

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4301443号
(P4301443)

(45) 発行日 平成21年7月22日(2009.7.22)

(24) 登録日 平成21年5月1日(2009.5.1)

(51) Int.Cl.	F I
A 6 1 K 8/35 (2006.01)	A 6 1 K 8/35
A 6 1 K 8/49 (2006.01)	A 6 1 K 8/49
A 6 1 K 8/40 (2006.01)	A 6 1 K 8/40
A 6 1 K 8/02 (2006.01)	A 6 1 K 8/02
A 6 1 K 9/70 (2006.01)	A 6 1 K 9/70 4 O 1
請求項の数 3 (全 14 頁) 最終頁に続く	

(21) 出願番号	特願2004-29878 (P2004-29878)	(73) 特許権者	000215958
(22) 出願日	平成16年2月5日(2004.2.5)		帝國製薬株式会社
(65) 公開番号	特開2005-220077 (P2005-220077A)		香川県東かがわ市三本松567番地
(43) 公開日	平成17年8月18日(2005.8.18)	(74) 代理人	100082072
審査請求日	平成19年1月18日(2007.1.18)		弁理士 清原 義博
		(72) 発明者	藤川 明男
			京都府京都市伏見区深草平田町4番地
		審査官	▲高▼岡 裕美
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 育毛剤及び該育毛剤を含有する貼布剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の(A)大環状合成ムスク、(B)ニトロ系合成ムスク、(C)インダン系合成ムスク及び(D)テトラリン系合成ムスクからなる群から選択される1種以上からなることを特徴とする育毛剤。

(A) 大環状合成ムスク

シベトン(9-シクロペンタデセン-1-オン)、シクロペンタデカノン、シクロヘキサデセノン(5-シクロヘキサデセン-1-オン)、シクロペンタデカノリド、12-ケトシクロペンタデカノリド(オキサシクロヘキサデカン-2,13-ジオン)、シクロヘキサデカノリド、シクロヘキサデセノリド(7-シクロヘキサデセノリド)、12-オキサ-16-ヘキサデカノリド、11-オキサ-16-ヘキサデカノリド、10-オキサ-16-ヘキサデカノリド、エチレンプラシレート、エチレンドデカンジオエート

(B) ニトロ系合成ムスク

ムスクケトン(2,6-ジニトロ-3,5-ジメチル-4-t-ブチルベンゼン)、ムスクキシロール(2,4,6-トリニトロ-5-t-ブチルベンゼン)、ムスクアンブレット(2,6-ジニトロ-3-メトキシ-1-メチル-4-t-ブチルベンゼン)、ムスクチベテン(2,6-ジニトロ-3,4,5-トリメチル-t-ブチルベンゼン)、ムスクモスケン(1,1,3,3,5-ペンタメチル-4,6-ジニトロインダン)

(C) インダン系合成ムスク

6-アセチルヘキサメチルインダリン(6-アセチル-1,1,2,3,3,5-ヘキ

10

20

サメチルインダン)、4 - アセチルジメチル - t - ブチルインダリン (4 - アセチル - 6 - t - ブチル - 1, 1 - ジメチルインダリン)、5 - アセチルテトラメチルイソプロピルインダン (5 - アセチル - 3 - イソプロピル - 1, 1, 2, 6 - テトラメチルインダン) (D) テトラリン系合成ムスク

6 - アセチルヘキサテトラリン (6 - アセチル - 1, 1, 2, 4, 4, 7 - ヘキサメチルテトラリン)、ヘキサメチルヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン (4, 6, 6, 7, 8, 8 - ヘキサメチル - 1, 3, 4, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン)

【請求項 2】

以下の (A) 大環状合成ムスク、(B) ニトロ系合成ムスク、(C) インダン系合成ムスク及び (D) テトラリン系合成ムスクからなる群から選択される 1 種以上が含有されていることを特徴とする育毛用貼付剤。

(A) 大環状合成ムスク

ムスコン (3 - メチルシクロペンタデカノン)、シベトン (9 - シクロペンタデセン - 1 - オン)、シクロペンタデカノン、シクロヘキサデセノン (5 - シクロヘキサデセン - 1 - オン)、シクロペンタデカノリド、12 - ケトシクロペンタデカノリド (オキサシクロヘキサデカン - 2, 13 - ジオン)、シクロヘキサデカノリド、シクロヘキサデセノリド (7 - シクロヘキサデセノリド)、12 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、11 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、10 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、エチレンブラシレート、エチレンドデカンジオエート

(B) ニトロ系合成ムスク

ムスクケトン (2, 6 - ジニトロ - 3, 5 - ジメチル - 4 - t - ブチルベンゼン)、ムスクキシロール (2, 4, 6 - トリニトロ - 5 - t - ブチルベンゼン)、ムスクアンプレット (2, 6 - ジニトロ - 3 - メトキシ - 1 - メチル - 4 - t - ブチルベンゼン)、ムスクチペテン (2, 6 - ジニトロ - 3, 4, 5 - トリメチル - t - ブチルベンゼン)、ムスクモスケン (1, 1, 3, 3, 5 - ペンタメチル - 4, 6 - ジニトロインダン)

