム）、パルファムオイル又はパルファムクリーム；

10

20

30

40

50

・ デンタルケア調製品、デンチャー（入れ歯）ケア調製品、及びマウスケア調製品、例えば、練り歯磨き、ジェル状歯磨き、歯磨き粉、マウスウォッシュコンセントレート、アンチ・ブランクマウスウォッシュ、デンチャークリーナー、又はデンチャー固定剤；

・ 化粧用ヘアトリートメント調製品、例えば、シャンプーとコンディショナーの形態にあるヘア洗浄調製品；ヘアケア調製品、例えば、プレトリートメント調製品、ヘアトニック、スタイリングクリーム、スタイリングジェル、ボマード、ヘアリンス、トリートメントパック、インテンシブヘアトリートメント；ヘアストラクチャリング調製品、例えばパーマメントウェーブヘアウェーブ用調製品（ホットウェーブ、マイルドウェーブ、コールドウェーブ）、縮毛矯正用調製品、液状ヘアセッティング用調製品、ヘアフォーム、ヘアスプレー；ブリーチング調製品、例えば、過酸化水素液、ライトニング（美白）シャンプー、ブリーチングクリーム、ブリーチングパウダー、ブリーチングペースト又はブリーチングオイル；一時的、半永久的又は永久的ヘア着色剤、自己酸化染料含有調製品、又はヘナ又はカモミールのような天然ヘア着色剤；

が考えられる。

【 0 0 9 6 】

以下は、本発明の抗微生物ポリグリセロール含有のいくつかの処方物の例を示すものである。明らかに、これらのものは、単に、簡単で、基本的な処方物であって、いろいろな濃度の本発明の抗微生物ポリグリセロールが容易に組み込まれ得る、同じような様々な処方物が、当技術分野では知られている。

【 0 0 9 7 】

抗微生物石鹸は、例えば、以下の組成：

0 . 0 1 ~ 5 重量 % の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマー、

0 . 3 ~ 1 重量 % の二酸化チタン、

1 ~ 1 0 重量 % のステアリン酸、

加えて 1 0 0 % になる石鹸基剤（例えば、獣脂肪酸又はココナッツ脂肪酸のナトリウム塩、又はグリセロール）、

を有している。

【 0 0 9 8 】

シャンプーは、例えば、以下の組成：

0 . 0 1 ~ 5 重量 % の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマー、

1 2 . 0 重量 % のナトリウムラウレス - 2 - スルファート、

4 . 0 重量 % のコクアミドプロピルベタイン、

3 . 0 重量 % の NaCl、及び

加えて 1 0 0 % になる水、

を有している。

【 0 0 9 9 】

デオドラントは、例えば、以下の組成：

0 . 0 1 ~ 5 重量 % の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマー、

6 0 重量 % のエタノール、

0 . 3 重量 % のパルファムオイル、及び

加えて 1 0 0 % になる水、

を有している。

【 0 1 0 0 】

本発明は、組成物の全体重量を基準にして、0 . 0 1 ~ 1 5 重量 % の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマーと、口腔用として許容される補佐剤とを含有している口腔用組成物にも関する。

【 0 1 0 1 】

口腔用組成物の例：

1 0 重量 % のソルビトール、

1 0 重量 % のグリセリン、

10

20

30

40

50

15重量%のエタノール、
15重量%のプロピレングリコール、
0.5重量%のナトリウムラウリルスルファート、
0.25重量%のナトリウムメチルコシルタウラート、
0.25重量%のポリオキシプロピレン/ポリオキシエチレンブロックコポリマー、
0.10重量%のペパーミント芳香剤、
0.1～0.5重量%の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマー、及び
48.6重量%の水。

【0102】

本発明による口腔用組成物は、例えば、ジェル、ペースト、クリーム、又は水性調製品（マウスウォッシュ）の形態であり得る。

10

【0103】

本発明による口腔用組成物は、虫歯の生成に対して効果があるフッ素イオンを放出する化合物、例えばフッ化物無機塩（例えば、フッ化ナトリウム、カリウム、アンモニウム又はカルシウム）又はフッ化物有機塩（例えば、フッ化アミン（これは、商品名OLAFLUORで知られている））を含み得る。

【0104】

本発明の抗微生物性ポリグリセロールポリマー又はコポリマーは、繊維布地材料を処理するのに、特に防腐するのにも適している。そのような材料は、染められていない、染められた、又は印刷された布地材料、例えば、絹、羊毛、ポリアミド又はポリウレタン、及び特にあらゆる種類のセルロース繊維材料である。そのような布地材料には、例えば、天然セルロース繊維（例えば綿）、リネン、ジュート及びアサ、並びにセルロース及び再生セルロースがある。

20

【0105】

本発明の抗微生物性ポリグリセロールポリマー又はコポリマーは、プラスチック、例えば、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリウレタン、ポリエステル、ポリアミド、ポリカーボネート、ラテックス等を処理するのに、特に抗微生物特性を付与するつまり防腐するのにも適している。使用分野は、したがって、例えば、床仕上げ、プラスチックコーティング、プラスチック製収容器及びパッケージング；台所及び浴室用品（例えば、ブラシ、シャワーカーテン、スポンジ、バスマット）、ラテックス、濾過材（空気フィルター及び水フィルター）、医療の分野で使われるプラスチック製物品（例えば、ドレッシング材、注射器、カテーテル等の、いわゆる「医療デバイス」、グローブ、及びマットレス）である。

30

【0106】

本発明の抗微生物性ポリグリセロールポリマー又はコポリマーは、コーティング、潤滑油等の工業用処方物等を処理するのに、特に抗微生物特性を付与するつまり防腐するのにも適している。

【0107】

紙、例えば衛生用品に使われている紙も、本発明のポリグリセロールポリマー又はコポリマーを用いて抗微生物特性が付与され得る。

40

【0108】

また、不織布（例えば、ナプキン/ダイヤパー、衛生タオル、下着ライナー）、及び衛生用、家庭用の布地も本発明に従って抗微生物特性が付与され得る。

【0109】

本発明の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマーは、洗濯及び洗浄処方品中にも、例えば液状又は粉粒状洗濯剤又は柔化剤中にも用いられ得る。

【0110】

抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマーは、硬表面を洗浄・消毒するための家庭用及び一般用洗浄剤中にも用いられ得る。

【0111】

50

例えば、洗浄用調製品は以下の組成：

0.01～5重量%の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマー

3.0重量%のオクチルアルコール4EO

1.3重量%の脂肪アルコールC₈～C₁₀ポリグルコシド

3.0重量%のイソプロパノール

加えて100%になる水

を有している。

【0112】

化粧品製造物及び家庭用品製造物の防腐に加えて、工業用製造物の防腐、工業用製造物への抗微生物特性付与、及び工業処理での殺生物剤としての使用が、例えば、紙処理で（特に紙処理液で）、デンプン又はセルロース誘導体からできている印刷用シックナーで、表面コーティングで、及びペイントでもあり得る。

10

【0113】

本発明の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマーは、木材の抗微生物処理にも、また皮革の抗微生物処理、皮革の防腐、及び皮革に抗微生物特性を付与するのにも適している。

【0114】

本発明による化合物は、微生物による損傷から化粧品製造物及び家庭用品製造物を防護するのにも適している。

【0115】

同時係属出願の60/720,662（これは、参照によりその全体が本明細書に組み込まれる）には、コーティング又は膜中における生物汚損から表面を防護するのに有用な化合物が開示されている。そのような表面としては、海洋環境（淡水環境、汽水環境及び塩水環境が挙げられる）と接触している表面、例えば、船の船殻、甲板の表面、又は循環水又は通過水システム中の管内部表面が挙げられる。他の表面、例えば、雨水に曝される壁、シャワー室の壁、屋根、樋、プールエリア、サウナ室、地下室又はガレージ等の湿った環境に曝されている床及び壁、さらには機具納屋及び屋外家具も同様に生物汚損を受け易いものである。

20

【0116】

本発明の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマーは、生物汚損を防護するのに、つまり同時係属出願の60/720,662に記載されている、表面への微生物蓄積を当該の物品又は物品の表面に抗微生物性エチレンイミンポリマー又はコポリマーを組み込むことによって又はそのような表面に抗微生物性エチレンイミンポリマー又はコポリマーを直接に又は上記同時係属出願に記載されているようにコーティング又は膜の一部として適用することによって解消又は防除するのにも有用である。

