

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号

特許第7343089号

(P7343089)

(45)発行日 令和5年9月12日(2023.9.12)

(24)登録日 令和5年9月4日(2023.9.4)

(51)国際特許分類

F I

A 6 1 K	31/7004(2006.01)	A 6 1 K	31/7004
A 6 1 K	31/047(2006.01)	A 6 1 K	31/047
A 6 1 K	8/06 (2006.01)	A 6 1 K	8/06
A 6 1 K	8/34 (2006.01)	A 6 1 K	8/34
A 6 1 K	8/35 (2006.01)	A 6 1 K	8/35

請求項の数 7 外国語出願 (全14頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2018-228036(P2018-228036)
 (22)出願日 平成30年12月5日(2018.12.5)
 (65)公開番号 特開2019-108325(P2019-108325
 A)
 (43)公開日 令和1年7月4日(2019.7.4)
 審査請求日 令和3年8月30日(2021.8.30)
 (31)優先権主張番号 17205658.2
 (32)優先日 平成29年12月6日(2017.12.6)
 (33)優先権主張国・地域又は機関
 欧州特許庁(EP)

(73)特許権者 503220392
 ディーエスエム アイピー アセッツ ビ
 ー・ブイ・
 DSM IP ASSETS B.V.
 オランダ国, 6411 テーイーヘ
 ーレン, ヘット オーバールーン 1
 Het Overloon 1, NL -
 6411 TE Heerlen, Net
 herlands
 (74)代理人 100107456
 弁理士 池田 成人
 (74)代理人 100128381
 弁理士 清水 義憲
 (74)代理人 100162352
 弁理士 酒巻 順一郎

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 保存増強剤

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

大腸菌(E.coli)過多に対する処理を必要とする人における、健康な皮膚恒常性を維持するため、且つ/又は皮膚マイクロバイオームバランスを維持するための局所組成物であって、フィタントリオール及びエリトルロースを含む局所組成物。

【請求項2】

フィタントリオールの量は、前記組成物の総重量に基づいて0.01~2.9重量%の範囲で選択される量である、請求項1に記載の局所組成物。

【請求項3】

エリトルロースの量は、前記組成物の総重量に基づいて0.005~2重量%の範囲で選択される量である、請求項1に記載の局所組成物。

【請求項4】

前記局所組成物の総重量に基づいて、エリトルロースの量は、0.05~0.2重量%の範囲で選択され、フィタントリオールの量は、0.1~2重量%の範囲で選択される、請求項1に記載の局所組成物。

【請求項5】

化粧組成物又は医薬組成物である、請求項1~4のいずれか一項に記載の局所組成物。

【請求項6】

O/Wエマルション、W/Oエマルション、ゲル、シャンプー調製物又はヘアコンディショナーである、請求項5に記載の局所組成物。

10

20

【請求項 7】

局所組成物を大腸菌 (E. coli) による汚染から保護するための保存増強剤としての、フィタントリオールとエリトルロースとの組み合わせの使用。

【発明の詳細な説明】

【0001】

本発明は、フィタントリオール及びエリトルロースを含む局所組成物並びに保存増強のためのその使用に関する。

【0002】

化粧組成物は、微生物にとって優れた生存環境を与えるため、微生物による汚染を特に受けやすい。そのため、保存及び微生物学的安定性は、製品の安全性及び法令順守を確実にするために、化粧製剤コンセプトの不可欠な部分である。しかし、国際認証及び穏やかな保存などの要求は、許容できる活性物質の数を制限している。増加する販売圧力は、化粧製剤中の従来の保存剤の量を減少させること又は化粧製品を微生物学的に安定な状態に保つ新規で穏やかな方法を探すことへの関心をもたらしめた。したがって、一般的に安全であると認識されている成分による保存増強などのコンセプトが一層重要になっている。

【0003】

そのため、特定の細菌に対して高度に特異的且つ有効であり、そのため、皮膚科学的に十分に認められる化粧品の製造を可能にしながら穏やかな保存を与え、皮膚マイクロバイオームのバランスをとる有効成分の相乗的な組み合わせを見出すことが引き続き必要とされている。

【0004】

エリトルロースは、セルフタンニング化粧品中でジヒドロキシアセトン (DHA) と組み合わせで使用されることが多い、広く認められている化粧成分である。

【0005】

フィタントリオール又は 3, 7, 11, 15 - テトラメチル - 1, 2, 3 - ヘキサデカントリオール (CAS 番号 74563 - 64 - 7) は、公知の化合物である。それは、化粧組成物中において、特にファルネソール及び少なくとも 1 種の他の活性作用物質と組み合わせで使用され、目に見える又は触知できる皮膚の不連続性を制御してきた (特許文献 1)。それは、汚染物質の皮膚への浸透を制限し、汚染物質の有害作用に対して保護することが可能な作用物質として (特許文献 2) にも記載されている。

[先行技術文献]

[特許文献]

【0006】

[特許文献 1] 国際公開第 2000 / 062745 号パンフレット

[特許文献 2] 欧州特許出願公開第 A - 1161938 号明細書

[非特許文献]

【0007】

[非特許文献 1] Roempp Lexikon Chemie, 10th edition 1997, Georg Thieme Verlag Stuttgart, New York

[非特許文献 2] A. Domsch, "Cosmetic Compositions", Verlag fuer chemische Industrie (ed. H. Ziolkowsky), 4th edition, 1992

[非特許文献 3] the International Cosmetic Ingredient Dictionary & Handbook

[非特許文献 4] "Handbook of Water soluble gums and resins" by Robert L. Davidson (Mc Graw Hill Book Company (1980))

【0008】

驚くべきことに、ここで、フィタントリオールとエリトルロースとの組み合わせが大腸

10

20

30

40

50

菌 (*Escherichia coli* (*E. coli*)) の増殖を相乗的に減少させ、化粧製剤及び／又は医薬製剤をこれらの細菌による汚染から保護するために使用され得ることが見出された。その選択性により、組み合わせは、皮膚の大腸菌 (*E. coli*) 過多の処理 (treatment) を必要とする人の皮膚恒常性及び／又は皮膚マイクロバイオームバランスを維持するためにさらに使用され得る。