(C) インダン系合成ムスク

6 - アセチルヘキサメチルインダリン (6 - アセチル - 1, 1, 2, 3, 3, 5 - ヘキサメチルインダン)、4 - アセチルジメチル - t - ブチルインダリン (4 - アセチル - 6 - t - ブチル - 1, 1 - ジメチルインダリン)、5 - アセチルテトラメチルイソプロピルインダン (5 - アセチル - 3 - イソプロピル - 1, 1, 2, 6 - テトラメチルインダン)

(D) テトラリン系合成ムスク

6 - アセチルヘキサテトラリン (6 - アセチル - 1, 1, 2, 4, 4, 7 - ヘキサメチルテトラリン)、ヘキサメチルヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン (4, 6, 6, 7, 8, 8 - ヘキサメチル - 1, 3, 4, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン)

【請求項 3】

支持体と、該支持体に含浸又は積層された基剤層とからなり、該基剤層には請求項 2 に記載の (A) 大環状合成ムスク、(B) ニトロ系合成ムスク、(C) インダン系合成ムスク及び (D) テトラリン系合成ムスクからなる群から選択される 1 種以上が含有されていることを特徴とする育毛用貼付剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は育毛剤及び該育毛剤を含有する貼布剤に関する。本発明の目的は、経皮吸収性に優れた育毛剤及び、皮膚局所に直接貼って使用することで、育毛剤を長時間にわたって徐々に経皮吸収させて、優れた育毛効果を発揮することができる貼布剤を提供することにある。

【背景技術】

【0002】

10

20

30

40

50

脱毛症の大部分を占める男性型脱毛症には、「男性ホルモン」が関与していることが知られている。

テストステロンなどの男性ホルモンはそのままの形では活性は低い。しかし、皮脂腺には還元酵素 5 - - リダクターゼが存在しており、テストステロンは活性の高い 5 - - デヒドロテストステロン (DHT) に還元される。DHT は毛母細胞が取り込んだ栄養成分を細胞分裂に必要なエネルギーに変換することを阻害するために、毛母細胞は細胞分裂に必要なエネルギーを生産することができず、これが、脱毛症の原因の一つと考えられている。

従って、テストステロンなどの男性ホルモンを活性の高い DHT に還元する 5 - - リダクターゼの活性を阻害することで、脱毛症の予防や治療を行うことができると考えられる。5 - - リダクターゼの阻害剤としては、エストラジオールなどの女性ホルモン (特許文献 1 参照) が知られているが、副作用の危険性が高く、広く普及するに至っていない。

10

【 0 0 0 3 】

一方、脱毛症の他の原因としては、毛母細胞の機能低下を挙げることができる。毛母細胞の機能を正常に戻すことができれば、脱毛を予防し、発毛を促進することができると考えられる。

毛母細胞の機能を正常化することができると考えられているものとして、細胞増殖因子、血行促進剤、毛母細胞賦活剤などが知られている。

細胞増殖因子としては、ジアルキルモノアミン誘導体、マイカイ花エキス、イチョウエキス、感光素 3 0 1 号、チョウレイエキス、サンザシエキス、グロスフェリン、プラセンタエキス、インスリン様成長因子 (IGF・I) などが知られている。

20

血行促進剤としては、センブリエキス、酢酸トコフェロール、ニコチン酸ベンジル、トウガラシチンキ、ミノキシジル、塩化カルプロニウムなどが知られている。

毛母細胞賦活剤としては、ペンタデカン酸グリセリド、6 - ベンジルアミノプリン (特許文献 2 参照) などが知られている。

【 0 0 0 4 】

【特許文献 1】特公平 6 - 0 1 0 1 2 7 号公報

【特許文献 2】特許第 2 6 3 6 1 1 8 号公報

【発明の開示】

30

【発明が解決しようとする課題】

【 0 0 0 5 】

現在一般に市販されている育毛剤組成物は、頭皮にふりかけたり、頭皮に塗布したり、或いは頭皮に直接塗り込んだりして使用するものが殆どである。育毛剤組成物中の有効成分は毛母細胞或いはその周辺で作用するものであるから、有効成分を毛乳頭にまで供給させないと、育毛効果を得ることはできない。

頭皮から毛乳頭にまで育毛剤組成物の有効成分を浸透させるには、有効成分を毛孔から毛包側壁を通過させなければならない。しかしながら、毛孔や毛包内は分泌された皮脂によって親油性の状態になっており、普通にシャンプーをして毛孔周辺をきれいにしたとしても、毛包内部は皮脂が詰まったままの状態であり、水溶性である育毛剤組成物の有効成分は毛母細胞の周辺に浸透し難い。

40

【 0 0 0 6 】

従って、従来の育毛剤組成物は一日に複数回使用することで、育毛効果を得ようとしている。しかしながら、従来の育毛剤組成物を一日に複数回使用したとしても、使用直後は有効成分の頭皮への供給量は増えるが、有効成分を長時間にわたって供給することはできず、十分な育毛効果を得ることは困難であった。また、従来の育毛剤組成物のように、一日に複数回使用する場合、使用することを忘れてしまったり、或いは忙しい時には使用することができない場合があり、従来の育毛剤組成物は長期間継続して使用することが困難であった。

