

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2006-1930

(P2006-1930A)

(43) 公開日 平成18年1月5日(2006.1.5)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 8/00 (2006.01)	A 6 1 K 7/48	4 C O 8 3
A 6 1 Q 19/00 (2006.01)	A 6 1 K 7/00	C
A 6 1 K 8/30 (2006.01)	A 6 1 K 7/00	J
A 6 1 K 8/72 (2006.01)	A 6 1 K 7/00	N
A 6 1 K 8/06 (2006.01)		

審査請求 有 請求項の数 22 O L (全 16 頁)

(21) 出願番号	特願2005-158199 (P2005-158199)	(71) 出願人	398029706
(22) 出願日	平成17年5月30日 (2005.5.30)		シェーリングーブラウ ヘルスケア プロ
(31) 優先権主張番号	60/579, 735		ダクツ, インコーポレイテッド
(32) 優先日	平成16年6月14日 (2004.6.14)		アメリカ合衆国 テネシー 38151,
(33) 優先権主張国	米国 (US)		メンフィス, ジャクソン アベニュー 3
			030
		(74) 代理人	100078282
			弁理士 山本 秀策
		(74) 代理人	100062409
			弁理士 安村 高明
		(74) 代理人	100113413
			弁理士 森下 夏樹
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 スキンケア組成物

(57) 【要約】

【課題】 改善された耐水性能を示し、処方物をつけた人の皮膚を横切る処方物の移動を減少させる物理的特性を有し、そして限定された滑り握り (s l i p g r i p) 性能特性を提供する、紫外線の物理的および生化学的影響に対して皮膚を保護するための処方物を提供すること。

【解決手段】 皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物であって、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、およびエチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアリル水素化ダイマージリノレートコポリマーを含む、処方物。

【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物であって、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、およびエチレンジアミン / ネオペンチルグリコール / ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマーを含む、処方物。

【請求項 2】

前記処方物が、水中油エマルジョンである、請求項 1 に記載の処方物。

【請求項 3】

前記少なくとも一種の乳化剤が、約 1 重量 % ~ 約 10 重量 % の量で存在する、請求項 2 に記載の処方物。

10

【請求項 4】

前記処方物が、油中水エマルジョンである、請求項 1 に記載の処方物。

【請求項 5】

前記少なくとも一種の乳化剤が、約 1 重量 % ~ 約 10 重量 % の量で存在する、請求項 4 に記載の処方物。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の処方物であって、前記エチレンジアミン / ネオペンチルグリコール / ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマーが、約 0.1 重量 % ~ 約 20 重量 % の量で存在する、処方物。

【請求項 7】

少なくとも一種の日焼け止め活性剤をさらに含む、請求項 1 に記載の処方物。

20

【請求項 8】

前記処方物が、少なくとも約 30 の SPF を有する、請求項 7 に記載の処方物。

【請求項 9】

前記処方物が、少なくとも約 40 の SPF を有する、請求項 7 に記載の処方物。

【請求項 10】

少なくとも一種の皮膚保護剤をさらに含む、請求項 1 に記載の処方物。

【請求項 11】

少なくとも一種の防虫剤をさらに含む、請求項 1 に記載の処方物。

【請求項 12】

少なくとも一種の皮膚保護剤をさらに含む、請求項 7 に記載の処方物。

30

【請求項 13】

少なくとも一種の防虫剤をさらに含む、請求項 7 に記載の処方物。

【請求項 14】

皮膚への局所適用のための処方物であって、一価アルコールおよびエチレンジアミン / ネオペンチルグリコール / ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマーを含む溶媒を含む、処方物。

【請求項 15】

請求項 14 に記載の処方物であって、前記エチレンジアミン / ネオペンチルグリコール / ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマーが、約 0.1 重量 % ~ 約 20 重量 % の量で存在する、処方物。

40

【請求項 16】

少なくとも一種の日焼け止め活性剤をさらに含む、請求項 14 に記載の処方物。

【請求項 17】

前記処方物が、少なくとも約 30 の SPF を有する、請求項 14 に記載の処方物。

【請求項 18】

前記処方物が、少なくとも約 40 の SPF を有する、請求項 17 に記載の処方物。

【請求項 19】

少なくとも一種の皮膚保護剤をさらに含む、請求項 14 に記載の処方物。

【請求項 20】

50

少なくとも一種の防虫剤をさらに含む、請求項 1 4 に記載の処方物。

【請求項 2 1】

少なくとも一種の皮膚保護剤をさらに含む、請求項 1 6 に記載の処方物。

【請求項 2 2】

少なくとも一種の防虫剤をさらに含む、請求項 1 6 に記載の処方物。

【発明の詳細な説明】

【背景技術】

【0 0 0 1】

(発明の背景)

太陽放射線に対する曝露が、有害な健康上の結果を有し得、時々、曝露後数年まで現れないことが、現在一般的に認識されている。もちろん、過剰な曝露に由来するすぐに現れる「日焼け」自体が、重大な急性の健康上の問題であり得る。 10

【0 0 0 2】

太陽の光線に曝露される間に皮膚によって受容される太陽の紫外線の量を減少するために多くの製品が、利用可能である。代表的な製品処方物は、紫外線透過に対する化学的および/または物理的障壁を含む、ローション、クリーム、軟膏またはゲルである。これらは、紫外線の物理的および生化学的影響に対して皮膚を保護するそれらの能力においてかなり変動がある。