30

【0117】

膜又はコーティングの一部として適用される場合は、本発明の抗微生物ポリグリセロールポリマー又はコポリマーは組成物の一部となるが、この組成物はまたバインダーを含んでいる。

【0118】

バインダーは、本発明の抗微生物剤と適合性があるいずれのポリマー又はオリゴマーでもあり得る。バインダーは、抗汚損組成物の調製の前はポリマー又はオリゴマーの形態であり得るが、調製の間の、又は基材への適用の後も含めた調製の後の重合によっても生成され得る。一部の用途では、例えば一部のコーティング用途では、抗汚損組成物のオリゴマー又はポリマーを適用の後に架橋するのが望ましくあり得る。

40

【0119】

本発明で用いられるバインダーという用語には、木材、プラスチック、ガラス等の表面の保護で工業的に用いられているグリコール、油、ワックス及び界面活性剤のような物質も含まれる。例としては、木材防水剤、ビニール保護剤、保護用ワックス等が挙げられる。

50

【 0 1 2 0 】

組成物はコーティング又は膜であり得る。組成物が、例えば、接着剤の使用によって、又はカレンダー加工及び共押出を含めた溶融加工によって表面に適用される熱可塑性の膜である場合は、バインダーは、その膜を調製するのに用いた熱可塑性のポリマーマトリックスとする。

【 0 1 2 1 】

組成物がコーティングである場合は、それは、溶液又は懸濁液、ペースト、ジェル、油として適用され得、またコーティング組成物は、固形物（例えば粉状コーティング）であり得、これは、続いて、熱、UV光又は他の方法によって硬化される。

【 0 1 2 2 】

本発明の組成物はコーティング又は膜であり得るので、バインダーは、コーティング処方物又は膜調製物中に用いられているいずれのポリマーからも成り得る。例えば、バインダーは、熱硬化ポリマー、熱可塑ポリマー、エラストマーポリマー、既架橋ポリマー、又は架橋性ポリマーである。

【 0 1 2 3 】

熱硬化ポリマー、熱可塑ポリマー、エラストマーポリマー、既架橋ポリマー、又は架橋性ポリマーとしては、ポリオレフィン、ポリアミド、ポリウレタン、ポリアクリレート、ポリアクリルアミド、ポリカーボネート、ポリスチレン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリエステル、PVC等のハロゲン化ビニルポリマー、天然ゴム及び合成ゴム、アルキド樹脂、エポキシ樹脂、不飽和ポリエステル、不飽和ポリアミド、ポリイミド、ケイ素含有ポリマー及びカルバメートポリマー、フッ素化ポリマー、置換アクリルエステル（例えば、エポキシアクリレートからの）誘導架橋アクリル樹脂、ウレタンアクリレート、又はポリエステルアクリレートが挙げられる。ポリマーは、ブレンド物、及び前掲の化学材料のコポリマーであっても良い。

【 0 1 2 4 】

本発明では、生体適合コーティングポリマー、例えば、ポリ[- アルコキシアルカノアート - コ - 3 - ヒドロキシアルケノアート] (P H A E) ポリエステル [Geiger et. al. Polymer Bulletin 52, 65-70 (2004)] もバインダーとして役立ち得る。

【 0 1 2 5 】

アルキド樹脂、ポリエステル、ポリウレタン、エポキシ樹脂、シリコン含有ポリマー、フッ素化ポリマー並びに酢酸ビニルポリマー、ビニルアルコールポリマー及びビニルアミンポリマーは、本発明で有用な一般的なコーティングバインダーの非限定的な例である。他のコーティングバインダーは、当然、本発明の一部である。

【 0 1 2 6 】

コーティングは、多くの場合、例えば、メラミン樹脂、尿素樹脂、イソシアネート、イソシアヌレート、ポリイソシアネート、エポキシ樹脂、無水物、ポリ酸及びアミンであって、促進剤を用いて又は用いずに架橋されている。

【 0 1 2 7 】

本発明の組成物は、例えば、生物繁殖に好適な条件にさらされる表面に塗布されるコーティングである。そのようなコーティング中に本発明の抗微生物性エチレンイミンポリマー又はコポリマーが存在していると、表面に生物が付着するのを防ぐだろう。

【 0 1 2 8 】

本発明の抗微生物ポリマー又はコポリマーは、海洋ゲルコート、セラック、ヴァーニッシュ、ラッカー又はペイントのような全体コーティングつまりペイント処方物の一部であって良いし、あるいはこの抗汚損組成物は、単に、本発明のポリマーとバインダーとを含んでいて良いし、あるいは、本発明のポリマー、バインダー、及び担体物質を含んでいて良い。そのようなコーティング処方物又はコーティング用途で遭遇される他の添加剤は、本発明の用途でも、至適な使用を見出すであろうことが予測される。

【 0 1 2 9 】

コーティングは、溶剤系又は水系であり得る。水系コーティングは、典型的には、より

10

20

30

40

50

環境に優しいとみなされている。

【 0 1 3 0 】

コーティングは、例えば、本発明のポリマーとバインダーとの水性ディスパージョン、あるいは水系のコーティング又はペイントである。例えば、コーティングは、本発明のポリマーと、アクリル、メタクリル又はアクリルアミドポリマー又はコポリマーとの、又はポリ[- アルコキシアルカノアート - コ - 3 - ヒドロキシアルケノアート] ポリエステルとの水性ディスパージョンを含む。

【 0 1 3 1 】

コーティングは、例えば、海洋用途で使われているコーティング又はヴァーニッシュである。

10

【 0 1 3 2 】

コーティングシステムは、保護コーティング、透明コート、又は以前にコートされている物品に塗布されている保護ワックスのような、既にコートされている表面に塗布され得る。

【 0 1 3 3 】

コーティングシステムとしては、海洋コーティングシステム、木材コーティングシステム、他の金属コーティングシステム、並びにプラスチックコーティングシステム及びセラミックスコーティングシステムが挙げられる。海洋コーティングシステムの例としては、不飽和ポリエステル、スチレン、及び触媒を含んでいるゲルコートが挙げられる。

【 0 1 3 4 】

コーティングは、例えばハウスペイント、あるいは他の装飾用又は防護用ペイントである。コーティングは、セメント、コンクリート又は他のレンガ物品に塗布されるペイント又は他のコーティングであり得る。コーティングは、地下室用又は基礎用としての防水加工材であり得る。

20

【 0 1 3 5 】

コーティング組成物は、表面には、スピンコーティング、ディップコーティング、スプレーコーティング、ドロダウンを含むいずれの慣用の手段によっても塗布され、あるいはブラシ、ローラー又は他のアプリーケーターによっても塗布される。

【 0 1 3 6 】

コーティング又は膜の厚みは用途に応じて変わるものであり、限られた試験の後に当業者には容易に分かるものである。

30

【 0 1 3 7 】

組成物は、保護用ラミネートフィルムの形態であり得る。

【 0 1 3 8 】

そのようなフィルムは、典型的には、熱硬化ポリマー、熱可塑ポリマー、エラストマーポリマー、又は架橋されたポリマーを含む。そのようなポリマーの例としては、限定するものではないが、ポリオレフィン、ポリアミド、ポリウレタン、ポリアクリレート、ポリアクリルアミド、ポリカーボネート、ポリスチレン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリエステル、PVC等のハロゲン化ビニルポリマー、天然ゴム及び合成ゴム、アルキド樹脂、エポキシ樹脂、不飽和ポリエステル、不飽和ポリアミド、ポリイミド、フッ素化ポリマー、ケイ素含有ポリマー、及びカルバメートポリマーが挙げられる。ポリマーは、ブレンド物、上記した化学物質のコポリマーであっても良い。

40

【 0 1 3 9 】

抗汚損組成物が予形成フィルムである場合は、これは、例えば、接着剤を用いることで、あるいは表面に共押出することで表面に適用される。予形成フィルムは、封止剤又はコーキング剤の使用を必要とし得る固定材によって機械的にも張り付けされ得、この場合は本発明のエステルがまた有利に利用され得る。

