

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5041664号
(P5041664)

(45) 発行日 平成24年10月3日 (2012. 10. 3)

(24) 登録日 平成24年7月20日 (2012. 7. 20)

(51) Int. Cl.

F 1

A 6 1 K 31/185	(2006. 01)	A 6 1 K 31/185
A 6 1 K 31/01	(2006. 01)	A 6 1 K 31/01
A 6 1 K 31/045	(2006. 01)	A 6 1 K 31/045
A 6 1 K 31/07	(2006. 01)	A 6 1 K 31/07
A 6 1 K 31/20	(2006. 01)	A 6 1 K 31/20

請求項の数 25 (全 23 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2004-514976 (P2004-514976)
(86) (22) 出願日	平成15年6月23日 (2003. 6. 23)
(65) 公表番号	特表2005-535617 (P2005-535617A)
(43) 公表日	平成17年11月24日 (2005. 11. 24)
(86) 国際出願番号	PCT/FR2003/001919
(87) 国際公開番号	W02004/000293
(87) 国際公開日	平成15年12月31日 (2003. 12. 31)
審査請求日	平成18年3月8日 (2006. 3. 8)
(31) 優先権主張番号	02/07763
(32) 優先日	平成14年6月21日 (2002. 6. 21)
(33) 優先権主張国	フランス (FR)
(31) 優先権主張番号	02/07764
(32) 優先日	平成14年6月21日 (2002. 6. 21)
(33) 優先権主張国	フランス (FR)

(73) 特許権者	391023932
	ロレアル
	フランス国パリ, リュ ロワイヤル 1 4
(73) 特許権者	599132904
	ネステク ソシエテ アノニム
	スイス国, ブベイ, アブニュー ネスレ
	5 5
(74) 代理人	100082005
	弁理士 熊倉 禎男
(74) 代理人	100084663
	弁理士 箱田 篤
(74) 代理人	100093300
	弁理士 浅井 賢治
(74) 代理人	100114007
	弁理士 平山 孝二

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 脱毛症を治療するためのタウリンの利用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

毛嚢脂腺単位の老化及び/又は脱毛症を治療し及び防止するのに有用な経口組成物を製造するための、経口組成物において少なくとも1種のポリフェノールと組み合わせたタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩の使用であって、該ポリフェノールがカテキン、エピカテキン、エピガロカテキン3-0-ガラート、エピガロカテキン、エピカテキン3-ガラート、プロシアニジン及びプロアントシアニジン、及びこれらの混合物から選択され、ポリフェノール/タウリン質量比が少なくとも0.5に等しい、使用。

【請求項 2】

毛包の結合組織の劣化を減じ又はこれを防止するのに有用な経口組成物を製造するための、請求項1記載の使用。

10

【請求項 3】

該経口組成物が、結合鞘の硬直化により誘発される該毛包の劣化を減じ又はこれを防止するのに有用であることを特徴とする、請求項1又は2記載の使用。

【請求項 4】

該経口組成物が、天然コラーゲンの過度の架橋及び/又は合成により誘発される該毛包の劣化を減じ又はこれを防止するのに有用であることを特徴とする、請求項1～3の何れか1項に記載の使用。

【請求項 5】

該経口組成物が、毛包周囲の皮膚組織におけるコラーゲンの代謝及び構造を調節するの

20

に有用であることを特徴とする、請求項1～4の何れか1項に記載の使用。

【請求項6】

該経口組成物が、該毛包の結合鞘におけるコラーゲンの代謝及び構造を調節するのに有用であることを特徴とする、請求項1～5の何れか1項に記載の使用。

【請求項7】

該経口組成物が、該毛包の矮小化を防止するのに有用であることを特徴とする、請求項1～6の何れか1項に記載の使用。

【請求項8】

該タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩の毎日の用量が、タウリンの当量として、0.5～4000mg/日なる範囲内にあることを特徴とする、請求項1～7の何れか1項に記載の使用。

10

【請求項9】

該タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩の毎日の用量が、タウリンの当量として、10～500mg/日なる範囲内にあることを特徴とする、請求項1～8の何れか1項に記載の使用。

【請求項10】

少なくとも1種のポリフェノールと組み合わせた該タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を、少なくとも1種の脂肪酸と組み合わせて使用することを特徴とする、請求項1～9の何れか1項に記載の使用。

【請求項11】

20

該脂肪酸が、炭素原子数18～22の、n-6及びn-3必須ポリ不飽和脂肪酸、及びそのエステル並びにその混合物から選択されることを特徴とする、請求項10記載の使用。

【請求項12】

該ポリフェノールの毎日の用量が、0.5～2000mg/日なる範囲内にあることを特徴とする、請求項1～11の何れか1項に記載の使用。

【請求項13】

該脂肪酸が、リノール酸、 γ -リノレン酸、リノレン酸、ステアリドン酸、クロセチン及び5,8,11,14-エイコサテトラエン酸、並びにこれらの混合物から選択されることを特徴とする、請求項10～12の何れか1項に記載の使用。

【請求項14】

30

該脂肪酸の毎日の用量が、0.5～3500mg/日なる範囲内にあることを特徴とする、請求項10～13の何れか1項に記載の使用。

【請求項15】

該脂肪酸の毎日の用量が、5～1500mg/日なる範囲内にあることを特徴とする、請求項10～13の何れか1項に記載の使用。

【請求項16】

該経口組成物が、さらにビタミンC及びE、亜鉛又はその塩、セレン及び少なくとも1種のカロチノイドから選択される少なくとも1種のサプリメントをも含む、請求項1～15の何れか1項に記載の使用。

【請求項17】

40

該経口組成物が、さらにビタミンC及びE、亜鉛又はその塩、セレン並びに β -カロテン、リコペン、ゼアキサンチン及びルテインから選択される少なくとも1種のカロチノイドから選択される少なくとも1種のサプリメントをも含む、請求項1～15の何れか1項に記載の使用。

【請求項18】

活性成分として、少なくとも1種のポリフェノールと組み合わせた少なくとも0.05～80質量%なる範囲のタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩及び賦形剤を含み、ビタミンCを含まない、経口吸収用かつ毛嚢脂腺単位の老化及び/又は脱毛症を治療し及び防止するのに有用な経口組成物を製造するための組成物であって、該ポリフェノールがカテキン、エピカテキン、エピガロカテキン3-O-ガレート、エピガロカテキン、エ

50

ピカテキン3-ガラート、プロシアニジン及びプロアントシアニジン、及びこれらの混合物から選択され、ポリフェノール/タウリン質量比が少なくとも0.5に等しい、組成物。

【請求項19】

該組成物が、少なくとも1種の脂肪酸及び/又は経口組成物において許容されるその塩を含むことを特徴とする、請求項18記載の組成物。

【請求項20】

該組成物が、0.01~10質量%なる範囲の少なくとも1種のポリフェノール及び/又は0.1~10質量%なる範囲の少なくとも1種脂肪酸を含むことを特徴とする、請求項19記載の組成物。

【請求項21】

カテキン、エピカテキン、エピガロカテキン3-0-ガラート、エピガロカテキン、エピカテキン3-ガラート、プロシアニジン及びプロアントシアニジン、及びこれらの混合物から選択される少なくとも1種のポリフェノールと組み合わせたタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を含み、ポリフェノール/タウリン質量比が少なくとも0.5に等しく、かつ適当な場合には賦形剤を含むことを特徴とする、経口吸収用かつ毛嚢腺単位の老化及び/又は脱毛症を治療し及び防止するのに有用な経口組成物を製造するための組成物。

【請求項22】

少なくとも幾つかのポリフェノールと組み合わせたタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を、0.75以上の、ポリフェノール/タウリン質量比で該組成物が含むことを特徴とする、請求項19記載の組成物。