【0 0 0 3】

より初期の日焼け止め処方物は、制限された太陽の曝露期間に由来する日焼け (sunburn) に対して保護し、一方、皮膚の日焼け (tanning) を可能にするのに十分な放射線を透過するように設計された。しかし、現在、できるだけ多くの紫外線曝露を排除することに焦点があり、皮膚の日焼け (tanning) は、あるものには、審美的に好ましいものの、太陽放射線に対する過剰な曝露に由来する組織の損傷の明らかな徴候であることが認識されている。任意の量の保護されていない曝露が、潜在的に、免疫系の抑制を引き起こし、そして将来の健康上の問題 (例えば、皮膚癌および他の皮膚学的な障害) を導くことが最近発見された。 20

【0 0 0 4】

SPF (太陽保護因子 (Sun Protection Factor)) 評点付けシステムが、任意の所定のアウトドア活動に適切な日焼け止めを選択する際の消費者の手引きを与えるために開発された。一般的に、SPF 数は、保護されていない皮膚が赤化を示す曝露時間に対する、適切に適用された日焼け止めが皮膚の明らかな赤化を妨げる時間の倍数におよそ対応する。従って、SPF 8 の日焼け止め処方物が適切に適用された場合、通常の保護されていない期間の 8 倍の間、視覚的な影響なしで、日向にとどまり得る。もちろん、皮膚に対する視覚的な影響を生み出す保護されていない曝露の期間は、皮膚細胞の違いに起因して、個体間で変動する。少なくとも 30 の SPF 値を有する、高い SPF 「サンブロッカー (sun blocker)」製品が現在人気がある。 30

【0 0 0 5】

大部分の市販の日焼け止め処方物は、身体からの発汗が、適用される処方物と相互作用する傾向に起因して、建築工事、園芸、運動競技および他の多くのような激しいアウトドア活動に従事するヒトによる使用にはあまり適していない。例えば、発汗または他の供給源からの水分 (雨を含む) は、日焼け止めの活性成分および処方物の他の刺激性成分を眼に入れ、不快にさせる。適用される日焼け止め処方物が、適用後潤滑なままであるか、または発汗または他の水分と混合した場合に潤滑になることはまた、特に、用具の確実な握りを必要とするテニスまたはゴルフのような活動において、しばしば有害である。 40

【0 0 0 6】

耐水性のサンケア (suncare) 処方物を有することが有利である。耐水性処方物によって、使用者は、紫外線に対して保護されながら、水泳のような活動に従事し得る。疎水性材料は、代表的に、耐水性薬剤として役立ち、エマルジョンにフィルム形成特性および耐水特性を与える。しかし、改善された耐水性能を示し、処方物をつけた人の皮膚を 50

横切る処方物の移動を減少させる物理的特性を有し、そして限定された滑り握り (s l i p g r i p) 性能特性を提供する製品についての必要性が依然として存在する。

【 0 0 0 7 】

数年間において入手可能であるが、上記のような不利益を示さない日焼け止め製品は、Scheri ng - Plough Health Care Products, Inc., Memphis, Tenn. U. S. A. によって、COPPERTONETM SPORTTM SPF 30 ローションとして販売される。この製品は、活性成分オクチルサリシレート、オクチルメトキシシナメート、ホモサレート (h o m o s a l a t e)、およびオキシベンゾンを合計して処方物の 25.5 重量% 含み、疎水性表面処理を有する 1.5 重量% のヒュームドシリカを用いて処方された水中油エマルジョンである。シリカは、
10
処方物の内相に活性薬剤を固定化し、そして皮脂および / または外部の水分の影響下での移動を妨げるのに役立つと考えられる。この製品はまた、適用した場合、非常に望ましい「乾燥した」感じを有し、日焼け止め活性成分としての使用を承認された成分以外の特定の成分を含まない通常のローションの非常に液状の性質とは全く異なる。

【 発明の開示 】

【 発明が解決しようとする課題 】

【 0 0 0 8 】

COPPERTONE SPORT SPF 30 製品のような物理的特性および特性を有するが、より予測可能な処方物の挙動および安定性を有する製品についての必要性が存在する。
20

【 課題を解決するための手段 】

【 0 0 0 9 】

上記目的を達成するために、本発明は、例えば、以下を提供する。

(項目 1) 皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物であって、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、およびエチレンジアミン / ネオペンチルグリコール / ステアシル水素化ダイマージリノレエートコポリマーを含む、処方物。

(項目 2) 前記処方物が、水中油エマルジョンである、項目 1 に記載の処方物。

(項目 3) 前記少なくとも一種の乳化剤が、約 1 重量% ~ 約 10 重量% の量で存在する、項目 2 に記載の処方物。

(項目 4) 前記処方物が、油中水エマルジョンである、項目 1 に記載の処方物。
30

(項目 5) 前記少なくとも一種の乳化剤が、約 1 重量% ~ 約 10 重量% の量で存在する、項目 4 に記載の処方物。

(項目 6) 項目 1 に記載の処方物であって、前記エチレンジアミン / ネオペンチルグリコール / ステアシル水素化ダイマージリノレエートコポリマーが、約 0.1 重量% ~ 約 20 重量% の量で存在する、処方物。

