

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2015-515500**(P2015-515500A)**(43) 公表日 **平成27年5月28日 (2015.5.28)**

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 8/89 (2006.01)	A 6 1 K 8/89	4 C 0 8 3
A 6 1 K 8/06 (2006.01)	A 6 1 K 8/06	
A 6 1 Q 19/00 (2006.01)	A 6 1 Q 19/00	
A 6 1 K 8/31 (2006.01)	A 6 1 K 8/31	

審査請求 有 予備審査請求 未請求 (全 23 頁)

(21) 出願番号	特願2015-510468 (P2015-510468)	(71) 出願人	590005058
(86) (22) 出願日	平成25年5月3日 (2013.5.3)		ザ プロクター アンド ギャンブル カ ンパニー
(85) 翻訳文提出日	平成26年10月30日 (2014.10.30)		アメリカ合衆国オハイオ州, シンシナティ ー, ワン プロクター アンド ギャンブ ル ブラザ (番地なし)
(86) 国際出願番号	PCT/US2013/039354		
(87) 国際公開番号	W02013/166342	(74) 代理人	110001243
(87) 国際公開日	平成25年11月7日 (2013.11.7)		特許業務法人 谷・阿部特許事務所
(31) 優先権主張番号	61/641, 897	(72) 発明者	スーリヤマニ ラウト
(32) 優先日	平成24年5月3日 (2012.5.3)		シンガポール 1 3 8 6 4 8 シンガポー ル イムノス ナンバー02-12 バイ オメディカル グローブ 8エー ピーア ンドジー インターナショナル オペレー ションズ エスエー シンガポール プラ ンチ エスジーアイシー
(33) 優先権主張国	米国 (US)		最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 水中油型エマルジョンスキンケア組成物

(57) 【要約】

組成物の約3重量%～約25重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約2重量%～約15重量%のシリコン粒子又はその混合物と、組成物の約0.1重量%～約5重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約30重量%～約90重量%の水と、を含む水中油型エマルジョンスキンケア組成物。該組成物は、閉塞性に大きな影響を与えることなく好ましい皮膚感覚をもたらす。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

水中油型エマルジョンスキンケア組成物であって、
組成物の約 3 重量%～約 25 重量%の炭化水素油又はその混合物と、
組成物の約 2 重量%～約 15 重量%のシリコン粒子又はその混合物と、
組成物の約 0.1 重量%～約 5 重量%の乳化剤又はその混合物と、
組成物の約 30 重量%～約 90 重量%の水と、
任意選択的に、更なる成分又はその混合物と、
を含む水中油型エマルジョンスキンケア組成物。

【請求項 2】

組成物の約 5 重量%～約 15 重量%の前記炭化水素油を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

組成物の約 7 重量%～約 10 重量%の前記炭化水素油を含む、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記炭化水素油が、ワセリン、鉱油、マイクロクリスタリンワックス、ポリアルケン、パラフィン、ケラシン、オゾケライト、ポリエチレン、ペルヒドロスクアレン、ポリアルファオレフィン、水素添加ポリイソブテン、及びこれらの混合物からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記炭化水素油が、ワセリンである、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

組成物の約 3 重量%～約 10 重量%の前記シリコン粒子を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

組成物の約 3 重量%～約 5 重量%の前記シリコン粒子を含む、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記シリコン粒子が、シリコン樹脂粒子、シリコンゴム粒子、及びこれらの混合物からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記乳化剤が、疎水変性架橋ポリアクリレートポリマー及びコポリマー、ポリアクリルアミドポリマー及びコポリマー、ポリアクリロイルジメチルタウレート、並びにこれらの混合物からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記更なる成分が、シリコン油であり、前記シリコン油が、約 2 重量%～約 15 重量%前記組成物中に存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

組成物の約 3 重量%～約 10 重量%の前記シリコン油を含む、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

組成物の約 3 重量%～約 5 重量%の前記シリコン油を含む、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

組成物の約 7 重量%～約 10 重量%の前記炭化水素油又はその混合物と、
組成物の約 3 重量%～約 5 重量%の前記シリコン粒子又はその混合物と、
組成物の約 0.5 重量%～約 1 重量%の前記乳化剤又はその混合物と、
組成物の約 3 重量%～約 5 重量%のシリコン油又はその混合物と、
組成物の約 50 重量%～約 85 重量%の水と、

10

20

30

40

50

任意選択的に、更なる成分又はその混合物と、を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記更なる成分が、ビタミン B 3 化合物、美白剤、ペプチド、糖アミン、スキンコンディショニング剤、日焼け止め剤、及びこれらの混合物からなる群より選択されるスキンケア活性物質である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記ビタミン B 3 化合物が、ナイアシンアミド、ナイアシンアミドの誘導体、ナイアシンアミド又はナイアシンアミドの誘導体の塩類、及びこれらの混合物からなる群より選択される、請求項 14 に記載の組成物。

10

【請求項 16】

皮膚の外観を改変するための活性物質；抗ニキビ活性物質；油溶性ビタミン化合物、テルペンアルコール、フィトステロール、サリチル酸及びその誘導体等の β -ヒドロキシ酸；キレート剤；フラボノイド化合物；抗炎症剤；抗セルライト剤；落屑活性物質；酸化防止剤／ラジカルスカベンジャー；日焼け（tanning）活性物質；皮膚鎮静又は皮膚治癒活性物質；抗微生物又は抗真菌活性物質、及びこれらの混合物からなる群より選択される補助成分を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 17】

請求項 1 に記載の組成物を皮膚に塗布することを含む、スキンケア方法。

【請求項 18】

請求項 14 に記載の組成物を皮膚に塗布することを含む、スキンケア方法。

20

【請求項 19】

スキンケア方法であって、

a) ビタミン B 3 化合物、美白剤、ペプチド、糖アミン、スキンコンディショニング剤、日焼け止め剤、及びこれらの混合物からなる群より選択されるスキンケア活性物質を含む製剤を皮膚に塗布する工程と、

b) 請求項 1 に記載の組成物を皮膚に塗布する工程と、を含む方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

30

【0001】

本発明は、水中油型エマルジョンスキンケア組成物に関する。また、本発明は、該組成物を塗布することを含むスキンケア方法に関する。

【背景技術】

【0002】

高い閉塞性をもたらすために炭化水素油等の閉塞剤がスキンケア製品で用いられてきた。このような高い閉塞性は、スキンケア製品に含有されるスキンケア活性物質の皮膚への浸透を強化するので、望ましい。具体的には、閉塞剤は、皮膚上に膜を形成するので、皮膚からの水分蒸発を防ぎ、スキンケア活性物質、特に水溶性活性物質の皮膚への吸収を強化する。

40

【0003】

しかし、閉塞剤の配合により、スキンケア製品が、例えば、脂っぽく、べたべたした感触等の好ましくない皮膚感覚を有するようになるので、ユーザーに好まれない。対照的に、ユーザーは、塗布後にフレッシュな感触又はひっかかり感（draginess）が少ない等、好ましい皮膚感覚を提供するスキンケア製品を好む。

【0004】

スキンケア製品の皮膚感覚を改善するために様々なアプローチが用いられている。例えば、1つのアプローチは、揮発性油を添加することである。低粘度環状シリコン油等の揮発性油は、皮膚に塗布した後に速やかに蒸発するので、皮膚との接触時にフレッシュな感触をもたらすためにスキンケア製品において一般的に用いられている。しかし、揮発性