【課題を解決するための手段】

50

【 0 0 0 7 】

本発明は上記した課題を解決するためになされた発明であり、請求項 1 に係る発明は、以下の (A) 大環状合成ムスク、(B) ニトロ系合成ムスク、(C) インダン系合成ムスク及び (D) テトラリン系合成ムスクからなる群から選択される 1 種以上からなることを特徴とする育毛剤に関する。

(A) 大環状合成ムスク

シベトン (9 - シクロペンタデセン - 1 - オン)、シクロペンタデカノン、シクロヘキサデセノン (5 - シクロヘキサデセン - 1 - オン)、シクロペンタデカノリド、12 - ケトシクロペンタデカノリド (オキサシクロヘキサデカン - 2, 13 - ジオン)、シクロヘキサデカノリド、シクロヘキサデセノリド (7 - シクロヘキサデセノリド)、12 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、11 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、10 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、エチレンブラシレート、エチレンドデカンジオエート

(B) ニトロ系合成ムスク

ムスクケトン (2, 6 - ジニトロ - 3, 5 - ジメチル - 4 - t - ブチルベンゼン)、ムスクキシロール (2, 4, 6 - トリニトロ - 5 - t - ブチルベンゼン)、ムスクアンプレット (2, 6 - ジニトロ - 3 - メトキシ - 1 - メチル - 4 - t - ブチルベンゼン)、ムスクチピテン (2, 6 - ジニトロ - 3, 4, 5 - トリメチル - t - ブチルベンゼン)、ムスクモスケン (1, 1, 3, 3, 5 - ペンタメチル - 4, 6 - ジニトロインダン)

(C) インダン系合成ムスク

6 - アセチルヘキサメチルインダリン (6 - アセチル - 1, 1, 2, 3, 3, 5 - ヘキサメチルインダン)、4 - アセチルジメチル - t - ブチルインダリン (4 - アセチル - 6 - t - ブチル - 1, 1 - ジメチルインダリン)、5 - アセチルテトラメチルイソプロピルインダン (5 - アセチル - 3 - イソプロピル - 1, 1, 2, 6 - テトラメチルインダン)

(D) テトラリン系合成ムスク

6 - アセチルヘキサテトラリン (6 - アセチル - 1, 1, 2, 4, 4, 7 - ヘキサメチルテトラリン)、ヘキサメチルヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン (4, 6, 6, 7, 8, 8 - ヘキサメチル - 1, 3, 4, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン)

請求項 2 に係る発明は以下の (A) 大環状合成ムスク、(B) ニトロ系合成ムスク、(C) インダン系合成ムスク及び (D) テトラリン系合成ムスクからなる群から選択される 1 種以上が含有されていることを特徴とする育毛用貼付剤に関する。

(A) 大環状合成ムスク

ムスコン (3 - メチルシクロペンタデカノン)、シベトン (9 - シクロペンタデセン - 1 - オン)、シクロペンタデカノン、シクロヘキサデセノン (5 - シクロヘキサデセン - 1 - オン)、シクロペンタデカノリド、12 - ケトシクロペンタデカノリド (オキサシクロヘキサデカン - 2, 13 - ジオン)、シクロヘキサデカノリド、シクロヘキサデセノリド (7 - シクロヘキサデセノリド)、12 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、11 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、10 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、エチレンブラシレート、エチレンドデカンジオエート

(B) ニトロ系合成ムスク

ムスクケトン (2, 6 - ジニトロ - 3, 5 - ジメチル - 4 - t - ブチルベンゼン)、ムスクキシロール (2, 4, 6 - トリニトロ - 5 - t - ブチルベンゼン)、ムスクアンプレット (2, 6 - ジニトロ - 3 - メトキシ - 1 - メチル - 4 - t - ブチルベンゼン)、ムスクチピテン (2, 6 - ジニトロ - 3, 4, 5 - トリメチル - t - ブチルベンゼン)、ムスクモスケン (1, 1, 3, 3, 5 - ペンタメチル - 4, 6 - ジニトロインダン)

(C) インダン系合成ムスク

6 - アセチルヘキサメチルインダリン (6 - アセチル - 1, 1, 2, 3, 3, 5 - ヘキサメチルインダン) 4 - アセチルジメチル - t - ブチルインダリン (4 - アセチル - 6 - t - ブチル - 1, 1 - ジメチルインダリン)、5 - アセチルテトラメチルイソプロピルインダン (5 - アセチル - 3 - イソプロピル - 1, 1, 2, 6 - テトラメチルインダン)

(D) テトラリン系合成ムスク

6 - アセチルヘキサテトラリン (6 - アセチル - 1, 1, 2, 4, 4, 7 - ヘキサメチルテトラリン)、ヘキサメチルヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン (4, 6, 6, 7, 8, 8 - ヘキサメチル - 1, 3, 4, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン)