【0009】

そのため、第1の実施形態において、本発明は、フィタントリオール及びエリトルロースを含む局所組成物に関する。

【0010】

本発明における用語「フィタントリオール」は、フィタントリオール、3, 7, 11, 15 - テトラメチル - ヘキサデカン - 1, 2, 3 - トリオール又は3, 7, 11, 15 - テトラメチル - 1, 2, 3 - ヘキサデカントリオール (CAS 番号 74563 - 64 - 7、EC / リスト番号: 277 - 923 - 2) を指す。フィタントリオールは、市販されている。

10

【0011】

本発明における用語「エリトルロース」は、D 形態若しくは L 形態の又はラセミ体としてのエリトルロースを指す。好ましくは、L (+) エリトルロース、すなわち 2 - ブタノン, 1, 3, 4 - トリヒドロキシ -, (3S) - [CAS 番号 533 - 50 - 6]、EC / リスト番号: 610 - 990 - 1 が使用される。エリトルロースは、例えば、DSM Nutritional Products Ltd, Kaiseraugst で市販されている。

20

【0012】

特定の有利な実施形態において、本発明は、大腸菌 (*E. coli*) に対して保存された局所組成物に関する。

【0013】

本発明のさらなる実施形態において、局所組成物は、好ましくは、組成物の総重量に基づいて約 0.01 ~ 2.9 重量% の範囲、より好ましくは約 0.01 ~ 2.5 重量% の範囲、最も好ましくは 0.05 ~ 2.0 重量% の範囲又はさらにより好ましくは 0.05 ~ 1.5 重量% の範囲で選択される量でフィタントリオールを含む。

【0014】

本発明のさらなる実施形態において、局所組成物は、好ましくは、組成物の総重量に基づいて約 0.005 ~ 2 重量% の範囲、より好ましくは約 0.01 ~ 1 重量% の範囲、最も好ましくは 0.025 ~ 0.5 重量% の範囲で選択される量でエリトルロースを含む。

30

【0015】

好ましくは、本発明の全ての実施形態において、フィタントリオールとエリトルロースとの比 (w/w) は、約 40 : 1 ~ 0.1 : 1 の範囲、より有利には約 15 : 1 ~ 0.5 : 1 の範囲、さらにより有利には約 10 : 1 ~ 0.5 : 1 の範囲で選択される。

【0016】

局所組成物の総重量に基づいて、0.05 ~ 0.2 重量% の範囲で選択される量のエリトルロースと、0.1 ~ 2 重量% の範囲で選択される量のフィタントリオールとを含む局所組成物が特に好ましい。

40

【0017】

フィタントリオールとエリトルロースとの組み合わせの保存増強活性を利用するために、それは、例えば、化粧組成物若しくは医薬組成物、医薬製品又は家庭用品などの複数の製剤又は用途に使用され得る。

【0018】

特に、フィタントリオール及びエリトルロースを含む局所組成物は、化粧組成物又は医薬組成物、好ましくは化粧 (非治療的 (non-therapeutic)) 組成物である。

【0019】

50

本発明の全ての実施形態において、用途は、好ましくは、皮膚恒常性の維持のため、又は大腸菌（*E. coli*）による汚染に対する局所組成物自体の保存のためなど、化粧的（非治療的（*non-therapeutic*））なものである。

【0020】

一実施形態において、本発明によるフィタントリオール及びエリトルロースを含む局所組成物は、特にヒトの皮膚又はヒトの頭皮及び毛髪など、哺乳類の角質組織に適用される。

【0021】

本願で使用される用語「化粧組成物」は、（非特許文献1）の「*Kosmetika*」の見出しで定義されている化粧組成物及び（非特許文献2）に開示されている化粧組成物を指す。

【0022】

一実施形態において、フィタントリオール及びエリトルロースを含む局所組成物は、O/Wエマルション、W/Oエマルション、ゲル、シャンプー調製物又はヘアコンディショナーである。

【0023】

O/Wエマルション、W/Oエマルション、ゲル、シャンプー調製物又はヘアコンディショナーの説明は、以下に与えられる。

【0024】

別の実施形態において、本発明は、保存増強剤（*preservation booster*）としてのフィタントリオール及び／又はエリトルロースの使用に関する。

【0025】

用語「保存増強剤」は、保存を考慮して相乗的且つ／又は有効性増強性性能を有する1種以上の成分に関する。この作用のため、より低量の従来の保存剤又は他の保存増強剤を使用でき、さらにいくつかの望ましくない保存剤を避けることができる。

【0026】

さらなる実施形態において、本発明は、健康な皮膚恒常性を維持するため、且つ／又は皮膚マイクロバイオーームバランスを維持するための、フィタントリオール及びエリトルロースを含む局所組成物の使用に関する。

【0027】

選択的な細菌に対する穏やかであるが効果的な保存のため、局所組成物は、大腸菌（*E. coli*）過多に対する処理（*treatment*）を必要とする人の皮膚恒常性及び皮膚マイクロバイオーームバランスを維持するのに特に好適である。

【0028】

別の実施形態において、本発明は、特に大腸菌（*E. coli*）に対する抗微生物剤としての、フィタントリオールとエリトルロースとの組み合わせの使用に関する。

【0029】

本明細書での用語「抗菌活性」（又は「抗微生物作用」）は、特に大腸菌（*Escherichia coli*）（大腸菌（*Escherichia coli*）ATCC 8739）などの病原性細菌又は望まれない細菌を死滅させ、且つ／又はその増殖を阻害する能力を意味する。適用される測定方法は、NF EN ISO 11930である。