50

油の配合は、典型的に、閉塞剤の濃度が希釈されることに起因して閉塞性を著しく低下させるので、スキンケア活性物質の浸透性が低くなる。

【0005】

別のアプローチは、閉塞剤を含有しないか又は限られた量しか含有しない水中油型エマルションを用いることである。このような水中油型エマルションは、典型的に多量の閉塞剤を含有する油中水型エマルションよりも優れた皮膚感覚を有する。それにも拘わらず、一方では、閉塞剤を配合しないか又は限られた量しか配合しないと、上述の通り、スキンケア活性物質の浸透性が低くなる。他方、水中油型エマルション中の閉塞剤の量を増加させることは、皮膚感覚を悪化させるので望ましくない。結論として、好ましい皮膚感覚とスキンケア活性物質の十分な浸透性、すなわち、高い閉塞性の両方を実現するために、現在のスキンケア用途のための水中油型エマルションにはまだ満たされていない要求が存在する。

10

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

したがって、閉塞性に大きな影響を与えることなく好ましい皮膚感覚を提供する水中油型エマルションスキンケア組成物が必要とされている。本発明の目的は、好ましい皮膚感覚に加えて比較的高い閉塞性を有する水中油型エマルションスキンケア組成物を提供することである。

【0007】

20

この目的は、本発明に係る組成物によって実現可能であることが見出された。

【0008】

本発明の利点は、効率的であり且つユーザーが要する時間の短いスキンケア方法、すなわち、特定の順序で皮膚に2つ以上の組成物を塗布する別々の工程を必要とすることなく、単一組成物を皮膚に塗布する1工程でスキンケア活性物質の十分な浸透を提供する方法を提供することである。

【0009】

本発明の更なる利点は、ユーザーにとって審美的に魅力のある水中油型エマルションスキンケア組成物を提供することである。

【課題を解決するための手段】

30

【0010】

本発明は、組成物の約3重量%～約25重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約2重量%～約15重量%のシリコン粒子又はその混合物と、組成物の約0.1重量%～約5重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約30重量%～約90重量%の水と、を含む水中油型エマルションスキンケア組成物に関する。

【0011】

好ましくは、本発明は、組成物の約3重量%～約25重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約2重量%～約15重量%のシリコン粒子又はその混合物と、組成物の約0.1重量%～約5重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約2重量%～約15重量%のシリコン油又はその混合物と、組成物の約30重量%～約90重量%の水と、を含む水中油型エマルションスキンケア組成物に関する。

40

【0012】

より好ましくは、本発明は、組成物の約5重量%～約15重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約3重量%～約10重量%のシリコン粒子又はその混合物と、組成物の約0.3重量%～約1.5重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約3重量%～約10重量%のシリコン油又はその混合物と、組成物の約30重量%～約88重量%の水と、を含む水中油型エマルションスキンケア組成物に関する。

【0013】

更により好ましくは、本発明は、組成物の約7重量%～約10重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約3重量%～約5重量%のシリコン粒子又はその混合物と、組

50

成物の約 0.5 重量%～約 1 重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約 3 重量%～約 5 重量%のシリコン油又はその混合物と、組成物の約 50 重量%～約 85 重量%の水と、を含む水中油型エマルシヨンスキンケア組成物に関する。

【0014】

本発明は、更に、該組成物を皮膚に塗布する工程を含むスキンケア方法に関する。

【発明を実施するための形態】

【0015】

用語の定義

本明細書で使用する時、用語「スキンケア製品」は、皮膚を処理若しくは手入れするため、又は何らかの形で保湿、改善、若しくは洗浄するために用いられる製品を意味する。スキンケア製品としては、皮膚保湿剤、皮膚洗浄剤、スキントリートメントエマルシヨ、化粧水、皮膚治療製品、皮膚角質除去剤 (skin exfoliants)、シェービングクリーム、スキンマスク等が挙げられるが、これらに限定されない。

【0016】

本明細書で使用する時、用語「スキンケア組成物」は、スキンケア製品の主要部分を構成する組成物を意味する。スキンケア組成物は、一般的に、皮膚を処理、保湿、改善、又は洗浄する機能をもたらすスキンケア活性物質を含む。

【0017】

本明細書で使用する時、用語「水中油型エマルシヨ」は、油が分散液体であり、水溶液が連続相であるエマルシヨを指す。

【0018】

本明細書で使用する時、用語「油中水型エマルシヨ」は、水が連続油相中の分散相である時のエマルシヨを指す。

【0019】

本明細書で使用する時、用語「閉塞性」は、皮膚を膜で覆い、それによって皮膚からの水分蒸発を防ぐことを指す。用語「閉塞剤」は、スキンケア製品に配合したとき、閉塞性の機能をもたらす材料を意味する。閉塞剤は、典型的に、比較的高い閉塞性を有する。

【0020】

本明細書で使用する時、用語「皮膚感覚」は、ユーザーが製品についてどのように感じるかというスキンケア製品についてのユーザーの知覚を指す。本発明では、フレッシュな感觸及びひっかかり感の基準が、皮膚感覚を特徴付けるために用いられる。

【0021】

本明細書において使用する時、用語「不揮発性」とは、25℃、1気圧において 26.7 Pa (0.2 mm Hg) 以下の蒸気圧を示す物質、及び／又は 1気圧で少なくとも 300℃の沸点を有する物質、を意味する。用語「揮発性」は、本明細書で使用する時、本明細書において定義した「不揮発性」に当てはまらない全ての物質を指す。

【0022】

本明細書で使用する時、「1つの (a 及び an)」を包含する項目は、請求項に使用するとき、請求又は記載されているものの 1つ又はそれ以上を意味すると理解される。

【0023】

本明細書で使用する時、用語「含む (comprise, comprises, comprising)」、「包含する (include, includes, including)」、「含有する (contain, contains, containing)」は、非限定的である、すなわち、最終結果に影響を及ぼすことのない他の工程及び他の成分を加えることができることを指す。上記用語には、「からなる」及び「から本質的になる」という用語が包含される。

【0024】

スキンケア組成物

本発明の水中油型エマルシヨンスキンケア組成物は、組成物の約 3 重量%～約 25 重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約 2 重量%～約 15 重量%のシリコン粒子又はその混合物と、組成物の約 0.1 重量%～約 5 重量%の乳化剤又はその混合物と、組

10

20

30

40

50

成物の約30重量%～約90重量%の水と、任意選択的に、更なる成分又はその混合物と、を含む。

【0025】

好ましくは、本明細書における組成物は、組成物の約5重量%～約15重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約3重量%～約10重量%のシリコーン粒子又はその混合物と、組成物の約0.3重量%～約1.5重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約30重量%～約90重量%の水と、任意選択的に、更なる成分又はその混合物と、を含む。より好ましくは、該組成物は、組成物の約7重量%～約10重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約3重量%～約5重量%のシリコーン粒子又はその混合物と、組成物の約0.5重量%～約1重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約50重量%～約85重量%の水と、任意選択的に、更なる成分又はその混合物と、を含む。

10

【0026】

好ましくは、本明細書における組成物は、更なる成分又はその混合物を含む。好ましい実施形態では、更なる成分は、シリコーン油、スキンケア活性物質、及びこれらの混合物からなる群より選択される。

【0027】

好ましくは、本明細書における組成物は、1つ以上の補助成分を含む。

【0028】

炭化水素油

本発明の水中油型エマルジョンスキンケア組成物は、組成物の約3重量%～約25重量%の量の炭化水素油又はその混合物を含む。好ましくは、炭化水素油は、組成物の約5重量%～約15重量%、より好ましくは約7重量%～約10重量%の量で組成物中に存在する。

20

【0029】

炭化水素油の好ましい例としては、ワセリン、鉱油、マイクロクリスタリンワックス、ポリアルケン、パラフィン、ケラシン、オゾケライト、ポリエチレン、ペルヒドロスクアレン、ポリアルファオレフィン、水素添加ポリイソブテン、及びこれらの混合物が挙げられる。炭化水素油の最も好ましい例は、ワセリン（例えば、Perfecta（登録商標）ワセリン、Sonneborn, Incから入手可能）である。

