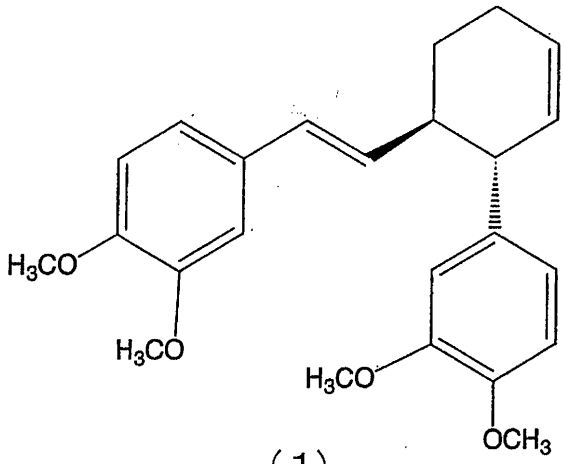
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成17年9月8日(2005.9.8)

【公開番号】特開2003-313116(P2003-313116A)
【公開日】平成15年11月6日(2003.11.6)
【出願番号】特願2002-120118(P2002-120118)
【国際特許分類第７版】
　Ａ６１Ｋ　 7/48
　Ａ６１Ｋ　 7/00
　Ａ６１Ｋ　 7/021
　Ａ６１Ｋ　31/09
　Ａ６１Ｋ　31/12
　Ａ６１Ｋ　35/78
　Ａ６１Ｐ　 7/02
　Ａ６１Ｐ　17/04
　Ａ６１Ｐ　17/16
　Ａ６１Ｐ　37/08
　Ａ６１Ｐ　43/00
【ＦＩ】
　Ａ６１Ｋ　 7/48
　Ａ６１Ｋ　 7/00　　Ｃ
　Ａ６１Ｋ　 7/00　　Ｋ
　Ａ６１Ｋ　 7/00　　Ｍ
　Ａ６１Ｋ　 7/00　　Ｎ
　Ａ６１Ｋ　 7/00　　Ｒ
　Ａ６１Ｋ　 7/00　　Ｕ
　Ａ６１Ｋ　 7/00　　Ｘ
　Ａ６１Ｋ　 7/021
　Ａ６１Ｋ　31/09
　Ａ６１Ｋ　31/12
　Ａ６１Ｋ　35/78　　Ｃ
　Ａ６１Ｋ　35/78　　Ｘ
　Ａ６１Ｐ　 7/02
　Ａ６１Ｐ　17/04
　Ａ６１Ｐ　17/16
　Ａ６１Ｐ　37/08
　Ａ６１Ｐ　43/00　　１１１

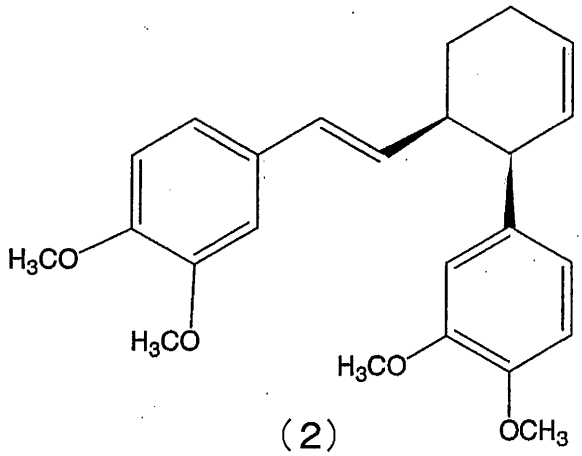
【手続補正書】
【提出日】平成17年3月10日(2005.3.10)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
　下記化合物１～２の少なくとも１種であることを特徴とするチロシナーゼ活性抑制剤。

【化１】



（１）

【化２】



（２）

【請求項２】
請求項１記載の抑制剤において、前記化合物１～２の少なくとも１種を有効成分として含有するショウガ科ショウガ属植物抽出物であることを特徴とするチロシナーゼ活性抑制剤。
【請求項３】
請求項１記載の化合物１～２の少なくとも１種であることを特徴とする美白剤。
【請求項４】
請求項３記載の美白剤において、前記化合物１～２の少なくとも１種を有効成分として含有するショウガ科ショウガ属植物抽出物であることを特徴とする美白剤。
【請求項５】
請求項１記載の化合物１～２の少なくとも１種又はこれを有効成分として含有するショウガ科ショウガ属植物抽出物を皮膚に塗布することを特徴とする美白方法。
【請求項６】
請求項１記載の化合物１～２の少なくとも１種又はこれを有効成分として含有するショウガ科ショウガ属植物抽出物を皮膚化粧料用担体に添加混合することを特徴とする美白用皮膚化粧料の製造方法。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０００１
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０００１】