【請求項23】

少なくとも幾つかのポリフェノールと組み合わせたタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を、1以上の、ポリフェノール/タウリン質量比で該組成物が含むことを特徴とする、請求項19記載の組成物。

【請求項24】

少なくとも幾つかのポリフェノールと組み合わせたタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を、0.75以上の、ポリフェノール/タウリン質量比で該組成物が含むことを特徴とする、請求項21記載の組成物。

【請求項25】

少なくとも幾つかのポリフェノールと組み合わせたタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を、1以上の、ポリフェノール/タウリン質量比で該組成物が含むことを特徴とする、請求項21記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、主として毛嚢腺単位の機能上の障害を予防し、また治療するための、特に脱毛症を予防し、また治療するための経口組成物におけるタウリン及び/又はヒポタウリンの使用に関するものである。本発明は、また脂肪酸、ポリフェノール及び/又はこれを含む抽出物の、場合によりタウリンとの組み合わせで、上記のような障害を治療し、また予防するための食物サプリメントにおける使用をも意図するものである。

【背景技術】

【0002】

幾つかの生理的な損傷が、加齢、季節の変化、ストレス及び大気の影響因子と関連して見られる。これらは、特に加齢に伴う毛髪密度の低下、毛幹の数及び径の減少を包含する。特に、幾人かの個人においては、脱毛症が発現する。

主として加齢に伴って現れる、毛髪の損傷(悪化)を防止するために、これまでは、必須アミノ酸を使用しており、これらは毛球におけるケラチン合成用の養分として重要であるものと認識されている。即ち、メチオニン、シスチン及びシステインは、該毛包の代謝に直接影響を及ぼすことが知られている。しかし、これらの必須アミノ酸は、タンパクの合

10

20

30

40

50

成に作用を及ぼす。これだけが、脱毛症に關与するメカニズムではない。

脱毛症の原因の中で、毛包周辺部の結合組織の損傷が、結合鞘の硬直化により反映され、これが毛包の矮小化を説明するものと考えられており、該毛嚢脂腺単位の老化の兆候である。

【0003】

さらに、これらの毛髪における損傷は、しばしば頭皮の状態における悪化、例えば多量の皮脂の生産を伴う。皮脂の過剰分泌又は脂漏症及びその結果としての、例えばアクネが、しばしば思春期に見られるが、ホルモン上の理由から成人、特に女性においても見ることができる。

これらの障害は、種々の程度で、同一の個人において組み合わせで発生する可能性がある。

10

毛包を特徴付ける脱毛症を排除する目的で、コラーゲンの代謝を阻害する医薬製品の使用が推奨されている。実際に、特にミノキシジルを使用することが知られており、また現時点では、抗-アンドロゲン性を示さずに、毛包の矮小化過程を排除できることが知られている、ミノキシジルの作用機構は、未だ未知である。

皮脂の過剰分泌を排除するために、イソトレチノイン(isotretinoin)の使用を含む局所的治療法が提案されているが、この治療は重度の副作用がない訳ではない。

脱毛症及び皮脂の過剰分泌に対して、全身的な経路を介する、抗-アンドロゲンの使用も推奨されている。しかし、この種の治療は、特に生殖器官に対して重度の副作用がない訳ではない。

20

【0004】

その一部として、文献WO 99/22728は、特に治療上の利用のために、脂肪酸を含む多数の化合物を記載している。しかし、該医薬製品が生体異物である限りにおいて、該製品は、その使用における固有の危険性と関連する欠点を持つ。さらに、該医薬製品は、一般に作用のかなり高い標的スペクトルを持つが、該毛嚢脂腺単位損傷の原因は、多岐に渡っている。

さらに、タウリンは、毛髪細胞を調節するための細胞活性化因子であることが記載されており、また文献WO 02/24189に、局所的に適用するための毛髪-刺激組成物における使用を提案している。しかし、局所的細胞活性化因子として使用されるタウリンは、細胞活性化の喪失が、脱毛症の幾つかの因子によって引起される可能性があるという事実のために、限られた作用を持つに過ぎない。これら因子が存続する場合には、細胞活性化因子の局所的適用による一時的な効果は、制限される。さらに、局所適用用途の組成物は、局所適用に関連する欠点を持つ。その適用頻度は、一般に高く、またこれら組成物の、治療すべき大面積への適用は、ある程度の時間を要する恐れがある。

30

【発明の開示】

【0005】

従って、経口投与可能であり、かつ毛髪老化の兆候及び/又は毛嚢脂腺単位の機能上の障害、及び特に脱毛症を治療し及び/又は予防する上で有効であり、さらに副作用を示さない活性な薬剤に対する需要が、依然としてあることが分かっている。該毛嚢脂腺単位は、毛包及び皮脂腺を含む。

40

驚いたことに、本出願人は、まずタウリンが毛包の結合組織に関する損傷を調節する上で有利であり、従って毛嚢脂腺単位の老化及び/又は脱毛症の治療及び予防において、タウリンを有利に使用できることを明らかにした。具体的には、タウリンがロイシンの組込みを害すること無しに、プロリンの組込みを低下することを観測することができ、このことは、タンパク質の全体としての合成を害すること無しに、コラーゲンの蓄積を特異的に減じるという、タウリンの利点を示している。

さらに、本出願人は、ポリフェノール及び/又は脂肪酸に富む抽出物を、経口で、特に食物サプリメントとして使用した場合に、該毛嚢脂腺単位において起こる障害に、有利な活性を示すことをも見出した。ポリフェノール及び/又は脂肪酸を含む経口投与用の組成物は、特にテストステロン(インタクリン(intacrine))の皮膚における活性化、及び/又は

50

そこから生じる皮脂分泌機能における亢進を、生殖器又は生殖機能に如何なる一般的な効果をも及ぼすこと無しに、阻害することができる。

【0006】

さらに、本出願人は、毛髪系以外の軟毛系の成長に対する刺激作用を誘発せずに、毛髪-喪失防止作用を得ることを可能とする、経口投与が有利であることに気付いた。このようにして、本発明に従って考察中の活性物質の経口投与が、毛髪密度に作用して、即ち頭皮1cm²当たりの毛髪数に作用して、かつ毛髪径の不均一性を減じることによって、良好な頭髪を維持する上で、特に有効であることを見出した。

従って、本発明の一局面によれば、本発明は、タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は経口投与性組成物において許容されるその塩の、毛嚢脂腺単位の老化及び/又は脱毛症を治療し及び防止するのに有用な、及び特に結合鞘の硬直化により誘発される、毛包結合組織の損傷(悪化)を減じ若しくは防止するのに有用な、経口投与組成物の製造における使用に関する。

10

タウリン、ヒポタウリン又は許容されるその塩は、本発明によれば経口投与用組成物において使用することができ、該組成物は、天然コラーゲンの過度の架橋及び/又は合成により誘発される毛包の損傷を減じ又は防止するために、並びに皮膚及び毛包周囲組織及び特に該毛包の結合鞘におけるコラーゲンの代謝及び構造化を調節するために有用である。特に、タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩は、該毛包の矮小化を防止するために使用できる。

【0007】

20

本発明の一変形によれば、該タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩は、脂肪酸、ポリフェノール及びこれらを含む抽出物から選択される少なくとも1種の化合物と組み合わせて使用される。

本発明のもう一つの局面によれば、本発明は、またフラボノール、アントシアニン、フラバノール、プロアントシアニジン及びフラバノン、並びにスチルベンから選択されるポリフェノール、及び/又は炭素原子数18~22の、n-6及びn-3必須ポリ不飽和脂肪酸、及びそのエステル並びにその混合物から選択される脂肪酸、及び/又はこれらを含む抽出物の、該毛嚢脂腺単位の障害を治療し又は予防するのに有用な、特に脂漏症を減じ又は予防するのに有用な、又は毛髪の喪失を減じ若しくは防止するためにも有用な、経口組成物を製造するための使用をも意図する。