【0030】

本発明による方法及び使用における抗菌活性は、好ましくは、非医療用、すなわち化粧用途でそれぞれインビトロ、エクスピボで実施されることが十分に理解される。

【0031】

特に大腸菌（*E. coli*）など、一過性であり且つ多くの場合に病原性である細菌に対する抗菌活性のため、フィタントリオールとエリトルロースとの組み合わせは、大腸菌（*E. coli*）過多に関連する不利な皮膚状態の処理（*treatment*）にさらに好適である。他方では、組み合わせの選択性は、皮膚恒常性及び／又は皮膚マイクロバイオーームのバランスが維持されることを可能にする。

【0032】

10

20

30

40

50

さらなる実施形態において、本発明は、病原性細菌、特に大腸菌（*E. coli*）を死滅させ、且つ／又は阻害する方法であって、前記病原性細菌、特に大腸菌（*E. coli*）をフィタントリオールとエリトルコースとの組み合わせと接触させることを含む方法に関する。

【0033】

さらなる実施形態において、本発明は、皮膚及び／又は頭皮を処理する（*treating*）方法であって、皮膚及び／又は頭皮を、本明細書に与えられる実施形態のいずれか1つによるフィタントリオール及びエリトルコースを含む局所組成物と接触させる工程を含む方法に関する。

【0034】

さらなる実施形態において、本発明は、皮膚及び／又は頭皮を処理する（*treating*）方法であって、健康な皮膚恒常性を維持するため、且つ／又は皮膚マイクロバイームバランスを維持するため、皮膚及び／又は頭皮を、本発明のフィタントリオール及びエリトルコースを含む局所組成物と接触させる工程を含む方法に関する。

【0035】

本発明による化粧組成物又は医薬組成物は、好ましくは、生理的に許容できる媒体、すなわち皮膚、粘膜及びケラチン繊維などのケラチン性物質と適合性のある媒体をさらに含む。好ましくは、生理的に許容できる媒体は、化粧品として又は薬学的に許容できる担体である。

【0036】

用語化粧品として又は薬学的に許容できる担体は、化粧組成物に従来使用されている全ての担体、及び／又は賦形剤、及び／又は希釈剤を指す。

【0037】

本発明による局所組成物は、一般に、本明細書に示される量のフィタントリオール及びエリトルコースを好適な担体と混合することによって調製される。

【0038】

担体の正確な量は、フィタントリオール及びエリトルコース、並びに当業者であれば担体と別であると分類するであろう他の任意選択の成分（例えば、他の有効成分）の実際のレベルに依存するであろう。

【0039】

有利な実施形態において、本発明による化粧組成物又は医薬組成物は、化粧組成物の総重量に基づいて、特に約80%～約95%の担体など、約50%～約99%、好ましくは約60%～約98%、より好ましくは約70%～約98%の担体を含む。

【0040】

特定の有利な実施形態において、担体は、特に約55～約90重量%の水など、少なくとも40重量%、より好ましくは少なくとも50重量%、最も好ましくは少なくとも55重量%の水からさらになる。

【0041】

本発明の組成物（担体を含む）は、保存剤／酸化防止剤、脂肪性物質／油、有機溶媒、シリコーン、増粘剤、柔軟剤、乳化剤、消泡剤、香料などの感覚的成分、界面活性剤、充填剤、アニオン性、カチオン性、非イオン性若しくは両性ポリマー又はそれらの混合物、噴射剤、酸性化剤又は塩基性化剤、染料、色素／着色剤、研磨剤、吸収剤、キレート剤及び／又は金属封鎖剤、精油、皮膚知覚剤、アストリンゼント、顔料或いはそのような組成物に通常製剤される他の成分など、従来の補助剤及び添加剤を含み得る。

【0042】

本発明によると、本発明による組成物は、化粧組成物又は医薬組成物に従来使用されている化粧品としての有効成分もさらに含み得る。例示的な有効成分は、UVフィルター、炎症の予防又は減少のための薬剤、引き締め、保湿、鎮静及び／又は活性化薬剤、並びに弾力性及び皮膚バリアを改善する薬剤を包含する。

【0043】

10

20

30

40

50

本発明の化粧組成物での使用に好適である、スキンケア産業で通常使用される化粧品賦形剤、希釈剤、補助剤、添加剤及び有効成分の例は、例えば、非限定的に、オンライン INFO BASE (<http://online.personalcarecouncil.org/jjsp/Home.jsp>) によりアクセス可能である、米国パーソナルケア製品協議会 (Personal Care Product Council) (<http://www.personalcarecouncil.org/>) による (非特許文献 3) に記載されている。

【0044】

有効成分及び賦形剤、希釈剤、補助剤、添加剤などの必要な量は、所望の製品形態及び用途に基づいて当業者により容易に決定され得る。追加の成分は、適切であると思われる通り、油相に、水相に又は別々に加えられ得る。

10

【0045】

本明細書で有用な化粧品としての有効成分は、場合により、2つ以上の利益を与えるか、又は2つ以上の作用様式によって機能することができる。

【0046】

当然のことながら、当業者は、本発明による組み合わせに本質的に関連する有利な性質が、想定される追加物又は複数の追加物によって有害に影響されないか又は実質的に有害に影響されないように、上述の任意選択の追加成分、補助剤、希釈剤及び添加剤並びに/又はそれらの量を選択するように配慮するであろう。

20

【0047】

好ましくは、本発明による化粧組成物又は医薬組成物は、溶媒又は脂肪性物質中の懸濁液又は分散液の形態であるか、或いは代替的にエマルジョン若しくはマイクロエマルジョン (特に O/W - 又は W/O - タイプのもの)、PIT - エマルジョン、ナノエマルジョン、多重エマルジョン (例えば、O/W/O - 又は W/O/W - タイプ)、ピッカリングエマルジョン、ハイドロゲル、リボゲル、単相若しくは多相溶液又はベシクル分散液の形態である。