請求項 3 に係る発明は、支持体と、該支持体に含浸又は積層された基剤層とからなり、該基剤層には請求項 2 に記載の (A) 大環状合成ムスク、(B) ニトロ系合成ムスク、(C) インダン系合成ムスク及び (D) テトラリン系合成ムスクからなる群から選択される 1 種以上が含有されていることを特徴とする育毛用貼付剤に関する。

10

【発明の効果】

【0008】

本発明に係る育毛剤は優れた育毛効果を有する。しかも、本発明に係る育毛剤は経皮吸収性に優れるので、従来の育毛剤に比べて優れた育毛効果を発揮することができる。

本発明に係る貼布剤は皮膚局所に直接貼って使用することで、基剤層に含まれる育毛剤を長時間にわたって徐々に経皮吸収させることができ、優れた育毛効果を発揮することが可能である。また、本発明に係る貼布剤は皮膚局所に貼るだけで、長時間にわたって育毛剤を徐々に経皮吸収させることができるので、従来の育毛剤組成物に比べて手軽に使用することができる。

【発明を実施するための最良の形態】

20

【0009】

以下、本発明について詳細に説明する。本発明に係る貼布剤は必須成分として、ムスク様香気を有する香料成分を含有する。

ムスクはジャコウとも呼ばれ、ジャコウジカ (*Moschus moschiferus* L.) の雄の腹部にある香のうの分泌物を乾燥したものである。ジャコウジカの商取引はワシントン条約で禁止されており、非常に高価である。

【0010】

本発明では、ムスク様香気を有する香料成分が育毛剤の有効成分である。本発明者らは、後述する試験例に示されるように、ムスク様香気を有する香料成分が育毛効果を有することを実験的に見出した。特に、ムスク様香気を有する香料成分を皮膚局所から経皮吸収させることで、優れた育毛効果を発揮することができる。

30

ムスク様の香気を有する香料成分としてムスクを使用することもできるが、ムスクは非常に高価であるとともに、必要量を長期間安定的に確保することが困難であるので、本発明では合成ムスクを使用する。合成ムスクとは、ムスクに含まれる香料成分を化学合成したもの、又はムスクと類似する香気を有する香料成分を化学合成したもの、或いはムスクに含まれる香料成分と類似する構造を有する香料成分を化学合成したものであり、いずれもムスク様の香気を有する。

合成ムスクの具体例としては、大環状合成ムスク、ニトロ系合成ムスク、インダン系合成ムスク、テトラリン系合成ムスクなどを例示することができる。

【0011】

40

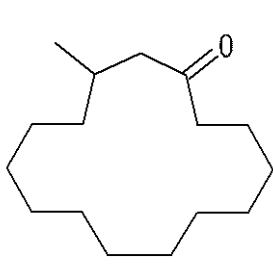
大環状合成ムスクとしては、化1の(1)に示されるムスコン(3 - メチルシクロペンタデカノン)、化1の(2)に示されるシベトン(9 - シクロペンタデセン - 1 - オン)、化1の(3)に示されるシクロペンタデカノン、化1の(4)に示されるシクロヘキサデセノン(5 - シクロヘキサデセン - 1 - オン)、化1の(5)に示されるシクロペンタデカノリド、化1の(6)に示される12 - ケトシクロペンタデカノリド(オキサシクロヘキサデカン - 2, 13 - ジオン)、化2の(7)に示されるシクロヘキサデカノリド、化2の(8)に示されるシクロヘキサデセノリド(7 - シクロヘキサデセノリド)、化2の(9)に示される12 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、化2の(10)に示される11 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、化2の(11)に示される10 - オキサ - 16 - ヘキサデカノリド、化2の(12)に示されるエチレンブラシレート、化2の(13)

50

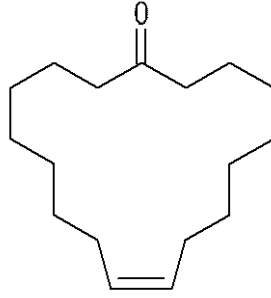
に示されるエチレンドデカンジオエートなどを例示することができる。

【 0 0 1 2 】

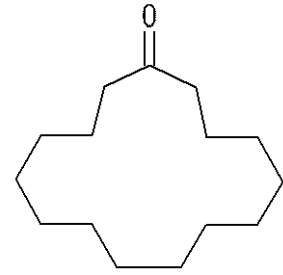
【 化 1 】



(1)

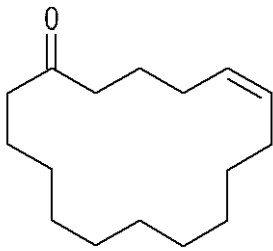


(2)

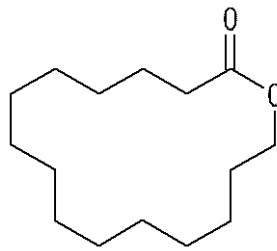


(3)

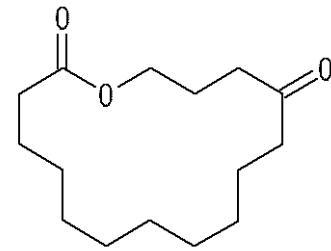
10



(4)