【0030】

理論に束縛されるものではないが、本明細書における炭化水素油は、組成物において閉塞剤として機能する。炭化水素油は、常温（25℃）で固体又は半固体である。皮膚に塗布したとき、炭化水素油は、皮膚上に膜を形成し、皮膚からの水の蒸発を防ぐので、皮膚の表面に水を保持する。したがって、スキンケア活性物質、特に水溶性剤の溶解状態が維持され、その皮膚への吸収が強化される。

30

【0031】

更に、多量の閉塞剤、例えば、50%超の炭化水素油を含有する組成物と比べて、限られた量の閉塞剤、例えば、25%未満の炭化水素油しか含有しない水中油型エマルジョンは、典型的に、同じ組成物中に油性活性物質及び水溶性活性物質が配合されていることからユーザーにとって審美的により魅力的であることに加えて、脂っぽさ及び重さが低減される。

40

【0032】

シリコーン粒子

本発明の水中油型エマルジョンスキンケア組成物は、組成物の約2重量%～約15重量%の量のシリコーン粒子又はその混合物を含む。好ましくは、シリコーン粒子は、組成物の約3重量%～約10重量%、より好ましくは約3重量%～約5重量%の量で組成物中に存在する。

【0033】

好ましくは、本明細書で使用するのに好適なシリコーン粒子は、シリコーン樹脂粒子、シリコーンゴム粒子、及びこれらの混合物からなる群より選択される。好ましい実施形態

50

では、シリコーン粒子は、球形シリコーン樹脂粒子、球形シリコーンゴム粒子、及びこれらの混合物からなる群より選択される。別の好ましい実施形態では、シリコーン粒子は、シリコーン樹脂粒子とシリコーンゴム粒子との混合物である。

【0034】

好ましくは、本明細書におけるシリコーン粒子は、シリコーン樹脂粒子である。より好ましくは、シリコーン粒子は、球形シリコーン樹脂粒子である。更により好ましくは、シリコーン粒子は、約0.01 μm ～約5 μm 、好ましくは約0.1 μm ～約4 μm 、より好ましくは約1 μm ～約3 μm 、更により好ましくは約2 μm の平均粒径を有する。

【0035】

非常に好ましい実施形態では、シリコーン粒子は、ポリメチルシルセスキオキサン（例えば、KMP-590、Shin-Etsu Chemicalから入手可能）である。

【0036】

本発明では、出願人は、驚くべきことに、水中油型エマルジョンスキンケア組成物中のシリコーン粒子と炭化水素油との組み合わせが、特定の濃度以下で、閉塞性に大きな影響を与えることなく好ましい皮膚感覚を実現することを見出した。具体的には、このような組み合わせ、すなわち、組成物の約2重量%～約15重量%のシリコーン粒子と組成物の約3重量%～約25重量%の炭化水素油との組み合わせは、好ましい皮膚感覚、特にフレッシュな感触の改善及びひっかかり感の低減とともに、比較的高い閉塞性を実現することが見出された。

【0037】

乳化剤

本発明の水中油型エマルジョンスキンケア組成物は、組成物の約0.1重量%～約5重量%の量の乳化剤又はその混合物を含む。好ましくは、乳化剤は、組成物の約0.1重量%～約2重量%、より好ましくは約0.3重量%～約1.5重量%、更により好ましくは約0.5重量%～約1重量%の量で組成物中に存在する。本明細書における乳化剤は、一般的に、水中油型エマルジョンにおいて、不連続相を連続相に分散及び懸濁させるのを補助する。

【0038】

広範な従来の乳化剤が、本明細書で使用するのに好適である。乳化剤の好ましい例としては、疎水変性架橋ポリアクリレートポリマー及びコポリマー、ポリアクリルアミドポリマー及びコポリマー、並びにポリアクリロイルジメチルタウレートが挙げられる。乳化剤のより好ましい例としては、商品名Pemulen（商標）TR-1、Pemulen（商標）TR-2（全てLubrizolから入手可能）を有するアクリレート／C10-30アルキルアクリレートクロスポリマー；商品名ACRYSOL（商標）22（Rohm and Hass製）を有するアクリレート／ステアレス-20メタクリレートコポリマー；商品名SEPIGEL 305（Seppic製）を有するポリアクリルアミドが挙げられる。

【0039】

非常に好ましい実施形態では、本明細書で使用される乳化剤は、組成物の約0.3重量%～約1.5重量%、好ましくは約0.5重量%～約1重量%、より好ましくは約0.5重量%の量で存在するアクリレート／C10-30アルキルアクリレートクロスポリマー（例えば、Pemulen（商標）TR-2、Lubrizolから入手可能）である。

【0040】

シリコーン油

本発明の水中油型エマルジョンスキンケア組成物は、更なる成分としてシリコーン油又はその混合物を含んでよい。本明細書におけるシリコーン油の好適なレベルは、組成物の約2重量%～約15重量%、好ましくは約3重量%～約10重量%、より好ましくは約3重量%～約5重量%である。

【0041】

本明細書におけるシリコーン油は、当該技術分野において周知の任意のシリコーン油か

ら選択してよい。シリコーン油は、米国特許第4,781,917号(Luebbeら、1988年11月1日発行)に開示されており、その全体を参照により本明細書に組み込む。1つの実施形態では、本明細書におけるシリコーン油は、揮発性シリコーン油、不揮発性シリコーン油、及びこれらの混合物からなる群より選択される。

【0042】

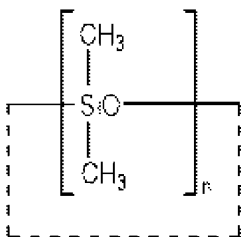
好ましい実施形態では、本明細書におけるシリコーン油は、揮発性シリコーン油である。より好ましくは、本明細書におけるシリコーン油は、直鎖状揮発性シリコーン油、環状揮発性シリコーン油、及びこれらの混合物からなる群より選択される。直鎖状揮発性シリコーン油は、一般に、25℃で $5\text{E}-6\text{m}^2/\text{s}$ (5センチストークス)未満の粘度を有するが、環状シリコーン油は、25℃で $1\text{E}-5\text{m}^2/\text{s}$ (10センチストークス)未満の粘度を有する。更に、様々なシリコーン物質についての記述は、Todd et al.,「Volatile Silicone Fluids for Cosmetics」, Cosmetics and Toiletries, 91:27~32(1976)に見出され、その全体を本明細書に参照により組み込む。

【0043】

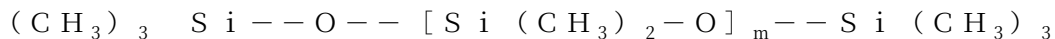
より好ましい実施形態では、本明細書におけるシリコーン油は、以下の式：

【0044】

【化1】



(式中、nは3~7である)に対応する揮発性シリコーン油；以下の式：



(式中、mは1~7である)に対応する直鎖状揮発性シリコーン；及び分枝状揮発性シリコーン、からなる群より選択される。揮発性シリコーン油の好ましい例としては、様々な粘度のシクロメチコン、例えば、Dow Corning(登録商標)200、Dow Corning(登録商標)244、Dow Corning(登録商標)245、Dow Corning(登録商標)344、及びDow Corning(登録商標)345、XIAMETER(登録商標)PMX-0245(全てDow Corningから入手可能)；SF-1204及びSF-1202(全てMomentiveから入手可能)、GE 7207及び7158(全てGeneral Electric Co.から入手可能)；SWS-03314(SWS Siliconesから入手可能)；並びにKF-995(Shin-Etsu Chemicalから入手可能)が挙げられる。直鎖状揮発性シリコーン油の好ましい例としては、KF-96A-1cs、KF-96L-1.5cs、KF-96L-2cs、KF96A-5cs(全てShin-Etsu Chemicalより入手可能)が挙げられる。分枝状揮発性シリコーン油の好ましい例としては、TMF-1.5(Shin-Etsu Chemicalから入手可能)が挙げられる。シリコーン油の最も好ましい例は、シクロペンタシロキサン(例えば、SF-1202、Momentiveから入手可能)である。