【 0 1 4 0 】

プラスチックフィルムは熱によっても張り付けされ得るものであり、そのようなものとしては、カレンダー加工、溶融張り付け、及びシュリンクラッピングが挙げられる。

50

【 0 1 4 1 】

本組成物は、ポリッシュ（光沢）剤（例えば家具ポリッシュ剤）又はグリコール又はミネラルオイルディスパージョンのような分散剤又は界面活性剤処方物あるいは例えば木材の保護で用いられる他の処方物の一部分であり得る。

【 0 1 4 2 】

有用な界面活性剤の例としては、限定するものではないが、ポリオキシエチレンをベースとする界面活性物質（例えば、ポリオキシエチレンソルビタンテトラオレアート（P S T）、ポリオキシエチレンソルビトールヘキサオレアート（P S H）、ポリオキシエチレン6トリデシルエーテル、ポリオキシエチレン12トリデシルエーテル、ポリオキシエチレン18トリデシルエーテルが挙げられる）、T W E E N R T M界面活性剤、T R I T O N R T M界面活性剤、及びポリオキシエチレン-ポリオキシプロピレンコポリマー〔例えば、P L U R O N I C R T M及びP O L O X A M E R R T M製品シリーズ（B A S F社から販売）〕が挙げられる。他のマトリックス形成成分としては、デキストラン、線状P E G分子（M W 5 0 0 ~ 5 , 0 0 0 , 0 0 0）、星状P E G分子、櫛状及びデンドリマー状高分岐P E G分子、並びに類似の線状、星状、及びデンドリマー状ポリアミンポリマー、さらには各種の炭酸系界面活性剤、過フッ素系界面活性剤（例えば、D U P O N T Z O N Y L R T Mフルオロ界面活性剤）、及びシリコーン系界面活性剤（例えば、ジメチルシロキサン-エチレンオキシドブロックコポリマー）が挙げられる。

【 0 1 4 3 】

本発明の抗微生物性組成物の多彩な用途を記載したが、組成物は、他の添加剤、例えば、抗酸化剤、U V吸収剤、立体障害アミン系化合物、ホスファイト又はホスホナイト系化合物、ベンゾフラン-2-オン系化合物、イオウ系相乗作用剤、ポリアミド系安定剤、ステアリン酸金属塩系化合物、造核剤、増量剤、補強剤、滑剤、乳化剤、染料、顔料、分散剤、他の光学的白化剤、難燃剤、帯電防止剤、発泡剤、さらには以下に列挙されているような類似の物質、又はこれらの混合物を含有していても良い。

【 0 1 4 4 】

基材は、無機又は有機基材、例えば、金属又は金属合金；先に記載した熱可塑性、エラストマー性、既架橋性又は架橋性ポリマー；木材又はゴム等の天然高分子；セラミック材；ガラス；皮革又は他の布地であり得る。

【 0 1 4 5 】

基材は、例えば、シリカ、二酸化シリコン、酸化チタン、酸化アルミニウム、酸化鉄、炭素、ケイ素、各種のケイ酸塩及びゾル-ゲル等の非金属無機物表面、レンガ、さらにはファイバーグラス及びプラスチック挽材（ポリマーと、木材かんなくず、木材粉、又は他の木材粒子とのブレンド物）等の複合材であり得る。

【 0 1 4 6 】

無機又は有機基材は、例えば、金属又は金属合金、熱可塑性、エラストマー性、既架橋性又は架橋性ポリマー、セラミック材、又はガラスである。

【 0 1 4 7 】

基材は、各層が同じ又は異なる成分からなる多層物品であり得る。コートされ又はラミネートされる表面は、コーティング又はラミネートがすでに適用されている曝された表面であって良い。

【 0 1 4 8 】

コートされる又はラミネートされる無機又は有機基材は、いずれの固形物形態にあっても良い。例えば、ポリマー基材は、フィルムの状態にあるプラスチック、射出成型物品、押出製造品、繊維、フェルト、又は織布であり得る。

【 0 1 4 9 】

例えば、建築に、あるいはサイジング材、鼻隠板や、メールボックス（郵便箱）等の耐久部材の製造に使われる成型又は押出ポリマー物品は、すべて、本発明の安定剤補充による方法から利益を受け得る。

【 0 1 5 0 】

本発明の方法から利益を受けるであろうプラスチックとしては、限定するものではないが、建築に使われる、又は耐久部材又は機械部品の製造に使われるプラスチックが挙げられ、例えば屋外家具、ポート、サイジング、屋根、窓ガラス、保護膜、絵画磁器、封止材、プラスチック製挽材のような複合材及びファイバー補強複合材、ディスプレイに使われているフィルムを含めた機能性フィルム、並びに合成繊維から作製された日よけのような物品、画布又は帆に使われているような布地、さらには屋外マッティングのようなゴム製物品、及び本開示に引用されている他の使用が挙げられる。例としては、ポリプロピレン、ポリエチレン、PVC、POM、ポリスルホン、スチレン系、ポリアミド、ウレタン、ポリエステル、ポリカーボネート、アクリルポリマー、ブタジエン、熱可塑性ポリオレフィン、アイオノマー、不飽和ポリエステル、並びにABS、SAN及びPC/ABSを含めたポリマー樹脂ブレンド物が挙げられる。

10

【0151】

本発明のポリグリセロールポリマー及びコポリマーは、有用な植物体（例えば農業の植物体、園芸の植物体、及び森林の植物体）、植物体部分、及び種子を病気及び腐敗から防護するのに効果がある。例えば、本発明は、また、有用な植物体、その所在場所、又はその繁殖物に、少なくとも1種の本発明のポリグリセロールポリマー及びコポリマーを含む組成物を適用することを含む方法を提供する。そのような組成物は、葉処理、土壌処理及び種子処理殺菌剤として用いられ得る。

【0152】

本発明の組成物は、各種の有用な植物の植物体に発生するあるいは植物体部分（果実、花、葉、茎、塊茎、根）に発生する植物病原性微生物を阻害又は破壊し得る。本発明組成物は、菌、有用植物体、その所在場所、その繁殖物、自生ライフサイクルから採取された植物由来天然物、及び/又はその加工された形体物、あるいは菌の攻撃によって脅かされている工業用材を、有効量の組成物で処理することで適用される。

20

【0153】

本発明による組成物は、有用植物体、その繁殖物、自生ライフサイクルから採取された植物体及び/又は動物由来天然物、及び/又はその加工された形体物、又は工業用材の菌による感染の前又は後に適用され得る。

【0154】

本発明の組成物は、様々な有用植物体又はその種子に存在する各種の菌、特に農場作物（例えば、ジャガイモ、タバコ及びサトウダイコン、さらにはコムギ、ライムギ、オオムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシ、シバ、ワタ、ダイズ、セイヨウアブラナ、パルスクロップ（豆類）、ヒマワリ、コーヒーの木、サトウキビ）に存在する菌、園芸植物及び蔓植物果実並びに観葉植物に存在する菌、野菜（例えばキュウリ、インゲンマメ及びウリ科植物）に存在する菌を防除するのに有望である。

30

【0155】

植物体に適用する場合は、本発明のポリグリセロールポリマー及びコポリマーは、ポリマー又はコポリマーを1~5000g a.i./ha、例えば2~2000g a.i./ha、例えば5~2000g a.i./ha、例えば10~1000g a.i./ha、例えば50、75、100、200、250、500、800、1000、1500g a.i./haの量で適用する（a.i.: active ingredient; 活性成分、ha: ヘクタール）。

