

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5390066号
(P5390066)

(45) 発行日 平成26年1月15日 (2014. 1. 15)

(24) 登録日 平成25年10月18日 (2013. 10. 18)

(51) Int. Cl.	F 1
A 6 1 K 8/60 (2006. 01)	A 6 1 K 8/60
A 6 1 Q 19/02 (2006. 01)	A 6 1 Q 19/02
A 6 1 K 31/70 (2006. 01)	A 6 1 K 31/70
A 6 1 P 17/00 (2006. 01)	A 6 1 P 17/00

請求項の数 12 外国語出願 (全 27 頁)

(21) 出願番号	特願2006-276900 (P2006-276900)	(73) 特許権者	391023932
(22) 出願日	平成18年10月10日 (2006. 10. 10)		ロレアル
(65) 公開番号	特開2007-106765 (P2007-106765A)		フランス国パリ、リュ ロワイヤル 1 4
(43) 公開日	平成19年4月26日 (2007. 4. 26)	(74) 代理人	100064908
審査請求日	平成21年8月19日 (2009. 8. 19)		弁理士 志賀 正武
(31) 優先権主張番号	0553080	(74) 代理人	100089037
(32) 優先日	平成17年10月11日 (2005. 10. 11)		弁理士 渡邊 隆
(33) 優先権主張国	フランス (FR)	(74) 代理人	100108453
(31) 優先権主張番号	0652774		弁理士 村山 靖彦
(32) 優先日	平成18年7月3日 (2006. 7. 3)	(74) 代理人	100110364
(33) 優先権主張国	フランス (FR)		弁理士 実広 信哉
		(72) 発明者	アンヌ・ローラン
			フランス・75017・パリ・リュ・テオ
			ドル・ドゥ・バンヴィル・8

最終頁に続く

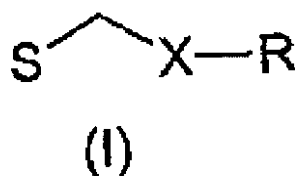
(54) 【発明の名称】 皮膚の脱色のためのC-グリコシド化合物の使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

少なくとも1種の下記式 (I) のC-グリコシド誘導体、それらの化粧品として許容可能な塩、それらの溶媒和物、並びに水和物、及びそれらの異性体を皮膚用美白剤及び/又は抗褐色化剤として含有する、皮膚の美白及び/又は抗褐色化用組成物。

【化 1】



式中、

- R は、以下を表す：
 - 飽和の直鎖状 C₁ ~ C₁₀ のアルキル基、不飽和の直鎖状 C₂ ~ C₁₀ のアルキル基、又は飽和もしくは不飽和の、分岐状の C₃ ~ C₁₀ のアルキル基（但し、置換フェニル基を除く。）；
- 前記基を構成する炭化水素鎖は、任意選択により以下の：

- - O R₄、
- - C O O R₄、

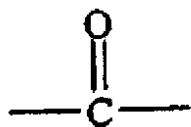
- - CONHR₄、

(ここでR₄は、水素原子、飽和の直鎖状C₁～C₁₂のアルキル、不飽和の直鎖状C₂～C₃₀のアルキル、及び飽和もしくは不飽和の、分岐状もしくは環状のC₃～C₃₀のアルキルである)、

から選択される少なくとも1種の基で置換されていてもよく、

- Xは以下の群：

【化2】



10



から選択される基を表し、

ここで、R'₁は水素原子、-OH基、もしくはR基を表し、Rは上で定義したとおりであり、

- Sは、L又はD系列のピラノース又はフラノース型のモノサッカライドを表し、前記モノサッカライドは、フリーのヒドロキシル基で置換されていてよく、

20

- S-CH₂-X結合は、αもしくはβであることができるC-アノメリック性をもつ結合を表す。

【請求項2】

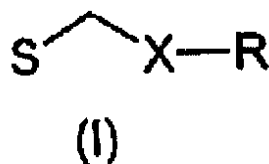
褐色になった皮膚の色を淡色化及び/又は白色化及び/又は均一にし、加齢による褐色色素沈着斑及び/又は染み及び/又はそばかすの形成防止及び/又は除去するための、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

色素沈着疾患を治療するための組成物を調製するための、少なくとも1種の下記式(I)のC-グリコシド誘導体、それらの化粧品として許容可能な塩、それらの溶媒和物、並びに水和物、及びそれらの異性体の使用。

30

【化3】



式中、

- Rは、以下を表す：

40

- 飽和の直鎖状C₁～C₁₀のアルキル基、不飽和の直鎖状C₂～C₁₀のアルキル基、又は飽和もしくは不飽和の、分岐状のC₃～C₁₀のアルキル基(但し、置換フェニル基を除く。)；

前記基を構成する炭化水素鎖は、任意選択により以下の：

- - OR₄、

- - COOR₄、

- - CONHR₄、

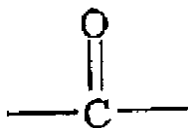
ここでR₄は、水素原子、飽和の直鎖状C₁～C₁₂のアルキル、不飽和の直鎖状C₂～C₃₀のアルキル、及び飽和もしくは不飽和の、分岐状もしくは環状のC₃～C₃₀のアルキル、

50

から選択される少なくとも 1 種の基で置換されていてもよく；

- X は以下の群：

【化 4】



10

から選択される基を表し、

ここで、 R_1' は水素原子、-OH 基、もしくは R 基を表し、R は上で定義したとおりであり；

- S は、L 又は D 系列のピラノース又はフラノース型のモノサッカライドを表し、前記モノサッカライドは、必然的なフリーのヒドロキシル基で置換されていてよく、

- S-CH₂-X 結合は、α もしくは β であることができる C-アノメリック性をもつ結合を表す。

【請求項 4】

20

前記組成物が、前腕の黒皮症、突発性黒皮症、妊娠又エストロン/プロゲステゲン避妊に伴う色素過剰症、PUVA 黒子症、偶発性色素過剰症、白皮もしくは白斑に起因する色素過剰症を治療するためのものである、請求項 3 に記載の使用。

【請求項 5】

前記誘導体が下記のものから選択される、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

1. C-β-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン；
2. C-α-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン；
3. 1-[2-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)プロピル]-C-β-D-キシロピラノース；
4. 1-[2-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)プロピル]-C-α-D-キシロピラノース；
5. C-β-D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパン；
6. C-α-D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパン；
7. C-β-D-キシロピラノシド-2-アミノプロパン；
8. C-α-D-キシロピラノシド-2-アミノプロパン；
9. C-β-D-キシロピラノシド-2-(フェニルアミノ)プロパン；
10. C-α-D-キシロピラノシド-2-(フェニルアミノ)プロパン；
11. 3-メチル-4-(C-β-D-キシロピラノシド)酪酸エチルエステル；
12. 3-メチル-4-(C-α-D-キシロピラノシド)酪酸エチルエステル；
13. 6-(C-β-D-キシロピラノシド)-5-ケトヘキサン酸；
14. 6-(C-α-D-キシロピラノシド)-5-ケトヘキサン酸；
15. 6-(C-β-D-キシロピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸；
16. 6-(C-α-D-キシロピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸；
17. 6-(C-β-D-キシロピラノシド)-5-アミノヘキサン酸；
18. 6-(C-α-D-キシロピラノシド)-5-アミノヘキサン酸；
19. 6-(C-β-D-キシロピラノシド)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸；
20. 6-(C-α-D-キシロピラノシド)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸；
21. 1-(C-β-D-キシロピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール；
22. 1-(C-α-D-キシロピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール；
23. 5-(C-β-D-キシロピラノシド)-4-ケトペンタン酸；
24. 5-(C-α-D-キシロピラノシド)-4-ケトペンタン酸；
25. 5-(C-β-D-キシロピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸；

30

40

50

26	5-(C- α -D-キシロピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	
27	5-(C- β -D-キシロピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
28	5-(C- α -D-キシロピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
29	5-(C- β -D-キシロピラノシド)-4-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;	
30	5-(C- α -D-キシロピラノシド)-4-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;	
31	1-(C- β -D-キシロピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
32	1-(C- α -D-キシロピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
33	1-(C- β -D-フコピラノシド)プロパン-2-オン ;	
34	1-(C- α -D-フコピラノシド)プロパン-2-オン ;	
35	1-(C- β -L-フコピラノシド)プロパン-2-オン ;	10
36	1-(C- α -L-フコピラノシド)プロパン-2-オン ;	
37	1-(C- β -D-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;	
38	1-(C- α -D-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;	
39	1-(C- β -L-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;	
40	1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;	
41	1-(C- β -D-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;	
42	1-(C- α -D-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;	
43	1-(C- β -L-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;	
44	1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;	
45	1-(C- β -D-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	20
46	1-(C- α -D-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
47	1-(C- β -L-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
48	1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
49	3-メチル-4-(C- β -D-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;	
50	3-メチル-4-(C- α -D-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;	
51	3-メチル-4-(C- β -L-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;	
52	3-メチル-4-(C- α -L-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;	
53	6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;	
54	6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;	
55	6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;	30
56	6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;	
57	6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
58	6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
59	6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
60	6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
61	6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;	
62	6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;	
63	6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;	
64	6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;	
65	1-(C- β -D-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;	40
66	1-(C- α -D-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
67	1-(C- β -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
68	1-(C- α -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
69	5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-ケトペンタン酸 ;	
70	5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-ケトペンタン酸 ;	
71	5-(C- β -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール)-4-ケトペンタン酸 ;	
72	5-(C- α -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール)-4-ケトペンタン酸 ;	
73	5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	
74	5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	
75	5-(C- β -L-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	50

