(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号

特許第4156802号
(P4156802)

(45)発行日　平成20年9月24日(2008.9.24)　(24)登録日　平成20年7月18日(2008.7.18)

(51)Int.Cl.　　F I
A61K 8/49 (2006.01)　　A61K 8/49
A61K 8/42 (2006.01)　　A61K 8/42
A61Q 17/04 (2006.01)　　A61Q 17/04

請求項の数 3　(全 28 頁)

(21)出願番号　特願2000-555582 (P2000-555582)
(86)(22)出願日　平成11年6月10日 (1999.6.10)
(65)公表番号　特表2002-518428 (P2002-518428A)
(43)公表日　平成14年6月25日 (2002.6.25)
(86)国際出願番号　PCT/EP1999/004008
(87)国際公開番号　WO1999/066896
(87)国際公開日　平成11年12月29日 (1999.12.29)
審査請求日　平成18年6月7日 (2006.6.7)
(31)優先権主張番号　98810571.4
(32)優先日　平成10年6月22日 (1998.6.22)
(33)優先権主張国　欧州特許庁 (EP)

(73)特許権者　396023948
チバ　ホールディング　インコーポレーテッド
Ｃｉｂａ　Ｈｏｌｄｉｎｇ　Ｉｎｃ.
スイス国，４０５７　バーゼル，クリベツクシュトラーセ　１４１
(74)代理人　100078662
弁理士　津国　肇
(74)代理人　100075225
弁理士　篠田　文雄
(72)発明者　ルター，ヘルムート
ドイツ国　デー－７９６３９　グレンツァハ－ヴィーレン　テュリンガーヴェーク　３アー

最終頁に続く

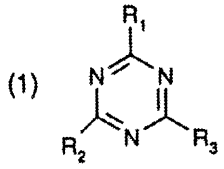
(54)【発明の名称】日焼け止め配合物

(57)【特許請求の範囲】
【請求項１】
（ａ）微粉化された不溶性有機ＵＶ吸収剤；及び
（ｂ）化粧品的に許容し得るキャリヤ
を含み、該微粉化された不溶性有機ＵＶ吸収剤が配合物の油相中に存在する日焼け止め配合物の調製方法であって、
（ｉ）第一工程で、該有機ＵＶ吸収剤を水性懸濁液として微粉化し、第二工程で、該微粉化された有機ＵＶ吸収剤を日焼け止め組成物の油相と混合し、最終工程で、配合物を少なくとも３週間貯蔵する工程、又は
（ｉｉ）第一工程で、該有機ＵＶ吸収剤を水性懸濁液として微粉化し、第二工程で、該微粉化された有機ＵＶ吸収剤を日焼け止め組成物の油相と混合し、最終工程で、水相から水を除去する工程
を含む方法。
【請求項２】
該微粉化された有機ＵＶ吸収剤が、トリアジン類、ベンゾトリアゾール類、ビニル基含有アミド、ケイ皮酸アミド又はスルホン化ベンズイミダゾールから選択される、請求項１記載の方法。
【請求項３】
請求項１又は２記載の方法によって調製される、日焼け止め配合物。
【発明の詳細な説明】