40

【0156】

実際の農場では施用量は所望する効果の程度によって左右されるものであって、典型的には、1ヘクタール当たり抗微生物剤の全体量は20~4000gである。

【0157】

種子を処理する場合は、種子1kg当たり本発明ポリグリセロールポリマー及びコポリマーを0.001~50g（例えば0.01~10g）の量が、一般には、十分である。

【0158】

本発明のポリグリセロールポリマー及びコポリマーを含んでいる組成物はいずれの慣用

50

の剤形でも用いられ得るものであり、例えば、乾燥種子処理用の粉剤（D S : powder）、種子処理用のエマルジョン製剤（E S : emulsion）、種子処理用のフロアブル製剤（F S : flowable concentrate）、種子処理用の液剤（L S : solution）、種子処理用の水和剤（W S : water dispersible powder）、種子処理用のマイクロカプセル製剤（C F : capsule suspension）、種子処理用のゲル剤（G F : gel）、乳剤（E C : emulsion concentrate）、懸濁製剤（S C : suspension concentrate）、サスポエマルジョン製剤（S E : suspo-emulsion）、マイクロカプセル製剤（C S : capsule suspension）、顆粒水和剤（W G : water dispersible granule）、顆粒エマルジョン製剤（E G : emulsifiable granule）、エマルジョン（油中水型）製剤（E O : emulsion, water in oil）、エマルジョン（水中油型）製剤（E W : emulsion, oil in water）、マイクロエマルジョン製剤（M E : micro-emulsion）、デイスパージョン油剤（O D : oil dispersion）、フロアブル油剤（O F : oil miscible flowable）、油剤（O L : oil miscible liquid）、液剤（S L : soluble concentrate）、超微量懸濁製剤（S U : ultra-low volume suspension）、超微量溶液剤（U L : ultra-low volume liquid）、工業用製剤（T K : technical concentrate）、分散製剤（D C : dispersible concentrate）、水和剤（W P : wettable powder）、又は農薬として許容される補佐剤との組み合わせにある技術的に実現可能な任意の製剤の形態で用いられ得る。

【 0 1 5 9 】

このような組成物は、通常の方法で、例えば、活性成分を適切な製剤用不活性物（希釈剤、溶剤、増量剤さらには場合により他の製剤用成分例えば界面活性剤、殺生物剤、凍結防止剤、粘着付与剤、増粘剤並びに補佐効果をもたらす化合物）と混合することで製造され得る。例えば、水分散製剤 [water dispersible concentrates]（例えば、E C、S C、D C、O D、S E、E W、E O等）、水和粉剤 [wetable powders] 及び水和顆粒剤 [wetable granules] のようなスプレー形態で施用される製剤は、湿潤剤や分散剤のような界面活性剤、及び、補佐効果をもたらす他の化合物を典型的に含有している。

【 0 1 6 0 】

種子ドレッシング用処方物は、本発明物と希釈剤との組み合わせを適切な種子ドレッシング用処方物剤形中に用いて（例えば、水性懸濁液として、あるいは種子への付着が良好な乾燥粉粒形態で）それ自体公知の方法で種子に適用される。当技術分野ではそのような種子ドレッシング用処方物は公知である。例えば遅速放出性カプセル又はマイクロカプセルとしては、種子ドレッシング用処方物は、単一活性成分、又は活性成分の組み合わせを、カプセル化された剤形中に含有し得る。

【 0 1 6 1 】

一般には、製剤には、0 . 0 1 ~ 9 0 重量%の少なくとも1種のポリグリセロールポリマー及びコポリマー、0 ~ 2 0 %の農薬として許容される界面活性剤、及び1 0 ~ 9 9 . 9 9 %の固体又は液体製剤用不活性物及び補佐剤、並びに場合により他の活性添加剤（特に殺微生物剤又は防腐剤等）が含まれている。組成物のコンセンレート形態は、一般には、約2 ~ 8 0 重量%（例えば、約5 ~ 7 0 重量%）の活性添加剤を全体として含有している。製剤の施用形態は、例えば、0 . 0 1 ~ 2 0 重量%（例えば0 . 0 1 ~ 5 重量%）の活性成分を含有している。

【 0 1 6 2 】

上記植物体防護用製剤の調製方法は周知であり、例えば、公開された米国特許出願公開第2 0 0 7 / 0 2 6 5 2 6 7号明細書（すでに参照により組み込まれている）に記載されている。

【 0 1 6 3 】

本発明の特定の実施形態は、したがって、

【 0 1 6 4 】

処方物又は方法に本発明ポリマー又はコポリマーの有効量を加えることを含む、建築用プラスチック、建築用コーティング、他の建築用材料、ホームケア処方品、パーソナルケア処方品、植物体、農場産物、工業用処方品を防護するための方法、つまり微生物の作用に

対抗する技術的方法に関し；

【 0 1 6 5 】

フケから頭皮を防護することを含む、微生物の作用から皮膚、粘膜及び皮膚付属器官を防護するための方法に関し、該方法は、本発明ポリマー又はコポリマーの有効量を含んでいる調製物を適用することを含み；

【 0 1 6 6 】

本発明ポリマー又はコポリマーの有効量、又は本発明ポリマー又はコポリマーの有効量を含んでいる組成物を組み込むこと又は適用することを含む、微生物の作用から紙、木材、皮革、合成布地又は綿のような天然布地を防護するための方法に関し；

【 0 1 6 7 】

本発明ポリマー又はコポリマーの有効量を含んでいる調製物を適用することを含む、硬表面の清浄・消毒方法に関し；

【 0 1 6 8 】

物品又は物品の表面に本発明の抗微生物ポリマー又はコポリマーを組み込むことを含む、又はそのような表面に直接又はコーティング又は膜の一部として抗微生物性エチレンイミンポリマー又はコポリマーを適用することによる、物品の生物汚損を防止するための方法に関する。

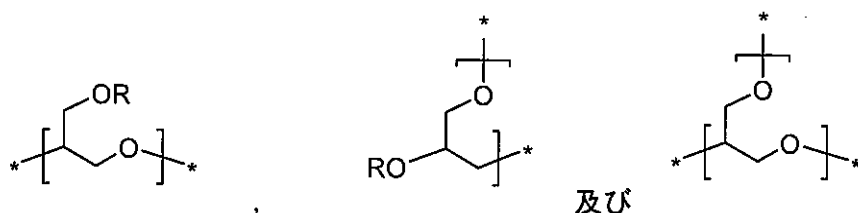
【 0 1 6 9 】

他の建築用材料としては、木材のほかに、金属、紙、ガラス、セラミック、コーティング、プラスチックさらには布地、コンクリートのような建材、セメント、接着材、コーキング材、天然木材と合成木材の複合木材等が挙げられる。

【 0 1 7 0 】

一部の本発明組成物ポリグリセロール抗微生物剤は公知の化合物であるが、多くは新規である。この新規なポリマーは、先に記載した反応に標準的な誘導体化反応を組み合わせた組み合わせから調製される。例えば、新規な化合物としては、ポリマーの骨格中に、グリセロール誘導部分構造

【化 2 4】



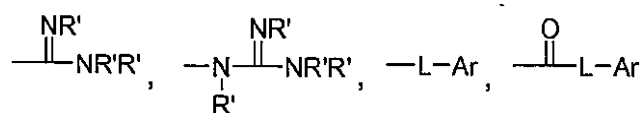
30

【 0 1 7 1 】

(式中、基 R は、

a) 1 又は複数の - O - 、 - N (R ') - 、 - C O N (R ') - 、 - S O - 又は - S O₂ - によって 1 又は複数回分断されていて、及び / 又は、 1 又は複数の - O R ' 、 - C O N R ' R ' 、 - N R ' R ' 、アンモニウム塩、式

【化 2 5】



40

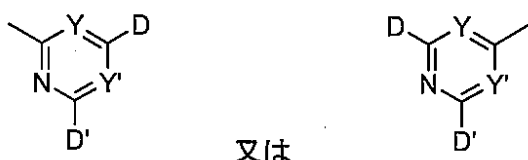
で表される基、又は基 - S i (G)₃ [式中、G は、それぞれ独立して、ヒドロキシル、C₁ ~ 4 アルキル又は C₁ ~ 4 アルコキシである] によって 1 又は複数回置換されている C₁ ~ 2₄ アルキル、C₃ ~ 2₄ アルケニル、C₁ ~ 2₄ アルキルカルボニル又は C₃ ~ 2₄ アルケニルカルボニル；

b) 置換されていないか又は 1 もしくは複数の基 R ' 、 - O R ' 、 - C O O R ' 、 - C O O M 、 - S O₃ M 、 - S O₃ H 、ホスホン酸、ハロゲン、- C O N R ' R ' 、 - N R ' R ' 、ホスホン酸塩又はアンモニウム塩によって 1 又は複数回置換されている、

50

式

【化 2 6】



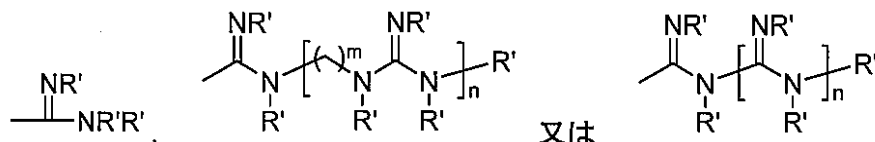
【 0 1 7 2】

[式中、Y 及び Y' は、独立して、N、C - R'、C - OR' 又は C - NR' R' であり、D 及び D' は、独立して、R'、- OR' 又は - NR' R' である] で表されるヘテロ環も含めた C₁ - 9 飽和又は不飽和ヘテロ環；及び