7 6 .	5-(C- α -L-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	
7 7 .	5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
7 8 .	5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
7 9 .	5-(C- β -L-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
8 0 .	5-(C- α -L-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
8 1 .	1-(C- β -D-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
8 2 .	1-(C- α -D-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
8 3 .	1-(C- β -L-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
8 4 .	1-(C- α -L-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
8 5 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	10
8 6 .	1-(C- α -D-グルコピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	
8 7 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)-2-アミノプロパン ;	
8 8 .	1-(C- α -D-グルコピラノシル)-2-アミノプロパン ;	
8 9 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
9 0 .	1-(C- α -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
9 1 .	3-メチル-4-(C- β -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;	
9 2 .	3-メチル-4-(C- α -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;	
9 3 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;	
9 4 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;	
9 5 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	20
9 6 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
9 7 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;	
9 8 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;	
9 9 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;	
1 0 0 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;	
1 0 1 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
1 0 2 .	1-(C- α -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
1 0 3 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;	
1 0 4 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;	
1 0 5 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;	30
1 0 6 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;	
1 0 7 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;	
1 0 8 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;	
1 0 9 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;	
1 1 0 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;	
1 1 1 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;	
1 1 2 .	1-(C- α -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;	
1 1 3 .	1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	
1 1 4 .	1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	
1 1 5 .	1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;	40
1 1 6 .	1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;	
1 1 7 .	1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
1 1 8 .	1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
1 1 9 .	3-メチル-4-(C- β -D-ガラクトピラノシル)酪酸エチルエステル ;	
1 2 0 .	3-メチル-4-(C- α -D-ガラクトピラノシル)酪酸エチルエステル ;	
1 2 1 .	6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;	
1 2 2 .	6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;	
1 2 3 .	6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
1 2 4 .	6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
1 2 5 .	6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;	50

- 1 2 6 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 1 2 7 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 1 2 8 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 1 2 9 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 1 3 0 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 1 3 1 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 1 3 2 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 1 3 3 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 1 3 4 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 1 3 5 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ; 10
 1 3 6 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 1 3 7 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 3 8 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 3 9 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)ペンタン-2,6-ジオール ;
 1 4 0 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)ペンタン-2,6-ジオール ;
 1 4 1 . 1-(C- β -D-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;
 1 4 2 . 1-(C- α -D-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;
 1 4 3 . 1-(C- β -L-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;
 1 4 4 . 1-(C- α -L-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;
 1 4 5 . 3'-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)プロパン-2'-オン ; 20
 1 4 6 . 3'-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)プロパン-2'-オン ;
 1 4 7 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;
 1 4 8 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;
 1 4 9 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
 1 5 0 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
 1 5 1 . 3-メチル-4-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 1 5 2 . 3-メチル-4-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 1 5 3 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 1 5 4 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 1 5 5 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ; 30
 1 5 6 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 1 5 7 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 1 5 8 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 1 5 9 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 1 6 0 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 1 6 1 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 1 6 2 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 1 6 3 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 1 6 4 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 1 6 5 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ; 40
 1 6 6 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 1 6 7 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 1 6 8 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 1 6 9 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 7 0 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 7 1 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;
 1 7 2 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール

【請求項 6】

前記誘導体が下記のものから選択される、請求項 3 又は 4 に記載の使用。

- 1 . C- β -D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン ; 50

- 2 . C- α -D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン ;
- 3 . 1-[2-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)プロピル]-C- β -D-キシロピラノース ;
- 4 . 1-[2-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)プロピル]-C- α -D-キシロピラノース ;
- 5 . C- β -D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパン ;
- 6 . C- α -D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパン ;
- 7 . C- β -D-キシロピラノシド-2-アミノプロパン ;
- 8 . C- α -D-キシロピラノシド-2-アミノプロパン ;
- 9 . C- β -D-キシロピラノシド-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 10 . C- α -D-キシロピラノシド-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 11 . 3-メチル-4-(C- β -D-キシロピラノシド)酪酸エチルエステル ; 10
- 12 . 3-メチル-4-(C- α -D-キシロピラノシド)酪酸エチルエステル ;
- 13 . 6-(C- β -D-キシロピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;
- 14 . 6-(C- α -D-キシロピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;
- 15 . 6-(C- β -D-キシロピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
- 16 . 6-(C- α -D-キシロピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
- 17 . 6-(C- β -D-キシロピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;
- 18 . 6-(C- α -D-キシロピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;
- 19 . 6-(C- β -D-キシロピラノシド)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
- 20 . 6-(C- α -D-キシロピラノシド)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
- 21 . 1-(C- β -D-キシロピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ; 20
- 22 . 1-(C- α -D-キシロピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;
- 23 . 5-(C- β -D-キシロピラノシド)-4-ケトペンタン酸 ;
- 24 . 5-(C- α -D-キシロピラノシド)-4-ケトペンタン酸 ;
- 25 . 5-(C- β -D-キシロピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;
- 26 . 5-(C- α -D-キシロピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;
- 27 . 5-(C- β -D-キシロピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;
- 28 . 5-(C- α -D-キシロピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;
- 29 . 5-(C- β -D-キシロピラノシド)-4-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
- 30 . 5-(C- α -D-キシロピラノシド)-4-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
- 31 . 1-(C- β -D-キシロピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ; 30
- 32 . 1-(C- α -D-キシロピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;
- 33 . 1-(C- β -D-フコピラノシド)プロパン-2-オン ;
- 34 . 1-(C- α -D-フコピラノシド)プロパン-2-オン ;
- 35 . 1-(C- β -L-フコピラノシド)プロパン-2-オン ;
- 36 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)プロパン-2-オン ;
- 37 . 1-(C- β -D-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;
- 38 . 1-(C- α -D-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;
- 39 . 1-(C- β -L-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;
- 40 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;
- 41 . 1-(C- β -D-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ; 40
- 42 . 1-(C- α -D-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;
- 43 . 1-(C- β -L-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;
- 44 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;
- 45 . 1-(C- β -D-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 46 . 1-(C- α -D-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 47 . 1-(C- β -L-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 48 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 49 . 3-メチル-4-(C- β -D-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;
- 50 . 3-メチル-4-(C- α -D-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;
- 51 . 3-メチル-4-(C- β -L-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ; 50

5 2 .	3-メチル-4-(C- α -L-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;	
5 3 .	6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;	
5 4 .	6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;	
5 5 .	6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;	
5 6 .	6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;	
5 7 .	6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
5 8 .	6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
5 9 .	6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
6 0 .	6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
6 1 .	6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;	10
6 2 .	6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;	
6 3 .	6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;	
6 4 .	6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;	
6 5 .	1-(C- β -D-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
6 6 .	1-(C- α -D-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
6 7 .	1-(C- β -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
6 8 .	1-(C- α -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
6 9 .	5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-ケトペンタン酸 ;	
7 0 .	5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-ケトペンタン酸 ;	
7 1 .	5-(C- β -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール)-4-ケトペンタン酸 ;	20
7 2 .	5-(C- α -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール)-4-ケトペンタン酸 ;	
7 3 .	5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	
7 4 .	5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	
7 5 .	5-(C- β -L-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	
7 6 .	5-(C- α -L-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;	
7 7 .	5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
7 8 .	5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
7 9 .	5-(C- β -L-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
8 0 .	5-(C- α -L-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;	
8 1 .	1-(C- β -D-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	30
8 2 .	1-(C- α -D-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
8 3 .	1-(C- β -L-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
8 4 .	1-(C- α -L-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;	
8 5 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	
8 6 .	1-(C- α -D-グルコピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	
8 7 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)-2-アミノプロパン ;	
8 8 .	1-(C- α -D-グルコピラノシル)-2-アミノプロパン ;	
8 9 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
9 0 .	1-(C- α -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
9 1 .	3-メチル-4-(C- β -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;	40
9 2 .	3-メチル-4-(C- α -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;	
9 3 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;	
9 4 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;	
9 5 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
9 6 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
9 7 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;	
9 8 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;	
9 9 .	6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;	
1 0 0 .	6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;	
1 0 1 .	1-(C- β -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;	50