(項目 7) 少なくとも一種の日焼け止め活性剤をさらに含む、項目 1 に記載の処方物。

(項目 8) 前記処方物が、少なくとも約 30 の S P F を有する、項目 7 に記載の処方物。

(項目 9) 前記処方物が、少なくとも約 40 の S P F を有する、項目 7 に記載の処方物。
40

(項目 10) 少なくとも一種の皮膚保護剤をさらに含む、項目 1 に記載の処方物。

(項目 11) 少なくとも一種の防虫剤をさらに含む、項目 1 に記載の処方物。

(項目 12) 少なくとも一種の皮膚保護剤をさらに含む、項目 7 に記載の処方物。

(項目 13) 少なくとも一種の防虫剤をさらに含む、項目 7 に記載の処方物。

(項目 14) 皮膚への局所適用のための処方物であって、一価アルコールおよびエチレンジアミン / ネオペンチルグリコール / ステアシル水素化ダイマージリノレエートコポリマーを含む溶媒を含む、処方物。

(項目 15) 項目 14 に記載の処方物であって、前記エチレンジアミン / ネオペンチルグリコール / ステアシル水素化ダイマージリノレエートコポリマーが、約 0.1 重量% ~ 約 20 重量% の量で存在する、処方物。
50

(項目 16) 少なくとも一種の日焼け止め活性剤をさらに含む、項目 14 に記載の処方物。

(項目 17) 前記処方物が、少なくとも約 30 の SPF を有する、項目 14 に記載の処方物。

(項目 18) 前記処方物が、少なくとも約 40 の SPF を有する、項目 17 に記載の処方物。

(項目 19) 少なくとも一種の皮膚保護剤をさらに含む、項目 14 に記載の処方物。

(項目 20) 少なくとも一種の防虫剤をさらに含む、項目 14 に記載の処方物。

(項目 21) 少なくとも一種の皮膚保護剤をさらに含む、項目 16 に記載の処方物。

(項目 22) 少なくとも一種の防虫剤をさらに含む、項目 16 に記載の処方物。

10

【0010】

(発明の要旨)

従って、皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物が開示され、これは、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、およびエチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマーを含む。

【0011】

皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物がまた開示され、これは、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、エチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアシル水素化ダイマーおよび少なくとも一種の日焼け止め活性剤を含む。

【0012】

皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物がまた開示され、これは、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、エチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマーおよび少なくとも一種の防虫剤を含む。

20

【0013】

皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物がまた開示され、これは、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、エチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマー、少なくとも一種の日焼け止め活性剤、および防虫剤を含む。

【0014】

皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物がまた開示され、これは、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、エチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマーおよび少なくとも一種の皮膚保護剤を含む。

30

【0015】

皮膚への局所適用のためのエマルジョン処方物がまた開示され、これは、水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、エチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマー、少なくとも一種の日焼け止め活性剤、および少なくとも一種の皮膚保護剤を含む。

【発明を実施するための最良の形態】

【0016】

(発明の詳細な説明)

本明細書中において一般的に化学物質に与えられる名称は、一般に認められた化学名であるか、あるいは、J. A. Wenninger 編、CTFA International Cosmetic Ingredient Dictionary、第 8 版、The Cosmetic, Toiletry and Fragrance Association, Washington, D. C., 2000 に列挙されるような、CTFA Adopted Names のような業界団体または監督官庁が認可した名称であるかのいずれかである。

【0017】

用語「重量%」は、本明細書中で使用される場合、処方物全体の重量当たりの成分の重量%を意味する。

40

50

【 0 0 1 8 】

本発明での使用に適切な耐水剤としては、二量化されたC₁₈ポリアミド樹脂である材料が挙げられる。この材料のINCI名は、エチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアリル水素化ダイマージリノレートコポリマーである。本明細書中に記載されるポリアミド樹脂は、より乾燥し、より審美的に好ましい皮膚の感じを有する処方物を生じる。さらに、この材料を含む処方物は、手において滑りやすくなく、使用者による確実な手の握りを可能にさせる。多くの他のポリアミド樹脂とは異なり、この材料は、80以下の軟化点を有し、これは、処方においてさらに都合がよい。なぜなら、この耐水剤の添加によって、処方物が、より低い温度で処方され得、従って、より便利であるからである。この成分の別の利点は、多くの他の耐水性を与える薬剤と同程度には処方物を濃くせず、従って、粘度制御におけるさらなる柔軟性を可能にすることである。さらに、この成分の使用は、ある程度の迅速な耐水性能を提供し、従って、従来の耐水性組成物の使用で推奨される水に入る前の待ち時間を除く組成物をもたらす。この材料は、エマルジョン日焼け止め組成物内に組み込まれ、そして流れる水の下、実質的なフィルムを形成することを見いだされた。この耐水性薬剤は、商品名「Sylvaclear（登録商標）C75V」で販売され、そしてFlorida、LakelandのArizona Chemical Companyから市販される。これは、米国特許第6,552,160号（これは、本明細書中においてその全体が、参考として援用される）に記載される手順に従って、報告されるように調製され得る。

10

【 0 0 1 9 】

20

エチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアリル水素化ダイマージリノレートコポリマーは、約0.05重量%～約20重量%、好ましくは、約1重量%～約5重量%、最も好ましくは、約1または2重量%の量で存在し得る。