10

c) 式

【化 2 7】



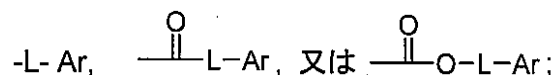
【 0 1 7 3】

[式中、m 及び n は、独立して、1 ~ 12 の数、好ましくは 1、2、3、4、5 又は 6 である] で表される基；

20

[上記式中、R' は、それぞれ、他のいずれの R' から独立して、水素；基

【化 2 8】



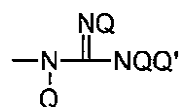
【 0 1 7 4】

C₁ - 24 アルキル、C₃ - 24 アルケニル、C₃ - 6 シクロアルキル又は C₁ - 24 アルキルカルボニル（これらは分断されていないか又は 1 もしくは複数の酸素原子、イオウ原子、カルボニル、- COO -、- CONH -、- NH -、- CON (C₁ - 24 アルキル) - 又は - N (C₁ - 24 アルキル) - によって 1 又は複数回分断されていて、この非分断又は分断アルキル、アルケニル、シクロアルキル又はアルキルカルボニルは置換されていないか又はハロゲン、- OH、C₂ - 24 アルキルカルボニル、C₁ - 24 アルコキシ、C₂ - 24 アルキルカルボキシ、- COOM、- CONH₂、- CON (H) (C₁ - 24 アルキル)、- CON (C₁ - 24 アルキル)₂、- NH₂、- N (H) (C₁ - 24 アルキル)、- N (C₁ - 24 アルキル)₂、- SO₃ M、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、イミダゾール、[式中、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、それぞれ、置換されていないか又は 1 もしくは複数の C₁ - 12 アルキルによって置換されており、またこのプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは中性であるか又はイオンのに帯電されている]、フェニル、1 又は複数の C₁ - 8 アルキルによって 1 又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、1 又は複数の C₁ - 8 アルキルによって 1 又は複数回置換されているナフチル、アミジン、グアニジン、アンモニウム塩、ホスホン酸、ホスホン酸塩、及び基

30

40

【化 2 9】



【 0 1 7 5】

[式中、Q 又は Q' は、独立して、水素、C₁ - 12 アルキル、フェニル又はベンジルである] から選択される 1 又は複数の基によって 1 又は複数回置換されている) ；であり、

50

又は

2つのR'が窒素原子に結合している場合は、それらが結合している窒素原子と一緒に、分断されていないか又は-O-、-NH-又は-N(C₁~₁₂アルキル)-によって分断されている5員、6員もしくは7員環をそれらは形成してよく；

Lは、直接結合、C₁~₁₂アルキレン（これは分断されていないか又は1もしくは複数の酸素原子、-NH-、-N(C₁~₁₂アルキル)又はフェニレンによって分断されている、及び/又は、置換されていないか又は1もしくは複数の-OH、C₁~₈アルキル、C₁~₂₄アルコキシ、C₂~₂₄アルキルカルボキシ、-NH₂、-N(H)(C₁~₈アルキル)、-N(C₁~₈アルキル)₂又はアンモニウム塩によって1又は複数回置換されている)であり；

Arは、C₆~₁₀芳香族又はC₁~₉飽和もしくは不飽和ヘテロ環（このC₆~₁₀芳香族又はC₁~₉飽和もしくは不飽和ヘテロ環は置換されていないか又は1もしくは複数のハロゲン、-OH、C₁~₂₄アルコキシ、C₂~₂₄アルキルカルボキシ、-COOQ'、-CONH₂、-CON(H)(C₁~₈アルキル)、-CON(C₁~₈アルキル)₂、-NH₂、-N(H)(C₁~₈アルキル)、-N(C₁~₈アルキル)₂、-SO₃M、SO₃H、アンモニウム塩、ホスホン酸、ホスホン酸塩、C₁~₂₄アルキル、(ハロゲン、フェニル、1又は複数のC₁~₈アルキルによって1又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン及びイミダゾール[式中、このプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、置換されていないか又は1もしくは複数のC₁~₁₂アルキルによって置換されており、またこのプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、中性であるか又はイオンのように帯電されている]から選択される1又は複数の基によって1又は複数回置換されている)C₁~₂₄アルキル又はC₂~₂₄アルキルカルボキシによって1又は複数回置換されている)

[式中、Q'は、水素、C₁~₂₄アルキル、金属陽イオン、アンモニウム塩、グリコールエーテル、フェニルもしくはベンジル、又は1もしくは複数のハロゲン、ヒドロキシ、C₁~₂₄アルコキシ又はC₁~₁₂アルキルによって1又は複数回置換されているフェニルもしくはベンジルである]であり；

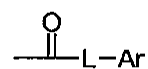
Mは、金属陽イオン又はアンモニウム陽イオンである]

から選択される)

【0176】

例えば、Rが、-O-、-N(R')-、-CON(R')-によって1又は複数回分断されていて、及び/又は1もしくは複数の-NR'R'、ハロゲン、アンモニウム塩、-L-Ar、

【化30】



によって1又は複数回置換されているC₁~₂₄アルキル又はC₁~₂₄アルキルカルボニルから選択される上記式で表される少なくとも1個の部分構造を含んでいるポリグリセロールポリマー。

【0177】

例えば、基Rの少なくとも一部が、

-O-によって1又は複数回分断されて、

1又は複数の-NR'R'、ハロゲン、アンモニウム塩、-L-Ar、

【化31】



【0178】

10

20

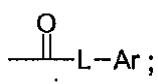
30

40

50

[式中、R' は、水素； - L - Ar、

【化 3 2】



【 0 1 7 9 】

$C_{1 \sim 24}$ アルキル又は $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニル（このアルキル又はアルキルカルボニルは分断されていないか又は 1 もしくは複数の酸素原子、 $-COO-$ 、 $-CONH-$ 、 $-NH-$ 、 $-CON(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})-$ 又は $-N(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})-$ によって 1 又は複数回分断されており、この非分断又は分断アルキル又はアルキルカルボニルは、置換されていないか又はハロゲン、 $-OH$ 、 $C_{2 \sim 24}$ アルキルカルボニル、 $C_{1 \sim 24}$ アルコキシ、 $C_{2 \sim 24}$ アルキルカルボキシ、 $-COOM$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CON(H)(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})$ 、 $-CON(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(H)(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_{1 \sim 24} \text{ アルキル})_2$ 、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、イミダゾール、[式中、プリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、それぞれ、置換されていないか又は 1 もしくは複数の $C_{1 \sim 12}$ アルキルによって置換されており、またこのプリン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン又はイミダゾールは、中性であるか又はイオンのに帯電されている]、フェニル、1 又は複数の $C_{1 \sim 8}$ アルキルによって 1 又は複数回置換されているフェニル、ナフチル、1 又は複数の $C_{1 \sim 8}$ アルキルによって 1 又は複数回置換されているナフチル、及びアンモニウム塩から選択される 1 又は複数の基によって 1 又は複数回置換されている) である] によって置換された $C_{1 \sim 24}$ アルキル又は $C_{1 \sim 24}$ アルキルカルボニルであるポリグリセロールポリマー。

10

20

【 0 1 8 0 】

例えば、 R は、

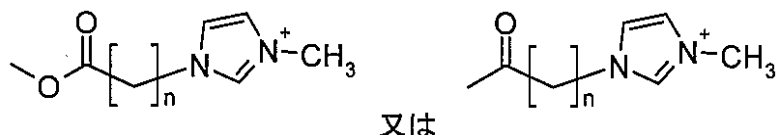
1 又は複数の $\text{NR}'\text{R}'$ 、ハロゲン又はアンモニウム塩によって 1 又は複数回置換された $\text{C}_{1 \sim 24}$ アルキル又は $\text{C}_{1 \sim 24}$ アルキル；