【0045】

シリコーン油、特に揮発性シリコーン油は、フレッシュな感触をもたらすためにスキンケア組成物で用いられている。しかし、このような揮発性シリコーン油の配合は、典型的に、閉塞性を著しく低下させるので、スキンケア活性物質の浸透性が低くなる。対照的に、出願人は、驚くべきことに、水中油型エマルジョンスキンケア組成物においてシリコーン油と炭化水素油及びシリコーン粒子とを合わせると、特定の濃度以下で、閉塞性を著しく損なわせることなく優れた皮膚感覚が実現されることを見出した。具体的には、このよ

うな組み合わせ、すなわち、組成物の約 3 重量%～約 25 重量%の炭化水素油と、組成物の約 2 重量%～約 15 重量%のシリコン粒子と、組成物の約 2 重量%～約 15 重量%のシリコン油との組み合わせは、閉塞性を著しく損なわせることなく、優れた皮膚感覚を実現する、特にフレッシュな感触を実質的に改善し、ひっかかり感を低減することを見出した。

【0046】

スキンケア活性物質

スキンケア活性物質又はその混合物は、更なる成分として本発明の水中油型エマルジョンスキンケア組成物中に存在してもよく、及び／又は本発明の組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤中に存在してもよい。ある実施形態では、スキンケア活性物質は、本発明の組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤中に存在する。好ましい実施形態では、スキンケア活性物質は、本発明の組成物中に存在する。理論に束縛されるものではないが、本組成物又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤は、様々なスキンケア活性物質の配合に多用途性をもたらすと考えられる。

【0047】

本明細書で使用するためのスキンケア活性物質は、皮膚の処理、保湿、改善、又は洗浄の機能をもたらす任意のスキンケア活性物質であってよい。1つの実施形態では、本明細書におけるスキンケア活性物質は、それがもたらす効果によって、又は予測される作用機序によって分類することができる。ただし、本明細書におけるスキンケア活性物質は、場合によっては、1つ超の効果をもたらしたり、1つ超の作用機序を介して機能したりすると理解するべきである。したがって、本明細書における分類は便宜上実施されたものであって、スキンケア活性物質を、列挙した特定の用途に制限することを意図するものではない。

【0048】

好ましい実施形態では、本明細書におけるスキンケア活性物質は、ビタミン B₃ 化合物、美白剤、ペプチド、糖アミン、スキンコンディショニング剤、日焼け止め剤、及びこれらの混合物からなる群より選択される。

【0049】

ビタミン B₃ 化合物

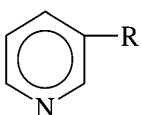
ナイアシンアミド等のビタミン B₃ 化合物は、本明細書で使用するための好ましいスキンケア活性物質である。本組成物において又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤において用いられるとき、ビタミン B₃ 化合物は、組成物又は製剤の約 0.1 重量%～約 30 重量%、好ましくは約 1 重量%～約 20 重量%、より好ましくは約 2 重量%～約 10 重量%存在する。

【0050】

本明細書で使用するとき、用語「ビタミン B₃ 化合物」とは、以下の式：

【0051】

【化 2】



(式中、Rは、 $-\text{CONH}_2$ (すなわち、ナイアシンアミド)、 $-\text{COOH}$ (すなわち、ニコチン酸) 又は $-\text{CH}_2\text{OH}$ (すなわち、ニコチルアルコール) ; これらの誘導体 ; 及び前述のいずれかの塩である) を有する化合物を意味する。前述のビタミン B₃ 化合物の代表的な誘導体としては、非血管拡張性のニコチン酸のエステル (例えば、トコフェリルニコチネート)、ニコチルアミノ酸、カルボン酸のニコチルアルコールエステル、ニコチン酸-N-オキシド、及びナイアシンアミド-N-オキシドを含むニコチン酸エステルが挙げられる。

【0052】

美白剤

美白剤は、本組成物及び／又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤中に含まれてよい。本明細書で使用するとき、用語「美白剤」とは、皮膚の外観を変化させるだけでなく、処理前と比較して、色素沈着過度を更に改善する活性成分を指す。本組成物において又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤において用いられるとき、美白剤は、組成物又は製剤の約 0.1 重量％～約 10 重量％、好ましくは約 0.2 重量％～約 5 重量％存在する。

【0053】

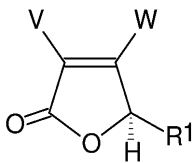
1つの実施形態では、本明細書における美白剤は、アスコルビン酸化合物、アゼライン酸、ブチルヒドロキシアニソール、没食子酸及びその誘導体、ヒドロキノイン、コウジ酸、アルブチン、クワ抽出物、ウンデシレノイルフェニルアラニン、セチルピリジニウムクロリド、グリシリジン酸、テトラヒドロクルクミン、及びこれらの混合物からなる群より選択される。

【0054】

美白剤の好ましい例は、以下の式：

【0055】

【化3】



(式中、V及びWは、独立して、 $-OH$ であり、 R^1 は、 $-CH(OH)-CH_2OH$ 及びこれらの塩類である)を有するアスコルビン酸化合物である。より好ましくは、本明細書におけるアスコルビン酸化合物は、アスコルビン酸塩又はその誘導体であり、例えば、当該技術分野において周知の方法によって調製したナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウム、バリウム、アンモニウム、及びプロタミン塩等が挙げられるが、これらに限定されない、当該技術分野において周知の無毒のアルカリ金属、アルカリ土類金属、及びアンモニウム塩である。

【0056】

ペプチド

ジー、トリ、テトラ、及びペンタペプチド、並びにこれらの誘導体が挙げられるが、これらに限定されないペプチドが、本組成物に及び／又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤に、含まれてよい。本明細書で使用するとき、用語「ペプチド」とは、天然ペプチドと合成ペプチドの両方を指す。また、ペプチドを含有する天然由来の組成物及び市販の組成物も本明細書で有用である。

【0057】

本組成物において又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤において用いられるとき、ペプチドは、安全且つ有効な量、好ましくは組成物又は製剤の約 1×10^{-6} 重量％～約 10 重量％、より好ましくは約 1×10^{-6} 重量％～約 0.1 重量％、更により好ましくは約 1×10^{-5} 重量％～約 0.01 重量％存在する。

【0058】

糖アミン

糖アミンは、本組成物中に及び／又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤中に、含まれてよい。本明細書で使用するとき、用語「糖アミン」とは、6炭糖のアミン誘導体を意味する。

【0059】

本明細書における糖アミンの好ましい例としては、グルコサミン、N-アセチルグルコサミン、マンノサミン、N-アセチルマンノサミン、ガラクトサミン、N-アセチルガラクトサミンが挙げられる。糖アミンのより好ましい例は、グルコサミンである。更に、2

つ以上の糖アミンの組み合わせを使用してもよい。

【0060】

本組成物において又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤において用いられるとき、本明細書における糖アミンは、組成物又は製剤の約0.001重量%～約20重量%、好ましくは約1重量%～約10重量%、より好ましくは約2重量%～約5重量%存在する。