【 0 0 2 0 】

用語「エマルジョン」は、皮膚への適用が意図された、水中油（o/w）型または油中水（w/o）型の分散処方物（特に、美容的または治療的利点を提供する、ローションおよびクリーム）を同定するために本明細書中で使用される。エマルジョンは、処方物についての意図される用途に依存して、数多くの所望される「活性」成分（皮膚着色剤、薬物物質（例えば、抗炎症剤、抗生物質、局所麻酔剤、抗真菌剤、角質溶解剤、など）、皮膚保護剤またはコンディショナー、湿潤剤、紫外線吸収剤、太陽光無しでの日焼け剤（sunless tanning agent）など、酸化防止剤、抗老化剤、皮膚の色を薄くする薬剤（skin lightening agent）、および防虫剤を含む）のいずれかを含み得る。

30

【 0 0 2 1 】

o/wエマルジョンおよびw/oエマルジョンを形成するための技術は、当該分野において非常に周知である。本発明は、任意の特定の処方技術に依存せず、特定の処方成分の選択が、必要ないくつかの特定の処方手順を十分にに行い得ることが認識される。

【 0 0 2 2 】

本発明の1つの局面に適切な乳化剤は、水中油型エマルジョンおよび/または油中水型エマルジョンを作製するための当該分野で公知の乳化剤である。水性の外側相は、皮膚接触のために多くの人々によって好まれる。なぜなら、油の外側相を有するエマルジョンのように、適用される場合に脂っこいかまたはねばねばした感覚を作り出さないからである。代表的な水中油乳化剤は、当該分野で周知なように、約9より大きい疎水性-親水性平衡（しばしば、「HLB」と略される）を有する；しかし、この「規則」は、多くの例外を有することが公知である。選択された乳化剤は、その化学的性質に依存して、油相または水相のいずれかの成分であり、エマルジョンの形成および維持の両方、または安定性を補助する。本発明の別の局面に適切な乳化剤は、油中水型のエマルジョンを作製するために当該分野で公知な乳化剤である。代表的な油中水乳化剤は、当該分野で周知なように約4～約6のHLB値を有する；しかし、この「規則」もまた、多くの例外を有することが公知である。適切な油中水乳化剤の選択は、処方の分野で周知である。

40

50

【0023】

日焼け止め処方物のための幅広く使用されている乳化剤系の大部分が、本発明において使用され得る。特に好ましい乳化剤は、Henkel製のEmerest 2712の商品名で入手可能なPEG-8 Distearate、Riken Vitamin Oil製の商品名POEM-S-105で入手可能なPEG-5 Glyceryl Stearate、Sabo製の商品名Sabowax ELH6で入手可能なPEG-6 Hydrogenated Castol Oil、Stepan製の商品名STEPAN PEG-300 MOで入手可能なPEG-6 Oleate、ICI Surfactants製の商品名Arlacel 83およびArlacel Cで入手可能なSorbitan Sesquioleate、Gattefosse S.A.製のCetasalの商品名で入手可能なTEA-Stearateである。別の好ましい乳化剤は、La Roche製の商品名Amphisol Aで入手可能な中和セチルホスフェートである。最も好ましくは、B.F. Goodrich製のPemulen TR-1およびPemulen TR-2の商品名で入手可能な、 $C_{10}-C_{30}$ アルキルアクリレート、およびアクリル酸、メタクリル酸またはスクロースのアリルエーテルもしくはペンタエリスリトールのアリルエーテル内で架橋されたそれらの単純エステルの中の1つのうちの1つ以上のモノマーの、アクリレート/ $C_{10}-C_{30}$ アルキルアクリレート架橋ポリマーである。本発明で使用される乳化剤の量は、約0.1~約10重量%、好ましくは、約0.5重量%~約5重量%、最も好ましくは、約2重量%~約4重量%の量で存在する。乳化剤の選択は、十分に当業者の範囲内であり、本発明の重要な局面ではない。使用され得るさらなる好ましい乳化剤としては、Croda Oleochemicals製の商品名Crill 6で入手可能なSorbitan Triisostearate、およびBASF製の商品名Cremophor GS 32で入手可能なPolyglyceryl-3 Distearateが挙げられる。

【0024】

当該分野において公知であるように、個々のエマルジョン液滴が、小さく均一な大きさを有することが好ましい。なぜなら、これらの特性は、より安定なエマルジョンをもたらすからである。逆に、幅広い粒子サイズ分布は、液滴間の界面張力が実質的に減少されなかったこと、従って、これらの液滴が、合体して、不安定なエマルジョンを生じる凝集を形成する傾向があることを示す。

【0025】

本発明の処方物は、皮膚に適用した際に上品な感じを提供し、一方で、現在製造されている他のスキンケア製品と比べて、処方の間の高温および剪断に耐える能力を改善し、および長時間の安定性を改善する。

【0026】

本発明の目的のために、「日焼け止め活性剤」は、活性な日焼け止め成分としての使用のために受け入れ可能であるとしてみなされる物質のすべてを、単独でまたは組み合わせで含む。監督官庁による認可は、一般的に、ヒトとの接触が意図された処方物中の活性剤の含有のために必要とされ、米国における日焼け止めでの使用について認可されているかまたは現在認可されている活性剤としては、パラアミノ安息香酸、アボベンゾン (avobenzene)、シノキセート、ジオキシベンゾン、ホモサレート、メンチルアントラニレート、オクトクリレン (octocrylene)、オクチルメトキシシンアメート、オクチルサリシレート、オキシベンゾン、パジメート (padimate) O、フェニルベンズイミダゾールスルホン酸、スライソベンゾン、トロラミン (trolamine) サリシレート、二酸化チタン、酸化亜鉛、ジエタノールアミンメトキシシンナメート、ジガロイルトリオレエート (digalloy trioleate)、エチルジヒドロキシプロピルPABA、グリセリルアミノベンゾエート、ジヒドロキシアセトンを含むローソーン (lawsone)、レッドベトロラタム (red petrolatum) が挙げられるが、これらに限定されない。