1 又は複数の NR^1R^2 、ハロゲン又はアンモニウム塩によって 1 又は複数回置換された $\text{C}_{1\sim 24}$ アルキルカルボニル又は $\text{C}_{1\sim 24}$ アルキルカルボニル；

ベンジル、ベンゾイル、又は1もしくは複数のハロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1 \sim 12}$ アルキル、 $C_{1 \sim 12}$ アルコキシ又は $C_{1 \sim 12}$ アルキルカルボキシによって1又は複数回置換されているベンジルもしくはベンゾイル；又は

30

【化 3 3】



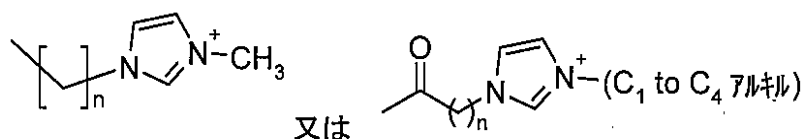
【 0 1 8 1 】

[式中、n は、1 ~ 12 の数、好ましくは 1、2、3、4、5 又は 6 である]
 によって置換された C_{1 ~ 24} アルキル又は C_{1 ~ 24} アルキルカルボニル ;
 から選択され ;

40

あるいは R は、基

【化 3 4】



【 0 1 8 2 】

「式中、 n は、 $1 \sim 12$ の数、好ましくは $1、2、3、4、5$ 又は 6 である」

50

である。

【 0 1 8 3 】

例えば、R は、少なくとも 1 個の $\text{NR}'\text{R}'$ [式中、 R' は、それぞれ、 C_{1-24} アルキル又は C_{1-24} アルキルカルボニルである] によって置換されている C_{1-24} アルキル及び C_{1-24} アルキルカルボニルから選択される。

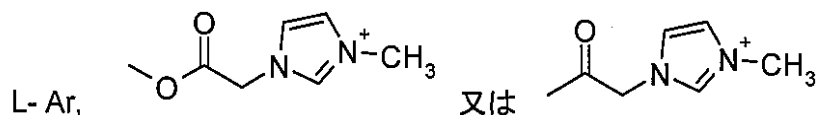
【 0 1 8 4 】

例えば、R は、少なくとも 1 個の $\text{NR}'\text{R}'$ によって置換されていて、少なくとも 1 個のハロゲン、 $\text{OR}'\text{SO}_3\text{M}$ 、 SO_3H 、又は式 $\text{L}-\text{Ar}$ で表される基によっても置換されている C_{1-24} アルキル及び C_{1-24} アルキルカルボニルから；

あるいは、

例えば、少なくとも 1 個の $\text{NR}'\text{R}'$ によって置換され、少なくとも 1 個のハロゲン、 OR' 又は式

【 化 3 5 】

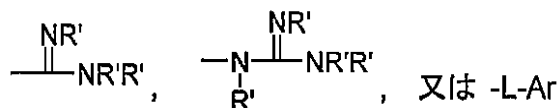


で表される基によっても置換された C_{1-24} アルキル及び C_{1-24} アルキルカルボニルから；選択される。

【 0 1 8 5 】

例えば、R は、1 又は複数の $-\text{O}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}')-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')-$ 、 $-\text{SO}-$ 又は $-\text{SO}_2-$ によって 1 又は複数回分断されていて、及び / 又は、式

【 化 3 6 】

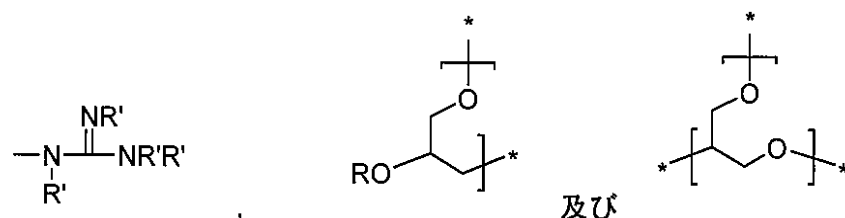


で表される 1 又は複数の基によって 1 又は複数回置換された C_{1-24} アルキル、 C_{1-24} アルキルカルボニル、 C_{3-24} アルケニル、及び C_{3-24} アルケニルカルボニルから選択される。

【 0 1 8 6 】

本発明の特定の一実施形態は、ポリグリセロール系抗微生物剤、その調製及び処方物、並びに抗微生物剤としてそれらを用いる方法に関するが、該薬剤は、ポリマーの骨格中にグリセロール誘導部分構造

【 化 3 7 】



【 0 1 8 7 】

(式中、基 R は、

1 又は複数の $-\text{O}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}')-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')-$ によって 1 又は複数回分断されている C_{1-24} アルキル、 C_{3-24} アルケニル、 C_{1-24} アルキルカルボニル又は C_{3-24} アルケニルカルボニル、

又は

1 又は複数の $-\text{OR}'$ 、 $-\text{CONR}'\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{R}'$ 、アンモニウム塩、式

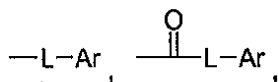
10

20

30

40

【化 3 8】



【0 1 8 8】

で表される基、又は基 - Si (G)₃ [式中、G は、それぞれ独立して、ヒドロキシル、C₁ ~ 4 アルキル又は C₁ ~ 4 アルコキシである] によって 1 又は複数回置換されたそのような分断 C₁ ~ 2 4 アルキル、C₃ ~ 2 4 アルケニル、C₁ ~ 2 4 アルキルカルボニル又は C₃ ~ 2 4 アルケニルカルボニル [式中、R'、L 及び Ar は、先に定義されているとおりである] から選択される)

10

を含んでいる高分岐ポリマー及びデンドリマーである。

【0 1 8 9】

例えば、基 R は、

1 又は複数の - O - 又は - N (R') - によって 1 又は複数回分断されている C₁ ~ 2 4 アルキル、C₃ ~ 2 4 アルケニル又は C₁ ~ 2 4 アルキルカルボニル、又は

1 又は複数の - O R'、- N R' R' 又はアンモニウム塩によって 1 又は複数回置換されたそのような分断 C₁ ~ 2 4 アルキル、C₃ ~ 2 4 アルケニル又は C₁ ~ 2 4 アルキルカルボニル [式中、R' は、H、C₁ ~ 2 4 アルキル、C₃ ~ 2 4 アルケニル、又は C₁ ~ 2 4 アルキルカルボニルである]

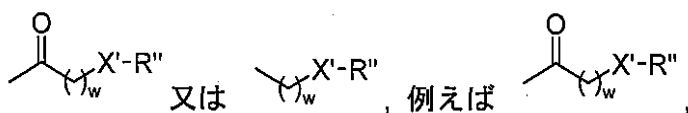
20

から選択される。

【0 1 9 0】

例えば、R は、基

【化 3 9】



【0 1 9 1】

[式中、X' は、- O -、- NH -、N (C₁ ~ 2 4 アルキル) 又は N (1 又は複数のヒドロキシ及び / 又は C₁ ~ 1 2 アルコキシによって置換された C₁ ~ 2 4 アルキル) であり、R'' は、C₁ ~ 2 4 アルキル、又は 1 もしくは複数のヒドロキシ及び / 又は C₁ ~ 1 2 アルコキシによって置換された C₁ ~ 2 4 であり、w は、1 ~ 1 2 (例えば 1 ~ 6) の数である]

30

である。

【0 1 9 2】

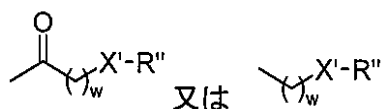
例えば、X' は - NH - 又は N (C₁ ~ 2 4 アルキル) であり、R'' は C₁ ~ 2 4 アルキルである。

【0 1 9 3】

R が、基

40

【化 4 0】



であり、X' が、アミノであるポリマーは、部分構造

【化 4 1】

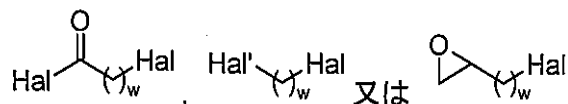


及び/又は

【 0 1 9 4】

含有高分岐グリセロールポリマーを

【化 4 2】



10

【 0 1 9 5】

[式中、H a l 又は H a l ' は、それぞれ、ハロゲン（例えば塩素又は臭素）である]
 のような化合物で処理し、そのあとアミンと反応させることにより簡便に調製される。