1 0 2 . 1-(C- α -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
1 0 3 . 6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;	
1 0 4 . 6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;	
1 0 5 . 6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;	
1 0 6 . 6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;	
1 0 7 . 6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;	
1 0 8 . 6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;	
1 0 9 . 6-(C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;	
1 1 0 . 6-(C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;	
1 1 1 . 1-(C- β -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;	10
1 1 2 . 1-(C- α -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;	
1 1 3 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	
1 1 4 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	
1 1 5 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;	
1 1 6 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;	
1 1 7 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
1 1 8 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
1 1 9 . 3-メチル-4-(C- β -D-ガラクトピラノシル)酪酸エチルエステル ;	
1 2 0 . 3-メチル-4-(C- α -D-ガラクトピラノシル)酪酸エチルエステル ;	
1 2 1 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;	20
1 2 2 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;	
1 2 3 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
1 2 4 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;	
1 2 5 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;	
1 2 6 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;	
1 2 7 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;	
1 2 8 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;	
1 2 9 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
1 3 0 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;	
1 3 1 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;	30
1 3 2 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;	
1 3 3 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;	
1 3 4 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;	
1 3 5 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;	
1 3 6 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;	
1 3 7 . 6-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;	
1 3 8 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;	
1 3 9 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)ペンタン-2,6-ジオール ;	
1 4 0 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)ペンタン-2,6-ジオール ;	
1 4 1 . 1-(C- β -D-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;	40
1 4 2 . 1-(C- α -D-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;	
1 4 3 . 1-(C- β -L-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;	
1 4 4 . 1-(C- α -L-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;	
1 4 5 . 3'-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)プロパン-2'-オン ;	
1 4 6 . 3'-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)プロパン-2'-オン ;	
1 4 7 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;	
1 4 8 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;	
1 4 9 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
1 5 0 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;	
1 5 1 . 3-メチル-4-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;	50

- 1 5 2 . 3-メチル-4-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 1 5 3 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 1 5 4 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 1 5 5 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 1 5 6 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 1 5 7 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 1 5 8 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 1 5 9 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 1 6 0 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 1 6 1 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 1 6 2 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 1 6 3 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 1 6 4 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 1 6 5 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 1 6 6 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 1 6 7 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 1 6 8 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 1 6 9 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 7 0 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 7 1 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;
 1 7 2 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール

10

20

【請求項 7】

前記 C - グリコシド誘導体が、組成物の総重量の 0 . 0 0 0 1 重量% ~ 2 5 重量% の量で用いられることを特徴とする、請求項 1、2、又は 5 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記 C - グリコシド誘導体が、組成物の総重量の 0 . 0 0 1 重量% ~ 1 0 重量% の量で用いられることを特徴とする、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記 C - グリコシド誘導体が、組成物の総重量の 0 . 0 0 0 1 重量% ~ 2 5 重量% の量で用いられることを特徴とする、請求項 3、4、又は 6 に記載の使用。

30

【請求項 10】

前記 C - グリコシド誘導体が、組成物の総重量の 0 . 0 0 1 重量% ~ 1 0 重量% の量で用いられることを特徴とする、請求項 9 に記載の使用。

【請求項 11】

前記 C - グリコシド誘導体が、少なくとも 1 種の脱色剤及び / 又は少なくとも 1 種の有機光保護剤及び / 又は少なくとも 1 種の無機光保護剤との組み合わせで用いられることを特徴とする、請求項 1、2、5、7、及び 8 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 12】

前記 C - グリコシド誘導体が、少なくとも 1 種の脱色剤及び / 又は少なくとも 1 種の有機光保護剤及び / 又は少なくとも 1 種の無機光保護剤との組み合わせで用いられることを特徴とする、請求項 3、4、6、9、及び 10 のいずれか一項に記載の使用。

40

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は皮膚の脱色及び / 又は美白のための、C - グリコシド化合物の使用に関する。

【背景技術】

【0002】

ヒトの皮膚の色は様々な因子、特に一年のうちの季節、人種及び性別に左右され、メラノサイトによって産生されるメラニンの性質及び濃度によって主に決定される。メラノサイトは、特有の細胞小器官であるメラノソームによってメラニンを合成する特化された細

50

胞である。さらに、その生涯の様々な時期に、いくらかの人々は、不均一な外観を皮膚に与える、皮膚の外観及びより詳細にはより色が濃く及び/又はより強く着色した染み、に直面している。これらの染みはまた、皮膚の表面にあるケラチノサイト中の高濃度のメラニンによるものでもある。

【0003】

非常に有効である無害な局所的脱色性物質の使用が、メラノサイト機能亢進による局所的色素過剰症、例えば、妊娠時に生じる突発性黒色種（「妊娠黒皮症」又は褐色斑）又はエストロン/プロゲステゲン避妊（良性のメラノサイト機能亢進及び増殖による局在化した色素過剰症）、例えば、光線性ほくろとして知られる老人性色素斑、偶発性色素過剰症（光感作又は外傷後の治癒によるものかもしれない）、並びに特定の白子、例えば白斑、の治療の観点から、特に非常に求められている。後者の状態（皮膚により白い外観を与える傷をもたらす治癒）に対して、その傷害を受けた皮膚に再び色素を与えうという要求に対しては、最終的な結果は、残りの正常な皮膚の領域を脱色して、皮膚全体に均一な白い色を付与することである。

10

【0004】

皮膚の色素の形成のメカニズム、すなわちメラニンの形成について言えば、特に複雑であり、図式的には以下の主要段階を含んでいる：

チロシン ---> ドーパ ---> ドーパキノン ---> ドーパクロム ---> メラニン

【0005】

チロシナーゼ（モノフェノールジヒドロキシルフェニルアラニン：オキシジェンオキシドリダクターゼ EC 1.14.18.1）は、上記反応シーケンス中に含まれる必須の酵素である。特に、チロシナーゼは、そのヒドロキシラーゼ活性によってチロシンの変換反応を触媒してドーパ（ジヒドロキシルフェニルアラニン）を与え、そのオキシダーゼ活性によってドーパの変換反応でドーパキノンを与える。このチロシナーゼは、特定の生物学的因子の影響下で、成熟状態にある場合にのみ作用する。

20

【0006】

脱色性物質は、メラニン産生に関与する酵素の1つを阻害すること若しくはメラニンの合成シーケンス中の化学物質の1つに対する構造的類似体として挿入されることのいずれかによって、メラニン産生が起こる表皮メラノサイトの活性に直接作用することができ及び/又はメラニンの生合成の1つの段階を妨害でき、したがってこのシーケンスがブロッ

30

【0007】

脱色剤として最も通常用いられる物質は、特にヒドロキノン及びその誘導体であり、特にそのエーテル類、例えば、ヒドロキノンモノメチルエーテル及びモノエチルエーテルである。しかし、これらの化合物は、望ましくない影響、例えば、高濃度での使用、敏感肌、もしくは皮膚疾患を示している肌などの特定の状況において、赤色皮膚斑の外観などをもたらす。

【0008】

さらに、チロシナーゼの活性化の阻害剤として、コウジ酸の使用が通常行われており、これはこの酵素の活性部位に存在する銅に配位する。しかし、この化合物は溶液中で不安定であることがわかっており、このことがその配合を複雑にしている。

40

【特許文献1】EP 1 345 919

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0009】

公知のものと同様に有効な作用をもつヒトの皮膚用の新規な美白剤であって、組成物中で安定であり、皮膚に対して、刺激性がなく、非毒性で、及び/又は非アレルギー性であるか、あるいは増強された作用をもち少量で用いることができ、観察される副作用を顕著に低減する美白剤に対する要求がまだ存在する。

【課題を解決するための手段】

50

【 0 0 1 0 】

この点で、出願人は驚くべきこと且つ予期せぬことに、特定の C - グリコシド化合物が、細胞毒性を示すことなく、良好な脱色活性を示すことを発見した。

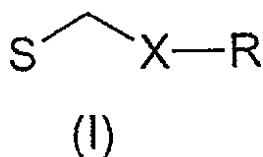
【 0 0 1 1 】

C - グリコシドは、プロテオグリカン及びグリコサミノグリカンの合成を誘導する特性を有し、したがって皮膚の細胞外マトリクスを強化することに寄与するとして既に E P 1 3 4 5 9 1 9 に開示されている。

【 0 0 1 2 】

さらに詳細には、本発明の目的はしたがって、少なくとも 1 種の下記式 (I) の化合物、それらの化粧品として許容可能な塩、それらの溶媒和物、並びに水和物、及びそれらの異性体の、化粧品又は医薬品、特に皮膚科学用の使用である。

【化 1】



式中、

- R は、以下を表す：
 - 飽和の直鎖状 C₁ ~ C₂₀、特に C₁ ~ C₁₀ のアルキル基、不飽和の直鎖状 C₂ ~ C₂₀、特に C₂ ~ C₁₀ のアルキル基、又は飽和もしくは不飽和の、分岐状もしくは環状の C₃ ~ C₂₀、特に C₃ ~ C₁₀ のアルキル基（但し、置換フェニル基を除く。）；
 - 飽和の直鎖状 C₁ ~ C₂₀、特に C₁ ~ C₁₀ のヒドロフルオロ - もしくはパーフルオロアルキル基、不飽和の直鎖状 C₂ ~ C₂₀、特に C₂ ~ C₁₀ のヒドロフルオロ - もしくはパーフルオロアルキル基、又は飽和もしくは不飽和の、分岐状もしくは環状の C₃ ~ C₂₀、特に C₃ ~ C₁₀ のヒドロフルオロ - もしくはパーフルオロアルキル基；
- 前記基を構成する炭化水素鎖には、適切であれば、以下の：

- 酸素
- 硫黄
- 窒素、及び
- ケイ素

から選択される 1、2、3、又はそれ以上のヘテロ原子が割り込んでいてもよく：

前記基を構成する炭化水素鎖は、任意選択により以下の：

- - O R₄、
- - S R₄、
- - N R₄ R₅、
- - C O O R₄、
- - C O N H R₄、
- - C N、
- ハロゲン原子、
- C₁ ~ C₆ ヒドロフルオロ - もしくはパーフルオロアルキル基、
- C₃ ~ C₈ シクロアルキル基、及び / 又は