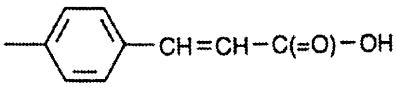
【０００１】
【発明の属する技術分野】
本発明は、新規な配合物に関し、特に、微粉化ＵＶ吸収剤を含み、その微粉化ＵＶ吸収剤が該配合物の油相中に存在する、新規なＵＶ保護配合物に関する。
【０００２】
【従来の技術】
地表に到達するＵＶ線への長期間の暴露が紅斑又は光線皮膚症並びに皮膚ガン発生率の増大又は皮膚老化の促進につながることは長らく知られている。
【０００３】
ＵＶ線に対抗し、それにより、皮膚に対する望ましくない影響を阻止することを意図する物質を含む種々の日焼け止め配合物が提案されている。
【０００４】
数多くの化合物、特に可溶性有機ＵＶ吸収剤及び不溶性微粉化無機化合物、特に酸化亜鉛及び二酸化チタンが、日焼け止め配合物におけるＵＶ保護剤としての使用に提案されている。
【０００５】
これらは、日焼け止め配合物における可溶性有機ＵＶ吸収剤の使用に関して、日焼け止め配合物における、ＳＰＦ（Sun Protection Factor:太陽光保護係数）で表されるＵＶ保護剤としての有効性が商業的目的にとってはしばしば低すぎ；それらの可溶性の結果として、比較的高いアレルゲン誘発性を示し；本来的な光化学的不安定性の結果として、保護効果の期間がしばしば短すぎるという欠点を抱えている。
【０００６】
不溶性無機化合物、例えば二酸化チタンの高い比重量は、それらを含有する配合物の安定性の低下につながる。その上、そのような無機化合物は、光と水の影響下で毒性のあるラジカルを生成すると論じられている（「Redox Mechanisms in Heterogeneous Photocatalysis」Serpone et al, Electrochemistry in Colloids and Dispersions, Editors Mackay and Texter, VCH Publishers Inc., New York 1992）。
【０００７】
ＧＢ－Ａ－２３０３５４９には、微粉化不溶性有機ＵＶ吸収剤を製造する方法並びにａ）全組成基準で、０．１～１５重量％、好ましくは０．５～１０重量％の、該方法によって製造される不溶性有機ＵＶ吸収剤の微粉化配合物と、場合によってはｂ）化粧品的に許容し得るキャリヤとを含む日焼け止め組成物が記載されている。
【０００８】
このようにして得られた微粉化不溶性有機ＵＶ吸収剤は、日焼け止め配合物に使用されると、優れたＵＶ保護を提供し、既知の無機ＵＶ吸収剤を含有する対応する日焼け止め配合物と少なくとも同じ高さのＳＰＦレーティングを示す。後者のＵＶ吸収剤とは異なり、微粉化不溶性有機ＵＶ吸収剤は、光の影響下で、人の皮膚を損傷又は感化させるおそれのあるラジカルを生成する傾向を示さない。
【０００９】
【発明が解決しようとする課題】
ＧＢ－Ａ－２３０３５４９に開示された概念の更なる展開において、今、日焼け止め配合物の油相中に存在する微粉化不溶性有機ＵＶ吸収剤が、驚くべきことに、日焼け保護において有意な改善を示すことが見いだされた。
【００１０】
【課題を解決するための手段】
したがって、本発明は、第一の態様として、
（ａ）微粉化有機ＵＶ吸収剤；及び
（ｂ）化粧品的に許容し得るキャリヤ
を含み、微粉化有機ＵＶ吸収剤が配合物の油相中に存在する、医薬品又は化粧品用途における使用に特に適した日焼け止め配合物を提供する。

【００１１】
微粉化有機ＵＶ吸収剤である成分（ａ）は、好ましくは、ＧＢ－Ａ－２３０３５４９に記載された方法、すなわち、粗粒形態の有機ＵＶ吸収剤を、粉砕装置中、微粉化有機ＵＶ吸収剤基準で１～５０重量％、好ましくは５～４０重量％の、式：$C_nH_{2n+1}O(C_6H_{10}O_5)_xH$（式中、ｎは、８～１６の整数であり、ｘはグルコシド基（$C_6H_{10}O_5$）の平均重合度であり、１．４～１．６の範囲である）で示されるアルキルポリグルコシド又はそのエステルの存在下で粉砕することを含む方法によって製造される。
【００１２】
微粉化有機ＵＶ吸収剤を製造するのに使用される粉砕装置は、例えば、ジェットミル、ボールミル、振動ミル又はハンマーミル、好ましくは高速攪拌ミル又はインパクトミル、特に回転ボールミル、振動ミル、チューブミル又はロッドミルであることができる。
【００１３】
アルキルポリグルコシドは、式：$C_nH_{2n+1}O(C_6H_{10}O_5)_xH$の化合物の$C_1$～$C_{12}$エステル、すなわち、$C_1$～$C_{12}$酸、例えばギ酸、酢酸、プロピオン酸、酪酸、スルホコハク酸、クエン酸又は酒石酸をグルコシド基（$C_6H_{10}O_5$）の１個以上の遊離ＯＨ基と反応させることによって形成されるエステルからなることができる。
【００１４】
微粉化有機ＵＶ吸収剤は、種々の方法で油相中に配合することができる。
【００１５】
好ましい配合方法では、微粉化有機ＵＶ吸収剤を粉末として配合することができる。このために、微粉化有機ＵＶ吸収剤を、既知の粉化処理、例えば溶剤（沈降）分離（solvent precipitation）、溶剤からの真空噴霧（vaccum spraying）などに付すことができる。これらの粉体は、０．１nm～２μmの粒径を有する。凝集を防ぐため、粉化の前に、微粉化有機ＵＶ吸収剤を界面活性剤、例えば非イオン性、アニオン性、カチオン性若しくは両性の界面活性剤、例えばリン脂質又は既知のポリマー、例えばＰＶＰ、アクリレートなどで被覆してもよい。
【００１６】
例えば、水溶性界面活性剤又は乳化剤を、微粉化有機ＵＶ吸収剤の水性懸濁液に加える。そして、該混合物を噴霧乾燥させる。噴霧乾燥処理の間に、界面活性剤又は乳化剤は、薄膜の形態で該微小粒子を包み込み、凝集を阻止するか、又は油相中での所望の粒径への再分散を容易にする。
【００１７】
もう一つの好ましい方法では、日焼け止め配合物を調製する間に微粉化有機ＵＶ吸収剤を油相に移すことができる。水性粉砕によって製造した微粉化有機ＵＶ吸収剤を日焼け止め配合物の油相と混合する時、水を既知の方法、例えば真空除去（vaccum removal）によって除去する。この手段により、微粉化有機ＵＶ吸収剤が配合物の油相に移される。
【００１８】
更には、日焼け止め組成物の水相中に存在する微粉化有機ＵＶ吸収剤が、数日又は数週間後に油相に移動することが観察された。
【００１９】
したがって、本発明のもう一つの態様は、第一工程で、有機ＵＶ吸収剤を水性懸濁液として微粉化し、第二工程で、微粉化有機ＵＶ吸収剤を日焼け止め組成物の油相と混合し、最終工程で、該配合物を少なくとも３週間貯蔵することにより、日焼け止め組成物を調製する方法に関する。
【００２０】
適当な有機ＵＶ吸収剤は、例えば、トリアジン類、ベンゾトリアゾール類、ビニル基含有アミド、ケイ皮酸アミド又はスルホン化ベンズイミダゾールＵＶ吸収剤であることができる。
【００２１】
トリアジン化合物の好ましいクラスは、式（１）