【0027】

10

20

30

40

50

特に好ましい日焼け止め活性剤としては、Universal Preserv-A-Chem製の商品名Uniderm Homosalで入手可能なホモメンチルサリシレート、ISP Vandyk製の商品名Escalol 567で入手可能なBenzophenone-3、BASF製のUvinul MS-40および3V Inc.製のUvasorb MET/C、Haarmann & Reimer製の商品名Neo Heliopan OSで入手可能なOctyl Salicylate、BASF製の商品名Uvinul N-539-SGおよびHaarmann & Reimer製の商品名Neo Heliopan 303で入手可能なOctocrylene、ならびにGivaudon RoureおよびRaroche製の商品名Parsol MCXで入手可能なOctyl methoxycinnamate、またはこれらの混合物が挙げられる。 10

【0028】

単一の活性成分による場合で可能であるよりも、より高いレベルの紫外線吸収を達成するために、またはより幅広い範囲の紫外線波長にわたって有用な吸収を提供するために、処方物中で2つ以上の日焼け止め成分の組み合わせを使用することが典型的である。いくつかの他の日焼け止め活性成分（例えば、Mexoryl（登録商標）SXの商標で販売される、テレフタリリデンジカンファー（dicamphor）スルホン酸）は、他の国での使用に受け入れられており、そしてこれらはまた、本発明の範囲内であると考えられる。

【0029】

本発明の処方物は、日焼け止め（sunscreen）能力（SPF<30）および/またはサンブロック（sunblock）能力（SPF>30）を有する。好ましくは、本発明の処方物は、少なくとも約30より大きい、好ましくは、少なくとも約40より大きい、好ましくは、約50のSPFを有する。 20

【0030】

防虫成分は、日焼け止めエマルジョンが通常、主にアウトドア活動に従事するヒトによって使用されるので、日焼け止めエマルジョンにおいて所望される。パーソナルケア製品ののための最も幅広く使用される活性剤は、N,N-ジエチル-m-トルアミドであり、しばしば「DEET」と呼ばれ、少なくとも約95% DEETを含む濃度の形態で入手可能である。他の合成化学防虫剤としては、ジメチルフタレート、エチルヘキサジオール、 30
インダロン、ジ-n-プロピルイソシンクロネート（di-n-propylisocinchonate）、ピシクロヘプテン、ジカルボキシミド（dicarboximide）、およびテトラヒドロフルアルデヒドが挙げられる。特定の植物由来の材料はまた、防虫活性を有し、これには、シトロネラ油およびシトロネラの他の供給源（レモンガラス油を含む）、リモネン、ローズマリー油およびユーカリ油が挙げられる。日焼け止めエマルジョンへ組み込むための防虫剤の選択は、防虫剤の臭いによってしばしば影響を受ける。使用される防虫剤の量は、薬剤の選択に依存する；DEETは、高い濃度（例えば、約15%以上まで）で有用であり、一方、植物由来の物質のうちのいくつかは、代表的に、かなり少ない量（例えば、0.1%以下）で使用される。

【0031】

本明細書中で使用される場合、日焼け後エマルジョン（after sun emulsion）処方物は、使用者に心地よい鎮静効果または治癒効果を提供する、使用者が任意の時間の間、日向にいた後に投与され得る処方物として規定される。このような処方物としては、例えば、アロエベラ、ビタミンA、ビタミンCおよびビタミンE、緑茶抽出物などが挙げられ得る。 40

【0032】

皮膚保護活性剤がまた本発明の範囲内である。適切な例としては、とりわけ、以下が挙げられる：（a）アラントイン、0.5~2%；（b）水酸化アルミニウムゲル、0.15~5%；（c）カラミン、1~25%、（d）ココアバター、50より多い；（e）タラ肝油、5~13.56%；（f）コロイド状オートミール；（g）ジメチコン、1~3 50

0 % ; (h) グリセリン、20 ~ 45 % ; (i) 固い脂肪 (H a r d f a t)、50 より多い ; (j) カオリン、4 ~ 20 % ; (k) ラノリン、12.5 ~ 50 % ; (l) 鉱油、50 % より多い ; (m) ペトロラタム、30 % より多い ; (n) 重炭酸ナトリウム ; (o) 局所用デンプン、10 ~ 98 % ; (p) 白色ワセリン、30 % より多い ; (q) 酢酸亜鉛、0.1 ~ 2 % ; (r) 炭酸亜鉛、0.2 ~ 2 % ; および (s) 酸化亜鉛、1 ~ 25 %。