【 0 1 9 6】

例えば、本発明の新規な化合物は、2種の異なる R 基が存在している先に記載した化合物であり、例えば少なくとも2種の R 基が、独立して、先に記載したアミノ、アルコキシ及び/又はヒドロキシル基によって置換された C₁ ~ C₄ アルキル及び/又は C₁ ~ C₄ アルキルカルボニル基である少なくとも2種の R 基が混在している場合の化合物である。

20

【実施例】

【 0 1 9 7】

以下の非限定的実施例は本発明のいくつかの態様を例示している。

【 0 1 9 8】

(実施例 1)

分岐グリセロールポリマー

500 mL 丸底フラスコ中のプロピレングリコール (3.0 グラム) にナトリウムメトキシド (3.0 グラム、25 wt % / メタノール) が加えられ、メタノールがロータリーエバポレーターで除去される。90 °C にて 10 mL / 時の速度で投入ポンプを介してグリシドールが加えられ、この反応混合物がこのあとさらに4時間加熱され、そのあとそのポリマーが熱メタノールに溶解される。得られたメタノール中混合物がアセトンに加えられると、ポリグリセロールポリマーが茶色のシロップ (104.1 グラム) として沈殿する。

30

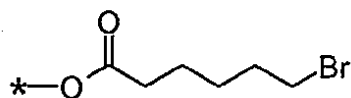
【 0 1 9 9】

(実施例 2)

外部アイス/ブラインパスで冷却された実施例 1 で得られたポリグリセロール (2.0 グラム) / DMF (15.5 グラム) 溶液にトリエチルアミン (2.73 グラム) が加えられる。6 - ブロモヘキサノイルクロリドが 10 分かけて滴下で加えられ、この反応物は 60 °C で 48 時間加熱される。得られた懸濁液は濾過され、濃縮され、以下の置換基：

40

【化 4 3】



を含有しているポリグリセロールポリマーが黄色のシロップ (3.73 グラム) として得られる。

【 0 2 0 0】

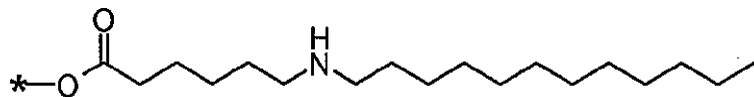
(実施例 3)

実施例 2 で得られた臭化ポリグリセリンにドデシルアミン (2.39 グラム) + 水酸化

50

カリウム（ 0 . 7 2 グラム ） / エタノール（ 2 0 グラム ） が加えられ、この混合物は 2 2 時間 8 0 にて攪拌され、冷却されてから C e l i t e で濾過され、濃縮されて、以下の置換基：

【化 4 4】



を含有しているポリグリセロールポリマーが黄色の半固形物（ 4 . 0 グラム ）として得られる。

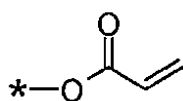
【 0 2 0 1】

10

（実施例 4）

実施例 1 で得られたポリグリセロール（ 2 . 0 グラム ） / D M F（ 1 7 グラム ）溶液にトリエチルアミン（ 5 . 4 グラム ）が加えられ、この混合物はアイス / ブラインパスで冷却される。塩化アクリロイルが 2 0 分かけて滴下で加えられ、この反応混合物は 4 8 時間攪拌しながら室温まで昇温される。得られた懸濁液は濾過され、濃縮されて、以下の置換基：

【化 4 5】



を含有しているポリグリセロールポリマーが黄色のシロップとして得られる。

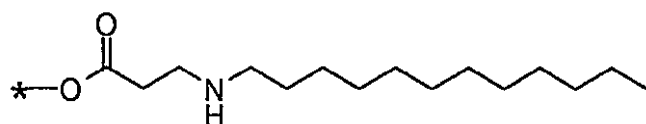
20

【 0 2 0 2】

（実施例 5）

実施例 4 の生成物にドデシルアミン（ 1 0 . 0 グラム ） / クロロホルム（ 2 9 グラム ）が加えられ、この混合物は室温にて 4 8 時間攪拌される。この反応混合物は濃縮されて黄色の半固形物が得られ、これは酢酸エチルで洗浄され、濾過されて、以下の置換基：

【化 4 6】



30

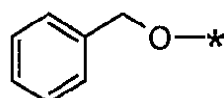
を含有しているポリグリセロールポリマーが白からはずれた色の固形物（ 1 0 . 3 グラム ）として得られる。

【 0 2 0 3】

（実施例 6）

実施例 1 で得られたポリグリセロール / D M F 溶液と、臭化ベンジルと、炭酸カリウムとの混合物が攪拌されて、以下の置換基：

【化 4 7】



40

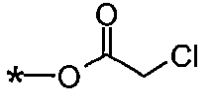
を含有しているポリグリセロールポリマーが調製される。

【 0 2 0 4】

（実施例 7）

実施例 2 の手順に従い、外部アイス / ブラインパスで冷却された実施例 1 で得られたポリグリセロール / D M F 溶液にトリエチルアミンそのあと塩化 1 - クロロアセチルが加えられて、以下の置換基：

【化 4 8】



を含有しているポリグリセロールポリマーが調製される。

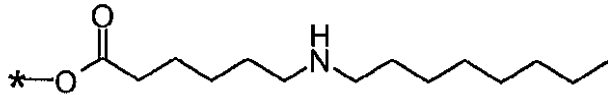
【0 2 0 5】

(実施例 8)

実施例 3 の手順に従い、実施例 2 で得られた臭化ポリグリセロールにオクチルアミン + 水酸化カリウム / エタノールが加えられて、以下の置換基：

【化 4 9】

10



を含有しているポリグリセロールポリマーが得られる。

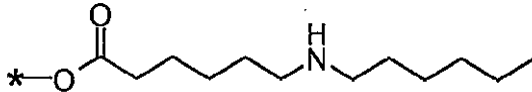
【0 2 0 6】

(実施例 9)

実施例 3 の手順に従い、実施例 2 で得られた臭化ポリグリセロールにヘキシルアミン + 水酸化カリウム / エタノールが加えられて、以下の置換基：

【化 5 0】

20



を含有しているポリグリセロールポリマーが得られる。

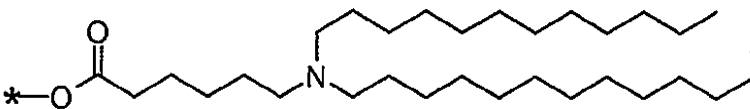
【0 2 0 7】

(実施例 10)

実施例 3 の手順に従い、実施例 2 で得られた臭化ポリグリセロールに N, N - ジ - ドデシルアミン + 水酸化カリウム / エタノールが加えられて、以下の置換基：

【化 5 1】

30



を含有しているポリグリセロールポリマーが得られる。

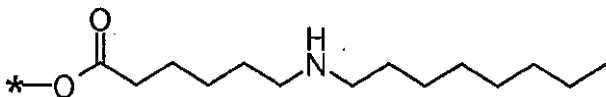
【0 2 0 8】

(実施例 11)

実施例 3 の手順に従い、実施例 2 で得られた臭化ポリグリセロールに N - オクチルアミン + 水酸化カリウム / エタノールが加えられて、以下の置換基：

【化 5 2】

40



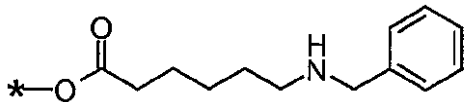
を含有しているポリグリセロールポリマーが得られる。

【0 2 0 9】

(実施例 12)

実施例 3 の手順に従い、実施例 2 で得られた臭化ポリグリセロールに N - ベンジルアミン + 水酸化カリウム / エタノールが加えられて、以下の置換基：

【化 5 3】



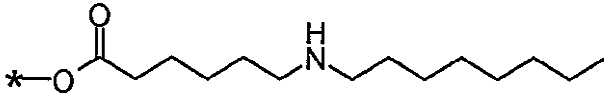
を含有しているポリグリセロールポリマーが得られる。

【0 2 1 0】

(実施例 1 3)

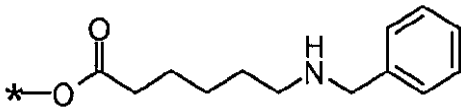
実施例 3 の手順に従い、実施例 2 で得られた臭化ポリグリセロールに N - オクチルアミンとベンジルアミンの混合物 + 水酸化カリウム / エタノールが加えられて、以下の置換基：