30

これらの経口組成物は、皮膚内のアンドロゲンの過度の代謝を減じ若しくは防止し、及び/又はテストステロンの該毛嚢脂腺単位に及ぼす影響を減じ、あるいは阻止する上で、特に有利である。

【0008】

本発明は、またタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は経口吸収用に許容されるその塩を含有する、経口吸収組成物にも関連し、この組成物は、活性試薬として、少なくとも0.05~80質量%なる範囲の量の、タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩及び賦形剤を含み、またビタミンCを含まず、さらに適当な場合には少なくとも1種のポリフェノール及び/又は1種の脂肪酸及び/又は経口組成物において許容されるその塩を含む。

40

より具体的には、該ポリフェノールは、フラボン、フラボノール、イソフラボン、アントシアニン、フラバノール、プロアントシアニジン及びフラバノン、並びにスチルベンから選択され、かつ該脂肪酸は、炭素原子数18~22の、n-6及びn-3必須ポリ不飽和脂肪酸、及びそのエステル並びにその混合物から選択される。

【0009】

本発明の別の局面は、経口吸収用の組成物に係り、該組成物は、フラボノール、アントシアニン、フラバノール、プロアントシアニジン及びフラバノン、並びにスチルベンから選択される少なくとも1種のポリフェノール、及び/又は炭素原子数18~22の、n-6及びn-3必須ポリ不飽和脂肪酸、及びそのエステル並びにその混合物から選択される脂肪酸、及び/又はこれらを含む抽出物を、タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は経口吸収用に許

50

容されるその塩、及び適当な場合には賦形剤と共に含有する。

本発明による経口吸収用の組成物は、0.01～30質量%なる範囲のタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を、0.1～50質量%なる範囲の少なくとも1種のポリフェノールを含む抽出物、及び特に0.1～25質量%なる範囲、殊に0.1～20質量%なる範囲、又はさらに0.1～15質量%なる範囲のカテキンとの組み合わせで含むことができる。

【0010】

本発明による経口吸収用の組成物は、特にタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を、少なくとも0.5に等しい、特に0.75以上及びとりわけ1以上のポリフェノール/タウリン比で、ポリフェノールとの組み合わせで含むことができる。

本発明の他の局面は、経口吸収用の組成物に係り、該組成物は、少なくとも0.01～30質量%なる範囲の、タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を0.01～10質量%なる範囲の脂肪酸との組み合わせで含有する。

一特定の態様によれば、本発明の経口吸収用組成物は、食物サプリメントである。

さらに、本発明は、タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は経口投与に対して許容されるその塩の経口投与を通して、毛髪の老化及び/又は脱毛症を治療し、かつ予防するための、化粧学的な方法をも意図する。

【0011】

本発明のさらなる局面によれば、本発明は、少なくとも1種の脂肪酸、一種のポリフェノール又はこれを含む抽出物を、場合によりタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩との組み合わせとして、投与することを通して、毛嚢脂腺単位の障害を治療し、また予防するための化粧学的な方法に関する。

特定の一態様において、タウリン、ヒポタウリン又は許容されるその塩は、タウリンの当量で表して、0.5～4000mg/日なる用量で投与され、該脂肪酸は0.5～5400mg/日なる用量で投与され、及び/又は該ポリフェノールは0.5～2000mg/日なる用量で投与される。

本発明によれば、医薬製品の悪影響無しに、医薬製品による処置価格と比較して安価に、予想される効果を達成することができる。該活性薬剤の経口摂取は、その適用を反復する必要なしに、より一定した効果を得ることを可能とする。

より具体的には、毛嚢脂腺単位の機能上の障害、特に脱毛症、例えば毛包周囲の結合組織の過度な架橋状態を表す兆候としてのプリカーサを、例えば頭皮の組織学的な解析又は拡大写真によって検出した個人の場合において、この経口摂取を行った場合、効能における制限は取除かれる。

【発明を実施するための最良の形態】

【0012】

本発明は、以下の詳細な説明並びに以下に記載する実施例に関する記載を読むことによって、より一層明確に理解されるであろう。

タウリン及びヒポタウリン

タウリン及び/又はその代謝産物であるヒポタウリンは、本発明の活性成分として使用できる。また、このような経口摂取用の組成物において許容されるその塩を使用することも可能である。本発明の組成物は各個人に投与するためのものであるので、これらの塩は、明らかに完全に無害なものとして選択される。この点に関連して、アルカリ金属又はアルカリ土類金属塩、特にマグネシウム、マンガン、鉄(II)又は亜鉛塩が、本発明にとって最も適したものである。

本発明によれば、ヒポタウリン又はタウリンは、0.5～4000mg/日なる範囲の、毎日の用量で及び好ましくは10～500mg/日なる範囲の用量で使用される。この毎日の用量は、より好ましくは約50～150mg/日なる範囲にある。本明細書の説明において示されたこれら容量は、タウリンの当量で表されたものである。

【0013】

ポリフェノール

あらゆる食品等級のポリフェノールを、本発明によるポリフェノールとして使用できる。これら化合物は、一般に植物から誘導され、その構造は炭化水素を基本とする骨格の特

10

20

30

40

50

性に従って分類される(ローラブラヴォーヌートリーションレビュー(Laura Bravo Nutrition Review), 1998, 56: 317-333, A. Scalbert, G. Williamson, J. Nutr., 2000, 130: 2073s-2085S)。

本発明によれば、「ポリフェノール」なる用語は、より具体的にはフラボノイド型の化合物、即ちフラボン、フラボノール、イソフラボン、アントシアニン、フラバノール、プロアントシアニジン及びフラバノン、並びにスチルベンを意味する。

フラボノール、アントシアニン、フラバノール、プロアントシアニジン及びフラバノン、並びにスチルベンが、より一層適している。

主なフラバノール類は、カテキン及びガロカテキン(gallo-catechins)類から選択される。プロシアニジン類は、低重合度ポリマー混合物として存在する、フラボノールポリマーである。これらは、植物抽出液中で、カテキンと結合していても良い。

【0014】

カテキン、エピカテキン、エピガロカテキン3-O-ガレート、エピガロカテキン、エピカテキン3-ガレート、プロシアニジン及びプロアントシアニジン及びこれらの混合物から選択される、ポリフェノール又はポリフェノール混合物を使用することが、好ましい。

カテキンモノマーを、適当な場合には、プロシアニジンオリゴマー(PCO)との混合物として使用することが、特に有利である。即ち、本発明で使用するポリフェノールは、単にカテキンモノマーのみからなるものではあり得ない。

これらポリフェノールを含む食料は、単離された化合物及び/又は植物抽出液、及びこれらの混合物から製造できる。

本発明によれば、これらポリフェノールの全てを提供できる、植物抽出液を使用することができる。

【0015】

より具体的には、カテキンは茶(カメリアシネンシス(Camellia sinensis))及びグレープ(ピティスビニフェラ(Vitis vinifera))、及びその他の果実(リンゴ、ナシ又は松の実(ピヌスマリチマ(Pinus maritime))中において極めて豊富である。飲料(ワイン、ビール、茶)及びチョコレート(テオブロマカカオ(Theobroma cacao))は、本発明によるカテキン含有食料を構成することのできる、資源である。

これらポリフェノールは単独で、あるいは混合物として使用でき、また栄養サプリメントの様々な形状(糖衣錠剤、ゲル、可溶性の粉末、ゲルカプセル、ウエハカプセル、強化食品等)として摂取できる。

これら食用ポリフェノールは、0.5~2000mg/日なる範囲、特に0.5~1000mg/日なる範囲及び好ましくは20~300mg/日なる範囲の用量で使用できる。

特に、これらポリフェノールは、「栄養的」な用量で、即ちバランスの取れた食事に基づいて人によって吸収される用量に等価な用量で、経口投与することができる。

一例として、40%のPCOを含有するブドウ種子の抽出液、30%の全ポリフェノールを含有する赤ワイン抽出液及び/又は30%のカテキンを含有する緑茶抽出液を挙げることができる。