【0033】

本発明の組成物は、幅広い範囲のさらなる任意の成分を含み得る。The C T F A C o s m e t i c I n g r e d i e n t H a n d b o o k , 第7版、1997および第8版、2000 (これらは、本明細書中においてその全体が参考として援用される) は、スキンケア組成物中で一般的に使用される幅広い種々の美容的および薬学的成分を記載し、これらは、本発明の組成物での使用に適切である。この参考文献に開示されるこれらの機能クラスの例としては、以下が挙げられる: 吸収剤、研磨剤、抗ケッキング (a n t i c a k i n g) 剤、消泡剤、酸化防止剤、結合剤、生物学的添加剤、緩衝剤、充填剤 (b u l k i n g a g e n t)、キレート剤、化学的添加剤、着色剤、美容収斂剤、美容殺生物剤、変性剤、薬物収斂剤、外用鎮痛剤、フィルム形成剤、芳香成分、湿潤剤、乳白剤、pH調節剤、可塑剤、保存剤、噴霧剤、還元剤、皮膚漂白剤、皮膚調整剤 (皮膚軟化剤、湿潤剤、種々雑多、および閉鎖剤 (o c c l u s i v e))、皮膚保護剤、溶媒、泡効果促進剤、ヒドロトロップ、可溶化剤、懸濁剤 (非界面活性剤)、日焼け防止剤、紫外線光吸収剤、防水剤、および粘度増加剤 (水性および非水性)。

【0034】

水は、エマルジョンを形成するために有効な量で使用される。給水において溶解された固体によって引き起こされ得るパッチ間の処方物の不一致を改善するために、脱イオン化または逆浸透のようなプロセスによって精製された水を使用することが一般的に好ましい。エマルジョンまたは組成物における水の量は、約15重量% ~ 95重量%、好ましくは、約45重量% ~ 75重量%、最も好ましくは、約60重量% ~ 約75重量%の範囲であり得る。

【0035】

あるいは、本発明の別の実施形態において、成分は、一価アルコール溶媒中に溶解され得る。本発明は、90 % までの一価アルコールを含み得る。一価アルコールの好ましい量は、約25 % ~ 約85 % であり、最も好ましくは、約35 % ~ 約75 % である。この実施形態において、日焼け防止活性剤は、約25 % ~ 約30 % の量で存在し得、そして防水剤は、約1 % ~ 約5 % の量で存在し得る。本発明のなおさらなる実施形態において、処方物は、一価アルコールに基づくゲル処方物であり得る。

【0036】

皮膚軟化剤は、皮膚を滑らかにかつ柔らかくすることを補助する油性のまたは油状の物質であり、皮膚の粗さ、割れ、または刺激をまた減少させ得る。代表的な適切な皮膚軟化剤としては、50 ~ 500センチポアズ (c p s) の範囲の粘度を有する鉱油、ラノリン油、ココナツヤシ油、ココアバター、オリーブ油、アーモンド油、マカダミアナツ油、アロエ抽出物 (例えば、アロエベラリボキノン (l i p o q u i n o n e)、合成ホホバ油、天然ソノーラ (s o n o r a) ホホバ油、ベニバナ油、トウモロコシ油、液体ラノリン、綿実油、およびピーナツ油が挙げられる。好ましくは、皮膚軟化剤は、H e n k e l K G a A 製の M y r i t o l 331 の商品名で販売されるココア油モノグリセリド、ジグリセリドおよびトリグリセリドの混合物であるココグリセリド、または H e n k e l K G a A 製の商品名 C e t i o l O E で入手可能なジカプリリルエーテル、もしくは F i n e t e x 製の商品名 F i n s o l v T N で販売される C₁₂ ~ C₁₅ アルキルベンゾエートである。一種以上の皮膚軟化剤が、約1重量% ~ 約10重量%、好ましくは、約5重量%の量の範囲で存在し得る。別の適切な皮膚軟化剤は、D o w C o r n i n g C o r p から入手可能な D C 200 F l u i d 350、シリコーン流体である。

【0037】

他の適切な皮膚軟化剤としては、スクアレン、ひまし油、ポリブテン、スイートアーモンド油、アボガド油、カロフィラム (calophyllum) 油、リシン油、ビタミンEアセテート、オリーブ油、シリコン油 (例えば、ジメチロポリシロキサン (dimethylopolysiloxane) およびシクロメチコン (cyclomethicone))、リノレンアルコール、オレイルアルコール、穀物の胚の油 (例えば、麦芽の油、イソプロピルパルミテート、オクチルパルミテート、イソプロピルミリステート、ヘキサデシルステアレート、ブチルステアレート、デシロレアート、アセチルグリセリド、(C₁₂ ~ C₁₅) アルコールのオクタノエートおよびベンゾエート、アルコールおよびポリアルコールのオクタノエートおよびデカノエート (例えば、グリコールおよびグリセリル)、リシノール酸エステル (例えば、イソプロピルアジペート、ヘキシルラウレートおよびオクチルドデカノエート)、ジカプリルリルマレエート、水素化植物油、フェニルトリメチコン (phenyltrimethicone)、ホホバ油ならびにアロエベラ抽出物が挙げられる。

10

【0038】

周囲温度で固体または半固体である他の適切な皮膚軟化剤が使用され得る。このような固体または半固体の美容皮膚軟化剤としては、グリセリルジラウレート、水素化ラノリン、ヒドロキシ化ラノリン、アセチル化ラノリン、ペトロラタム、イソプロピルラノレート、ブチルミリステート、セチルミリステート、ミリスチルミリステート、ミリスチルラクテート、セチルアルコール、イソステアリルアルコール、およびイソセチルラノレートが挙げられる。1種以上の皮膚軟化剤が、必要に応じて処方物中に含まれ得る。