【0061】

スキンコンディショニング剤

スキンコンディショニング剤は、本組成物に及び／又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤に、含まれてよい。好ましくは、このようなスキンコンディショニング剤は、湿潤剤、角質除去剤、皮膚軟化剤、及びこれらの混合物からなる群より選択される。

10

【0062】

湿潤剤は、保湿したり、鱗屑を低減したり、皮膚から積層鱗屑が除去されるように促したりするための、多価アルコールである。典型的な多価アルコールとしては、ポリアルキレングリコール、より好ましくはアルキレンポリオール及びその誘導体が挙げられる。湿潤剤の好ましい例は、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ソルビトール、ヒドロキシプロピルソルビトール、ヘキシレングリコール、1,3-ブチレングリコール、1,2,6-ヘキサントリオール、エトキシ化グリセリン、プロポキシ化グリセリン、及びこれらの混合物である。最も好ましい湿潤剤は、グリセリンである。

20

【0063】

角質除去剤は、C2～C30アルファードロキシカルボン酸、ベーターヒドロキシカルボン酸、これら酸の塩類、及びこれらの混合物からなる群より選択してよい。角質除去剤の好ましい例は、グリコール酸、乳酸、及びサリチル酸、並びにこれらのアンモニウム塩類である。

【0064】

皮膚軟化剤は、炭化水素、脂肪酸、脂肪族アルコール、エステル、及びこれらの混合物からなる群より選択してよい。

【0065】

本組成物において又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤において用いられるとき、スキンコンディショニング剤は、組成物又は製剤の約1重量%～約60重量%、好ましくは約2重量%～約50重量%、より好ましくは約5重量%～約40重量%存在する。

30

【0066】

日焼け止め剤

日焼け止め剤は、本組成物に及び／又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤に、含まれてよい。本明細書で使用するときに、用語「日焼け止め剤」は、一般的に、紫外線の曝露による角質層の過剰な鱗屑及び質感変化を防ぐものである。

【0067】

広範な従来の日焼け止め剤が、本明細書で使用するのに適している。日焼け止め剤の好ましい例としては、メトキシケイ皮酸オクチル、サリチル酸オクチル、オクトクリレン、アポベンゾン、ホモサラート、オクチルトリアゾン、及びこれらの混合物が挙げられる。他の従来の日焼け止め剤もまた本明細書で有用である。このような剤としては、例えば、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、2-フェニルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸、オクチルジメチル-p-アミノ安息香酸、2-エチルヘキシルN,N-ジメチル-p-アミノベンゾエート、p-アミノ安息香酸、オキシベンゾン、4-イソプロピルジベンゾイルメタン、3-ベンジリデンカンファー、3-(4-メチルベンジリデン)カンファーが挙げられる。

40

【0068】

本組成物において又は本組成物を塗布する前に皮膚に塗布される製剤において用いられ

50

るとき、日焼け止め剤は、組成物又は製剤の約0.1重量%～約20重量%、好ましくは約0.5重量%～約10重量%、より好ましくは約1重量%～約5重量%存在する。的確な量は、選択した日焼け止め剤及び所望の太陽光線保護指数（SPF）に応じて変化する。SPFは、通常使用されている、紅斑に対する日焼け止め剤の光防護の尺度である。Federal Register, Vol. 43, No. 166, pp. 38206～38269（1978年8月25日）を参照のこと。

【0069】

補助成分

種々の補助成分を本発明の組成物に配合してよい。好ましくは、本明細書における補助成分は、皮膚の外観を改変するための活性物質；抗ニキビ活性物質；油溶性ビタミン化合物、テルペンアルコール、フィトステロール、サリチル酸及びその誘導体等のβ-ヒドロキシ酸；キレート剤；フラボノイド化合物；抗炎症剤；抗セルライト剤；落屑活性物質；酸化防止剤／ラジカルスカベンジャー；日焼け（tanning）活性物質；パンテノン酸誘導体（パンテノール、デクスパンテノール、エチルパンテノールを含む）、アロエベラ、アラントイン、ビサボロール及びグリチルリチン酸二カリウム等の皮膚鎮静又は皮膚治癒活性物質；抗微生物又は抗真菌活性物質、及びこれらの混合物からなる群より選択される。

【0070】

組成物の調製

本発明の水中油型エマルシオンスキンケア組成物は、一般的に、スキンケア組成物製造の技術分野において公知であるような従来の方法によって調製される。このような方法は、通常、加熱、冷却、真空の適用等を用いて又は用いずに、成分を1つ以上の工程で混合して比較的均一な状態にすることを含む。製品形態の非限定的な例は、ゲル、エマルション、ローション、クリーム、軟膏、溶液、液体等であってよい。

【0071】

本明細書における組成物は、

a) 70℃～75℃で炭化水素油とシリコーン粒子との組み合わせを加熱し、次いで、1000rpm～3000rpmの剪断力を適用することによって該組み合わせを乳化剤と混合する工程と、

b) 1000rpm～3000rpmの剪断力を適用することによって工程a)で得られた組み合わせを70℃～75℃の水と混合する工程と、

c) 工程b)で得られた組み合わせを8000rpm～12000rpmのホモジナイザーで8分間～12分間ホモジナイズして、該組み合わせの粒径を低下させ、水中油型エマルションを形成する工程と、によって調製してよく、

該組成物において、該炭化水素油は、組成物の約3重量%～約25%の量で存在し、該シリコーン粒子は、組成物の約2重量%～約15重量%の量で存在し、界面活性剤は、組成物の約0.1重量%～約5重量%の量で存在し、水は、組成物の約30重量%～約90重量%で存在する。

【0072】

好ましい実施形態では、本明細書における組成物は、

a) 70℃～75℃で炭化水素油とシリコーン粒子との組み合わせを加熱し、次いで、1000rpm～3000rpmの剪断力を適用することによって該組み合わせを乳化剤と混合する工程と、

b) 1000rpm～3000rpmの剪断力を適用することによって工程a)で得られた組み合わせを70℃～75℃の水と混合する工程と、

c) 工程b)で得られた組み合わせを8000rpm～12000rpmのホモジナイザーで8分間～12分間ホモジナイズして、該組み合わせの粒径を低下させる工程と、

d) 工程c)で得られた組み合わせの温度が35℃未満になったら、該組み合わせにシリコーン油を添加し、混合し、次いで、混合物を8000rpm～12000rpmのホモジナイザーで8分間～12分間ホモジナイズして水中油型エマルションを形成する工程と、によって調製され、

該組成物において、該炭化水素油は、組成物の約3重量%～約25%の量で存在し、該シリコン粒子は、組成物の約2重量%～約15重量%の量で存在し、界面活性剤は、組成物の約0.1重量%～約5重量%の量で存在し、該シリコン油は、約2重量%～約15重量%の量で存在し、水は、組成物の約30重量%～約90重量%で存在する。

【0073】

より好ましい実施形態では、本明細書における組成物は、

a) 70℃～75℃で炭化水素油とシリコン粒子との組み合わせを加熱し、次いで、1000rpm～3000rpmの剪断力を適用することによって該組み合わせを乳化剤と混合する工程と、

b) 1000rpm～3000rpmの剪断力を適用することによって工程a)で得られた組み合わせを70℃～75℃の水と混合する工程と、

c) 工程b)で得られた組み合わせを8000rpm～12000rpmのホモジナイザーで8分間～12分間ホモジナイズして、該組み合わせの粒径を低下させ、水中油型エマルジョンを形成する工程と、

d) 工程c)で得られた組み合わせの温度が35℃未満になったら、該組み合わせにシリコン油及びビタミンB3化合物を添加し、混合し、次いで、混合物を8000rpm～12000rpmのホモジナイザーで8分間～12分間ホモジナイズして水中油型エマルジョンを形成する工程と、によって調製され、