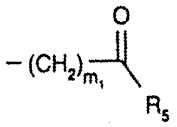
【００２２】
【化２５】



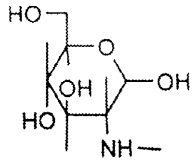
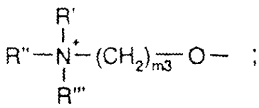
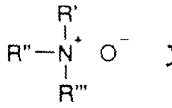
【００２３】
で示されるものである。
【００２４】
式中、R_1、R_2及びR_3は、独立して、Ｈ；ＯＨ；C_1～C_3アルコキシ；NH_2；ＮＨ－R_4；Ｎ（R_4）$_2$；ＯR_4（R_4は、C_1～C_3アルキルである）；フェニル；フェノキシ；アニリノ；ピロロであり、各フェニル、フェノキシ若しくはアニリノ又はピロロ基は、非置換であるか、或いはＯＨ、カルボキシ、ＣＯ－NH_2、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、メチリデンカンファー基、基：－（ＣＨ＝ＣＨ）$_m$Ｃ（＝Ｏ）－ＯR_4、基：
【００２５】
【化２６】

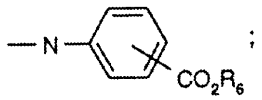


【００２６】
又は対応するアルカリ金属、アンモニウム、モノ、ジ若しくはトリ－C_1～C_4アルキルアンモニウム、モノ、ジ若しくはトリ－C_2～C_4アルカノールアンモニウムの塩類、又はそれらのC_1～C_3アルキルエステル、式（１ａ）
【００２７】
【化２７】

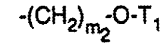


【００２８】
の基から選択される１、２又は３個の置換基によって置換されており；
R_5は、ヒドロキシ；非置換であるか、又は１個以上のＯＨ基によって置換されているC_1～C_5アルキル；C_1～C_5アルコキシ；アミノ；モノ若しくはジ－C_1～C_5アルキルアミノ；Ｍ；式（１ｂ）；（１ｃ）；（１ｄ）；又は（１ｅ）
【００２９】
【化２８】

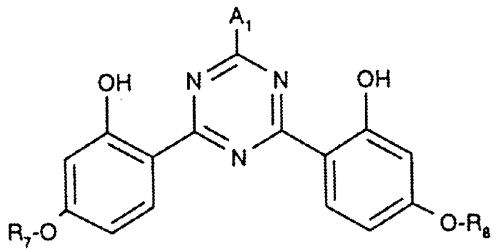
(1b)  ;(1c)  ;(1d)  又は

(1e)  ;

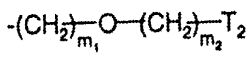
【００３０】
の基であり；
Ｒ′、Ｒ″及びＲ′′′は、互いに独立して、非置換であるか、又は１個以上のＯＨ基によって置換されている$Ｃ_{1}$～$Ｃ_{14}$アルキルであり；
$Ｒ_{6}$は、水素；Ｍ；$Ｃ_{1}$～$Ｃ_{5}$アルキル；又は式
【００３１】
【化２９】



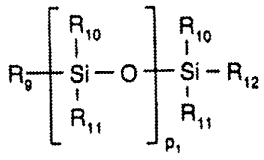
【００３２】
の基であり、
Ｍは、金属カチオンであり；
$Ｔ_{1}$は、水素；又は$Ｃ_{1}$～$Ｃ_{8}$アルキルであり；
ｍは、０又は１であり；
$ｍ_{1}$は、１～５であり；
$ｍ_{2}$は、１～４であり；
$ｍ_{3}$は、２～１４である。
【００３３】
式（１）の好ましい化合物は、式（２）
【００３４】
【化３０】

(2) 