20

【0039】

湿潤剤は、その吸湿特性に起因して、水の保持を促進する、湿らせる薬剤である。適切な湿潤剤としては、グリセリン、ポリマー性グルコール (例えば、ポリエチレングリコールおよびポリプロピレングリコール)、マンニトールおよびソルビトールが挙げられる。好ましくは、湿潤剤は、Sorbitol、70% USPまたはポリエチレングリコール400、NFである。1種以上の湿潤剤が、必要に応じて、約1重量% ~ 約10重量%、好ましくは、約5重量%の量で処方物中に含まれ得る。

【0040】

乾燥感覚改変剤は、エマルジョンに添加された場合、エマルジョンが乾燥した場合に皮膚に「乾燥した感じ」を与える薬剤である。乾燥感覚改変剤としては、タルク、カオリン、チョーク、酸化亜鉛、シリコン流体、無機塩 (例えば、硫酸バリウム)、表面処理シリカ、沈殿シリカ、ヒュームドシリカ (例えば、U.S.A.、N.Y.、New YorkのDegussa Inc. から入手可能なAerosil) が挙げられ得る。別の乾燥感覚改変剤は、Fowlerの名称で発行され、そしてSchering-Plough Healthcare Products, Inc. に譲渡された米国特許第6,488,916号に開示される型のエピクロロヒドリン架橋グリセリルデンブレンである。

30

【0041】

例えば、B.F. Goodrich Co. から入手可能なCarbopol Ultrez、あるいはCarbopol ETD 2001のようなさらなる濃化剤を組み込むことが有利であり得る。さらなる濃化剤の選択は、十分に当業者の範囲内である。

40

【0042】

さらなる防水剤または耐水剤は、フィルム形成特性および防水特性をエマルジョンに与える疎水性材料である。適切なさらなる防水剤は、ビニルピロリドンならびにエイコセンおよびドデカンモノマーのコポリマー (例えば、U.S.A.、N.J.、WayneのISP Inc. のそれぞれ、Ganex V 220およびGanex V 216 Polyemrの商品名) である。なお他の適切な防水剤としては、ポリエチレンポリマー (例えば、New Phase Technologiesから入手可能なPerfoma V 825) およびChevron製の商品名PA-18で入手可能なポリ無水物樹脂No. 18が挙げられる。防水剤は、U.S. Food and Drug Ad

50

ministration in 「Sunscreen Drug Products for OTC Human Use」, Federal Register, Vol. 43, Aug. 25, 1978, Part 2, pp. 38206 - 38269 によって記載される手順を使用して、耐水性については少なくとも40分間、そして防水性については少なくとも80分間、循環する水に曝露した後に、日焼け止め剤が、皮膚において有効なままであるようにさせるのに有効な量で使用される。

【0043】

抗菌性保存剤は、日焼け止め組成物において微生物を駆除するか、またはその増殖を予防または阻害する物質または調製物であり、これはまた、酸化からの保護を提供し得る。保存剤は、エマルジョンのような水性ベースの製品を自己滅菌するためにしばしば使用され得る。これは、製品の製造および配布の間、ならびに通常の使用の間に製品をさらに不注意に汚染し得る消費者による使用の間の増殖に由来する製品内に存在し得る微生物の発生を妨げるためになされる。代表的な保存剤としては、パラ-ヒドロキシベンゾエート（パラベン）（特に、メチルパラベン、プロピルパラベン、イソブチルパラベンおよびこれらの混合物）の低級アルキルエステル、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコールおよび安息香酸、ジアゾリジニル、尿素、クロロフェネシン、ヨードプロピニルおよびブチルカルバメートが挙げられる。好ましい保存剤は、Sutton製の Germaben II の商品名で入手可能である。一種以上の抗菌性保存剤は、必要に応じて、約0.001～約10重量%、好ましくは、約0.05～約1重量%の範囲の量で含まれ得る。

10

【0044】

酸化防止剤は、空気中での酸素の作用（酸化）に起因する劣化から保護するためまたは悪化を遅延させるために日焼け止め剤に添加される天然または合成の物質である。これらはまた、皮膚組織における酸化反応を減少させ得る。酸化防止剤は、酸敗（rancidity）および非酵素的な褐変反応産物の生成を導き得る酸化性の劣化を妨げる。代表的に適切な酸化防止剤としては、没食子酸プロピルエステル、没食子酸オクチルエステル、および没食子酸ドデシルエステル、ブチル化ヒドロキシアニソール（BHA、オルト異性体およびメタ異性体の混合物として通常購入される）、ブチル化ヒドロキシトルエン（BHT）、緑茶抽出物、尿酸、システイン、ピルベート（pyruvate）、ノルジヒドログアイアレチン酸、ビタミンA、ビタミンEおよびビタミンC、ならびにそれらの誘導体が挙げられる。一種以上の酸化防止剤は、必要に応じて、約0.001～約5重量%、好ましくは、約0.01～約0.5重量%の範囲の量で日焼け止め組成物中に含まれ得る。

20

30

【0045】

キレート剤は、イオンが、関与する環のそれぞれから化学結合によって保持されるように、例えば、複素環構造で金属イオンをキレートするかまたは結合するために使用される物質である。適切なキレート剤としては、エチレンジアミンテトラ酢酸（EDTA）、EDTA二ナトリウム、エデト酸カルシウム二ナトリウム、EDTA三ナトリウム、アルブミン、トランスフェリン、デスフェロキサミン、デスフェラル（desferal）、デスフェロキサミンメシレート、EDTA四ナトリウムおよびEDTA二カリウムが挙げられる。一種以上のキレート剤が、必要に応じて約0.001～約0.5重量%、好ましくは、約0.01重量%の範囲の量で日焼け止め組成物中に含まれ得る。