【0016】

プロシアニジンオリゴマー(PCO)は、0.5~1000mg/日なる範囲及び好ましくは20~250mg/日なる範囲の用量で使用できる。これらは、ブドウ種子の抽出液によって与えることができ、該抽出液はそのPCO含有率に従って服用される。一例として、上記の40%のPCOを含有するブドウ種子の抽出液については、150mg/日、即ちPCO 60mg/日なる用量で使用される。

さらに、カテキンは、0.5~1000mg/日なる範囲及び好ましくは20~300mg/日なる範囲の用量で使用できる。これらは、例えば30%のカテキンを含有する緑茶抽出液によって与えることができ、従って抽出液の用量は、約375mg/日、即ちカテキン112.5mg/日となる。

ポリフェノールの毎日の服用量として、ポリフェノール成分に富む赤ワイン抽出液の毎日の服用量(赤ワインの粉末化された抽出物600mg:12mg PCO/ヒト/日、即ち全ポリフェノール18mg)、ポリフェノール成分に富むブドウ種子の抽出液の毎日の服用量(赤ワインの粉

10

20

30

40

50

未化された抽出物300mg：18mg PCO/ヒト/日、即ち全ポリフェノール27mg)、ポリフェノール成分に富む緑茶抽出液の毎日の服用量(緑茶の粉末化された抽出物225mg：67.5mg カテキン/日)を例示することができる。

【0017】

該ポリフェノールは、上記カテゴリーの一種から選択することができ、またこれらの混合物を使用することも可能である。これら食物サプリメントの組成物は、0.01～10質量%なる範囲の少なくとも1種のポリフェノールを含むことができる。

これらポリフェノールを、タウリン及び/又はヒポタウリンとの組合せで投与する場合、0.01～30質量%なる範囲の量の、タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又はその許容される塩に対して、0.1～50質量%なる範囲の割合で投与することができる。

10

本出願人は、特に体重60kgの人にたいして、220mg/kg/日なる用量と等価である、赤ワインの濃縮物37mg/kg/日なる用量での経口投与は、前立腺に何等有害な影響を及ぼすこと無しに、毛髪喪失に対して所期の効果を持つことを明らかにした。これについては、特に以下の実施例において例示する。

前に記載したように、少なくとも0.5に等しい、特に0.75以上、及びとりわけ1以上の、ポリフェノール/タウリン比にて、ポリフェノールをタウリンとの組合せで使用することが有利である。より具体的には、この質量比は、0.5～2なる範囲、特に0.75～1.5なる範囲、あるいは0.9～1.3なる範囲であり得、また特に約1.2であってもよい。

【0018】

同様に、特に、最も有利な本発明の組成物は、0.01～30質量%なる範囲のタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又はその許容される塩、及び特にタウリンを、0.1～25質量%なる範囲のカテキン、特に0.1～20質量%なる範囲の植物抽出液又は植物抽出液の混合物として存在するカテキンとの組合せで含有する。

20

カテキンの特別な場合において、これら化合物は、少なくとも0.4に等しい、特に0.7より大きな、又は0.7～1.5なる範囲のカテキン/タウリン質量比にて、タウリン、ヒポタウリン及び/又はその塩と組み合わせることができる。

脂肪酸

本発明によれば、「脂肪酸」とは、ポリ不飽和脂肪酸、即ちシス,シス-メチレンで遮断された二重結合を含む任意の脂肪酸を意味する。

これら食用のポリ不飽和脂肪酸は、一般にその炭素鎖の長さ及びその二重結合の位置に従って定義される。これら必須脂肪酸は、末端メチル基に最も近い不飽和結合の位置によって特徴付けられる、2つの群(3及び6)に分類される。

30

【0019】

炭素原子数18～22の、n-6及びn-3脂肪酸群の必須ポリ不飽和脂肪酸に属する、2群の脂肪酸並びにそのエステル及びその混合物が、本発明にとって特別に最も適したものである。明らかに、これらの脂肪酸は、食品基準に従って許容されるという利点を持つ。

好ましくは、これら脂肪酸は、テルペン又はテルペン誘導体とは結合していない。

「-6」脂肪酸として知られる、n-6系のポリ不飽和脂肪酸に関連して、まず炭素原子数18で、かつ2個の不飽和を含むリノール酸(18:2 6)を挙げることができ、また -リノレン酸(18:3 6)も、本発明にとってとりわけ有利な脂肪酸である。

40

-リノレン酸の源は、植物油(マツヨイグサ油、ルリジサ(borage)油、黒フサスグリ種子油及び麻実油)、及びスピルリナ(spirulina)、トグロコウイカ(Spirula maxima)及びS. プラテンシス(platensis)の抽出液から選択されるであろう。

【0020】

「-3」ポリ不飽和脂肪酸として知られる、n-3系のポリ不飽和脂肪酸に関連して、その第一の例は、 -リノレン酸(18:3 3)であり、ステアリドン酸(stearidonic acid)(C18:4n-3)も、本発明においてとりわけ有利な脂肪酸である。

例えば、ウォルナッツ(Juglans regia)及び大豆(Glycine max)由来の植物油は、魚油と同様に、 -3ポリ不飽和脂肪酸に富んでいる。

これら 3ポリ不飽和脂肪酸は、食物連鎖を介して、動物プランクトン、甲殻類動物/軟

50

体動物及び魚類に見出される。

魚油は、EPA(エイコサペンタエン酸=20:5 3)及びDHA(ドコサヘキサエン酸=22:6 3)の、主な工業的源を構成する。しかし、微細藻類(microalgal)バイオマスも、3脂肪酸抽出用の原料物質を構成することができる。

該微細藻類(microalgae)の栄養上の品位は、株の適正な選択及び培養条件に関連する代謝的な方向付け(metabolic orientation)により改善することができる。

微細藻類の利点は、これらがEPA及びDHA等の脂肪酸を合成することから、全く大きなものである。

【0021】

好ましくは、リノール酸、 α -リノレン酸、リノレン酸、ステアリドン酸、クロセチン及び5,8,11,14-エイコサテトラエン酸及びこれらの混合物又はこれらを含む抽出物を使用する。従って、該脂肪酸及び/又は該抽出物は、単独で又は混合物として使用することができる。

10

本発明による、推奨される毎日の投与量は、該脂肪酸について、0.5~3500mg/日なる範囲及び特に5~1500mg/日なる範囲にある。

本発明による、該推奨される毎日の投与量は、該n-3脂肪酸については、0.5~2500 mg/日なる範囲及び好ましくは5~360mg/日なる範囲にあり、また該n-6脂肪酸については、0.5~2600 mg/日なる範囲及び好ましくは5~1200mg/日なる範囲にある。

該脂肪酸は、上記カテゴリーの一種から選択され、またその混合物も使用できる。該経口投与組成物は、0.01~10質量%なる範囲の少なくとも1種の脂肪酸を含むことができる。

20

タウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩との組み合わせの場合には、本発明による組成物は、0.01~30質量%なる範囲のタウリン及び/又はヒポタウリン及び/又は許容されるその塩を、0.01~10質量%なる範囲の脂肪酸と共に含有する。

【0022】

他の活性薬剤

本発明による考察中の該活性薬剤、即ちタウリン、ヒポタウリン又はその塩、脂肪酸、ポリフェノール及びこれらの混合物は、1種又はそれ以上の他の活性薬剤、例えば特にビタミン類及び酸化防止剤と、場合によっては錯体として組合せることができる。