【0048】

本発明による化粧組成物又は医薬組成物は、液剤、ローション、濃厚ローション、ゲル、クリーム、ミルク、軟膏又はペースト剤の形態であり得る。

【0049】

30

本発明による化粧組成物又は医薬組成物は、3 ~ 10 の範囲、好ましくは pH 3 ~ 8 の範囲、最も好ましくは pH 3 ~ 7.5 の範囲の pH を有する。pH は、当業者に公知の方法、例えばグリコール酸、乳酸、リンゴ酸、クエン酸及び酒石酸を含むヒドロキシ酸などの酸、又は例えば水酸化ナトリウム、若しくは水酸化カリウム、若しくは水酸化アンモニウム、若しくはトリエタノールアミン、若しくはトロメタミンなどのアミン並びにこれらの混合物などの塩基を使用することによって調整される。

【0050】

好ましくは、本発明による組成物は、例えば、0.01 ~ 1 重量% の量などの少なくとも 0.0001 重量% の量のクエン酸を含み、特に pH 調整のために 0.01 ~ 0.5 重量% の量が使用される。

40

【0051】

本発明による化粧組成物は、有利には、さらなる保存剤又は保存増強剤を含む。好ましくは、追加の保存剤又は保存増強剤は、フェノキシエタノール、エチルヘキシルグリセリン、ヒドロキシアセトフェノン、カプリル酸グリセリル、カプリリルグリコール、1,2 - ヘキサンジオール、プロパンジオール、プロピレングリコール及びそれらの混合物からなる群から選択される。存在する場合、保存剤又は保存増強剤は、好ましくは、組成物の総重量に基づいて 0.01 ~ 2 重量% の量、より好ましくは 0.05 ~ 1.5 重量% の量、最も好ましくは 0.1 ~ 1.0 重量% の量で使用される。本発明による化粧組成物は、例えば、パラベン及び/又はメチルイソチアゾリジンなどのさらなる/他の保存剤を全く含まないことが特に好ましい。

50

【 0 0 5 2 】

本発明による化粧組成物は、最も特にスキンケア又はヘアケア調製物など、特にスキンケア調製物、機能性調製物及び／又はヘアケア調製物である。

【 0 0 5 3 】

スキンケア調製物の例は、特に光保護調製物、抗加齢調製物、光老化の処理 (t r e a t m e n t) のための調製物、ボディオイル、ボディローション、ボディゲル、トリートメントクリーム、皮膚保護軟膏、保湿ゲル又は保湿スプレー、顔用及び／又は体用保湿剤などの保湿調製物並びに皮膚美白調製物である。

【 0 0 5 4 】

機能性調製物の例は、非限定的に、ホルモン調製物、ビタミン調製物、野菜抽出物調製物、抗加齢調製物、日焼け止め調製物及び／又は抗微生物性 (抗菌性又は抗真菌性) 調製物などの有効成分を含む化粧組成物である。

【 0 0 5 5 】

一実施形態において、本発明による化粧組成物は、O / Wエマルション、W / Oエマルション及び／又はシャワージェル若しくはヘアジェルなどのゲルである。

【 0 0 5 6 】

本発明によるO / Wエマルションは、有利には、(i) 組成物の総重量に基づいて約 0 . 0 1 ~ 2 . 9 重量 % の範囲、より好ましくは約 0 . 0 1 ~ 2 . 5 重量 % の範囲、最も好ましくは 0 . 0 5 ~ 2 . 0 重量 % の範囲で選択される量のフィタントリオール、(i i) 組成物の総重量に基づいて約 0 . 0 0 5 ~ 2 重量 % の範囲、より好ましくは約 0 . 0 1 ~ 1 重量 % の範囲、最も好ましくは 0 . 0 2 5 ~ 0 . 5 重量 % の範囲で選択される量のエリトルロース、(i i i) 水、並びに(i v) クエン酸ステアリン酸グリセリル (g l y c e r y l s t e a r a t c i t r a t e) 、ステアリン酸グリセリル (g l y c e r y l s t e a r a t e) (自己乳化性) 、ステアリン酸、ステアリン酸の塩、ジステアリン酸ポリグリセリル - 3 - メチルグルコース、セテアレス - 2 0 、ステアレス - 2 、ステアレス - 1 2 、ステアリン酸 P E G - 4 0 、リン酸エステル及びその塩、例えばリン酸セチル (アンフィソル (A m p h i s o l) (登録商標) A) 、セチルリン酸ジエタノールアミン (アンフィソル (登録商標) D E A) 、セチルリン酸カリウム (アンフィソル (登録商標) K) 、セテアリル硫酸ナトリウム (s o d i u m c e t e a r y l s u l f a t) 、オレイン酸グリセリルリン酸ナトリウム、水素化植物性リン酸グリセリズ、オレイン酸ソルビタン、セスキオレイン酸ソルビタン、イソステアリン酸ソルビタン、トリオレイン酸ソルビタン、ラウリルグルコシド、デシルグルコシド、ステアロイルグルタミン酸ナトリウム、ポリステアリン酸スクロース及び水添ポリイソブテン (H y d r a t e d P o l y i s o b u t e n) 並びにこれらの混合物のリストから選択される少なくとも 1 種の O / W - 又は S i / W - 乳化剤を含む。また、例えば、P V P エイコセンコポリマー、アクリレーツ / C _{10 ~ 30} アルキルアクリレートクロスポリマー、アクリレーツ / ステアレス - 2 0 メタクリレートコポリマー、P E G - 2 2 / ドデシルグリコールコポリマー、P E G - 4 5 / ドデシルグリコールコポリマー及びこれらの混合物などの 1 種以上の合成ポリマーを乳化剤として使用できる。特定の好ましい実施形態において、O / W - 乳化剤は、特にセチルリン酸カリウム (アンフィソル (登録商標) K として市販) などのリン酸セチル、ステアリン酸グリセリル (及び) ステアリン酸 P E G 1 0 0 (アラセル (A r l a c e l) (登録商標) 1 6 5 として市販) 及び／又は特にラウレス - 3 5 (3 5 の E O 単位を有するラウリルアルコール ; ブリジ (B r i j) (登録商標) 3 5 として市販) などのポリアルキレングリコールエーテルの群から選択される。少なくとも 1 種の O / W 乳化剤は、好ましくは、組成物の総重量に対して約 0 . 0 0 1 ~ 1 0 重量 % の量、より好ましくは 0 . 1 ~ 7 重量 % の量で使用される。さらに、O / Wエマルションの形態の化粧組成物は、有利には、非限定的に、セチルアルコール (ロロール (L o r o l) C 1 6 、ラネッテ (L a n e t t e) 1 6) セテアリルアルコール (ラネッテ (登録商標) O) 、ステアリルアルコール (ラネッテ (登録商標) 1 8) 、ベヘニルアルコール (ラネッテ (登録商標) 2 2) 、ステアリン酸グリセリル、ミリスチン酸グリセリル (エストール (E s t o