R₄ 及び R₅ は互いに独立して、水素原子、飽和の直鎖状 C₁ ~ C₃₀、特に C₁ ~ C₁₂ のアルキル、パーフルオロアルキル、もしくはヒドロフルオロアルキル基、不飽和の直鎖状 C₂ ~ C₃₀、特に C₂ ~ C₁₂ のアルキル、パーフルオロアルキル、もしくはヒドロフルオロアルキル基、飽和もしくは不飽和の、分岐状もしくは環状の C₃ ~ C₃₀、特

10

20

30

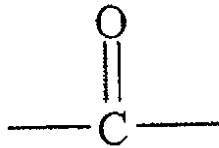
40

50

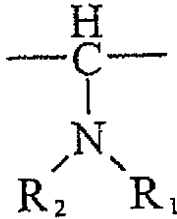
に $C_3 \sim C_{12}$ のアルキル、パーフルオロアルキル、もしくはヒドロフルオロアルキル基、又は $C_6 \sim C_{10}$ のアリール基、から選択される少なくとも 1 種の基で置換されていてよく；

- X は以下の群：

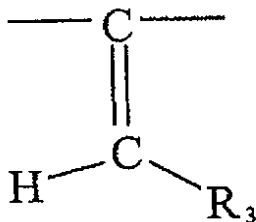
【化 2】



10



20



30

から選択される基を表し、

R_1 、 R_2 、及び R_3 は互いに独立して、水素原子、もしくは R 基を表し、R は上で定義したとおりであり、 R_1' は水素原子、-OH 基、もしくは R 基を表し、R は上で定義したとおりであり、 R_1 はまた $C_6 \sim C_{10}$ アリール基を表すこともでき；

- S は、モノサッカライド又は 20 以下の糖単位、特に 6 以下の糖単位を、L 及び / 又は D 系列のピラノース及び / 又はフラノース型で含むポリサッカライドを表し、前記モノ - もしくはポリサッカライドは、必然的なフリーのヒドロキシル基、及び任意選択により 1 以上の任意に保護されたアミン官能基で置換されていてよく、

40

- S-CH₂-X 結合は、α もしくは β であることができる C-アノメリック性をもつ結合を表す。

【0013】

本発明の関連では、「ハロゲン」の語は塩素、フッ素、臭素、又はヨウ素を意味するものとして理解される。

【0014】

「ヘテロ原子」の語は、窒素、酸素、又は硫黄を意味するものとして理解される。

【0015】

「アリール」の語は、任意選択で 1 以上の $C_1 \sim C_4$ アルキル基で置換されていてよい、フェニルを除いた芳香環を意味する。

50

【 0 0 1 6 】

「 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル」の語は、例えば、シクロプロピル、シクロペンチル、及びシクロヘキシルを含む、3～8の炭素原子を有する脂肪族環を意味する。

【 0 0 1 7 】

本発明の実施に適したアルキル基のなかでは、メチル、エチル、イソプロピル、*n*-プロピル、*n*-ブチル、*t*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、ペンチル、*n*-ヘキシル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びアリル基を特に挙げることができる。

【 0 0 1 8 】

本発明の一態様によれば、式(Ⅰ)のC-グリコシド誘導体で、SがL及び/又はD系列で、ピラノース及び/又はフラノース型の、モノサッカライドもしくは6以下の糖単位を含むポリサッカライドを用いてよい。前記モノ-もしくはポリサッカライドは、少なくとも1つの必然的なフリーヒドロキシル基及び/又は任意選択により1以上の必要な保護されたアミン官能基を表し、X及びRはさらに、上述した全ての定義を保っている。

10

【 0 0 1 9 】

有利には、本発明のモノサッカライドは、D-グルコース、D-ガラクトース、D-マンノース、D-キシロース、D-リキソース、L-フコース、L-アラビノース、L-ラムノース、D-グルクロン酸、D-ガラクトン酸、D-イズロン酸、N-アセチル-D-グルコサミン、又はN-アセチル-D-ガラクトサミン、及び有利にはD-グルコース、D-キシロース、N-アセチル-D-グルコサミン、又はL-フコース、特にD-キシロース、から選択されうる。

20

【 0 0 2 0 】

さらにとりわけ、6以下の糖単位を有する本発明のポリサッカライドは、D-マルトース、D-ラクトース、D-セロピオース、D-マルトリオース；D-イズロン酸もしくはD-グルクロン酸から選択されるウロン酸をD-ガラクトサミン、D-グルコサミン、N-アセチル-D-ガラクトサミン、もしくはN-アセチル-D-グルコサミンと結合したジサッカライド；少なくとも1つのキシロースを含有するオリゴサッカライド（有利にはキシロピオース、メチルβ-キシロピオシド、キシロトリオース、キシロテトラオース、キシロペンタオース、及びキシロヘキサオース、特に1-4結合を介して結合した2個のキシロース分子から構成されるキシロピオース、から選択することができる）から選択することができる。

30

【 0 0 2 1 】

さらにとりわけ、Sは、D-グルコース、D-キシロース、D-フコース、D-ガラクトース、又はD-マルトース、特にD-キシロースから選択されるモノサッカライドを表すことができる。

【 0 0 2 2 】

本発明の別の態様によれば、式(Ⅰ)に対応するC-グリコシド誘導体を用いてもよく、その場合、式(Ⅰ)中、Xは、 $-CO-$ 、 $-CH(OH)-$ 、 $-CH(NR_1R_2)-$ 、又は $-CH(R)-$ 、特に $-CO-$ 、 $-CH(OH)-$ 、 $-C(NH_2)-$ 、 $-C(NHCH_2CH_2CH_2OH)-$ 、 $-C(NHPh)-$ 、又は $-C(CH_3)-$ 、及びさらにとりわけ、 $-CO-$ 、 $-CH(OH)-$ 、又は $-CH(NH_2)-$ 基、好ましくは、 $-CH(OH)-$ 基を表し、S及びRはなお上で示した全ての定義を保っている。

40

【 0 0 2 3 】

本発明の別の態様によれば、式(Ⅰ)に対応するC-グリコシド誘導体を用いてもよく、その場合、式(Ⅰ)中、Rは、飽和で直鎖状の $C_1 \sim C_{20}$ 、特に $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基、不飽和で直鎖状の $C_2 \sim C_{20}$ 、特に $C_2 \sim C_{10}$ のアルキル基、又は飽和もしくは不飽和の、分岐状もしくは環状の $C_3 \sim C_{20}$ 、特に $C_3 \sim C_{10}$ のアルキル基（フェニル基を除く）を表し、これは任意選択で、上述したとおり置換されていてもよく、S及びRはなお上述した全ての定義を保っている。好ましくは、Rは、直鎖状の $C_1 \sim C_4$ 、特に $C_1 \sim C_3$ のアルキル基を表し、これは任意選択で $-OH$ 、 $-COOH$ 、又は $-C$

50

OR' ' ₂ で置換されていてもよく、R' ' ₂ は飽和の C₁ ~ C₄ アルキル基、特にエチル基である。好ましくは、R は、不飽和で直鎖状の C₁ ~ C₄、特に C₁ ~ C₂ のアルキル基、特にエチル基、を表す。

【0024】

式 (I) の C - グリコシド誘導体の中では、以下のものの使用が好ましい：

- R は、飽和で直鎖状の C₁ ~ C₂₀、特に C₁ ~ C₁₀ のアルキル基、不飽和で直鎖状の C₂ ~ C₂₀、特に C₂ ~ C₁₀ のアルキル基、又は飽和もしくは不飽和の、分岐状もしくは環状の C₃ ~ C₂₀、特に C₃ ~ C₁₀ のアルキル基（フェニル基は除く）を表し、これは任意選択で上述したように置換されていてもよく；
- S は、上述したようにモノサッカライドを表し；
- X は、上述したように、-CO-、-CH(OH)-、-CH(NR₁R₂)-、又は -CH(R)- を表す。

10

【0025】

好ましくは、式 (I) の C - グリコシド誘導体であって以下のものが使用される：

- R は、直鎖状の C₁ ~ C₄、特に C₁ ~ C₃ の基であって、任意選択により -OH、-COOH、もしくは COOR' ' ₂ によって置換されていてもよく、R' ' ₂ は、飽和の C₁ ~ C₄ アルキル基、特にエチル基であり；
- S は、上述したようにモノサッカライドを表し；
- X は、-CO-、-CH(OH)-、-C(NH₂)-、-C(NHCH₂CH₂CH₂OH)-、-C(NHPh)-、又は -C(CH₃)-、さらにとりわけ、-CO-、-CH(OH)-、又は -CH(NH₂)- 基から選択される基、好ましくは、-CH(OH)- 基を表す。

20

【0026】

好ましくは、式 (I) の C - グリコシド誘導体であって以下のものが使用される：

- R は、不飽和で直鎖状の C₁ ~ C₄、特に C₁ ~ C₂ のアルキル基、特にエチル基を表し；
- S は、上述したようにモノサッカライドを表し、特に D - グルコース、D - キシロース、N - アセチル - D - グルコサミン、もしくは L - フコース、特に D - キシロース、を表し、；
- X は、-CO-、-CH(OH)-、又は -C(NH₂)-、好ましくは -CH(OH)- 基を表す。