本発明の目的にとって、用語「活性薬剤」とは、考察中の化合物、例えばタウリンが、ビヒクル又は賦形剤型の機能というよりも、寧ろ該化合物に固有の生物学的及び化学的な活性を示すように使用されることを意味する。

30

言うまでもないが、本発明の組成物は、幾つかの活性薬剤を含む。

使用可能な活性薬剤としては、亜鉛又はその塩、特に硫酸塩及びグルコネート、ビタミンB5、B6、B8、C、E又はPP、 α -カロテン及びカロチノイド、例えばアリルスルフィド又はアジョエン(ajoene)としてのニンニク抽出物、セレン、クルクミン、クルクミノイド、ナイアシン、リトスペルミン酸(lithospermic acid)及びアデノシンを挙げることができる。

特に、ビタミンC及びEを含む酸化防止剤錯体、亜鉛又はその塩、セレン及び少なくとも1種のカロチノイド、特に α -カロテン、リコペン、ゼアキサンチン及びルテインを使用することができる。

40

【0023】

例えば、80~120 μ gのセレン当たり100~150mgなる範囲のビタミンC、20~50mgなる範囲のビタミンE、10~40mgなる範囲の亜鉛及び3~10mgなる範囲の α -カロテンを含む酸化防止剤複合体が好ましい。

しかし、本発明の組成物は、有利には1質量%未満のビタミンCを含むことができ、あるいはビタミンCを全く含まないものであり得る。

本発明による活性薬剤は、また公知の毛髪喪失防止(抜け毛防止)活性薬剤、及び特に再度の育毛を可能とし及び/又は毛髪の喪失を停止させる活性をさらに増強する化合物、例えばより具体的には以下に列挙する化合物と組み合わせることも可能である。

50

- ニコチン酸エステル、より特定のには、 C_3 - C_6 アルキルニコチネート、及び特にメチル又はヘキシルニコチネート、ベンジルニコチネート又はトコフェリルニコチネート；
- 当分野において周知の、ステロイド系及び非-ステロイド系抗炎症剤、特にヒドロコルチゾン及びその塩並びに誘導体、及びニフルミン(niflumic)酸；
- レチノイド及びより具体的には、トレチノイン(tretinoin)としても知られるt-トランス-レチノイン酸、イソトレチノイン、レチノール又はビタミンA及びその誘導体、例えばアセテート、パルミテート又はプロピオネート、モトレチニド(motretinide)、エトレチニド(etretinide)及び亜鉛トランス-レチノエート；
- 抗菌剤、具体的にはマクロライド、ピラノシド及びテトラサイクリンから選択されるもの、及び特にエリスロマイシン；

10

【0024】

- カルシウムアンタゴニスト、例えばシンナリジン及びジルチアゼム；
- エストリオール又はその類似体、又はチロキシシン及びその塩等のホルモン；
- 抗-アンドロゲン性薬剤、例えばオキシメンドロン、スピロノラクトン又はジエチルスチルベストロール；
- OH-ラジカルスカベンジャー、例えばジメチルスルホキシド；
- エステル化されたオリゴ糖、例えばEP-A-0 211 610及びEP-A-0 064 012に記載されているもの；
- ヘキソ糖(hexosaccharidic)酸誘導体、例えばEP-A-0 375 388に記載されている該誘導体、特にグルコ糖(glucosaccharidic)酸；
- グリコシダーゼ阻害剤、例えばEP-A-0 334 586に記載されているもの、特にD-グルカロ-1,5-ラクタム；
- グリコサミノグリカナーゼ及びプロテオグリカナーゼ阻害剤、例えばEP-A-0 277428に記載されているもの、特にL-ガラクトノ-1,4-ラクトン；
- チロシンキナーゼ阻害剤、例えばEP-A-0 403 238に記載されているもの、特に1-アミド-1-シアノ-(3,4-ジヒドロキシフェニル)-エチレン。

20

【0025】

本発明の活性薬剤は、また化合物3-メチル-7-クロロ[2H]-1,2,4-ベンゾチアジジン1,1-ジオキシドに対応するジアゾキシド；スピロキサゾン又は7-(アセチルチオ)-4',5'-ジヒドロスピロ[アンドロスト-4-エン-17,2'-(3'H)フラン]-3-オン；リン脂質、例えばレシチン；サリチル酸及びその誘導体及びより具体的にはフランス特許第2,581,542号に記載されているもの、及びより具体的にはベンゼンリングの5-位に炭素原子数2~12のアルキル基を持つサリチル酸誘導体、ヒドロキシカルボン酸又はケトカルボン酸及びそのエステル、ラクトン及び対応するその塩；アンスラリン(anthralin)、エイコサ-5,8,11-トリエン(triynoic)酸及びそのエステル及びアミド、及びミノキシジル並びにその誘導体(これら化合物は、EP 353 123、EP 356 271、EP 408 442、EP 522 964、EP 420 707、EP 459 890、EP 519 819、US 4 139 619及びUS 459 812に記載されているものである)と、場合によってはその他の成分との混合物として、組み合わせることができる。

30

上記化合物は、本発明の経口組成物及び特に食物サプリメントに配合されるが、その食物サプリメントとしての使用が可能であり、かつその処方が、本発明の活性薬剤処方と相溶性であることを条件とする。これら追加の活性薬剤は、その食物サプリメントとしての利用に対して、相容れる用量にて、本発明に従って使用される。従って、幾つかの化合物に対しては、原則として、本発明の食物サプリメントに対する補充物として使用することが好ましい。

40

【0026】

該活性薬剤の摂取のためには、経口組成物及び特に食物サプリメントの多数の態様が可能である。これらは、糖衣錠剤、ゲルカプセル、ゲル、エマルジョン、錠剤、ウエハカプセル又は溶液、特に飲用可能なアンプル等を製造する通常の方法により、処方される。特に、本発明の活性薬剤は、食物サプリメント又は強化食品、例えば食用のバー、又は圧縮又は非-圧縮粉末等の任意の他の形状で、配合することができる。該粉末は、水、ソーダ

50

、乳製品又は大豆誘導体で希釈することができ、あるいは食用のバーに配合することも可能である。

該活性薬剤は、このような経口組成物又は食物サプリメント用の一般的な賦形剤及び成分、例えば特に、食品分野において一般的な、脂肪及び/又は水性成分、湿潤剤、増粘剤、保存剤、テクスチャー(texture)、風味及び/又は被覆剤、酸化防止剤、保存剤及び染料と共に処方できる。

【0027】

経口用組成物、及び特に食物サプリメント用の処方用の薬剤及び賦形剤は、当分野において公知であり、従って詳しく説明はしない。本発明による化粧学的方法は、例えば毎日、例えばゲルカプセル、ゲル、糖衣錠剤、エマルション、錠剤、ウエハカプセル又は飲用可能なアンプル等の形状であり得る、経口組成物又は食物サプリメントを、その形態に依存して、該タウリン及び/又はヒポタウリン又は許容されるその塩を、タウリンの当量で表して、0.5~4000mg/日なる範囲、好ましくは10~500mg/日なる範囲、及びより好ましくは約150mg/日なる割合で摂取するように、及び/又は該ポリフェノールを、約0.5~2000mg/日なる範囲の用量で摂取するように、及び/又は該脂肪酸を、0.5~5400mg/日なる範囲及び好ましくは5~1600mg/日なる範囲の用量で摂取するように、経口摂取することによって達成される。

本発明の方法は、単なる摂取からなるものであり得るが、一般に、適当な場合には、1回以上の中断期間を介して、少なくとも4週間又は4~8週間という長期間に渡り適用される。

一例として、黒フサスグリ種子油によって与えることができる、 α -リノレン酸については、約10~3000mg/日なる範囲及び好ましくは50~1000mg/日なる範囲の服用量を意図することができる。