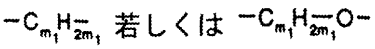
【００３５】
で示される化合物である。
【００３６】
式中、
$Ｒ_{7}$及び$Ｒ_{8}$は、互いに独立して、$Ｃ_{1}$～$Ｃ_{18}$アルキル；$Ｃ_{2}$～$Ｃ_{18}$アルケニル；式：－$ＣＨ_{2}$－ＣＨ（－ＯＨ）－$ＣＨ_{2}$－Ｏ－$Ｔ_{1}$の基；又は式
【００３７】
【化３１】



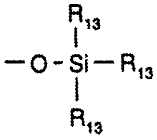
【００３８】
の基；式（２ａ）
【００３９】
【化３２】

(2a) 

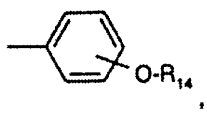
【００４０】
の基であり；
R_9は、直接結合；直鎖状又は分岐鎖状のC_1～C_4アルキレン基又は式
【００４１】
【化３３】

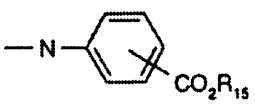


【００４２】
の基であり；
R_{10}、R_{11}及びR_{12}は、互いに独立して、C_1～C_{18}アルキル；C_1～C_{18}アルコキシ又は式
【００４３】
【化３４】

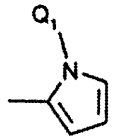


【００４４】
の基であり；
R_{13}は、C_1～C_5アルキルであり；
T_1は、水素；又はC_1～C_8アルキルであり；
m_1、m_2及びm_3は、互いに独立して、１～４であり；
p_1は、０又は１～５の数であり；
A_1は、式（２ｂ），（２ｃ）又は（２ｄ）
【００４５】
【化３５】

(2b) 

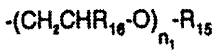
(2c) 

又は

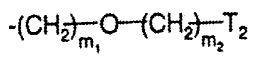
(2d) 

【００４６】

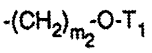
の基であり；
R_{14}は、水素；C_1～C_{10}アルキル；
【００４７】
【化３６】



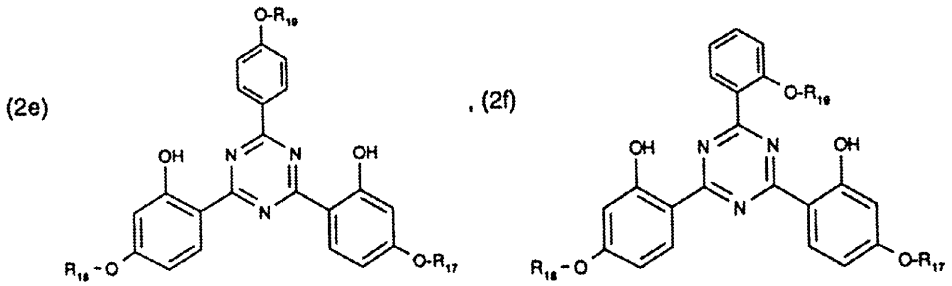
【００４８】
；－CH_2－CH（－OH）－CH_2－O－T_1；又は式
【００４９】
【化３７】



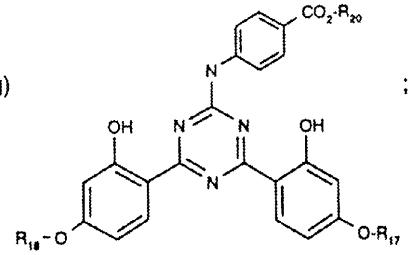
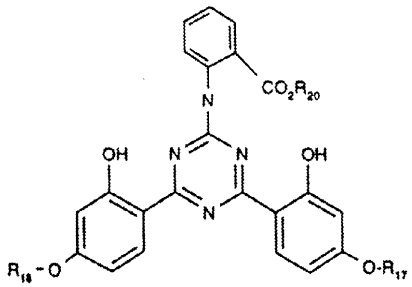
【００５０】
の基であり；
R_{15}は、水素；M；C_1～C_5アルキル；又は式
【００５１】
【化３８】



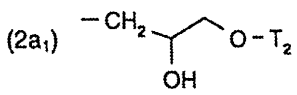
【００５２】
の基であり；
R_{16}は、水素；又はメチルであり；
Q_1は、C_1～C_{18}アルキルであり；
Mは、金属カチオンであり；
n_1は、１～１６である。
【００５３】
式（２）の好ましい化合物は、式（２ｅ）；（２ｆ）
【００５４】
【化３９】



【００５５】
；式（２ｇ）；（２ｈ）
【００５６】
【化４０】

(2g)  ; (2h) 

【００５７】
の化合物である。
【００５８】
式中、
R_{17}及びR_{18}は、互いに独立して、C_3～C_{18}アルキル；又は－CH_2－CH（－OH）－CH_2－O－T_1であり；
R_{19}は、C_1～C_{10}アルキル又は式（２a_1）
【００５９】
【化４１】