30

【0027】

本発明において説明した化合物の非治療上の使用のために許容可能な塩は、上記化合物の通常为非毒性の塩、例えば、有機もしくは無機酸から形成されるものを包含する。例としては、無機酸、例えば、硫酸、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、もしくはホウ酸などの塩が挙げられる。1つ以上のカルボン酸、スルホン酸、もしくはホスホン酸基を有する有機酸類の塩も挙げることができる。それらは、直鎖状、分岐状、もしくは環状の脂肪族酸であることができ、又は芳香族酸であることもできる。これらの酸はO及びNから選択される1以上のヘテロ原子を、例えばヒドロキシ基の形態で、追加して含むことができる。特に、プロピオン酸、酢酸、テレフタル酸、クエン酸、及び酒石酸を挙げることができる。

40

【0028】

式 (I) の化合物が酸基を有する場合、その酸基（1もしくは2以上）の中和は、無機塩基、例えば、LiOH、NaOH、KOH、Ca(OH)₂、NH₄OH、Mg(OH)₂、もしくはZn(OH)₂、又は有機塩基、例えば、一級、二級、若しくは三級アルキルアミン（例えば、トリエチルアミンまたはブチルアミン）で行うことができる。この一級、二級、又は三級アルキルアミンは、1つ以上の窒素及び/又は酸素原子を有することができる、したがって、例えば、1以上のアルコール官能基を有することができる；特に、2 - アミノ - 2 - メチルプロパノール、トリエタノールアミン、2 - (ジメチルアミノ)プロパノール、もしくは2 - アミノ - 2 - (ヒドロキシメチル) - 1, 3 - プロパンジ

50

オールを挙げることができる。リシン又は3-(ジメチルアミノ)プロピルアミンも挙げることができる。

【0029】

本発明で説明する化合物に対する許容可能な溶媒和物には、通常の溶媒和物、例えば、前記化合物の合成の最終段階で、溶媒の存在によって形成されるものなどが含まれる。例としては、水、又は直鎖状もしくは分岐状アルコール、例えば、エタノールもしくはプロパノールの存在による溶媒和物が挙げられる。

【0030】

本発明に従って用いられる式(I)のC-グリコシド誘導体の中で、以下のものが特に好ましい：

1. C-β-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン；
 2. C-α-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン；
 3. 1-[2-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)プロピル]-C-β-D-キシロピラノース；
 4. 1-[2-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)プロピル]-C-α-D-キシロピラノース；
 5. C-β-D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパン；
 6. C-α-D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパン；
 7. C-β-D-キシロピラノシド-2-アミノプロパン；
 8. C-α-D-キシロピラノシド-2-アミノプロパン；
 9. C-β-D-キシロピラノシド-2-(フェニルアミノ)プロパン；
 10. C-α-D-キシロピラノシド-2-(フェニルアミノ)プロパン；
 11. 3-メチル-4-(C-β-D-キシロピラノシド)酪酸エチルエステル；
 12. 3-メチル-4-(C-α-D-キシロピラノシド)酪酸エチルエステル；
 13. 6-(C-β-D-キシロピラノシド)-5-ケトヘキサン酸；
 14. 6-(C-α-D-キシロピラノシド)-5-ケトヘキサン酸；
 15. 6-(C-β-D-キシロピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸；
 16. 6-(C-α-D-キシロピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸；
 17. 6-(C-β-D-キシロピラノシド)-5-アミノヘキサン酸；
 18. 6-(C-α-D-キシロピラノシド)-5-アミノヘキサン酸；
 19. 6-(C-β-D-キシロピラノシド)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸；
 20. 6-(C-α-D-キシロピラノシド)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸；
 21. 1-(C-β-D-キシロピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール；
 22. 1-(C-α-D-キシロピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール；
 23. 5-(C-β-D-キシロピラノシド)-4-ケトペンタン酸；
 24. 5-(C-α-D-キシロピラノシド)-4-ケトペンタン酸；
 25. 5-(C-β-D-キシロピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸；
 26. 5-(C-α-D-キシロピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸；
 27. 5-(C-β-D-キシロピラノシド)-4-アミノペンタン酸；
 28. 5-(C-α-D-キシロピラノシド)-4-アミノペンタン酸；
 29. 5-(C-β-D-キシロピラノシド)-4-(フェニルアミノ)ペンタン酸；
 30. 5-(C-α-D-キシロピラノシド)-4-(フェニルアミノ)ペンタン酸；
 31. 1-(C-β-D-キシロピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール；
 32. 1-(C-α-D-キシロピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール；
- 【0031】
33. 1-(C-β-D-フコピラノシド)プロパン-2-オン；
 34. 1-(C-α-D-フコピラノシド)プロパン-2-オン；
 35. 1-(C-β-L-フコピラノシド)プロパン-2-オン；
 36. 1-(C-α-L-フコピラノシド)プロパン-2-オン；
 37. 1-(C-β-D-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン；
 38. 1-(C-α-D-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン；
 39. 1-(C-β-L-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン；

- 40 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-ヒドロキシプロパン ;
- 41 . 1-(C- β -D-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;
- 42 . 1-(C- α -D-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;
- 43 . 1-(C- β -L-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;
- 44 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-アミノプロパン ;
- 45 . 1-(C- β -D-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 46 . 1-(C- α -D-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 47 . 1-(C- β -L-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 48 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
- 49 . 3-メチル-4-(C- β -D-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ; 10
- 50 . 3-メチル-4-(C- α -D-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;
- 51 . 3-メチル-4-(C- β -L-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;
- 52 . 3-メチル-4-(C- α -L-フコピラノシド)酪酸エチルエステル ;
- 53 . 6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;
- 54 . 6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;
- 55 . 6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;
- 56 . 6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-ケトヘキサン酸 ;
- 57 . 6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
- 58 . 6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
- 59 . 6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ; 20
- 60 . 6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
- 61 . 6-(C- β -D-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;
- 62 . 6-(C- α -D-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;
- 63 . 6-(C- β -L-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;
- 64 . 6-(C- α -L-フコピラノシド)-5-アミノヘキサン酸 ;
- 65 . 1-(C- β -D-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;
- 66 . 1-(C- α -D-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;
- 67 . 1-(C- β -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;
- 68 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール ;
- 69 . 5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-ケトペンタン酸 ; 30
- 70 . 5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-ケトペンタン酸 ;
- 71 . 5-(C- β -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール)-4-ケトペンタン酸 ;
- 72 . 5-(C- α -L-フコピラノシド)ヘキサン-2,6-ジオール)-4-ケトペンタン酸 ;
- 73 . 5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;
- 74 . 5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;
- 75 . 5-(C- β -L-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;
- 76 . 5-(C- α -L-フコピラノシド)-4-ヒドロキシペンタン酸 ;
- 77 . 5-(C- β -D-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;
- 78 . 5-(C- α -D-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;
- 79 . 5-(C- β -L-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ; 40
- 80 . 5-(C- α -L-フコピラノシド)-4-アミノペンタン酸 ;
- 81 . 1-(C- β -D-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;
- 82 . 1-(C- α -D-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;
- 83 . 1-(C- β -L-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;
- 84 . 1-(C- α -L-フコピラノシド)ペンタン-2,5-ジオール ;
- 【 0 0 3 2 】
- 85 . 1-(C- β -D-グルコピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;
- 86 . 1-(C- α -D-グルコピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;
- 87 . 1-(C- β -D-グルコピラノシル)-2-アミノプロパン ;
- 88 . 1-(C- α -D-グルコピラノシル)-2-アミノプロパン ; 50

- 89 . 1-(C-β-D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
 90 . 1-(C-α-D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
 91 . 3-メチル-4-(C-β-D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 92 . 3-メチル-4-(C-α-D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 93 . 6-(C-β-D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 94 . 6-(C-α-D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 95 . 6-(C-β-D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 96 . 6-(C-α-D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 97 . 6-(C-β-D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 98 . 6-(C-α-D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ; 10
 99 . 6-(C-β-D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 100 . 6-(C-α-D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 101 . 1-(C-β-D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 102 . 1-(C-α-D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 103 . 6-(C-β-D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 104 . 6-(C-α-D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 105 . 6-(C-β-D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 106 . 6-(C-α-D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 107 . 6-(C-β-D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 108 . 6-(C-α-D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ; 20
 109 . 6-(C-β-D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 110 . 6-(C-α-D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 111 . 1-(C-β-D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;
 112 . 1-(C-α-D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;
【 0 0 3 3 】
 113 . 1-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;
 114 . 1-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;
 115 . 1-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;
 116 . 1-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;
 117 . 1-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ; 30
 118 . 1-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
 119 . 3-メチル-4-(C-β-D-ガラクトピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 120 . 3-メチル-4-(C-α-D-ガラクトピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 121 . 6-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 122 . 6-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 123 . 6-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 124 . 6-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 125 . 6-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 126 . 6-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 127 . 6-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ; 40
 128 . 6-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 129 . 1-(C-β-D-ガラクトピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 130 . 1-(C-α-D-ガラクトピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 131 . 6-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 132 . 6-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 133 . 6-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 134 . 6-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 135 . 6-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 136 . 6-(C-α-D-ガラクトピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 137 . 6-(C-β-D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ; 50