【実施例】

【0028】

以下の説明及び実施例において、特に述べない限り、%は質量%であり、また「~なる範囲(内)」なる表現で記載される数値範囲は、記載された上限及び下限を含むものとする。上記成分は、成型する前に、当業者が容易に実施できる順序及び条件下で混合される。

以下に与えられる実施例及び図面は、本発明の範囲の非-限定的な例示として与えられるものである。

脂肪酸及びポリフェノールの活性を立証するための実施例

これら化合物の活性を明らかにするために、特定の毛嚢脂腺形成に及ぼす活性の検出テスト：CVOテストを利用した。

ハムスターのCVO(肋骨脊椎器官)は、毛嚢脂腺単位(毛包及びその皮脂腺)に富む皮膚領域である。このものの生成サイズは、テストステロンの作用下では増大する。このテスト(Liao S.等, Arch. Dermatol. Res., 2001, Apr.: 293(4): 200-205)は、該CVOに及ぼす化合物の抗-アンドロゲン作用を検出すること、即ち該化合物がテストステロンの作用を阻害するか否かを決定することからなる。

【0029】

1. 脂肪酸によるCVOテスト

このテストでは、飼料中に10%で含まれる黒フサスグリ種子油を、85日間に渡り、オスのハムスターに給餌した。この栄養補給物は、テストステロンにより誘起される、該CVOのサイズにおける増大を阻止することが分かる。

即ち、図1における破線は、この実験中(x軸上の期間)、補給されなかったコントロール動物における、該CVOのサイズ(mm²)の変化を表す。この曲線によれば、テストステロン-誘発性の該CVOのサイズにおける増大が、観測される。図中の実線は、補給を行った動物の場合における、該CVOのサイズにおける変化を示し、この増加は、事実上零まで減じられる。

2. ポリフェノールを用いたCVOテスト

18%のフラバノイド成分を含有する、ロバーテット(Robertet)赤ワイン濃縮液(飼料43g

10

20

30

40

50

中0.11g)としての栄養物を毎日与えたところ、85日間の摂取時点で、右CV0/左CV0の差が、事実上零であることが分かった(図2)。

【 0 0 3 0 】

即ち、図2における破線は、この実験中(x軸上の期間)、補給されなかったコントロール動物における、該CV0のサイズ(mm²)の変化を表す。この曲線によれば、テストステロン-誘発性の該CV0のサイズにおける増大が、観測される。図中の実線は、補給を行った動物の場合における、該CV0のサイズにおける変化を示し、この増加は、事実上零まで減じられる。

3. 生殖器に関する副作用の有無

これらの経口投与用の栄養サプリメントの供給を受けたハムスターの場合には、抗-アンドロゲン性作用の影響は、該CV0ばかりでなく、雄の動物における生殖器官においてさえ観測された。両者において、これら栄養サプリメントは、精囊腺又は前立腺の質量に悪影響を及ぼすことはないことが分かった。

【 0 0 3 1 】

タウリンの活性を立証するための実施例

スクリーニング法により、該化合物の、繊維芽細胞の成長及び細胞外マトリックスの主な構成成分の合成に及ぼす影響を評価する目的で、研究を行った。この技術は、この細胞代謝に対するタウリンの利点を研究し、かつ評価することを可能とした(T. Shigematsu等, Biochimica et Biophysica Acta, 1200 (1994) 79-83)。

正常なヒト皮膚繊維芽細胞のプール(NHDFプールPF2、第8継体において使用)を、培地中で標準的な条件下で培養した(DMEM、2mMのL-グルタミン、50IU/ml/50g/mlペニシリン/ストレプトマイシン、0.5%子牛血清)。

タウリンは、無菌培地内で、10mM及び1mMなる濃度にて、未処理のコントロールプランクに対してテストした。

繊維芽細胞へのチミジン、プロリン及びロイシンの組込みの結果を、以下の表1に与えるが、この表1は、インビトロ培養における、NHDFにより新たに合成された巨大分子への、チミジン、プロリン及びロイシンの組込みに及ぼす、タウリンの作用を示す。下線で示した数値は、大幅な変動が見られた場合を示す(表1において、「統計上有意」とは、統計的有意さ：p<0.005を意味する)。これらの結果は、コントロールに対する百分率(%対照)として表されている。

【 0 0 3 2 】

【表 1】

	チミジン		プロリン		ロイシン	
	%対照	統計上有意	%対照	統計上有意	%対照	統計上有意
1mMタウリン	89	p>0.05	<u>88</u>	p>0.01	100	p>0.05
10mMタウリン	90	p>0.05	<u>87</u>	p>0.01	105	p>0.05

【 0 0 3 3 】

これら2種の処理濃度において、タウリンは、該繊維芽細胞による、細胞増殖を表すチミジンの組込み、又は非-コラーゲンタンパク質の合成を示すロイシンの組込みを有意に変更せず、他方でタウリンが、該繊維芽細胞によるプロリンの組込みを有意に阻害したことを示している。

処方例

実施例1：糖衣錠型の処方物

【 0 0 3 4 】

【表 2】

成分	mg/糖衣錠
タウリン	50
糖衣錠コア用の賦形剤	
ミクロクリスタリンセルロース	70
エンコンプレス (Encompress™)	60
ステアリン酸マグネシウム	3
無水コロイダルシリカ	1
被覆剤	
セラック	5
タルク	61
スクロース	250
ポリビドン	6
二酸化チタン	0.3
着色剤	5

10

【0035】

この型の糖衣錠は、1日当たり2～3回摂取することができる。

実施例2：植物又は動物ゼラチンゲルカプセル

【0036】

20

【表 3】

活性成分	mg/糖衣錠
タウリン	80
デンプン	128
ステアリン酸マグネシウム	2.5

【0037】

この型のゲルカプセルは、1日当たり2～3回摂取することができる。

30

実施例3：単一投与型ゲル

【0038】

【表 4】

活性成分	質量%
タウリン	4
亜鉛-富化した酵母 (22.75% の Zn)	2
賦形剤	
ロジゲル (Rhodigel™)	2.3
ココア抽出液	20
ソルビン酸カリウム	0.05
安息香酸ナトリウム	0.05
水	全体を100とするのに十分な量

40

【0039】

50

1日当たり、この製品の200～400mlを使用することができる。

実施例4：単一投与型ゲル

【0040】

【表5】

活性成分	質量%
タウリン	4
黒フサスグリ種子オイル	10
賦形剤	
糖シロップ	50
マルトデキストリン	17
ゼンタンガム	0.8
安息香酸ナトリウム	0.2
水	全体を100とするのに十分な量

10

【0041】

1日当たり、この製品の200～400mlを使用することができる。

実施例5：単一投与型ゲル

【0042】

【表6】

活性成分	質量%
タウリン	4
黒フサスグリ種子オイル	10
酸化防止剤複合体	*
賦形剤	
糖シロップ	50
マルトデキストリン	17
ゼンタンガム	0.8
安息香酸ナトリウム	0.2
水	全体を100とするのに十分な量

20

30

*：この酸化防止剤複合体は、ゲル200ml当たり、120mgのビタミンC、100μgのセレン、30mgのビタミンE、20mgの亜鉛及び6mgのβ-カロテンを含む。

【0043】

1日当たり、この製品の200～400mlを使用することができる。

実施例6：ウエハカプセル

【0044】

【表7】

	量(mg/カプセル)
タウリン	50
亜鉛グルコネート	160
ワイン抽出液(20%PCO)	300
グリセロール	150
ステアリン酸マグネシウム	0.02
水	全体を900mgとするのに十分な量

40

【0045】

実施例7：ウエハカプセル

【0046】

50

【表 8】

	量 (mg/カプセル)
タウリン	50
亜鉛グルコネート	160
ワイン抽出液 (20% PCO)	300
グリセロール	150
ステアリン酸マグネシウム	0.02
ビタミン複合体	十分な量*
水	全体を900mgとするのに十分な量