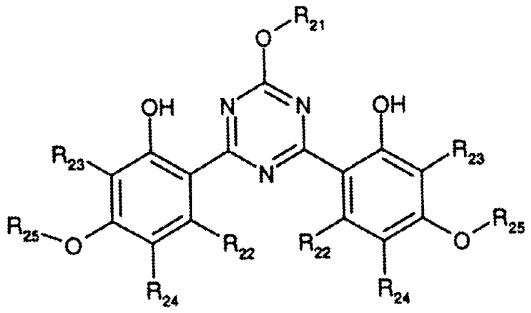
(2a1) 

【００６０】
若しくは式（２a_2）
【００６１】
【化４２】

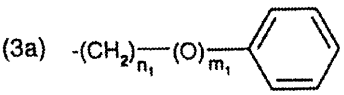
(2a2) 

【００６２】
の基であり；
R_{20}は、水素；M；C_1～C_5アルキル；－NH－C_1～C_5アルキル、好ましくは－NH－tert－アルキル；又は式：－（CH_2）$_m$－O－T_2の基であり；
T_1及びT_2は、互いに独立して、水素；又はC_1～C_5アルキルであり；
mは、１～４である。
【００６３】
最高に当てはまるものは、
R_{17}及びR_{18}が、互いに独立して、C_3～C_{18}アルキル；又は－CH_2－CH（－OH）－CH_2－O－T_1であり；
R_{19}がC_1～C_{10}アルキルである、式（２ｅ）及び（２ｆ）の化合物並びに
R_{17}及びR_{18}が、互いに独立して、C_3～C_{18}アルキル；又は－CH_2－CH（－OH）－CH_2－O－T_1であり；
T_1が水素；又はC_1～C_5アルキルである、式（２ｇ）及び（２ｈ）の化合物である。
【００６４】
この場合に非常に特に好ましいものは、R_{17}とR_{18}とが同じ意味である式（２ｅ）～（２ｈ）のトリアジン化合物である。
【００６５】
更には、興味深いトリアジン類は、式（３）
【００６６】

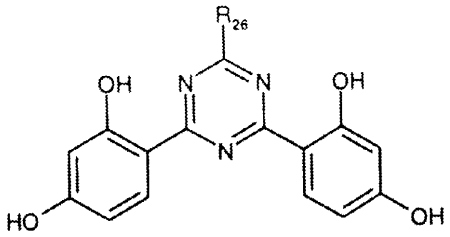
【化４３】

(3) 

【００６７】
に対応する。
【００６８】
式中、
R_{21}は、C_1～C_{30}アルキル；C_2～C_{30}アルケニル；非置換であるか、又はC_1～C_5アルキルで一若しくは多置換されているC_5～C_{12}シクロアルキル、C_1～C_5アルコキシ－C_1～C_{12}アルキル；アミノ－C_1～C_{12}アルキル；C_1～C_5モノアルキルアミノ－C_1～C_{12}アルキル；C_1～C_5ジアルキルアミノ－C_1～C_{12}アルキル；式（３ａ）；又は（３ｂ）
【００６９】
【化４４】

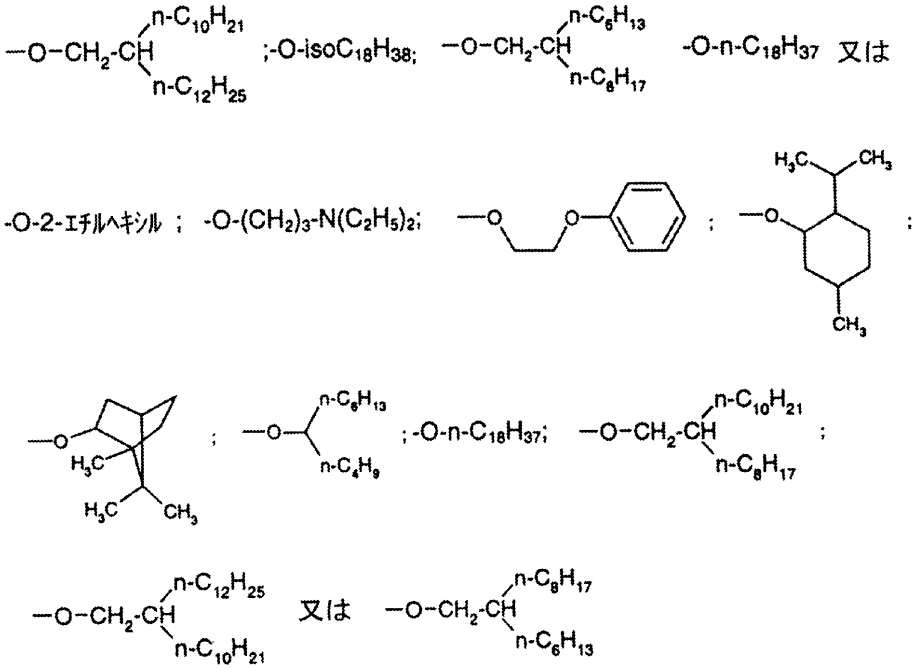
(3a)  又は (3b) 