【発明の属する技術分野】
本発明は、チロシナーゼ活性抑制剤及び美白剤、特にその有効成分に関する。
【手続補正３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０００４
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０００４】
一方、皮膚外用剤においては、肌荒れ改善の以外の機能も求められており、メラニン色素の異常沈着によるしみやそばかす、肝斑等などの色素沈着に対する美白を目的として、美白剤が配合されている。美白剤としては、ビタミンＣ及びその誘導体、コウジ酸やアルブチン等が知られており、これらはメラニン生成に不可欠なチロシナーゼの活性を抑制することにより、メラニン生成を抑制する。しかしながら、これらによっても未だ十分な効果は得られていない。
本発明は前記従来技術の課題に鑑みなされたものであり、その目的は、優れたチロシナーゼ活性抑制作用を有し、メラニン生成を抑制して美白効果を発揮する物質を提供することにある。
【手続補正４】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０００５
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０００５】
【課題を解決するための手段】
前記目的を達成するために本発明者らが鋭意検討を行った結果、ある種のメトキシベンゼン誘導体がチロシナーゼ活性抑制作用を有し、メラニン生成を抑制することも見出し、本発明を完成するに至った。
すなわち、本発明のチロシナーゼ活性抑制剤は、前記化合物１～２の少なくとも１種であることを特徴とする。
【手続補正５】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０００７
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正６】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０００８
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０００８】
本発明の抑制剤において、前記化合物１～２の少なくとも１種を有効成分として含有するショウガ科ショウガ属植物抽出物であることが好適である。
また、本発明にかかる美白剤は、前記化合物１～２の少なくとも１種であることを特徴とする。
また、本発明の美白剤において、前記化合物１～２の少なくとも１種を有効成分として含有するショウガ科ショウガ属植物抽出物であることが好適である。
本発明にかかる美白方法は、前記化合物１～２の少なくとも１種又はこれを有効成分として含有するショウガ科ショウガ属植物抽出物を皮膚に塗布することを特徴とする。
また、本発明にかかる美白用皮膚化粧料の製造方法は、前記請求項１記載の化合物１～

２の少なくとも１種又はこれを有効成分として含有するショウガ科ショウガ属植物抽出物を皮膚化粧料用担体に添加混合することを特徴とする。
【手続補正７】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０００９
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０００９】
【発明の実施の形態】
本発明にかかる化合物１～２は公知の方法を用いて植物から単離することができる。例えば、化合物１及び２はPhytochemistry, vol.32, No.2, p357-363, 1993(著者：Akiko Jitoe, Toshiya Masuda, and Nobuji Nakatani)に記載された方法等を用いることができる。
植物としては、ショウガ科(Zingiberaceae)ショウガ属(Zingiber)植物が挙げられる。ショウガ科ショウガ属植物としては、ぽんつくしょうが等が例示される。ぽんつくしょうがは、沖縄、東南アジアなどの熱帯地方に自生し、学名はZingiber purpureum Roxb.あるいはZingiber cassumunarである。Zingiber purpureum Roxb.とZingiber cassumunarとはシノニム(Synonym)の関係であることが判明している。
【手続補正８】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００１０
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００１０】
用いる部位としては、化合物１～２が得られる限り特に限定されず、例えば、根、根茎、茎、葉、花、果実、全草等が挙げられるが、好ましくは根又は根茎である。
具体例を挙げると、ぽんつくしょうがの根又は根茎の粉砕物を抽出溶媒に室温～加温下で浸漬して抽出し、この抽出物をカラム分離精製、再結晶等により精製して化合物１～２を得ることができる。
【手続補正９】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００１２
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００１２】
本発明においては、化合物１～２の他、これらを有効成分として含む抽出物を用いることもできる。このような抽出物としては、上記抽出溶媒で抽出された一次抽出物、及びこの一次抽出物をシリカゲルクロマトグラフィー等で粗精製して得られる粗画分が挙げられる。
なお、本発明の化合物１～２として、天然物から抽出されたものの他、化学的合成等により製造された合成品を用いることも可能である。
化合物１～２及びこれらを有効成分とする粗画分の製造方法の一例を以下に示す。
【手続補正１０】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００１８
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正１１】
【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】００１９
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正１２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２０
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正１３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２１
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正１４】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２２
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００２２】
製造例４　化合物１～２を有効成分として含有する粗画分
　Zingiber purpureum Roxb.の根茎500ｇを粉砕し、室温で1週間、エタノールに浸漬し、抽出を行った。抽出液を濾過し濃縮した後、濃縮液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサンと酢酸エチルの混合系）にかけ、化合物１～２を含有する粗画分1.3ｇを得た。
【手続補正１５】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２３
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正１６】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２４
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００２４】
　本発明にかかる化合物はチロシナーゼ活性抑制作用を有し、メラニン生成抑制効果にも優れることが判明した。よって、これらは美白剤として有用であり、皮膚に塗布して皮膚のメラニン色素の異常沈着によるしみ、そばかす、肝斑、雀卵斑などの色素異常の改善・予防に適用することができる。
　なお、化合物１～２は公知物質であるが、チロシナーゼ活性抑制作用やメラニン生成抑制作用については報告されていない。
　本発明において、化合物１～２の配合量は、外用剤全量中０．００１～２０．０質量％、好ましくは０．０１～１０．０質量％である。０．００１質量％未満であると、本発明でいう効果が十分に発揮されず、２０．０質量％を超えて配合しても効果の増加は実質上望めないし、皮膚外用剤への配合も難しくなる傾向にある。
【手続補正１７】

【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２８
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正１８】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２９
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正１９】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３０
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２０】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３１
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３２
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３３
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３４
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２４】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３５
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２５】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３６

【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２６】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３７
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２７】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３８
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２８】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００３９
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正２９】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００４０
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正３０】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００４１
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正３１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００４２
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正３２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００４３
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正３３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００５３
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正３４】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００６１
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正３５】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００６４
【補正方法】削除
【補正の内容】

【手続補正３６】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００７９
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００７９】
【発明の効果】
以上説明したように、本発明の化合物１～２はチロシナーゼ活性抑制作用、メラニン生成抑制作用を有するので、美白効果を発揮することができる。