- 1 3 8 . 6-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 3 9 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)ペンタン-2,6-ジオール ;
 1 4 0 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)ペンタン-2,6-ジオール ;

【 0 0 3 4 】

- 1 4 1 . 1-(C- β -D-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;
 1 4 2 . 1-(C- α -D-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;
 1 4 3 . 1-(C- β -L-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;
 1 4 4 . 1-(C- α -L-フコフラノシル)プロパン-2-オン ;
 1 4 5 . 3'-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)プロパン-2'-オン ;
 1 4 6 . 3'-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)プロパン-2'-オン ;
 1 4 7 . 1-(C- β -D-ガラクトピラノシル)-2-ヒドロキシプロパン ;
 1 4 8 . 1-(C- α -D-ガラクトピラノシル)-2-アミノプロパン ;
 1 4 9 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
 1 5 0 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-2-(フェニルアミノ)プロパン ;
 1 5 1 . 3-メチル-4-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 1 5 2 . 3-メチル-4-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)酪酸エチルエステル ;
 1 5 3 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 1 5 4 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトヘキサン酸 ;
 1 5 5 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 1 5 6 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシヘキサン酸 ;
 1 5 7 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 1 5 8 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノヘキサン酸 ;
 1 5 9 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 1 6 0 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ヘキサン酸 ;
 1 6 1 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 1 6 2 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)ヘキサン-2,6-ジオール ;
 1 6 3 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 1 6 4 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ケトペンタン酸 ;
 1 6 5 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 1 6 6 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-ヒドロキシペンタン酸 ;
 1 6 7 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 1 6 8 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-アミノペンタン酸 ;
 1 6 9 . 6-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 7 0 . 6-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)-5-(フェニルアミノ)ペンタン酸 ;
 1 7 1 . 1-(アセタミド-C- β -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール ;
 1 7 2 . 1-(アセタミド-C- α -D-グルコピラノシル)ペンタン-2,5-ジオール

【 0 0 3 5 】

C- α -D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパン及びC- β -D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパンを用いることが好ましく、C- β -D-キシロピラノシド-2-ヒドロキシプロパンが好ましい。

【 0 0 3 6 】

もちろん、本発明によれば、式 (I) に相当する C - グリコシド誘導体は、単独で、あるいは混合物として、任意の割合で、用いることができる。

【 0 0 3 7 】

本発明によれば、式 (I) に相当する C - グリコシド誘導体は、天然もしくは合成由来で、完全にもしくは部分的に精製されていることができ、あるいはそれらを含む任意の製剤であることができる。

【 0 0 3 8 】

「天然由来」の語は、その中に誘導体が存在する天然材料、例えば植物、から抽出された誘導体を意味することが理解される。「合成由来」の語は、化学合成又はバイオテクノ

10

20

30

40

50

ロジーによって調製された誘導体を意味することが理解される。

【 0 0 3 9 】

「完全にもしくは部分的に精製され」の表現は、本明細書では、その合成時又はその天然の状態（生もしくは乾燥した植物もしくは細胞）と比較して、本発明の組成物中の式（Ⅰ）のC - グリコシド誘導体が濃縮されているか及び / 又はその合成で生成する反応副生物の少なくとも一部分から、又は誘導体が存在する天然材料のその他の成分の少なくとも一部分からの、各々で遊離されていることを意味する。

【 0 0 4 0 】

C - グリコシド誘導体は、特に、E P 1 3 4 5 9 1 9 に開示された合成法によって得ることができる。

10

【 0 0 4 1 】

本発明の式（Ⅰ）の化合物は、ヒトの皮膚の有効な脱色及び / 又は色を薄くすることを可能にする。

【 0 0 4 2 】

皮膚の着色は、太陽光への皮膚の暴露から生じる正常な生理的過程である。魅力的にする目的で、皮膚の外観を、色素沈着を制限することによってより美しくし、それにより色のより濃い皮膚の領域の発現を抑制することが所望されうる。

【 0 0 4 3 】

また、例えば、活性メラノサイトの局所的な増殖に関連しうる皮膚疾患によって生じる色素沈着も起こる。

20

【 0 0 4 4 】

上記C - グリコシドを、例えば、紫外線照射への暴露に続くメラニン産生から生じる褐色の外観と対抗することを望む人の皮膚に、又は褐色の色素沈着斑又は加齢による染みがある人の皮膚に適用することを、特に目的としている。

【 0 0 4 5 】

したがって、式（Ⅰ）の化合物は、特に、色素斑、そばかす、又は加齢による染みの形成を防止及び / 又は和らげるための、並びに / 又は褐色になった皮膚の色を薄くし及び / 又は白くし及び / 又は均一にするための、皮膚の美白剤として及び / 又は抗褐色剤として用いることができる。

【 0 0 4 6 】

30

これらの化合物は、日焼け斑（サンスポット）の予防及び / 又は治療に特に有効である。老人性黒子としても知られるサンスポットは、太陽への慢性的暴露によって誘導される、より増大した局所的なメラニン産生に対応する小さな褐色斑によって特徴づけられる。それらは通常は、顔、手の甲、前腕、背中の上部、及び首筋、さらに毛髪のない頭皮の頭皮領域に現れる。

【 0 0 4 7 】

本発明の対象は、したがって、皮膚の色素疾患の治療を目的とする皮膚用組成物の製造における、上で定義した式（Ⅰ）の化合物の使用である。

【 0 0 4 8 】

式（Ⅰ）の化合物はまた、メラノサイト機能亢進による局所的色素過剰症、例えば前腕の黒皮症、妊娠時に現れる突発性黒皮症（「妊娠黒皮症」又は褐色斑）、又はエストロン / プロゲステゲン避妊、P U V A 黒子症、炎症後の色素過剰症、偶発性色素過剰症（光感作又は外傷後の治癒によるものかもしれない）、ならびに特定の白子、例えば白斑、の治療に用いることができる。

40

【 0 0 4 9 】

本脱色物質はまた、より見えにくくするために淡色化することが望ましいであろう表面の体の増殖物の白化、特に体毛の白化における用途を有する。

【 0 0 5 0 】

式（Ⅰ）の化合物が化粧品又は医薬目的に用いられる場合には、それらは様々な経路、例えば経口経路、によって処方されうる。これらの化合物は、この処方の方法に対して適

50

切な組成物に配合される。摂取のためには、様々な態様の経口組成物、特に食品添加剤の態様が可能である。それらは従来法によって、糖で被覆した錠剤を含めた錠剤、カプセル、ハードゼラチンカプセル、ゲルもしくはエマルション、を製造するために配合される。特に、本発明の活性主成分は、食品補助剤（サプリメント）もしくは強化食品の任意の他の形態、例えばフード・バー、またはコンパクト化された若しくはコンパクト化されていない粉末に組み込まれうる。この粉末は、水、発泡性飲料、乳製品、もしくは大豆誘導品中に希釈されることができ、あるいはフード・バー中に組み込まれうる。

【0051】

したがって、本発明の別の目的は、少なくとも1種のC-グルコシド化合物の、摂取又は皮膚及び／又は頭皮及び／又は粘膜への適用を含む、ヒトの肌を白くする及び／又は頭皮を白くする及び／又は粘膜を白くするための化粧方法である。局所適用の場合には、C-グリコシド化合物は、皮膚及び／又は頭皮及び／又は粘膜と接触しされたままにされることができ、次に任意選択で濯ぎおとされることができ、この方法は、褐色の色素斑及び／又は加齢による斑点を除去するために、及び／又は褐色の皮膚の淡色化のために、特に適している。

10

【0052】

それらの局所使用の点では、式(I)の化合物は、生理学的に許容可能な媒体を含有する組成物中に配合することができる。特に、本組成物は皮膚への局所適用のために適している。生理学的に許容可能な媒体は、好ましくは、化粧品として又は皮膚科学的に許容可能な媒体であり、すなわち、不快な外観がなく、使用者に受け入れ難いヒリヒリ、ひきつり、又は発赤を起こさないものである。

20

【0053】

「生理学的に許容可能な媒体」の語は、ヒトのケラチン物質、例えば、皮膚、粘膜、爪、頭皮、及び／又は髪、と相性の良い媒体を意味することが理解される。

【0054】

本発明の組成物は、化粧品又は医薬、特に皮膚科学への応用を目的としうる。

【0055】

本発明との関連で使用しうる式(I)の化合物の量は、所望する効果に非常に明白に左右される。例として、局所経路による投与のためには、この量は、組成物の総重量に対して、例えば、0.0001重量%～25重量%、0.001重量%～10重量%、好ましくは0.01重量%～5重量%、特に0.1重量%～2重量%の範囲であることができる。経口経路による投与の場合は、式(I)の化合物の量は、10～1000mg/体重1kg/日(1日当たり、体重1kg当たり、10～1000mg)、好ましくは100mg/体重1kg/日であってよい。

30

【0056】

経口投与の場合には、本組成物は、錠剤(糖でコーティングした錠剤を含む)、ハードゼラチンカプセル、シロップ、懸濁液、溶液、粉末、顆粒、エマルション、制御された放出を可能にする脂質又はポリマータイプの微小球又はナノスフェア又はベシクルの懸濁液の形態で提供されうる。好ましくは、本組成物はサプリメント形態で提供される。