【００７０】
の基であり；
R_{22}、R_{23}及びR_{24}は、互いに独立して、水素、ヒドロキシル、C_1～C_{30}アルキル、C_2～C_{30}アルケニルであり；
R_{25}は、水素；又はC_1～C_5アルキルであり；
m_1は、０又は１であり；
n_1は、１～５である。
【００７１】
好ましい化合物は、式（４）
【００７２】
【化４５】

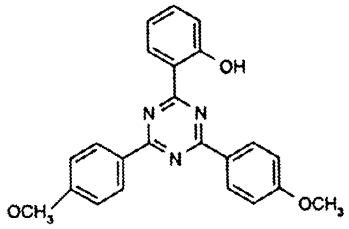
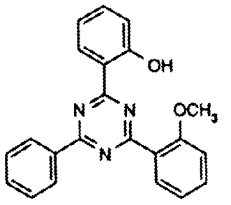
(4) 

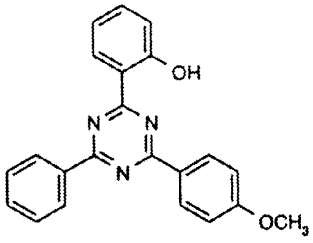
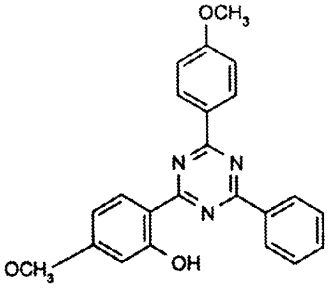
【００７３】
に対応する。
【００７４】
式中、
R_{26}は、

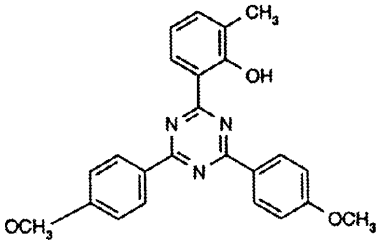
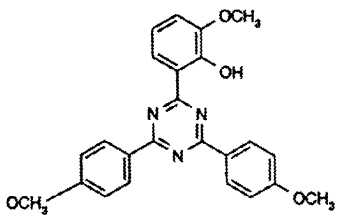
【００７５】
【化４６】

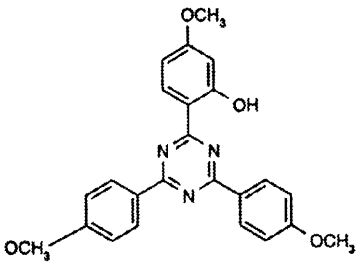
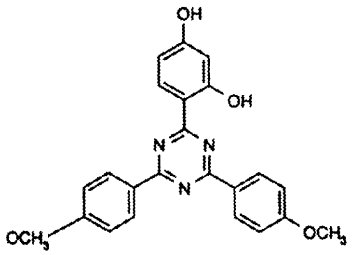


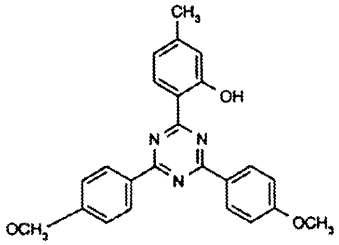
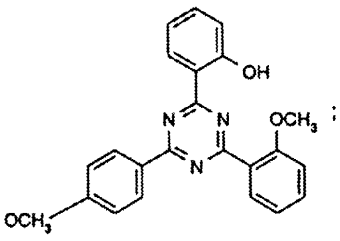
【００７６】
である。
【００７７】
式（１）の更に好ましい化合物は、式（５）～（２４）
【００７８】
【化４７】

(5)  ; (6)  ;

(7)  ; (8)  ;

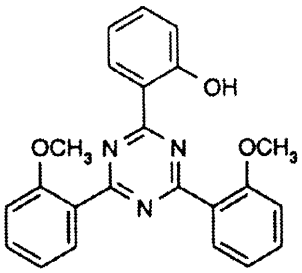
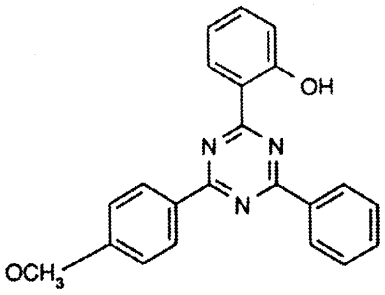
(9)  ; (10)  ;