10

20

30

40

50

1) (登録商標) 3650)、水素化ココグリセリド(リポシア(Lipocire) Na10)などのアルキルアルコール及びこれらの混合物のリストから選択される少なくとも1種の共乳化剤を含む。

【0057】

本発明によるW/Oエマルションは、有利には、(i)組成物の総重量に基づいて約0.01~2.9重量%の範囲、より好ましくは約0.01~2.5重量%の範囲、最も好ましくは0.05~2.0重量%の範囲で選択される量のフィタントリオール、(ii)組成物の総重量に基づいて約0.005~2重量%の範囲、より好ましくは約0.01~1重量%の範囲、最も好ましくは0.025~0.5重量%の範囲で選択される量のエリトルコース、(iii)水、並びに(iv)ジポリヒドロキシステアリン酸(dipolyhydroxystearate)ポリグリセリル-2、ジポリヒドロキシステアリン酸PEG-30、セチルジメチコンコポリオール、ジイソステアリン酸ポリグリセリル-3、オレイン酸/イソステアリン酸のポリグリセロールエステル、ヘキサリシノール酸(hexaricinolate)ポリグリセリル-6、オレイン酸ポリグリセリル-4、オレイン酸ポリグリセリル(polyglyceryl)-4/ヤシ油脂肪酸PEG-8プロピレングリコール、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸ナトリウム、ラウリン酸カリウム、リシノール酸カリウム、ヤシ脂肪酸ナトリウム、牛脂脂肪酸ナトリウム、ヒマシ油脂肪酸カリウム、オレイン酸ナトリウム及びこれらの混合物のリストから選択される少なくとも1種のW/O-又はW/Si-乳化剤を含む。さらなる好適なW/Si-乳化剤は、ラウリルポリグリセリル-3ポリジメチルシロキシエチルジメチコン及び/又はPEG-9ポリジメチルシロキシエチルジメチコン及び/又はセチルPEG/PPG-10/1ジメチコン及び/又はPEG-12ジメチコンクロスポリマー及び/又はPEG/PPG-18/18ジメチコンである。少なくとも1種のW/O乳化剤は、好ましくは、組成物の総重量に対して約0.001~10重量%の量、より好ましくは0.2~7重量%の量で使用される。

【0058】

本発明によるゲル調製物は、有利には、(i)組成物の総重量に基づいて約0.01~2.9重量%の範囲、より好ましくは約0.01~2.5重量%の範囲、最も好ましくは0.05~2.0重量%の範囲で選択される量のフィタントリオール、(ii)組成物の総重量に基づいて約0.005~2重量%の範囲、より好ましくは約0.01~1重量%の範囲、最も好ましくは0.025~0.5重量%の範囲で選択される量のエリトルコース、(iii)水、及び(iv)少なくとも1種の水溶性増粘剤を含む。そのような水溶性増粘剤は、当業者に周知であり、例えば(非特許文献4)に列記されている。特に好適な水溶性増粘剤は、ポリアクリル酸(例えば、商標カルボマー(Carbomer)又はカーボポール(Carbopol)(登録商標)で市販されている)、2-アクリルアミド-2-メチルプロパンスルホン酸のホモポリマー(例えば、Rheothik(登録商標)11-80として市販されている)、アクリレートコポリマー(例えば、商標ペムレン(Pemulen)(登録商標)又はアキュリン(Aculyn)(登録商標)33で市販されている)、分岐鎖のポリ(メタクリロイルオキシエチルトリメチルアンモニウムクロリド)(INCI名ポリクオタニウム-37)、未修飾グアーガム(例えば、商標ジャガー(Jaguar)で市販されている)、スターチ若しくはその誘導体及び/又はヒドロキシアルキルセルコース(hydroxyalkylcellulosen)からなる群から選択される。好ましくは、水溶性増粘剤は、組成物の総重量に基づいて約0.001~10重量%の量、より好ましくは0.2~7重量%の量で使用される。

【0059】

本発明によって好適であり、言及され得るヘアケア調製物の例は、シャンプー、ヘアコンディショナー(ヘアリンスとも称される)、理髪組成物、ヘアトニック、毛髪再生組成物、ヘアローション、ウォーターウェーブローション、ヘアスプレー、ヘアクリーム、ヘアジェル、ヘアオイル、ヘアボマード又はヘアブリリアンティンである。したがって、使用される実際の目的に応じて短時間又は長時間、毛髪及び頭皮に適用される調製物が常に

10

20

30

40

50

ある。

【 0 0 6 0 】

本発明によるヘアケア調製物がシャンプーとして供給される場合、これらは、透明な液体、不透明な液体（真珠光沢効果あり）、クリーム形態、ゲル状又は他に粉末形態若しくはタブレット形態及びエアゾールであり得る。これらのシャンプーの主成分である界面活性剤原材料は、本質的に、アニオン性、カチオン性、非イオン性及び両性であり得、これらの物質の組み合わせでも存在し得る。