該組成物において、該炭化水素油は、組成物の、約3重量%～約25%の量で存在し、該シリコン粒子は、約2重量%～約15重量%の量で存在し、界面活性剤は、約0.1重量%～約5重量%の量で存在し、該シリコン油は、約2重量%～約15重量%の量で存在し、該ビタミンB3化合物は、約1重量%～約20重量%の量で存在し、水は、約30重量%～約90重量%で存在する。

【0074】

スキンケア方法

本発明のスキンケア方法は、水中油型エマルジョンスキンケア組成物を皮膚に塗布することを含み、該組成物は、組成物の約3重量%～約25重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約2重量%～約15重量%のシリコン粒子又はその混合物と、組成物の約0.1重量%～約5重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約30重量%～約90重量%の水と、任意選択的に、更なる成分又はその混合物と、を含む。

【0075】

1つの実施形態では、本明細書におけるスキンケア方法は、多段階方法、例えば、二段階方法である。本明細書で使用するとき、用語「多段階」とは、2つ以上の組成物を特定の順序で皮膚に塗布する別々の工程を必要とすることを指す。好ましくは、スキンケア方法は、a) スキンケア活性物質を含む製剤を皮膚に塗布する工程と、b) 本発明の組成物を皮膚に塗布する工程と、を含む。より好ましい実施形態では、本明細書におけるスキンケア活性物質は、ビタミンB3化合物、美白剤、ペプチド、糖アミン、スキンコンディショニング剤、日焼け止め剤、及びこれらの混合物からなる群より選択される。

【0076】

別の実施形態では、本明細書におけるスキンケア方法は、一段階方法である。本明細書で使用するとき、用語「一段階」とは、2つ以上の組成物を特定の順序で皮膚に塗布する別々の工程を必要とすることなく、単一の組成物を皮膚に塗布することを指す。好ましくは、スキンケア方法は、組成物を皮膚に塗布することを含み、該組成物は、約3重量%～約25重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約2重量%～約15重量%のシリコン粒子又はその混合物と、組成物の約0.1重量%～約5重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約30重量%～約90重量%の水と、スキンケア活性物質又はその混合物と、を含む。より好ましい実施形態では、スキンケア活性物質は、ビタミンB3化合物、美白剤、ペプチド、糖アミン、スキンコンディショニング剤、日焼け止め剤、及びこれらの混合物からなる群より選択される。

【0077】

当該技術分野では、多段階スキンケア方法は、一般的に、一段階方法によりも時間がかかるにも拘わらず、スキンケア活性物質の皮膚への浸透がより有効であると考えられる。典型的に、多段階方法は、スキンケア活性物質を含む第1の組成物を皮膚に塗布する工程と、次いで、閉塞剤を含有し且つ高い閉塞性を有する第2の組成物を皮膚に塗布して、該スキンケア活性物質の皮膚への十分な浸透を確実にする工程と、を含む。しかし、本発明では、出願人は、驚くべきことに、組成物の約3重量%～約25重量%の炭化水素油又はその混合物と、組成物の約2重量%～約15重量%のシリコーン粒子又はその混合物と、組成物の約0.1重量%～約5重量%の乳化剤又はその混合物と、組成物の約30重量%～約90重量%の水又はその混合物と、スキンケア活性物質又はその混合物と、を含む水中油型エマルジョンスキンケア組成物が、比較的高い閉塞性をもたらすので、他の組成物を塗布する別々の工程を必要することなく、組成物中に含有されているスキンケア活性物質の皮膚への浸透を強化することを見出した。

10

【0078】

試験方法

I. スキンケア組成物の閉塞性を決定する方法

前記方法は、コラーゲンフィルム（N a t u r i n C O F F I J）が半透膜として配置されている標準化ステンレス鋼試験チャンバを用いる。カップに塩化カルシウム（10g）を満たし、試験する材料（0.535g）を膜の粗面上にコーティングする。試験チャンバを閉じ、最初に25℃/60%RHの温度管理されている室内に1時間置き、次いで、40℃/75%RHの室内に24時間置く。試験期間後、カップの重量を測定する。また、塩化物を除去した後のカップの重量も測定する。CaCl₂による水蒸気の吸収を閉塞性の計算に用いる。

20

【0079】

以下の式を用いて閉塞性を計算する：

$$\text{閉塞性 (\%)} = 100 - \left((\text{カップの総重量} - \text{CaCl}_2 \text{を含まないカップの重量}) - 10 (\text{元のCaCl}_2) \times 10.0 \right)$$

【0080】

II. スキンケア組成物の皮膚感覚を決定する方法

合計10人の資格のあるパネリストが試験に参加した。ボランティアの前腕を石鹸で洗い、水でよくすすぎ、紙タオルで拭いて完全に乾かした。0.1mLの試験製品及びベースラインを前腕に塗布した。試験製品対ベースラインの特性を両側スケール（-3～+3）で評価した。「0」は、コントロールと比べて差がないことを示す。結果は、試験に参加した10人のボランティアの平均値である。

30

【0081】

「フレッシュな感触」は、べたべたしていない特性を指し、正の特性と呼ばれる。正の値のフレッシュな感触は、ベースラインよりも優れたフレッシュな感触を意味し、その絶対値が大きいほど、ベースラインに対してより大きな差があることを意味する。

【0082】

「ひっかかり感」は、皮膚に塗布されている間に製品によって生じる抵抗を指す。負の値のひっかかり感は、ベースラインよりもひっかかり感に優れていることを意味し、その絶対値が大きいほどベースラインに対してより大きな差を有することを意味する。

40

【実施例】

【0083】

本明細書に記載の実施例は、本発明を例示することを意味するが、本発明の範囲を制限又は他の方法で定義するために使用するものではない。実施例1A～1Iは、本発明に係る実施例であり、実施例2A～2Dは、比較例である。

【0084】

実施例1A～1I：水中油型エマルジョンスキンケア組成物の処方

列挙された成分を列挙された比率（重量%）で含む下記の組成物を作製する。

【0085】

50

【表 1】

表 1

	1A	1B	1C	1D	1E	1F	1G	1H	1I
Perfecta(登録商標)ワセリン ^a	7.5%	7.5%	15%	7.5%	7.5%	20%	15%	15%	5%
KMP-590 ^b	7.5%	7.5%	7.5%	3.75%	3.75%	10%	7.5%	5%	5%
SF-1202 ^c	0	0	0	3.75%	3.75%	10%	7.5%	5%	5%
Pemulen(商標)TR-2 ^d	0.5%	0.5%	0.5%	0.5%	0.5%	0.5%	0.5%	0.5%	0.5%
ナイアシンアミド	0	5%	0	0	5%	0	0	0	0
水	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた

10

a Perfecta(登録商標)ワセリンは、Sonneborn, Incから入手可能である。

b KMP-590は、Shin-Etsu Chemicalから入手可能なポリメチルシルセスキオキサンである。

c SF-1202は、Momentiveから入手可能なシクロペンタシロキサンである。

d Pemulen(商標)TR-2は、Lubrizolから入手可能なアクリレート/C10~30アルキルアクリレートクロスポリマーである。

20

【0086】

実施例1Aの組成物の調製

実施例1Aの組成物を、

a) 70℃でPerfecta(登録商標)ワセリンとKMP-590との組み合わせを加熱し、2000rpmの剪断力を適用することによって前記組み合わせをPemulen(商標)TR-2と混合する工程と、

b) 2000rpmの剪断力を適用することによって工程a)で得られた組み合わせを70℃の水と混合する工程と、

c) 工程b)で得られた組み合わせを10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして、前記組み合わせの粒径を低下させ、水中油型エマルジョン組成物を形成する工程と、によって調製し、