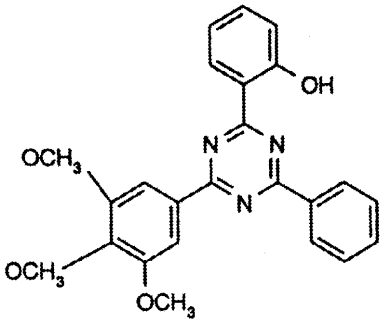
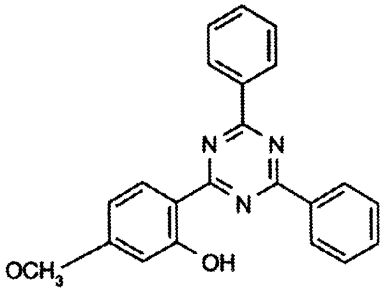
(11)  ; (12)  ;

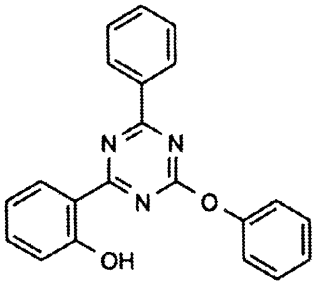
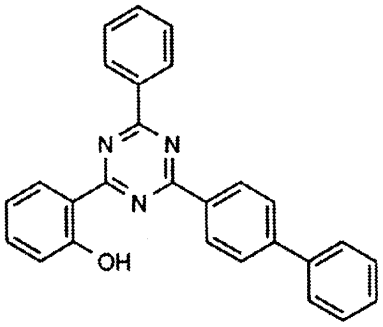
(13)  ; (14)  ;

【００７９】

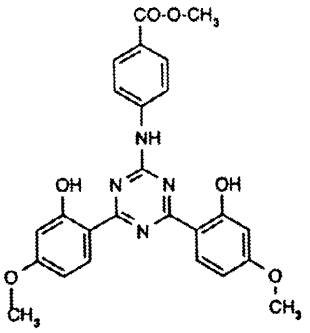
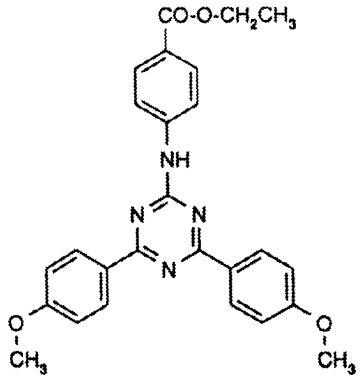
【化４８】

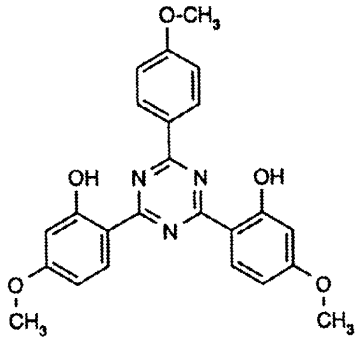
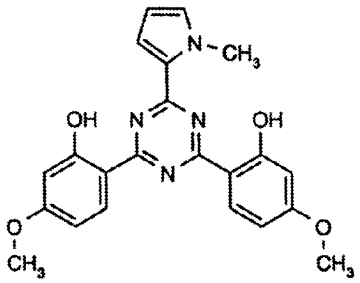
(15)  ; (16)  ;

(17)  ; (18)  ;

(19)  ; (20)  ;

【００８０】
【化４９】

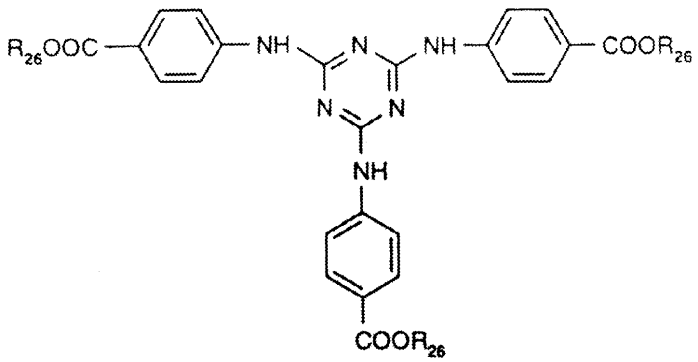
(21)  ;(22)  ;

(23)  及び (24) 

【００８１】
のいずれかで示される化合物並びに２，４，６－トリス（ジイソブチル－４′－アミノベンザルマロネート）－ｓ－トリアジン及び２，４－ビス（ジイソブチル－４－アミノベンザルマロネート）－６－（４′－アミノベンジリデンカンファー）－ｓ－トリアジンである。

【００８２】
式（１）の特に好ましい化合物は、式（２５）

【００８３】
【化５０】

(25) 

【００８４】
で示される化合物である。

【００８５】
式中、個々の基R_{26}は、同じであるか又は異なり、それぞれが、水素；アルカリ金属；アンモニウム基：$N(R_{27})_4$（R_{27}は、水素又は有機基である）；C_1～C_3アルキル；又は１～１０個のエチレンオキシド単位を含み、末端ＯＨ基がC_1～C_3アルコールによってエーテル化されていてもよいポリオキシエチレン基である。