【 0 0 6 1 】

本発明によるシャンプー調製物に組み込むのに好適なアニオン性界面活性剤の例は、 $C_{10} \sim C_{20}$ アルキル - 及びアルキレンカルボキシレート、アルキルエーテルカルボキシレート、脂肪族アルコールサルフェート、脂肪族アルコールエーテルサルフェート、アルキロールアミドサルフェート及びスルホネート、脂肪酸アルキロールアミドポリグリコールエーテルサルフェート、アルカンスルホネート及びヒドロキシアルカンスルホネート、オレフィンスルホネート、イソチオネートのアシルエステル、アルファ - スルホ脂肪酸エステル、アルキルベンゼンスルホネート、アルキルフェノールグリコールエーテルスルホネート、スルホスクシネート、スルホコハク酸モノエステル及びジエステル、脂肪族アルコールエーテルホスフェート、タンパク質 - 脂肪酸縮合生成物、アルキルモノグリセリドサルフェート及びスルホネート、アルキルグリセリドエーテルスルホネート、脂肪酸メチルタウリド、脂肪酸サルコシネート及びスルホリシノレートである。これらの化合物及びその混合物は、例えば、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、アンモニウム、モノ -、ジ - 及びトリエタノールアンモニウム並びに類似のアルキルアンモニウム (alkyl ammonium) 塩など、水に可溶性又は水に分散性である塩の形態で使用される。

【 0 0 6 2 】

好適なカチオン性界面活性剤の例は、ジ ($C_{10} \sim C_{24}$ アルキル) ジメチルアンモニウムクロリド又はブロミド、好ましくはジ ($C_{12} \sim C_{18}$ アルキル) - ジメチルアンモニウムクロリド又はブロミド； $C_{10} \sim C_{24}$ - アルキルジメチルエチルアンモニウムクロリド又はブロミド； $C_{10} \sim C_{24}$ - アルキルトリメチルアンモニウムクロリド又はブロミド、好ましくはセチルトリメチルアンモニウムクロリド又はブロミド及び $C_{20} \sim C_{24}$ - アルキルトリメチルアンモニウムクロリド又はブロミド； $C_{10} \sim C_{24}$ - アルキルジメチルベンジルアンモニウムクロリド又はブロミド、好ましくは $C_{12} \sim C_{18}$ - アルキルジメチルベンジルアンモニウムクロリド；N - ($C_{12} \sim C_{18}$ - アルキル) ピリジニウムクロリド又はブロミド、好ましくは N - ($C_{12} \sim C_{16}$ - アルキル) ピリジニウムクロリド又はブロミド；N - ($C_{12} \sim C_{18}$ - アルキル) イソキノリニウムクロリド、ブロミド又はモノアルキルサルフェート；N - ($C_{12} \sim C_{18}$ - アルキル) コラミノホルミルメチル (alkyl oyl col amino formyl methyl)) ピリジニウムクロリド；N - ($C_{12} \sim C_{18}$ - アルキル) - N - メチルモルホリニウムクロリド、ブロミド又はモノアルキルサルフェート；N - ($C_{12} \sim C_{18}$ - アルキル) - N - エチルモルホリニウムクロリド、ブロミド又はモノアルキルサルフェート； $C_{16} \sim C_{18}$ - アルキルペンタオクスエチルアンモニウム (alkyl penta ox ethyl ammonium) クロリド；イソブチルフェノキシエチルジメチルベンジルアンモニウムクロリド；N, N - ジエチルアミノエチルステアリルアミド及びオレイルアミドと、塩化水素酸、酢酸、乳酸、クエン酸、リン酸との塩；N - アシルアミドエチル - N, N - ジエチル - N - メチルアンモニウムクロリド、ブロミド又はモノアルキルサルフェート及び N - アシルアミノエチル - N, N - ジエチル - N - ベンジルアンモニウムクロリド、ブロミド又はモノアルキルサルフェート（ここで、アシルは、好ましくは、ステアリル又はオレイルである）などの四級アンモニウム塩である。

【 0 0 6 3 】

洗剤物質として使用できる好適な非イオン性界面活性剤の例は、脂肪族アルコールエトキシレート（アルキルポリエチレングリコール）；アルキルフェノールポリエチレングリコール；アルキルメルカプタンポリエチレングリコール；脂肪族アミンエトキシレート（

アルキルアミノポリエチレングリコール)；脂肪酸エトキシレート(アシルポリエチレングリコール)；ポリプロピレングリコールエトキシレート(プルロニック(P l u r o n i c))；脂肪酸アルキロールアミド(脂肪酸アミドポリエチレングリコール)；スクロースエステル；ソルビトールエステル及びポリグリコールエーテルである。

【0064】

シャンプーに加えることができる両性界面活性剤の例は、アルカリ金属塩並びにモノ - 、ジ - 及びトリアルキルアンモニウム塩としての N - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) - - アミノプロピオネート及び N - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) - - イミノジプロピオネート；N - アシルアミドアルキル - N , N - ジメチルアセトベタイン、好ましくは N - (C₈ ~ C₁₈ - アシル)アミドプロピル - N , N - ジメチルアセトベタイン；C₁₂ ~ C₁₈ - アルキルジメチルスルホプロピルベタイン；イミダゾリンに基づく両性界面活性剤(商品名：M i r a n o l (登録商標)、S t e i n a p o n (登録商標))、好ましくは 1 - (- カルボキシメチルオキシエチル) - 1 - (カルボキシメチル) - 2 - ラウリルイミダゾリニウムのナトリウム塩；アミンオキシド、例えば C₁₂ ~ C₁₈ - アルキルジメチルアミンオキシド、脂肪酸アミドアルキルジメチルアミンオキシドである。

【0065】

本発明によるヘアケア調製物は、ヘアケアに慣例であるさらなる添加剤、例えば香料、着色剤、また髪を同時に染めるか又は色合いを付けるもの、溶媒、乳白剤及び真珠光沢剤、例えば脂肪酸とポリオールとのエステル、脂肪酸のマグネシウム塩及び亜鉛塩、コポリマーを主成分とする分散液、増粘剤、例えば塩化ナトリウム、塩化カリウム及び塩化アンモニウム、硫酸ナトリウム、脂肪酸アルキロールアミド、セルロース誘導体、天然ゴム、また植物抽出物など、ゼラチン、コラーゲン加水分解物、天然又は合成の主成分を有するポリペプチド、卵黄、レシチン、ラノリン及びラノリン誘導体などのタンパク質誘導体、脂肪、油、脂肪族アルコール、シリコーン、脱臭剤、抗菌活性を有する物質、抗脂漏活性を有する物質、角質溶解作用及び角質軟化作用を有する物質、例えば硫黄、サリチル酸及び酵素など、並びにオラミン、クリンバゾール、ジンクピリチオン(z i n k p y r i t h i o n)、ケトコナゾール、サリチル酸、硫黄、タール調製物などのさらなるフケ防止剤、ウンデセン酸(u n d e c e n i c a c i d)の誘導体、イラクサ(n e t t e l)、ローズマリー(r o s m a r y)、ハコヤナギ、カンバ、クルミ、ヤナギ樹皮及び/又はアルニカの抽出物などをさらに含み得る。