(5)

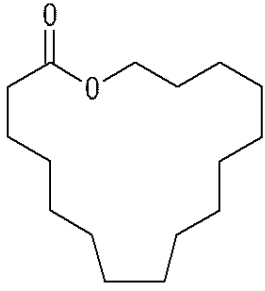


(6)

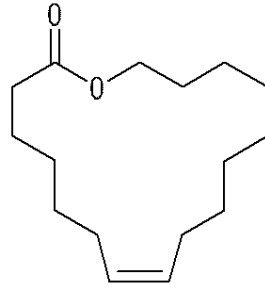
20

【 0 0 1 3 】

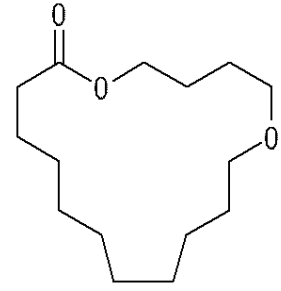
【化2】



(7)

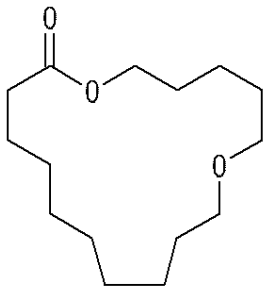


(8)

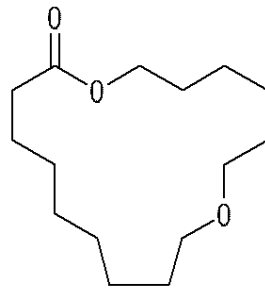


(9)

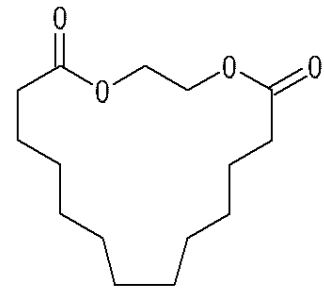
10



(10)

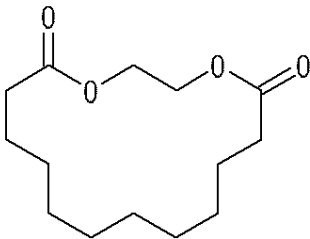


(11)



(12)

20



(13)

30

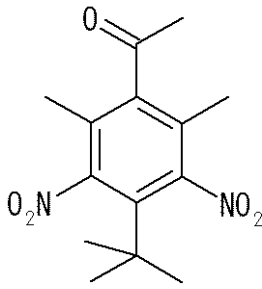
【0014】

ニトロ系ムスクとしては、化3の(1)に示されるムスクeton(2,6-ジニトロ-3,5-ジメチル-4-t-ブチルベンゼン)、化3の(2)に示されるムスクシロール(2,4,6-トリニトロ-5-t-ブチルベンゼン)、化3の(3)に示されるムスクアンプレット(2,6-ジニトロ-3-メトキシ-1-メチル-4-t-ブチルベンゼン)、化3の(4)に示されるムスクチベテン(2,6-ジニトロ-3,4,5-トリメチル-t-ブチルベンゼン)、化3の(5)に示されるムスクモスケン(1,1,3,3,5-ペンタメチル-4,6-ジニトロインダン)などを例示することができる。

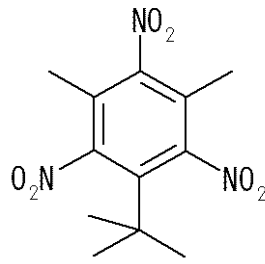
【0015】

40

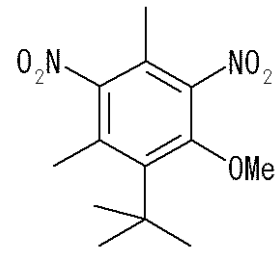
【化3】



(1)

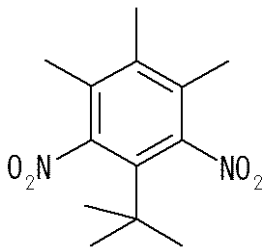


(2)

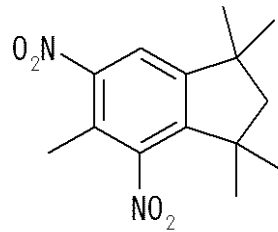


(3)

10



(4)



(5)

20

【0016】

インダン系ムスクとしては、化4の(1)に示される6-アセチルヘキサメチルインダリン(6-アセチル-1,1,2,3,3,5-ヘキサメチルインダン)、化4の(2)に示される4-アセチルジメチル-t-ブチルインダリン(4-アセチル-6-t-ブチル-1,1-ジメチルインダリン)、化4の(3)に示される5-アセチルテトラメチルイソプロピルインダン(5-アセチル-3-イソプロピル-1,1,2,6-テトラメチルインダン)などを例示することができる。