30

前記組成物において、Perfecta(登録商標)ワセリンは、組成物の7.5重量%の量で存在し、KMP-590は、組成物の7.5重量%の量で存在し、Pemulen(商標)TR-2は、組成物の0.5重量%の量で存在し、水は、組成物の84.5重量%の量で、存在する。

【0087】

実施例1Bの組成物の調製

実施例1Bの組成物を、

a) 70℃でPerfecta(登録商標)ワセリンとKMP-590との組み合わせを加熱し、2000rpmの剪断力を適用することによって前記組み合わせをPemulen(商標)TR-2と混合する工程と、

40

b) 2000rpmの剪断力を適用することによって工程a)で得られた組み合わせを70℃の水と混合する工程と、

c) 工程b)で得られた組み合わせを10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして、前記組み合わせの粒径を低下させる工程と、

d) 工程c)で得られた組み合わせの温度が35℃未満になったら、前記組み合わせにナイアシンアミドを添加し、混合し、次いで、混合物を10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして水中油型エマルジョンを形成する工程と、によって調製し、

50

前記組成物において、Perfecta(登録商標)ワセリンは、組成物の、7.5重

量%の量で存在し、KMP-590は、7.5重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、0.5重量%の量で存在し、ナイアシンアミドは、5重量%の量で存在し、水は、79.5重量%の量で、存在する。

【0088】

実施例1Cの組成物の調製

実施例1Cの組成物は、Perfecta（登録商標）ワセリンが、組成物の、15重量%の量で存在し、水が77重量%の量で存在することを除いて、実施例1Aと同じ工程によって調製する。

【0089】

実施例1Dの組成物の調製

実施例1Dの組成物を、

a) 70℃でPerfecta（登録商標）ワセリンとKMP-590との組み合わせを加熱し、2000rpmの剪断力を適用することによって前記組み合わせをPemulen（商標）TR-2と混合する工程と、

b) 2000rpmの剪断力を適用することによって工程a)で得られた組み合わせを70℃の水と混合する工程と、

c) 工程b)で得られた組み合わせを10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして、前記組み合わせの粒径を低下させる工程と、

d) 工程c)で得られた組み合わせの温度が35℃未満になったら、前記組み合わせにSF-1202を添加し、混合し、次いで、混合物を10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして水中油型エマルジョンを形成する工程と、によって調製し、

前記組成物において、Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の、7.5重量%の量で存在し、KMP-590は、3.75重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、0.5重量%の量で存在し、SF-1202は、3.75重量%の量で存在し、水は、84.5重量%の量で、存在する。

【0090】

実施例1Eの組成物の調製

実施例1Eの組成物を、

a) 70℃でPerfecta（登録商標）ワセリンとKMP-590との組み合わせを加熱し、2000rpmの剪断力を適用することによって前記組み合わせをPemulen（商標）TR-2と混合する工程と、

b) 2000rpmの剪断力を適用することによって工程a)で得られた組み合わせを70℃の水と混合する工程と、

c) 工程b)で得られた組み合わせを10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして、前記組み合わせの粒径を低下させる工程と、

d) 工程c)で得られた組み合わせの温度が35℃未満になったら、前記組み合わせにSF-1202及びナイアシンアミドを添加し、混合し、次いで、混合物を10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして水中油型エマルジョンを形成する工程と、によって調製し、

前記組成物において、Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の、7.5重量%の量で存在し、KMP-590は、3.75重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、0.5重量%の量で存在し、SF-1202は、3.75重量%の量で存在し、ナイアシンアミドは、5重量%の量で存在し、水は、組成物の79.5重量%の量で、存在する。

【0091】

実施例1Fの組成物の調製

以下を除いて実施例1Dと同じ工程によって実施例1Fを調製する：Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の、20重量%の量で存在し、KMP-590は、10重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、0.5重量%の量で存在し、

S F-1202は、10重量%の量で存在し、水は、59.5重量%の量で、存在する。

【0092】

実施例1Gの組成物の調製

以下を除いて実施例1Dと同じ工程によって実施例1Gを調製する：Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の、15重量%の量で存在し、KMP-590は、7.5重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、0.5重量%の量で存在し、SF-1202は、7.5重量%の量で存在し、水は、69.5重量%の量で、存在する。

【0093】

実施例1Hの組成物の調製

以下を除いて実施例1Dと同じ工程によって実施例1Hを調製する：Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の、15重量%の量で存在し、KMP-590は、5重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、0.5重量%の量で存在し、SF-1202は、5重量%の量で存在し、水は、74.5重量%の量で、存在する。

【0094】

実施例1Iの組成物の調製

以下を除いて実施例1Dと同じ工程によって実施例1Iを調製する：Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の、5重量%の量で存在し、KMP-590は、5重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、0.5重量%の量で存在し、SF-1202は、5重量%の量で存在し、水は、84.5重量%の量で、存在する。

【0095】

比較例2A～2D：水中油型エマルシヨンスキンケア組成物の比較処方

列挙された成分を列挙された比率（重量%）で含む以下の比較組成物を作製する。

【0096】

【表2】

表2

	2A	2B	2C	2D
Perfecta（登録商標）ワセリン ^a	10%	7.5%	30%	2%
KMP-590 ^b	0	0	15%	1.5%
SF-1202 ^c	0	7.5%	15%	1.5%
Pemulen（商標）TR-2 ^d	0.5%	0.5%	0.5%	0.5%
水	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた	100%まで加えた

a Perfecta（登録商標）ワセリンは、Sonneborn, Incから入手可能である。

b KMP-590は、Shin-Etsu Chemicalから入手可能なポリメチルシルセスキオキサンである。

c SF-1202は、Momentiveから入手可能なシクロペンタシロキサンである。

d Pemulen（商標）TR-2は、Lubrizolから入手可能なアクリレート／C10～30アルキルアクリレートクロスポリマーである。

【0097】

比較例2Aの組成物の調製

実施例2Aの組成物を、

a) 70℃でPerfecta（登録商標）ワセリンを加熱し、2000rpmの剪断力を適用することによってそれをPemulen（商標）TR-2と混合する工程と、

b) 2000rpmの剪断力を適用することによって工程a)で得られた組み合わせを

70℃の水と混合する工程と、

c) 工程b) で得られた組み合わせを10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして、前記組み合わせの粒径を低下させ、水中油型エマルション組成物を形成する工程と、によって調製し、

前記組成物において、Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の、10重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、0.5重量%の量で存在し、水は、89.5重量%の量で、存在する。

【0098】

比較例2Bの組成物の調製

実施例2Bの組成物を、

a) 70℃でPerfecta（登録商標）ワセリンを加熱し、2000rpmの剪断力を適用することによってそれをPemulen（商標）TR-2と混合する工程と、

b) 2000rpmの剪断力を適用することによって工程a) で得られた組み合わせを70℃の水と混合する工程と、

c) 工程b) で得られた組み合わせを10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして、前記組み合わせの粒径を低下させる工程と、

d) 工程c) で得られた組み合わせの温度が35℃未満になったら、前記組み合わせにSF-1202を添加し、混合し、次いで、混合物を10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして水中油型エマルションを形成する工程と、によって調製され、

前記組成物において、Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の7.5重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、組成物の0.5重量%の量で存在し、SF-1202は、組成物の7.5重量%の量で存在し、水は、組成物の84.5重量%の量で、存在する。