【化 5 4】



及び

【化 5 5】



のうちの 1 つを含有している異なるグリセロール誘導部分構造が利用可能となっているポリグリセロールポリマーが得られる。

【0 2 1 1】

微生物活性：

bacteria、e. coli、s. aureus；fungi、a. pull、p. funic、a. niger に対する活性について、微生物の付着について、又はバイオフィーム蓄積について実施例 1 ~ 10 で得られたポリマーが試験される。化合物は、すべて、少なくとも 1 つの試験で効果がある。一部のものは、2 つ以上の試験でも、効果がある。

【0 2 1 2】

殺微生物活性は、EN 1040 標準試験法を若干修正した方法に従って試験される。細胞カウント数が約 10^7 cfu/ml の細菌懸濁液が適切な濃度の特定の物質と接触され、室温における連続攪拌下での 5 分及び 30 分のインキュベーション時間の後、残留の細胞カウント数が測定される。スタフィロコッカス・アウレウス (Staphylococcus aureus；黄色ブドウ球菌) がグラム陽性菌として、エシェリキア・コーライ (Escherichia coli；大腸菌) がグラム陰性菌として試験される。得られた細胞カウント数低下が水対照に対して比較される。

【0 2 1 3】

殺菌活性は、EN 12175 標準試験法を若干修正した方法に従って試験される。孢子細胞カウント数が約 10^6 cfu/ml の菌孢子懸濁液が適切な濃度の特定の物質と接触され、室温における連続攪拌下での 30 分及び 60 分のインキュベーション時間の後、残留の孢子細胞カウント数が測定される。ペニシリウム・フェニキュローザム (Penicillium funiculosum；食品汚染菌)、アスペルギルス・ニゲル (Aspergillus niger；コウジカビ) 及びアウレオパシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans；黒色酵母) が主要なカビ株として試験される。得られた細胞カウント数低下が水対照に対して比較される。

【0 2 1 4】

バイオフィーム阻害は、マイクロプレート方式のスクリーニングアッセイで試験される。試験用標準ポリカーボネート試験片が、0.5% 濃度化合物水又はエタノール中溶液と

半時間接触されて、ピン表面に化合物が膜を形成する。ピンはこのあと層流下にある室温にて乾燥される。コートされたピンは、細胞カウント数 $10^4 \sim 10^5$ cfu/ml のマイクロプレート中スタフィロコッカス・アウレウス (Staphylococcus aureus) 細菌接種源と接触させられ、プラスチック表面にバイオフィルムが 24 時間に亘って形成される。緩く付着した細胞はこのあと 2 回の濯ぎ洗い工程で濯ぎ出され、そのあと表面のバイオフィルムが超音波処理により取り離される。溶離した細胞は Casobros の新鮮マイクロプレートに移され、620nm での光学密度を測定することによって増殖が 24 時間に亘って追跡される。結果は、24 時間のインキュベーション時間で溶離した細胞の増殖曲線として、処理されていないサンプルの増殖曲線と比較して評価される。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP2008/061462

| A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C08G65/34 C08G83/00 C08L71/00 C08L101/00 | | |
|--|--|--|
| 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) C08G C08L A61Q | | |
| 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 | | |
| C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | |
| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
| X | US 6 440 405 B1 (COOPER STUART L [US] ET AL) 27 August 2002 (2002-08-27) column 6, line 25 - column 7, line 32; claims | 1-22 |
| X | US 2006/188537 A1 (LAMBA-KOHLI NINA M [US]) 24 August 2006 (2006-08-24) claims | 1-22 |
| X | DE 103 11 163 A1 (ALBERT LUDWIGS UNI FREIBURG VE [DE]) 23 September 2004 (2004-09-23) claims | 1-22 |
| ----- -/- | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family 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 can not 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. *Z* document member of the same patent family | | |
| Date of the actual completion of the international search 16 December 2008 | | Date of mailing of the international search report 13/01/2009 |
| Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax (+31-70) 340-3016 | | Authorized officer Deraedt, Gilbert |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2008/061462

| 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 WPI Week 200781 Thomson Scientific, London, GB; AN 2007-877099 XP002508259 & JP 2007 217578 A (UNIV MIE NAT UNIV CORP) 30 August 2007 (2007-08-30) abstract | 1-22 |
| X | WO 01/12725 A (NESTE CHEMICALS OY [FI]; SKRIFVARS MIKAEL [FI]; AIROLA KARRI [FI]; KAA) 22 February 2001 (2001-02-22) claims | 1-22 |
| A | WO 2006/130978 A (UNIV BRITISH COLUMBIA [CA]; BROOKS DONALD E [CA]; KIZHAKKEDATHU JAYACH) 14 December 2006 (2006-12-14) claims | 1 |
| A | R. HAAG, E.A.: "An approach to core-shell-type architectures in hyperbranched polyglycerols by selective chemical differentiation" MACROMOLECULES, vol. 33, 2000, pages 8158-816, XP002508110 the whole document | 1,22 |
| A | A. SUNDER, E.A.: "Molecular nanocapsules based on amphiphilic hyperbranched polyglycerols" ANGEWANDTE CHEMIE, INT. ED., vol. 38, no. 23, 1999, pages 3552-3555, XP002508111 the whole document | 1,22 |
| A | C.Z. CHEN, E.A.: "Recent advances in antimicrobial dendrimers" ADVANCED MATERIALS, vol. 12, no. 11, 2000, pages 843-846, XP002508112 the whole document | 1,22 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2008/061462

| Patent document cited in search report | | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|----|---------------------|----------------------------|-----------------------------|
| US 6440405 | B1 | 27-08-2002 | NONE | |
| US 2006188537 | A1 | 24-08-2006 | NONE | |
| DE 10311163 | A1 | 23-09-2004 | NONE | |
| JP 2007217578 | A | 30-08-2007 | NONE | |
| WO 0112725 | A | 22-02-2001 | AU FI | 6446500 A 991705 A |
| | | | | 13-03-2001 12-02-2001 |
| WO 2006130978 | A | 14-12-2006 | EP US | 1891143 A1 2008292579 A1 |
| | | | | 27-02-2008 27-11-2008 |

フロントページの続き

| (51) Int.Cl. | | F I | テーマコード (参考) |
|-------------------------|--|---------------|-------------|
| A 6 1 L 2/16 (2006.01) | | A 6 1 L 2/16 | Z |
| A 0 1 N 37/02 (2006.01) | | A 0 1 N 37/02 | |
| A 0 1 N 43/50 (2006.01) | | A 0 1 N 43/50 | A |
| A 0 1 P 3/00 (2006.01) | | A 0 1 P 3/00 | |
| A 0 1 N 35/10 (2006.01) | | A 0 1 N 35/10 | |
| C 1 1 D 3/37 (2006.01) | | C 1 1 D 3/37 | |
| A 0 1 N 33/08 (2006.01) | | A 0 1 N 33/08 | |

(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, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, 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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

(74) 代理人 100122389

弁理士 新井 栄一

(72) 発明者 ホワン, シンユー

アメリカ合衆国 0 7 0 5 4 ニュージャージー州, パルシパニー, ファーミングデイル ドライブ 9 1

(72) 発明者 ヘンドリクス - ガイ, カルメン

アメリカ合衆国 1 0 6 0 3 ニューヨーク州, ホワイト プレインズ, ペリー アベニュー 1 7

(72) 発明者 エルダー, スチュワート トッド

アメリカ合衆国 0 7 4 0 5 ニュージャージー州, バトラー, ストーニーブルック コート 2 0

(72) 発明者 プリュス, アンドレア

スイス国 4 6 0 0 オルテン, シューマツトウェグ 3 9

(72) 発明者 ダイセンロス, テッド

アメリカ合衆国 0 6 8 0 4 コネチカット州, ブルックフィールド, バーンビュー テラス 3 2

F ターム(参考) 4C058 AA02 AA03 AA07 AA23 AA28 AA30 JJ03 JJ04

4C083 AD111 AD112 BB48 CC01 CC02 CC23 CC31 CC38 CC41 EE23

FF01

4H003 DA01 DA02 DA07 EB38 FA34

4H011 AA02 BA01 BB03 BB04 BB06 BB09 DA13 DA16 DC05 DD07

DG05