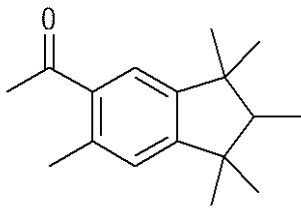
【0017】

テトラリン系ムスクとしては、化4の(4)に示される6-アセチルヘキサテトラリン(6-アセチル-1,1,2,4,4,7-ヘキサメチルテトラリン)、化4の(5)に示されるヘキサメチルヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン(4,6,6,7,8,8-ヘキサメチル-1,3,4,6,7,8-ヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン)などを例示することができる。

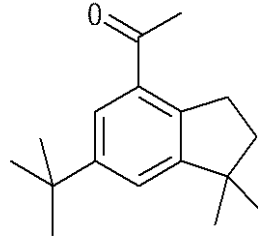
【0018】

30

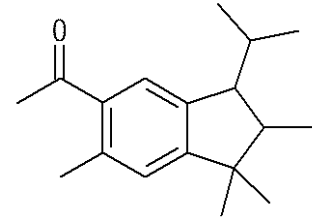
【化4】



(1)

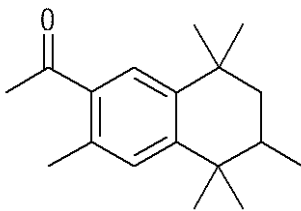


(2)

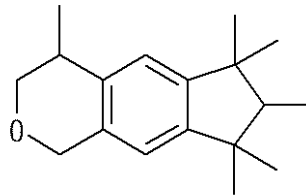


(3)

10



(4)



(5)

20

【0019】

本発明では、上述した合成ムスクのうち、一種類の合成ムスクを単独で使用することもでき、或いは二種類以上の合成ムスクの混合物として使用することもできる。

上述した合成ムスクは後述する基剤層中に配合されて本発明に係る貼布剤とされるが、基剤層中における合成ムスクの含有量は特に限定されないが、基剤層100重量部当り、0.0001~10重量部、好ましくは0.001~7重量部、より好ましくは0.01~5重量部である。0.0001重量部未満であると、育毛効果を発揮し難くなり、10重量部を超えると、それ以上の育毛効果が得られないばかりか、ムスク様の香気が強くなり好ましくない。

30

【0020】

本発明に係る貼布剤は有効成分である合成ムスクを含有する。貼布剤に育毛剤の有効成分を含有することにより、長時間にわたって有効成分の一定量を徐々に経皮吸収させることができるので、優れた育毛効果を得ることができる。

【0021】

本発明に係る貼布剤は支持体と、この支持体に積層又は含浸された基剤層とからなり、有効成分である合成ムスクは基剤層に含有される。

40

支持体は通常の貼布剤に用いられる支持体であればよく、例えば、非伸縮性又は伸縮性のフィルム、不織布、編布などを例示することができる。

支持体の材質としては、ポリエチレン、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリエチレンテレフタレート、ポリブチレンテレフタレート、ポリエチレンナフタレート、ポリスチレン、ナイロン、綿、レーヨン、レーヨン/ポリエチレンテレフタレート、ポリアクリロニトリル、ポリビニルアルコール、アクリル系樹脂、ポリウレタン、スチレン-イソプレン-スチレンブロック共重合体、スチレン-ブタジエン-スチレンブロック共重合体、スチレン-エチレン-プロピレン-スチレンブロック共重合体、スチレン-ブタジエンゴム、エチレン-酢酸ビニル共重合体、セロハン等を例示することができる。

50

また支持体には高分子フィルムを積層することができる。高分子フィルムとしては、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリエステル、ポリアミド、ポリビニルアルコール、ポリ塩化ビニル、ポリ塩化ビニリデン、ポリウレタン、ポリスチレン、エチレン - 酢酸ビニル共重合体、ポリカーボネートなどを例示することができる。

支持体の厚さは特に限定されないが、 $1\ \mu\text{m} \sim 1\ \text{cm}$ 、より好ましくは $100\ \mu\text{m} \sim 1000\ \mu\text{m}$ とされる。

【0022】

支持体には基剤層が積層又は含浸される。基剤層は皮膚面に対する粘着性に優れ、皮膚局所への適用が容易であり、しかも、有効成分の溶解性に優れるとともに、有効成分を徐々に放出して経皮吸収させることができるものである。本発明では、一般的な貼布剤の基剤層であればいずれも使用することができる。

10

具体的には、粘着剤又は水溶性高分子などから構成された基剤層を例示することができる。

【0023】

粘着剤としては、ゴム系粘着剤、酢酸ビニル系粘着剤、エチレン - 酢酸ビニル系粘着剤、塩化ビニル系粘着剤、アクリル系粘着剤、ポリアミド系粘着剤、ポリエチレン系粘着剤、ポリサルファイド粘着剤などを例示することができる。

基剤層を粘着剤から構成する場合、粘着剤の含有量は特に限定されないが、基剤層100重量部当り、5～50重量部、好ましくは10～40重量部、より好ましくは15～35重量部である。

20

【0024】

水溶性高分子としては、天然高分子、半合成高分子、合成高分子を例示することができる。

天然高分子としては、ゼラチン、澱粉、寒天、グルコマンナン、アルギン酸又はその塩、アラビアガム、トラガントガム、ローカストビーンガム、アカシアガム、グアガム、カラギーナンなどを例示することができる。