40

【0046】

芳香剤は、審美的に好ましい芳香を日焼け止め組成物に与え得る芳香性物質である。代表的な芳香剤としては、精油を作り出すために、単独でまたは任意の組み合わせで使用され得る、植物的供給源（すなわち、バラの花びら、クチナシの花、ジャスミンの花など）から抽出された芳香性材料が挙げられる。あるいは、アルコール抽出物は、芳香を混ぜ合わせるために調製され得る。しかし、天然の物質からの芳香を得ることの比較的高い費用に起因して、特に高容量の製品において、合成的に調製された芳香を使用するのが現在の傾向である。本発明での使用のための好ましい芳香は、Sozio, Inc. から入手可能な Fragrance SZ-2108 および Fragrance SZ-1405 で

50

ある。一種以上の芳香が、必要に応じて、約 0.001 ~ 約 5 重量%、好ましくは、約 0.01 ~ 約 0.5 重量%の範囲の量で日焼け止め組成物中に含まれ得る。

【0047】

pH 改变剤は、処方物の pH を低く（例えば、より酸性の pH 値へ）またはより高く（例えば、より塩基性の pH 値へ）調節する化合物である。適切な pH 改变剤の選択は、十分に当業者の範囲内である。

【0048】

本発明は、以下の実施例によってさらに記載されるが、これらの実施例は、いかなる様式においても、添付の特許請求の範囲によって規定されるように、本発明を制限することを意図しない。

10

【実施例】

【0049】

【表 1】

実施例 1

% W/W	成分記載
部分 A	
47.7	USP 精製水
0.38	Pemulen TR-1
5	プロピレングリコール USP

20

【0050】

【表 2】

0.01	EDTA ニナトリウム
0.5	アラントイン
0.5	ベンジルアルコール
0.2	メチルパラベン , NF
部分 B	
4	Lexfeel 7,
7.5	オクチノキセート , USP
6	オキシベンゾン , USP
0.01	ビタミン E, DL α トコフェロール
0.2	Oleth-3
5	オクチサレート , USP
0.1	プロピルパラベン NF
9	ホモメンチルサリシレート ; Homosal
1.5	Sylvaclear C75V
2	オクトクリレン
部分 C	
10	USP 精製水
0.35	トリエタノールアミン 99% NF
部分 D	
0.05	Fragrance SZ-2108

部分 A の成分を、P em u l e n およびアラントインを除いて混合した。P em u l e n を、ゆっくりまき、次いで、アラントインを迅速に攪拌することによって混合した。部分 b の成分を、第二のビーカーで混合し、そして約 1 7 5 に加熱した。次いで、二つの相を、約 1 5 分間、分散器を用いて混合した。次いで、トリエタノールアミン (t r i e t h a n o l o m i n e) および水を添加した。次いで、約 2 分間、攪拌しながら芳香剤を添加した。

【 0 0 5 1 】

10

20

30

【表 3】

実施例 2

% W/W	成分記載
部分 A	
48	USP 精製水
0.38	Pemulen TR-1
5	プロピレングリコール USP
0.01	EDTA ニナトリウム
1	Germaben
部分 B	
7.5	オクチノキセート, USP
6	オキシベンゾン, USP
0.01	ビタミン E, DL α トコフェロール

10

【0052】

20

【表 4】

0.2	Oleth-3
5	オクチサレート, USP
13	ホモメンチルサリシレート ; Homosal
1.5	Sylvaclear C75V
2	オクトクリレン
部分 C	
10	USP 精製水
0.35	トリエタノールアミン 99% NF
部分 D	
0.05	Fragrance SZ-2108

30

部分 A の成分を、Pemulen を除いて混合した。Pemulen をゆっくりまいた。部分 B の成分を、第二のビーカーで混合し、そして約 175 に加熱した。次いで、二つの相を、約 15 分間、分散器を用いて混合した。次いで、トリエタノールアミン (triethanolamine) および水を添加した。次いで、約 2 分間、攪拌しながら芳香剤を添加した。

【0053】

40

この実施例に記載される手順に従って調製した日焼け止めローションは、約 50 の SPF を有する高い SPF サンプロックを生じる。

【0054】

水相、油相、少なくとも一種の乳化剤、およびエチレンジアミン/ネオペンチルグリコール/ステアシル水素化ダイマージリノレートコポリマー耐水性形成剤を含む、エマルジョン処方物であるスキンケア組成物が開示される。

【0055】

本発明の現在好ましい実施形態を本明細書中に記載したが、記載される実施形態の特定の変更および改変が、本発明の精神および範囲から逸脱することなくなされ得ることが、本発明が関係する当業者に明らかである。従って、本発明が、添付の特許請求の範囲およ

50

び適用され得る法の規則によって必要とされる程度にのみ制限されることが意図される。

フロントページの続き

(72)発明者 ケビン シー . フォウラー

アメリカ合衆国 テネシー 3 8 0 5 3 , ミリントン , ロック - キューバ ロード 1 2 8 0

F ターム(参考) 4C083 AC111 AC122 AC152 AC332 AC342 AC472 AC482 AC531 AC532 AC542

AC682 AD091 AD092 AD662 BB01 BB46 BB51 CC02 CC19 DD32

DD33 EE17