【0099】

比較例2Cの組成物の調製

実施例2Cの組成物を、

e) 70℃でPerfecta（登録商標）ワセリンとKMP-590との組み合わせを加熱し、次いで、2000rpmの剪断力を適用することによって前記組み合わせをPemulen（商標）TR-2と混合する工程；

f) 2000rpmの剪断力を適用することによって工程a) で得られた組み合わせを70℃の水と混合する工程と、

g) 工程b) で得られた組み合わせを10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして、前記組み合わせの粒径を低下させる工程と、

h) 工程c) で得られた組み合わせの温度が35℃未満になったら、前記組み合わせにSF-1202を添加し、混合し、次いで、混合物を10000rpmのTK Robomicsホモジナイザーで10分間ホモジナイズして水中油型エマルションを形成する工程と、によって調製し、

前記組成物において、Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の30重量%の量で存在し、KMP-590は、組成物の15重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、組成物の0.5重量%の量で存在し、SF-1202は、組成物の15重量%の量で存在し、水は、組成物の39.5重量%の量で、存在する。

【0100】

比較例2Dの組成物の調製

以下を除いて実施例2Cと同じ工程によって実施例2Dを調製する：Perfecta（登録商標）ワセリンは、組成物の2重量%の量で存在し、KMP-590は、組成物の1.5重量%の量で存在し、Pemulen（商標）TR-2は、組成物の0.5重量%の量で存在し、SF-1202は、組成物の1.5重量%の量で存在し、水は、組成物の94.5重量%の量で、存在する。

【0101】

実施例 1 及び 2 の比較データ

実施例 1 A、1 C、1 D、1 F～1 I、及び 2 A～2 D の組成物の閉塞性及び皮膚感覚を測定する比較実験を実施する。実験結果を表 3 に示す。

【0102】

閉塞性は、本明細書に上記したスキンケア組成物の閉塞性を決定する方法に従って測定する。閉塞性の値が 70 % しかない、ナイアシンアミドが皮膚に良好に浸透しないことに留意すべきである。

【0103】

皮膚感覚は、本明細書に上記したスキンケア組成物の皮膚感覚を決定する方法に従って測定する。実施例 2 A は、フレッシュな感触及びひっかかり感のデータを得るためのベースラインとして用いる。

【0104】

【表 3】

表 3

実施例	閉塞性(%)	フレッシュな感触	ひっかかり感
2A	90.3	0	0
1A	88.2	0.6	-1
1C	96.5	0.66	-0.77
1D	77.0	1.2	-1.4
1F	95.6	0.3	-0.4
1G	92.0	0.66	-0.88
1H	90.2	0.3	-0.4
1I	78.0	0.9	-1.1
2B	75.1	0.7	-0.7
2C	96.5	-0.2	0.5
2D	70.5	0.11	-0.22

【0105】

表 3 に示す通り、本発明に係る水中油型エマルジョンスキンケア組成物（実施例 1 A、1 C、1 D、1 F、1 G、1 H、及び 1 I）は、閉塞性に大きな影響を与えることなく好ましい皮膚感覚を示すが、一方、本発明の範囲外である比較組成物（実施例 2 B、2 C、及び 2 D）は、負の皮膚感覚又は比較的低い閉塞性を示す。具体的には、実施例 1 A は、実施例 1 A におけるシリコン粒子の量が実施例 2 B におけるシリコン油の量と同じであるにも拘わらず、実施例 2 B（75.1 %）よりも遥かに高い値の閉塞性（88.2 %）を示す。更に、実施例 2 C は、かなり高い値の閉塞性（96.5 %）を有するにも拘わらず、かなり負の皮膚感覚、すなわち、低い値のフレッシュな感触（-0.2）及び高い値のひっかかり感（0.5）を示す。対照的に、実施例 1 F は、実施例 2 C とほぼ同じ閉塞性の値（95.6 %）に加えて、正の皮膚感覚、すなわち、0.3 の値のフレッシュな感触及び -0.4 の値のひっかかり感を示す。更に、実施例 2 D は、かなり低い値の閉塞性（70.5 %）及びベースラインに近い皮膚感覚を示す。対照的に、実施例 1 I は、優れた皮膚感覚、すなわち、0.9 の値のフレッシュな感触及び -1.1 の値のひっかかり感を示すが、閉塞性の値（78.0 %）は、低過ぎない。

【0106】

全ての百分率、比率、及び割合は、特に指示がない限り、全組成物の重量を基準とする。全ての温度は、特に断らない限り、摂氏温度（℃）である。特別の定めのない限り、測定は全て 25℃で行われる。構成成分又は組成物の濃度は全て、その構成成分又は組成物の活性レベルに関するものであり、市販の供給源に存在し得る不純物、例えば、残留溶媒又は副生成物は除外される。

【0107】

本明細書の全体を通じて与えられるすべての最大の数値限定は、それよりも小さい数値限定を、そうしたより小さい数値限定があたかも本明細書に明確に記載されているものとして包含するものと理解すべきである。本明細書全体を通して記載される全ての最小数値限定は、このようなより高い数値限定が本明細書に明示的に記載されているかのように、全てのより高い数値限定を含む。本明細書全体を通して記載される全ての数値範囲は、このようなより狭い数値範囲が本明細書に明示的に記載されているかのように、このようなより広い数値範囲内の全てのより狭い数値範囲を含む。

【0108】

本明細書に開示した寸法及び値は、記載された正確な数値に厳密に限定されるものと理解されるべきではない。むしろ、特に断らないかぎり、そのような寸法のそれぞれは、記載された値及びその値の周辺の機能的に同等の範囲の両方を意味するものとする。例えば、「40 mm」として開示された寸法は、「約40 mm」を意味することを意図する。

【0109】

相互参照されるか又は関連する全ての特許又は特許出願を含む、本願に引用される全ての文書を、特に除外すること又は限定することを明言しない限りにおいて、その全容にわたって本願に援用するものである。いずれの文献の引用も、こうした文献が本願で開示又は特許請求される全ての発明に対する先行技術であることを容認するものではなく、また、こうした文献が、単独で、あるいは他の全ての参照文献とのあらゆる組み合わせにおいて、こうした発明のいずれかを参照、教示、示唆又は開示していることを容認するものでもない。更に、本文書において、用語の任意の意味又は定義の範囲が、参考として組み込まれた文書中の同様の用語の任意の意味又は定義と矛盾する場合には、本文書中で用語に割り当てられる意味又は定義に準拠するものとする。

【0110】

本発明の特定の実施形態が例示され記載されてきたが、本発明の趣旨及び範囲から逸脱することなく他の様々な変更及び修正を実施できることが、当業者には自明であろう。したがって、本発明の範囲内にあるそのようなすべての変更及び修正を添付の特許請求の範囲で扱うものとする。

10

20

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2013/039354

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. A61K8/31 A61Q19/00 A61K8/891 A61K8/02 A61K8/06
ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 2003/113357 A1 (BELL MICHAEL DAVID [GB] ET AL) 19 June 2003 (2003-06-19) paragraphs [0099] - [0102], [0045], [0001], [0004], [0009], [0064], [0030], [0072] examples II, IV, V -----	1-19

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

17 July 2014

Date of mailing of the international search report

25/07/2014

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Verrucci, Marinella

Information on patent family members

PCT/US2013/039354

フロントページの続き

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC

(72)発明者 ナオヒサ ヨシミ

シンガポール 1 3 8 6 4 8 シンガポール イムノス ナンバー 0 2 - 1 2 バイオメディカル
グローブ 8 エー ピーアンドジー インターナショナル オペレーションズ エスエー シン
ガポール ブランチ エスジーアイシー

Fターム(参考) 4C083 AB051 AC011 AC012 AC021 AC301 AC471 AC841 AC851 AC852 AD021
AD091 AD092 AD151 AD152 AD172 AD191 AD391 AD411 AD491 AD531
AD631 BB01 CC05 DD33 EE03 EE06 FF05