* : このビタミン複合体は、60mgのビタミンC、50 μ gのセレン、15mgのビタミンE、10mgの亜鉛及び3mgのリコペンを含む。

【 0 0 4 7 】

実施例8：糖衣錠型の処方物

【 0 0 4 8 】

【表 9】

	量 (mg/糖衣錠)
タウリン	50
ブドウ種子抽出物 (40%のPCO)	100
緑茶抽出物 (30%のカテキン)	125
硫酸亜鉛 (22.75%)	22
糖衣錠のコア用の賦形剤	
ミクロクリスタリンセルロース	70
エンコンプレス (Encompress™)	60
ステアリン酸マグネシウム	3
無水コロイダルシリカ	1
被覆剤	
セラック	5
タルク	61
スクロース	250
ポリビドン	6
二酸化チタン	0.3
着色剤	5

【 0 0 4 9 】

この型の糖衣錠は、1日当たり1～3回に渡り摂取することができる。

実施例9：糖衣錠型の処方物

【 0 0 5 0 】

【表 1 0】

	量 (mg/糖衣錠)
ブドウ種子抽出物 (40%のPCO)	100
緑茶抽出物 (30%のカテキン)	125
硫酸亜鉛 (22.75%)	22
糖衣錠のコア用の賦形剤	
ミクロクリスタリンセルロース	70
エンコンプレス	60
ステアリン酸マグネシウム	3
無水コロイダルシリカ	1
被覆剤	
セラック	5
タルク	61
スクロース	250
ポリビドン	6
二酸化チタン	0.3
着色剤	5

10

【 0 0 5 1】

この型の糖衣錠は、1日当たり1～2回に渡り摂取することができる。

実施例10：糖衣錠型の処方物

20

【 0 0 5 2】

【表 1 1】

	量 (mg/糖衣錠)
タウリン	50
ブドウ種子抽出物 (40%のPCO)	50
緑茶抽出物 (30%のカテキン)	125
硫酸亜鉛 (22.75%)	22
糖衣錠のコア用の賦形剤	
ミクロクリスタリンセルロース	70
エンコンプレス	60
ステアリン酸マグネシウム	3
無水コロイダルシリカ	1
被覆剤	
セラック	5
タルク	61
スクロース	250
ポリビドン	6
二酸化チタン	0.3
着色剤	5

30

【 0 0 5 3】

この型の糖衣錠は、1日当たり1～3回に渡り摂取することができる。

40

実施例11：植物又は動物ゼラチンゲルカプセル

【 0 0 5 4】

【表 1 2】

活性成分	量 (mg/ゲルカプセル)
ブドウ種子抽出物 (40%のPCO)	50
緑茶抽出物 (30%のカテキン)	175
デンプン	128
ステアリン酸マグネシウム	2.5

【 0 0 5 5 】

1日あたり1～4個のゲルカプセルを摂取することができる。

10

実施例12：植物又は動物ゼラチンゲルカプセル

【 0 0 5 6 】

【表 1 3】

活性成分	量 (mg/ゲルカプセル)
タウリン	80
ブドウ種子抽出物 (40%のPCO)	50
緑茶抽出物 (30%のカテキン)	175
デンプン	128
ステアリン酸マグネシウム	2.5

20

【 0 0 5 7 】

1日あたり1～4個のゲルカプセルを摂取することができる。

実施例13：単一投与型ゲル

【 0 0 5 8 】

【表 1 4】

活性成分	量 (質量%)
タウリン	4
ブドウ種子抽出物 (40%のPCO)	4
緑茶抽出物 (30%のカテキン)	6
亜鉛-富化した酵母 (22.75%のZn)	2
賦形剤	
ロジゲル (Rhodigel™)	2.3
ココア抽出物	20
ソルビン酸カリウム	0.05
安息香酸ナトリウム	0.05
水	全体を100とするに要する量

30

【 0 0 5 9 】

1日当たり、200～400mlの、このゲルを使用することができる。

40

実施例14：単一投与型ゲル

【 0 0 6 0 】

【表 1 5】

活性成分	量(質量%)
ブドウ種子抽出物(40%のPCO)	4
緑茶抽出物(30%のカテキン)	10
黒フサスグリ種子オイル	10
賦形剤	
糖シロップ	50
マルトデキストリン	17
ザンタンガム	0.8
安息香酸ナトリウム	0.2
水	全体を100とするに要する量

10

【 0 0 6 1 】

1日当たり、200～400mlの、このゲルを使用することができる。

実施例15：ウエハカプセル

【 0 0 6 2 】

【表 1 6】

	量(mg/カプセル)
タウリン	50
亜鉛グルコネート	60
ワイン抽出物(20%PCO)	300
グリセロール	150
ステアリン酸マグネシウム	0.02
水	全体を900mgとするに要する量

20

【 0 0 6 3 】

1日あたり1～4個のウエハカプセルを摂取することができる。

実施例16：粉末(散剤)

30

全ポリフェノールの540mgまでを与えるワイン抽出物1.8g(360mgのPCOを含む)、120mgまでのタウリン、0.01gのグッドブレンド(Goodblend)甘味料、0.4gのFRAM0584香料及び4gのマルトデキストリンを、1日毎に消費するために、水、乳製品に希釈するための、又は穀物/果実製のダイエットバーに配合するための、粉末として使用した。

同一の条件下で、以下に列挙するものを使用した：

- ・同一の全ポリフェノール量を与える、ブドウの抽出物及び/又はその生物工学的な製品(グレープジュース、ワイン等)の混合物と、タウリンの量150mg/日をもたらす、タウリンに富む天然タンパク質源との組み合わせ。
- ・同一の全ポリフェノール量を与える、ツバキ(Camellia sinensis)又はカカオ樹の種子(Theobroma cacao)の抽出物と、同一のタウリンの量をもたらす、タウリンに富む天然タンパク質源との組み合わせ。

40

【 0 0 6 4 】

実施例17

実施例5で得たゲル200ml中の、120mgのビタミンC、100 µgのビタミンE、20mgの亜鉛及び6mgのβ-カロテン、及び実施例10の糖衣錠中の60mgのビタミンC、50 µgのビタミンE、10mgの亜鉛及び3mgのβ-カロテンを含有するビタミン複合体を、実施例13のゲル処方物に添加する。

実施例18

実施例17の処方において、該β-カロテンをリコペンで置換する。

50

実施例19：単一服用ゲル**【 0 0 6 5 】****【表 1 7】**

活性成分	量(質量%)
タウリン	4
ブドウ種子抽出物(40%のPCO)	4
緑茶抽出物(30%のカテキン)	6
黒フサスグリ種子オイル	10
賦形剤	
糖シロップ	50
マルトデキストリン	17
ザンタンガム	0.8
安息香酸ナトリウム	0.2
水	全体を100とするに要する量

10

【 0 0 6 6 】

1日当たり、200～400mlなる用量を摂取することができる。

実施例20：ウエハカプセル**【 0 0 6 7 】****【表 1 8】**

成分	量(mg/カプセル)
タウリン	50
亜鉛グルコネート	60
ワイン抽出物(20%のPCO)	200
黒フサスグリ種子オイル	300
グリセロール	150
ステアリン酸マグネシウム	0.02
天然香料	
水	全体を900mgとするに要する量

20

30

【 0 0 6 8 】

1日当たり、このウエハカプセル1～3個を、摂取することができる。

40

50

実施例21：糖衣錠型の処方物

【 0 0 6 9 】

【表 1 9】

	量(mg/糖衣錠)
タウリン	50
ブドウ種子抽出物(40%のPCO)	50
緑茶抽出物(30%のカテキン)	125
硫酸亜鉛(22.75%)	22
糖衣錠のコア用賦形剤	
ミクロクリスタリンセルロース	70
エンコンプレス	60
ステアリン酸マグネシウム	3
無水コロイダルシリカ	1
被覆剤	
セラック	5
タルク	61
スクロース	250
ポリビドン	6
二酸化チタン	0.3
着色剤	5