【0025】

半合成高分子としては、メチルセルロース、メチルセルロースナトリウム、エチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、デキストリンなどを例示することができる。

30

【0026】

合成高分子としては、ポリアクリル酸又はその塩、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリビニルメタクリレート、メチルビニルエーテル - 無水マレイン酸共重合体、カルボキシビニルポリマー、ポリエチレンオキサイド、イソブチレン - 無水マレイン酸共重合体などを例示することができる。

【0027】

上述した水溶性高分子は公知の架橋剤又は重合剤で処理されていても構わない。また上述した水溶性高分子は一種又は二種以上を配合することができる。

基剤層を水溶性高分子から構成する場合、水溶性高分子の含有量は、基剤層100重量部当り、1～20重量部、好ましくは3～15重量部、より好ましくは5～10重量部である。

40

【0028】

さらに、本発明では基剤層に必要な応じて、水、溶解剤、経皮吸収促進剤、保湿剤、皮膚刺激緩和剤、界面活性剤などを配合することができる。

【0029】

基剤層に水を含有する場合、水の含有量は、基剤層100重量部当り、20～80重量部、好ましくは30～70重量部、より好ましくは40～60重量部である。

【0030】

溶解剤としては、オレイン酸、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ミリスチン酸イソプロピル、ミリスチン酸ブチル、パルミチン酸イソプロピ

50

ル、パルミチン酸セチル、ステアリン酸ブチル、ステアリン酸イソセチル、セバシン酸ジエチル、セバシン酸ジイソプロピル、リノール酸エチル、リノール酸イソプロピル、サリチル酸メチル、サリチル酸グリコールベンジルアルコール、N - メチル - 2 - ピロリドン、オレイルアルコール、ジメチルスルホキシド、ハッカ油、ユーカリ油、ヒマシ油、リモネン等を例示することができる。

溶解剤を配合する場合、上述した溶解剤のうち的一种又は二種以上を配合することができる。

溶解剤の含有量は、基剤層100重量部当り、0.01~10重量部、好ましくは0.05~7重量部、より好ましくは0.1~5重量部である。

【0031】

経皮吸収促進剤としては、ジイソプロピルアジペート、レシチン、スクワラン、スクワレン、エイゾン、メントール、ポリエチレングリコール、ミリスチン酸イソプロピル、クロタミトン、ハッカ油、ユーカリ油、リモネン、オレイン酸、リノレイン酸ジイソプロピルアジペート、ジメチルスルホキシド等を例示することができる。

経皮吸収促進剤を配合する場合、上述した経皮吸収促進剤のうち的一种又は二種以上を配合することができる。

経皮吸収促進剤の含有量は、基剤層100重量部当り、0.01~10重量部、好ましくは0.05~7重量部、より好ましくは0.5~5重量部である。

【0032】

保湿剤としては、グリセリン、ソルビトール、乳酸、尿素、プロピレングリコール、エチレングリコール、ジエチレングリコール、トリエチレングリコール、ポリエチレングリコール、1,3-ブチレングリコール等を例示することができる。

保湿剤を配合する場合、上述した保湿剤のうち的一种又は二種以上を配合することができる。

保湿剤の含有量は、基剤層100重量部当り、10~70重量部、好ましくは20~60重量部、より好ましくは30~55重量部である。

【0033】

皮膚刺激緩和剤としては、塩酸ジフェンヒドラミン、タンニン酸ジフェンヒドラミン、マレイン酸クロルフェラミン、マレイン酸フェニラミン、アンレキサノクス、イブシラスト、アゼラスチン、オキサトミド、クロモグリク酸塩、タザノラスト、テルフェナジン、トラニラスト、フマル酸ケトチフェン、レビリナスト、グリチルリチン酸、グリチルレチン酸、シクロデキストリンなどを例示することができる。

皮膚刺激緩和剤を配合する場合、上述した皮膚刺激緩和剤のうち的一种又は二種以上を配合することができる。

皮膚刺激緩和剤の含有量は、基剤層100重量部当り、0.01~10重量部、好ましくは0.05~7重量部、より好ましくは0.1~5重量部である。

【0034】

界面活性剤としては、ポリオキシエチレングリコール脂肪酸エステル、プロピレングリコール脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリグリセリン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビット脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンヒマシ油、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレンステロール、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルなどを例示することができる。

界面活性剤を配合する場合、上述した界面活性剤のうち的一种又は二種以上を配合することができる。

界面活性剤の含有量は、基剤層100重量部当り、0.01~10重量部、好ましくは0.05~7重量部、より好ましくは0.1~5重量部である。

【0035】

10

20

30

40

50

さらに本発明では、必要に応じて、アスコルビン酸、ステアリン酸エステル、没食子酸エステル、エテド酸塩、ジブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソールなどの酸化防止剤、チモール、塩化ベンザルコニウム、パラベン等の防腐剤、リン酸、ホウ酸、クエン酸、酢酸、リンゴ酸、酒石酸、乳酸、水酸化ナトリウム、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン、ジイソプロパノールアミンなどのpH調整剤、カオリン、酸化チタン、タルク、ベントナイト、酸化亜鉛、モンモリロナイト、無水ケイ酸などの無機粉体、ポリブテン、天然ラテックス、酢酸ビニルエマルジョン、ポリアクリル酸エステルエマルジョン、ポリアクリル酸エマルジョンなどの粘着付与剤を、適宜任意に配合することができる。