【0057】

局所適用の場合は、本組成物は、想定している応用において通常使用されている成分を含むことができる。

40

【0058】

特に、水、溶媒、鉱物油、動物及び／又は植物由来のオイル、ワックス、顔料、充填剤、界面活性剤、化粧用又は皮膚科学用活性成分、UVスクリーン剤、ポリマー、ゲル化剤、又は保存料を挙げることができる。

【0059】

もちろん、当業者は、本発明の化合物の有利な特性が想定した添加によって悪影響がない若しくは悪影響が実質的にないように、この若しくはこれらの任意の追加化合物、及び／又はそれらの量を選択することに注意を払うであろう。

50

【 0 0 6 0 】

本発明の組成物は、通常、化粧品及び皮膚科学分野で使用される任意の配合形態で提供することができる；それは、特に、水性もしくは水／アルコール性溶液（任意選択でゲル化していてもよい）、任意選択で２相ローションタイプでもよい分散液、水中油型もしくは油中水型もしくは多重エマルジョン、水性ゲル、微小球（これらの微小球は、ポリマーナノ粒子、例えば、ナノスフェア及びナノパーティクルであることができる）を用いた水性相中のオイルの分散液、又はイオン性及び／又はノニオン性タイプの脂質ベシクルの形態であることができる。

【 0 0 6 1 】

本発明の組成物がエマルジョンである場合、脂肪相の割合は、組成物の総重量に対して 5 ～ 8 0 重量％、好ましくは 5 ～ 5 0 重量％の範囲であることができる。エマルジョン形態の本組成物に用いられるオイル、乳化剤、及び任意選択による共乳化剤は、考慮している分野で従来用いられているものから選択される。乳化剤及び共乳化剤は、本組成物中に、組成物の総重量に対して 0 . 3 ～ 3 0 重量％、好ましくは 0 . 5 ～ 2 0 重量％の範囲の割合で存在する。

【 0 0 6 2 】

この組成物は多かれ少なかれ流動体であることができ、白色もしくは着色したクリーム、軟膏、乳液、ローション、美容液（セラム）、ペースト、又はフォームの外観をもつことができる。それは任意選択により、アエロゾル形態で皮膚に適用することもできる。それは任意選択で、固体形状、例えばスティック形状で提供することもできる。それは手入れ用品（ケア製品）及び／又はメイクアップ用品として用いることができる。

【 0 0 6 3 】

この組成物は、顔、手、足、主要な解剖学的部分、又は身体のための、洗浄、保護、処置、又は手入れ用クリーム（例えば、昼用クリーム（デイ・クリーム）、夜用クリーム（ナイトクリーム）、メイクアップ除去クリーム、ファウンデーションクリーム、又は日焼け防止剤）、液体ファンデーション、メイクアップ除去用乳液、保護もしくは手入れ用ボディ乳液、サン・ミルクもしくはローション、皮膚を手入れするためのゲルもしくはフォーム、例えば、クレンジング・ローションを構成することができる。

【 0 0 6 4 】

本発明の有利な面では、用いられる本組成物は、さらに、少なくとも１種の脱色剤、及び／又は少なくとも１種の落屑剤、及び／又は少なくとも１種の平滑（スムージング）剤、及び／又は少なくとも１種の有機光保護剤、及び／又は少なくとも１種の無機光保護剤を追加で含むことができる。

【 0 0 6 5 】

別の脱色剤と組み合わせた少なくとも１種のＣ－グリコシド化合物の使用は、特に、それぞれの脱色剤のより少ない量を用いることを可能にする。「脱色」剤の用語は、例えば、脱色又は抗着色剤を意味し、以下の化合物があるがこのリストに限定されない。

コウジ酸；エラグ酸；アルブチン及びその誘導体、例えば、特許出願 E P - 8 9 5 7 7 9 及び E P - 5 2 4 1 0 9 に開示されているもの；ヒドロキノン；アミノフェノール誘導体、例えば、特許出願 W O 9 9 / 1 0 3 1 8 及び W O 9 9 / 3 2 0 7 7 に開示されているもの、特に N - コレスチリルオキシカルボニル - パラ - アミノフェノール、及び N - エチルオキシカルボニル - パラ - アミノフェノール；イミノフェノール誘導体、特に、特許出願 W O 9 9 / 2 2 7 0 7 に開示されたもの；L - 2 - オキシチアゾリジン - 4 - カルボン酸又はプロシステイン、並びにその塩及びエステル；カルシウム D - パンテテインスルホネート；アスコルビン酸及びその誘導体、特にアスコルビルグルコシド；及び、植物抽出物、特に甘草 (liquorice)、ブラックベリー、タツナミソウ (skull cap)、及びバコパモンニエリ (Bacopa monnieri) の抽出物。

【 0 0 6 6 】

特に、Ｃ－グリコシドは、組成物中でアスコルビン酸（ビタミン C）及び／又はその類似体又は誘導体の１種と組み合わせることができる。

【 0 0 6 7 】

アスコルビン酸の類似体又は誘導体は、特にその塩、例えば、特に、アスコルビン酸ナトリウム、アスコルビルリン酸マグネシウム、又はアスコルビルリン酸ナトリウム、そのエステル、例えば、特にその酢酸エステル、プロピオン酸エステル、又はパルミチン酸エステル、又はその糖類、例えば、特にグリコシル化アスコルビン酸、である。特定の環境パラメータ、例えば、光、熱、及び水性媒体への高い敏感さを付与しているその化学構造（ α -ケトラクトン）により、アスコルビン酸を、アスコルビン酸のモノサッカライドエステルの形態又はホスホリル化したアルコールビン酸の金属塩の形態で用いることが有利でありうる。

本発明で用いることができるアスコルビン酸のモノサッカライドエステルは、特に、アスコルビン酸の、グルコース、マンノース、フルクトース、フコース、ガラクトース、N - アセチルグルコサミン、又はN - アセチルムラミン誘導体、並びにそれらの混合物、さらに特に、2 - アスコルビルグルコシドもしくは2 - O - (α - D - グルコピラノシル) - L - アスコルビン酸、又は6 - O - (β - D - ガラクトピラノシル) - L - アスコルビン酸、である。後者の化合物及びそれらの調製法は、特に、EP - A - 4 8 7 4 0 4、EP - A - 4 2 5 0 6 6、及びJ 0 5 2 1 3 7 3 6に開示されている。

【 0 0 6 8 】

一部については、ホスホリル化アルコールビン酸の金属塩は、アルカリ金属アスコルビルホスフェート、アルカリ土類金属アスコルビルホスフェート、及び遷移金属アスコルビルホスフェートから選択される。マグネシウムアスコルビルホスフェート（アスコルビルリン酸マグネシウム）の使用が有利である。

【 0 0 6 9 】

「落屑剤」の語は、以下の作用が可能な任意の化合物を意味するものと理解される：

- 剥離を促進することによって落屑に直接作用する〔例えば、 β - ヒドロキシ酸類、特に、サリチル酸及びその誘導体（5 - (n - オクタノイル)サリチル酸を含む）； α - ヒドロキシ酸、例えば、グリコール酸、クエン酸、乳酸、酒石酸、リンゴ酸、又はマンデル酸；尿素；ゲンチシン酸；オリゴフコース類；桂皮酸；サハラ・ジャポニカ(*Saphora japonica*)の抽出物；レスベラトロール〕；

- 又は、角質細胞間結合（コルネオデスモソーム）の落屑または分解に関与する酵素〔例えば、グリコシダーゼ、角質層キモトリプシン酵素（SCCE）、又はその他のプロテアーゼ（トリプシン、キモトリプシン様）〕。無機塩に配位する以下の薬剤を挙げることにもできる：EDTA；N - アセチル - N, N', N' - エチレンジアミン三酢酸；アミノスルホン酸化合物、及び特に、N - (2 - ヒドロキシエチル)ピペラジン - N' - 2 - エタンスルホン酸（HEPES）；2 - オキソチアゾリジン - 4 - カルボン酸（プロシステイン）誘導体；グリシン型の α - アミノ酸の誘導体（EP 0 8 5 2 9 4 9に開示されているもの、及びまた、Trilon Mの名称でBASF社から販売されているメチルグリシン二酢酸ナトリウム）；蜂蜜；又は、糖誘導体、例えば、O - オクタノイル - 6 - D - マルトース及びN - アセチルグルコサミン。

【 0 0 7 0 】

本発明の組成物に用いることができる平滑剤としては、以下のものが挙げられる：

5 環性トリテルペン及びそれらを含む植物抽出物（例えば、甘草(*Glycyrrhiza glabra*)）、例えば、 β - グリシルレチン酸及びその塩及び/又はその誘導体（グリシルレチン酸モノグルクロニド、ステアシルグリシルレチネート、又は3 - ステアロイルオキシグリシルレチン酸）、ウルソル酸及びその塩類、オレアノール酸及びその塩類、ベツリン酸及びその塩類、ボタン（*Paeonia suffruticosa*及び/又は*lactiflora*）の抽出物、サリチル酸の塩類特にサリチル酸亜鉛、Codif社のフィコサッカライド(*phycosaccharides*)、カラフトコンブ(*Laminaria saccharina*)の抽出物、カノーラ油、ピサボロール、カモミール抽出物、アラントイン、Seppic社のSepivital EPC（ビタミンE及びCのリン酸ジエステル）、オメガ - 3 不飽和オイル（例えば、ジャコウバラ(*musk rose*)、クロフサスグリ（ブラックカラント）の種、エキウム(*echium*)オイル又は魚油）、プランクトン抽出物、カブリロ