10

20

【 0 0 7 0 】

この型の糖衣錠は、1日当たり1～3回摂取することができる。

実施例22

ゲル200ml当たり、120mgのビタミンC、100 μgのビタミンE、20mgの亜鉛及び6mgの - カロテンを含むビタミン複合体を、実施例19の処方物に添加する。

実施例23

ゲル200ml当たり、120mgのビタミンC、100 μgのビタミンE、20mgの亜鉛及び6mgのリコペンを含むビタミン複合体を、実施例19の処方物に添加する。

実施例24

糖衣錠用の、60mgのビタミンC、50 μgのビタミンE、10mgの亜鉛及び3mgのリコペンを含むビタミン複合体を、実施例22の処方物に添加する。

30

実施例25：錠剤型の処方物

【 0 0 7 1 】

【表 2 0】

活性成分	量(mg/錠剤)
タウリン	75
ブドウ種子抽出物(40%PCO)	75
緑茶抽出物(30%のカテキン)	187.5
亜鉛グルコネート(14.3%のZn)	52.3
賦形剤	全体を1gとするに要する量

40

【 0 0 7 2 】

この型の錠剤を1日当たり2回摂取する。

実施例26

ほぼ18～40歳の範囲の、細い精彩を欠いた脂漏性の毛髪を持つ、各18名の女性からなる2群に、6ヶ月間に渡り摂取してもらった：

- 以下の組成を有する毛髪用処方物：

【 0 0 7 3 】

50

【表 2 1】

成分	量 (mg)
タウリン	150
緑茶抽出物 (30%のカテキン)	375
ブドウ種子抽出物 (40%PCO及び20%のカテキン)	150
硫酸亜鉛 (22.75%)	15*

*: 亜鉛の質量で表示

【 0 0 7 4 】

10

- 又は、ブラシーボ、即ち同一の外観を持つ、マルトデキストリンを主成分とする錠剤。

この治療の効果を、自己評価により、あるいはT0、T3ヶ月及びT6ヶ月経過時点における、3回該毛髪に櫛を通して脱毛させることより、検討した。

この櫛を通した際の、毛髪の数における均一な減少が、該治療群において観測され、統計的に有意なこの違いを、該ブラシーボを投与した群の、6ヵ月後の値と比較した。この結果を図3に示す。

【図面の簡単な説明】

【 0 0 7 5 】

20

【図 1】 CV0テストにおいて、脂肪酸をハムスターに摂取させた際の結果を示す。

【図 2】 CV0テストにおいて、ポリフェノールをハムスターに摂取させた際の結果を示す。

【図 3】 本発明に従って治療した個体、及びコントロールとしての個体の場合において観測された、毛髪喪失防止の結果を示す。

【図 1】

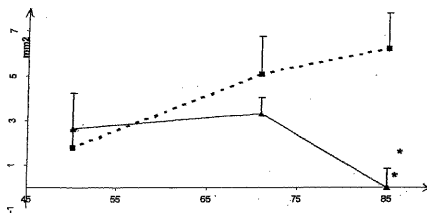


FIG. 1

【図 2】

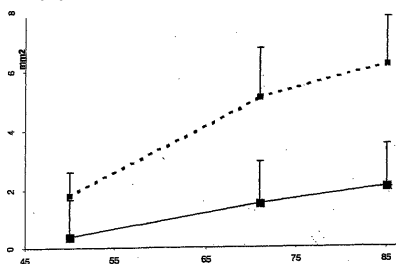


FIG. 2

【図 3】

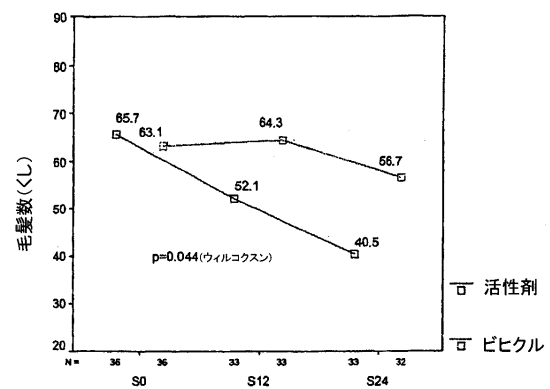


FIG. 3

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

A 6 1 K 31/201 (2006.01)	A 6 1 K 31/201
A 6 1 K 31/202 (2006.01)	A 6 1 K 31/202
A 6 1 K 31/23 (2006.01)	A 6 1 K 31/23
A 6 1 K 31/232 (2006.01)	A 6 1 K 31/232
A 6 1 K 31/352 (2006.01)	A 6 1 K 31/352
A 6 1 K 31/353 (2006.01)	A 6 1 K 31/353
A 6 1 K 31/355 (2006.01)	A 6 1 K 31/355
A 6 1 K 31/375 (2006.01)	A 6 1 K 31/375
A 6 1 K 31/437 (2006.01)	A 6 1 K 31/437
A 6 1 K 31/7048 (2006.01)	A 6 1 K 31/7048
A 6 1 K 31/765 (2006.01)	A 6 1 K 31/765
A 6 1 K 33/04 (2006.01)	A 6 1 K 33/04
A 6 1 K 33/30 (2006.01)	A 6 1 K 33/30
A 6 1 P 17/14 (2006.01)	A 6 1 P 17/14
A 2 3 L 1/305 (2006.01)	A 2 3 L 1/305
A 2 3 L 1/30 (2006.01)	A 2 3 L 1/30
A 6 1 K 9/06 (2006.01)	A 6 1 K 9/06
A 6 1 K 9/08 (2006.01)	A 6 1 K 9/08
A 6 1 K 9/107 (2006.01)	A 6 1 K 9/107
A 6 1 K 9/14 (2006.01)	A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 9/20 (2006.01)	A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 9/28 (2006.01)	A 6 1 K 9/28
A 6 1 K 9/48 (2006.01)	A 6 1 K 9/48

Z

(31)優先権主張番号 02/07765

(32)優先日 平成14年6月21日(2002.6.21)

(33)優先権主張国 フランス(FR)

前置審査

(72)発明者 デュラントン アルベール

フランス エフ - 7 8 6 0 0 メゾン ラフィット ビス リュ デュ ティル 5 5

(72)発明者 ブレトン リオネル

フランス エフ - 7 8 0 0 0 ヴェルサイユ リュ ド サトリ 1 4

審査官 瀬下 浩一

(56)参考文献 特開平10-099048(JP,A)

特開平11-332514(JP,A)

特開平10-028553(JP,A)

特開平07-048270(JP,A)

特開平08-073350(JP,A)

特開平10-007553(JP,A)

特開2001-269148(JP,A)

特開2001-270881(JP,A)

特開2002-097116(JP,A)

特開2002-003371(JP,A)

国際公開第 0 1 / 0 5 8 2 8 3 (WO , A 1)

国際公開第 9 9 / 0 2 2 7 2 8 (WO , A 1)

国際公開第 0 0 / 0 3 0 4 7 7 (WO , A 1)

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

A61K 31/185

A61K 31/01

A61K 31/045

A61K 31/07

A61K 31/20

A61K 31/201

A61K 31/202

A61K 31/23

A61K 31/232

A61K 31/352

A61K 31/353

A61K 31/355

A61K 31/375

A61K 31/437

A61K 31/7048

A61K 31/765

A61K 33/04

A61K 33/30

A61K 9/06

A61K 9/08

A61K 9/107

A61K 9/14

A61K 9/20

A61K 9/28

A61K 9/48

A61P 17/14

A23L 1/30

A23L 1/305

CAPLus/MEDLINE/EMBASE/BIOSIS(STN)

JSTPLus/JMEDPLus(JDreamII)