【0066】

シャンプーは、個々の成分を混合し、必要に応じて、調製物の特定の種類に適切なさらなる処理によりそれ自体公知の方法で製造される。

【0067】

フィタントリオールとエリトルロスとの組み合わせが本発明に従って使用でき、言及され得るヘアケア調製物の例は、ヘアコンディショナー、ヘアトニック及び毛髪再生組成物であり、それは、特定の時間後に髪からすすがれるか、又は製剤によっては髪に残され得る。

【0068】

これらの調製物の全ては、フィタントリオールとエリトルロスとの組み合わせを加えて、それ自体公知の方法でシャンプーに関して既に言及された通りにも製造される。

【0069】

本発明による特定の好適なヘアケア調製物は、(i) 組成物の総重量に基づいて約 0 . 0 1 ~ 2 . 9 重量%の範囲、より好ましくは約 0 . 0 1 ~ 2 . 5 重量%の範囲、最も好ましくは 0 . 0 5 ~ 2 . 0 重量%の範囲で選択される量のフィタントリオール、(i i) 組成物の総重量に基づいて約 0 . 0 0 5 ~ 2 重量%の範囲、より好ましくは約 0 . 0 1 ~ 1 重量%の範囲、最も好ましくは 0 . 0 2 5 ~ 0 . 5 重量%の範囲で選択される量のエリトルロス、(i i i) 水、及び(v i) 少なくとも 1 種のアニオン性界面活性剤を含むシャンプー調製物である。好ましくは、アニオン性界面活性剤は、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸アンモニウム、ラウリルエーテル硫酸ナトリウム、ラウリルエーテル硫酸

アンモニウム、ラウロイルサルコシン (sarcosinate) ナトリウム、オレイルコハク酸ナトリウム、スルホコハク酸ラウリルアンモニウム、ドデシルベンゼン (dodecylbenzyl) スルホン酸ナトリウム及び/若しくはドデシルベンゼンスルホン酸トリエタノールアミン又はこれらの混合物、特にラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸アンモニウム、ラウリルエーテル硫酸ナトリウム及び/又はラウリルエーテル硫酸アンモニウムなどからなる群から選択される。本発明による組成物中のアニオン性界面活性剤の総量は、組成物の総重量に基づいて 0.5 ~ 45 重量%、好ましくは 1.5 ~ 35 重量%、より好ましくは 7 ~ 25 重量%、特に 7 ~ 15 重量%である。

【0070】

本発明による特定の好適なヘアコンディショナーは、リンスオフ又はリーブオンコンディショナー、好ましくはリンスオフコンディショナーであり得る。本発明による特定の有利なヘアコンディショナーは、(i) 組成物の総重量に基づいて約 0.01 ~ 2.9 重量%の範囲、より好ましくは約 0.01 ~ 2.5 重量%の範囲、最も好ましくは 0.05 ~ 2.0 重量%の範囲で選択される量のフィタントリオール、(ii) 組成物の総重量に基づいて約 0.005 ~ 2 重量%の範囲、より好ましくは約 0.01 ~ 1 重量%の範囲、最も好ましくは 0.025 ~ 0.5 重量%の範囲で選択される量のエリトルコース、(iii) 水、及び(iv) 例えば、非限定的に、シリコンオイル、四級ポリマー、天然由来のコンディショニング剤などの少なくとも1種のコンディショニング剤を含む。

【0071】

四級ポリマーは、好ましくは、例えばポリクオタニウム-6 (例えば、商品名 TILAMAR (登録商標) Quat 640 又は 641 で商品化されている)、ポリクオタニウム-22 (例えば、商品名 TILAMAR (登録商標) Quat 2240 又は 2241 で商品化されている)、ポリクオタニウム-7 (例えば、商品名 TILAMAR (登録商標) Quat 710、711 又は 712 で商品化されている) などから選択される。天然由来のコンディショニング剤は、好ましくは、例えばグアーヒドロキシプロピルトリモニウムクロリド (例えば、商品名 ジャガー C-17、ジャガー C-1000、ジャガー C-13S で商品化されている) などの糖系のポリマーから選択されるが、これらに限定されない。原則的に、あらゆるシリコンオイルがヘアコンディショナーにおける使用に好適である。しかし、シリコンオイルは、好ましくは、ジメチコン、ジメチコノール、ポリジメチルシロキサン、アリアル化されたシリコン、環状シリコン、シリコン界面活性剤及びアミノ化されたシリコンから選択され、揮発性又は非揮発性であり得る。特定の好適なシリコンオイルは、Dow Corning などの種々の供給業者から利用可能なジメチコン、ジメチコノール、ポリジメチルシロキサンである。ヘアコンディショナー中の少なくとも1種のシリコンオイルの総量は、好ましくは、組成物の総重量に基づいて 0.01 ~ 10 重量%、好ましくは 0.02 ~ 7.5 重量%、より好ましくは 0.05 ~ 5 重量%、最も好ましくは 0.1 ~ 3 重量%の範囲で選択される。

【0072】

以下の実施例は、本発明の組成物及び効果をさらに説明するために与えられる。これらの実施例は、説明のために過ぎず、本発明の範囲を決して限定しないものとする。

【0073】

[実施例]