10

20

30

40

50

イルグリシン、Seppic社のSeppicalm VG (パルミトイルプロリンナトリウム及びスイレン (ニンファエアルバ (*Nymphaea alba*)))、ピジウム(pygeum)の抽出物、ボスウェリアセラタ(*Boswellia serrata*)の抽出物、センチペダカンニガミ (*Centipeda cunnighami*) の抽出物、ヒマワリ(*Helianthus annuus*)の抽出物、フラックス(*Linum usitatissimum*)の抽出物、トコトリエノール類、コラノキ(*Cola nitida*)の抽出物、ピペロナル、クロープの抽出物、ヤナギラン(*Epilobium angustifolium*)の抽出物、アロエ・ベラ、バコパモンニエリ(*Bacopa monnieri*)の抽出物、植物ステロール類、コルチゾン、ヒドロコルチゾン、インドメタシン、及びベタメタゾン。

【 0 0 7 1 】

有機光保護剤は、特に、アントラニレート；桂皮酸誘導体；ジベンゾイルメタン誘導体；サリチル酸誘導体；カンファー誘導体；トリアジン誘導体、例えば、US 4 3 6 7 3 9 0、EP 0 8 6 3 1 4 5、EP 0 5 1 7 1 0 4、EP 0 5 7 0 8 3 8、EP 0 7 9 6 8 5 1、EP 0 7 7 5 6 9 8、EP 0 8 7 8 4 6 9、EP 0 9 3 3 3 7 6、EP 0 5 0 7 6 9 1、EP 0 5 0 7 6 9 2、EP 0 7 9 0 2 4 3、及びEP 0 9 4 4 6 2 4に開示されているもの；ベンゾフェノン誘導体； β ， β - ジフェニルアクリレート誘導体；ベンゾトリアゾール誘導体；ベンザルマロネート誘導体；ベンゾイミダゾール誘導体；イミダゾリン類；ビスベンゾアゾリル誘導体、例えばEP 0 6 6 9 3 2 3及びUS 2 4 6 3 2 6 4に開示されているもの；p - アミノ安息香酸 (P A B A) 誘導体；メチレンビス (ヒドロキシフェニルベンゾトリアゾール) 誘導体、例えば、US 5 2 3 7 0 7 1、US 5 1 6 6 3 5 5、GB 2 3 0 3 5 4 9、DE 1 9 7 2 6 1 8 4、及びEP 0 8 9 3 1 1 9に開示されているもの；サンスクリーン用ポリマー及びサンスクリーン用シリコン、例えばWO 9 3 / 0 4 6 6 5に開示されているもの； α - アルキルスチレンから誘導される二量体類、例えば、DE 1 9 8 5 5 6 4 9に開示されているもの、から選択される。

【 0 0 7 2 】

無機光保護剤は、それ自体はUV保護剤として公知の、コーティングされ又はコーティングされていない金属酸化物、例えば、酸化チタン (アモルファス、あるいはルチル型及び/又はアナターゼ型の結晶性)、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化ジルコニウム、又は酸化セリウムから形成されている顔料又はナノ顔料から選択される。従来のコーティング剤はさらにアルミナ及び/又はステアリン酸アルミニウムである。コーティングされ又はコーティングされていない金属酸化物から形成されたそのようなナノ顔料は、特にEP 0 5 1 8 7 7 2及びEP 0 5 1 8 7 7 3に開示されている。

【 0 0 7 3 】

光保護剤は、通常、組成物の総重量に対して0.1～20重量%の範囲、好ましくは組成物の総重量に対して0.2～15重量%の割合で本発明の組成物中に存在する。

【 0 0 7 4 】

好ましくは、C - グリコシド誘導体 (1種以上) は、少なくとも1種の脱色剤及び/又は少なくとも1種の光保護剤と組み合わせて使用されうる。

【 0 0 7 5 】

以下の実施例は、本発明の範囲を限定することなく、本発明を説明する。化合物は、場合によっては、化学名又はCTFE (国際化粧品成分辞典及びハンドブック (International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook) 名で引用する。

【 発明を実施するための最良の形態 】

【 0 0 7 6 】

[実施例]

[実施例 1 : C - β - D - キシロピラノシド - n - プロパン - 2 - オンの脱色活性の実証]

場所に関してランダム化した (被験者は被験者自身の管理下にある) 二重盲検単一施設臨床試験 (活性成分対活性成分のベシクルからなるプラセボ、以下の詳細中に説明する配合を参照されたい) を、平均年齢62歳の、フォトタイプIII (6レベルのスケールのIII : I - 常に焼灼、褐色日焼けしない ; II - 常に焼灼、わずかに褐色日焼け ; III - 中程度に

10

20

30

40

50

焼灼、徐々に褐色日焼け；IV - 最小限の焼灼、容易に褐色日焼け；V - ほとんど焼灼せず、豊富な褐色日焼け；VI - 焼灼したことなし、多い色素沈着）の、顔の全体に老化が中程度に表れている15人の女性に実施した。化学線作用による黒子の臨床的評価は、以下の4つの主要なレベル（0～3）と3つの中間レベル（0.5；1.5；2.5）を含む7つのレベルの尺度にしたがって、本試験の最初と最後に皮膚科医によって実施した。

- ・ 0 - 染みなし
- ・ 1 - わずかな染み
- ・ 2 - 多くの染み
- ・ 3 - 非常に多くの染み

【0077】

女性たちは、下記組成物の総重量に対して10重量%濃度のC-β-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オンを2mg/cm²の割合で、又はプラセボを、予め印をつけておいた領域（複数）に3ヶ月間（98日）1日2回適用した。

【0078】

【表1】

化学名	
白色ワセリン	4
ソルビタントリステアレート	0.9
ポリエチレングリコール(40EO)ステアレート	2
香料	0.25
ミリスチルミリステート	2
メチル、ブチル、エチル、プロピル、及びイソブチル-p-ヒドロキシベンゾエート(7/57/22/14)の混合物	0.3
グリセリルモノノジステアレート(36/64)/カリウムステアレート混合物	3
水素化イソパラフィン(6-8モルのイソブチレン)	8.5
高純度水酸化ナトリウム	0.05
グリセロール	3
微生物学的に清浄な脱イオン水	35.84
クロルヘキシジンジグルコネート(溶液)	0.25
シクロペンタジメチルシリコーン	5
高純度の二回蒸留したセチルアルコール	4
植物由来の脂肪酸(主成分ステアリン酸)	1.2
エチレンジアミンテトラ酢酸二ナトリウム塩, 2H ₂ O	0.15
DL-α-トコフェリルアセテート(ビタミンEアセテート)	0.3
保護された2-エチルヘキシル4-メトキシシンナメート	0.52
1,5-アンヒドロ-6,8-ジデオキシ-L-グルコ-オクチール(水中に30%)	28.74

【0079】

C-β-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オンで処置した側の主スコアは、処置前の1.07±0.62から、0.93±0.68(p=0.08)に低下したが、プラセボ側では、このスコアは、1.10±0.69から1.13±0.67(NS)へ増加した。したがって、処置した側では被験者の54%がより低いスコアを示しているのに対して、本試験の開始時ではこれは13%であった。

【0080】

10

20

30

40

50

〔実施例 2：局所用組成物の例〕

以下の成分（重量％）を含む、水中油型エマルジョンタイプの、顔のケア用美白クリームを調製した：

- C-β-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン	0.005%	
- グリセリルステアレート	2%	
- ポリソルベート 60（ICI社のTween 60）	1%	
- ステアリン酸	1.4%	
- トリエタノールアミン	0.7%	
- カーボマー	0.4%	
- シアバターの液体画分	12%	10
- パーヒドロスクアレン	12%	
- 抗酸化剤	0.05%	
- 香料、保存料	適量	
- 水	100%まで適量	

【0081】

〔実施例 3：局所用組成物の例〕

以下の成分（重量％）を含む皮膚用脱色ゲルを調製した：

- C-β-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン	2%	
- ヒドロキシプロピルセルロース（Hercules社のKlucel H）	1%	
- 抗酸化剤	0.05%	20
- イソプロパノール	40%	
- 香料、保存料	適量	
- 水	100%まで適量	

【0082】

〔実施例 4：経口用組成物の例〕

以下の成分（重量％）を含む、糖でコーティングした錠剤を調製した：

（活性成分 糖でコーティングした 1 錠剤当たりの mg）

C-β-D-キシロピラノシド-n-プロパン-2-オン・・・300

（糖でコーティングした錠剤のコアの賦形剤）

マイクロクリスタリンセルロース・・・70

Encompress（登録商標）・・・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

（コーティング剤）

ラック・・・5

タルク・・・61

ポリビドン(Polyvidone)・・・6

このタイプの糖でコーティングした錠剤は、1日当たり1～4回摂取できる。

フロントページの続き

審査官 八次 大二郎

(56)参考文献 特表2004-525877(JP,A)

特開平06-092835(JP,A)

特開平09-295927(JP,A)

特開平07-157494(JP,A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A61K 8/60

A61K 31/70

A61P 17/00

A61Q 19/02

CAplus/REGISTRY(STN)