【0036】

10

基剤層の露出面は剥離層によって被覆、保護することが望ましい。剥離層としては、使用時に基剤層から容易に剥離することができるものであれば特に限定されず、例えば基剤層と接触する面にシリコーン樹脂、フッ素樹脂等を塗布することによって剥離処理を施した、ポリエステル、ポリ塩化ビニル、ポリ塩化ビニリデン、ポリエチレンテレフタレート等のフィルムなどを例示することができる。

【0037】

本発明に係る貼布剤は皮膚局所に貼付して使用する。皮膚局所に貼付された貼布剤は基剤層に含まれる有効成分であるムスク様香気を有する化合物を長時間にわたって徐々に放出して有効成分を経皮吸収させることができ、優れた育毛効果を発揮することができる。

本発明に係る貼布剤の適用箇所は特に限定されず、頭、腕、脚、腰、肩等の人体の各部全てに好適に適用することができる。

20

【実施例】

【0038】

以下、本発明を実施例に基づき説明するが、本発明はこれらの実施例に何ら限定されるものではない。尚、配合量は重量%である。

【0039】

(試料の調製)

以下の組成からなる基剤に表1に記載の合成ムスクを加えたものと、厚さ100μmのポリエチレン製の織布からなる支持体とを用いて、常法に従い実施例の各貼布剤を調製した。尚、合成ムスクを全く含有していない対照例の貼布剤も同様に調製した。

30

<基剤の組成>

ポリアクリル酸ナトリウム	5.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム	3.0
酒石酸	0.5
D-ソルビトール	20
グリセリン	20
ゼラチン	3.0
水酸化アルミニウム	0.5
メチルパラベン	0.1
精製水	適量
合成ムスク	0.35
合計	100.0重量%

40

【0040】

(試験例)

18~40歳の脱毛症の男性を対象に、円周3cmの円形に切断した各貼布剤を左肩部に貼付(朝と晩の一日二回、貼付した貼布剤を交換)してもらい、試験開始から3ヶ月後の貼布剤を貼った箇所の毛髪の本数の増減について調べ、以下の評価基準に従い、評価した。結果を表1に記載する。

<評価基準>

試験開始前と試験終了後の毛髪の増加率は、60%以上であった。・・・A

50

試験開始前と試験終了後の毛髪の増加率は、45～60%であった。・・・B

試験開始前と試験終了後の毛髪の増加率は、30～45%であった。・・・C

試験開始前と試験終了後の毛髪の増加率は、0～30%であった。・・・D

試験開始前と試験終了後の毛髪の増加率は、0%であった。・・・E

【0041】

【表1】

合成ムスク	添加量	評価結果
ムスコン	0.35%	A
シクロヘキサデセノン	0.35%	B
シクロヘキサデカノリド	0.35%	B
11-オキサ-16-ヘキサデカノリド	0.35%	B
ムスクケトン	0.35%	B
ムスクチベテン	0.35%	B
ムスクモスケン	0.35%	A
6-アセチルヘキサメチルインダリン	0.35%	C
4-アセチルジメチル- ϵ -ブチルインダリン	0.35%	B
5-アセチルテトラメチルイソプロピルインダリン	0.35%	C
6-アセチルヘキサテトラリン	0.35%	B
ヘキサメチルヘキサヒドロシクロペンタベンゾピラン	0.35%	B
対照例	—	E

10

20

【0042】

表1に示されるように、合成ムスクを配合した各実施例の試料では、毛髪数の増加が確認された。一方、合成ムスクを全く含有しない対照例の試料では、毛髪数の有意な増加は確認されず、合成ムスクが育毛効果を有することが確認された。

フロントページの続き

(51) Int.Cl.			F I
A 6 1 K	31/04	(2006.01)	A 6 1 K 31/04
A 6 1 K	31/121	(2006.01)	A 6 1 K 31/121
A 6 1 K	31/122	(2006.01)	A 6 1 K 31/122
A 6 1 K	31/365	(2006.01)	A 6 1 K 31/365
A 6 1 P	17/14	(2006.01)	A 6 1 P 17/14
A 6 1 Q	7/00	(2006.01)	A 6 1 Q 7/00

- (56) 参考文献 特開2005-170846 (JP, A)
特開平04-275217 (JP, A)
特開平04-275218 (JP, A)
特開2005-139072 (JP, A)
化粧品製剤実用便覧, 日光ケミカルズ株式会社, 1982年 5月28日, 第55頁, (「ヘアトニック」の項参照)

- (58) 調査した分野(Int.Cl., DB名)
A 6 1 K 8 / 0 0 - 8 / 9 9
A 6 1 Q 1 / 0 0 - 9 9 / 0 0
CAplus (STN)
REGISTRY (STN)