抗微生物有効性は、規制による曝露試験方法 (NF EN ISO 11930) と同様に評価する。そのため、それぞれの活性物質のエタノール溶液を調製し、滅菌条件下において、0.85 重量% NaCl を含む生理学的血清に、表 1 に概説された濃度でさらに溶解させる。フィタントリオールを含む試料を、10 重量% エタノールを補った生理学的血清に可溶化させ、エリトルコースのみを含む試料を、1 重量% エタノールを補った生理学的血清に可溶化させた。

【0074】

活性物質の溶液を 96 - ディープウェルプレート (1.6 ml / ウェル) に置いた。ウェルを $1.5 \times 10^5 \sim 1 \times 10^6$ cfu/ml の大腸菌 (Escherichia co

10

20

30

40

50

1 i) により汚染させ、表 1 に概説した初期の汚染を得た。汚染後、各ウェルを完全に混合して、大腸菌 (E . c o l i) の均質な分布を確実にした。次いで、各プレートを 2 2 で 2 4 時間インキュベートした。(残存) 集団の計数を汚染後 2 4 時間で実施する。

【 0 0 7 5 】

【表 1】

表1: 結果

試験溶液	時間 [h]	大腸菌(Escherichia coli) コロニー数[cfu/ml]	対数減少値
0.2 wt.-% フィタントリオール	0	580000	
	24	1000	-2.763
0.2 wt.-% エリトルロース	0	580000	
	24	33700	-1.236
0.1 wt.-% フィタントリオール	0	580000	
	24	0	-5.763
0.1 wt.-% エリトルロース	0	580000	
	24	0	-5.763

10

【 0 0 7 6 】

20

上記表からわかるように、フィタントリオールとエリトルロースとの組み合わせは、大腸菌 (E . c o l i) に対して相乗効果を示し、化粧製剤 (クリーム、ゲル、ローション、シャンプー、コンディショナーなど) の保存増強剤として、且つ皮膚上の大腸菌 (E . c o l i) の集団の平衡を保つために使用され得る。

さらなる実施形態は以下のとおりである。

〔実施形態 1〕

フィタントリオール及びエリトルロースを含む局所組成物。

〔実施形態 2〕

フィタントリオールの量は、前記組成物の総重量に基づいて約 0 . 0 1 ~ 2 . 9 重量 % の範囲、より好ましくは約 0 . 0 1 ~ 2 . 5 重量 % の範囲、最も好ましくは 0 . 0 5 ~ 2 . 0 重量 % の範囲で選択される量である、実施形態 1 に記載の局所組成物。

30

〔実施形態 3〕

エリトルロースの量は、前記組成物の総重量に基づいて約 0 . 0 0 5 ~ 2 重量 % の範囲、より好ましくは約 0 . 0 1 ~ 1 重量 % の範囲、最も好ましくは 0 . 0 2 5 ~ 0 . 5 重量 % の範囲で選択される量である、実施形態 1 に記載の局所組成物。

〔実施形態 4〕

前記局所組成物の総重量に基づいて、エリトルロースの量は、0 . 0 5 ~ 0 . 2 重量 % の範囲で選択され、フィタントリオールの量は、0 . 1 ~ 2 重量 % の範囲で選択される、実施形態 1 に記載の局所組成物。

〔実施形態 5〕

化粧組成物又は医薬組成物である、実施形態 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の局所組成物。

40

〔実施形態 6〕

O / W エマルジョン、W / O エマルジョン、ゲル、シャンプー調製物又はヘアコンディショナーである、実施形態 5 に記載の局所組成物。

〔実施形態 7〕

健康な皮膚恒常性を維持するため、且つ / 又は皮膚マイクロバイオーームバランスを維持するための、実施形態 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の局所組成物の使用。

〔実施形態 8〕

保存増強剤としての、フィタントリオールとエリトルロースとの組み合わせの使用。

〔実施形態 9〕

50

好ましくは大腸菌（E．coli）に対する抗微生物剤としての、フィタントリオールとエリトルコースとの組み合わせの使用。

〔実施形態 1 0〕

皮膚及び／又は頭皮を治療する方法であって、前記皮膚及び／又は頭皮を実施形態 1 ～ 5 のいずれか 1 つに記載の局所組成物と接触させる工程を含む方法。

〔実施形態 1 1〕

健康な皮膚恒常性を維持するため、且つ／又は皮膚マイクロバイオーームバランスを維持するための、実施形態 1 0 に記載の方法。

〔実施形態 1 2〕

前記健康な皮膚恒常性及び／又は皮膚マイクロバイオーームバランスは、それを必要とする人の皮膚上の大腸菌（E．coli）の集団を減少させることによって維持される、実施形態 1 1 に記載の方法。

10

〔実施形態 1 3〕

大腸菌（E．coli）を死滅させ、且つ／又は阻害する方法であって、大腸菌（E．coli）をフィタントリオールとエリトルコースとの組み合わせと接触させることを含む方法。

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

A 6 1 K	9/06 (2006.01)	A 6 1 K	9/06	
A 6 1 K	9/107(2006.01)	A 6 1 K	9/107	
A 6 1 P	31/04 (2006.01)	A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	43/00 (2006.01)	A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 Q	19/00 (2006.01)	A 6 1 Q	19/00	

(72)発明者 クリスティーネ メンドロック - エディンガー

スイス, 4303 カイザーアウークシュト, ヴルミスヴェーク 576, ケアオブ ディーエ
スエム ニュートリショナル プロダクツ リミテッド, パテント ディパートメント

審査官 石井 裕美子

(56)参考文献

米国特許出願公開第2012/0128602(US, A1)

米国特許出願公開第2005/0131077(US, A1)

特表2012-500195(JP, A)

(58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)

A 6 1 K 31/7004

A 6 1 K 31/047

A 6 1 K 8/06

A 6 1 K 8/34

A 6 1 K 8/35

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/107

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00

A 6 1 Q 19/00

JSTPlus/JMEDPlus/JST7580(JDreamIII)

Caplus/REGISTRY/MEDLINE/EMBASE/BIOSIS(ST
N)