【００８６】

式（２５）の化合物に関連して、R_{26}がアルカリ金属である時、それは、好ましくはカリウム又は特にナトリウムであり；R_{26}が基：$N(R_{27})_4$（R_{27}は、前記の意味である）である時、それは、好ましくはモノ、ジ若しくはトリ－C_1～C_4アルキルアンモニウム塩、モノ、ジ若しくはトリ－C_2～C_4アルカノールアンモニウム塩又はそのC_1～C_3アルキルエステルであり；R_{27}がC_1～C_3アルキル基である時、それは、好ましくはC_1～C_2アルキル基、より好ましくはメチル基であり；R_{27}がポリオキシエチレン基である時、それは、好ましくは２～６個のエチレンオキシド単位を含む。

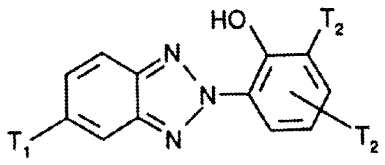
【００８７】

トリアゾール微粉化有機ＵＶ吸収剤の一つの好ましいクラスは、式（２６）

【００８８】

【化５１】

(26)



【００８９】

で示されるものである。

【００９０】

式中、T_1は、C_1～C_3アルキル又は好ましくは水素であり；T_2は、C_1～C_4アルキル、好ましくはtert－ブチル、又はフェニル、好ましくはα，α－ジメチルベンジルによって置換されているC_1～C_4アルキルである。

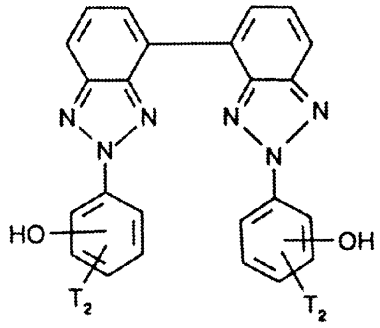
【００９１】

トリアゾール微粉化有機ＵＶ吸収剤の更に好ましいクラスは、式（２７）

【００９２】

【化５２】

(27)



【００９３】

で示されるものである。

【００９４】

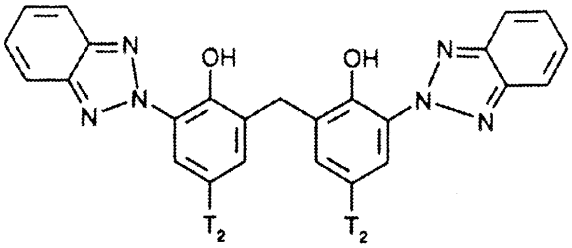
式中、T_2は、前記の意味である。

【００９５】

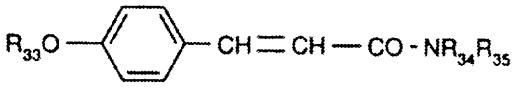
トリアゾール微粉化有機ＵＶ吸収剤のなお更好ましいクラスは、式（２８）

【００９６】

【化５３】

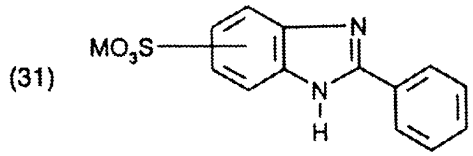
(28) 

【００９７】
で示されるものである。
【００９８】
式中、T_2は、水素、C_1～C_{12}アルキル、好ましくはtert－ブチル、又はフェニル、好ましくはα，α－ジメチルベンジルによって置換されているC_1～C_4アルキルである。
【００９９】
ビニル基含有アミド微粉化有機ＵＶ吸収剤の好ましいクラスは、式（２９）
（２９）　R_{28}－（Ｙ）$_m$－ＣＯ－Ｃ（R_{29}）＝Ｃ（R_{30}）－Ｎ（R_{31}）（R_{32}）
で示されるものである。
【０１００】
式中、
R_{28}は、C_1～C_3アルキル、好ましくはC_1～C_2アルキル、又は場合によってはＯＨ、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ若しくは$CO-OR_{33}$から選択される１、２又は３個の置換基によって置換されているフェニルであり；
R_{33}は、C_1～C_3アルキルであり；
R_{29}、R_{30}、R_{31}及びR_{32}は、同じであるか又は異なり、それぞれが、C_1～C_3アルキル、好ましくはC_1～C_2アルキル又は水素であり；
Ｙは、－ＮＨ－又は－Ｏ－であり；
ｍは、０又は１である。
【０１０１】
式（２９）の好ましい化合物は、４－メチル－３－ペンテン－２－オン、エチル－３－メチルアミノ－２－ブテノエート、３－メチルアミノ－１－フェニル－２－ブテン－１－オン及び３－メチルアミノ－１－フェニル－２－ブテン－１－オンである。
【０１０２】
ケイ皮酸アミド微粉化有機ＵＶ吸収剤の好ましいクラスは、式（３０）
【０１０３】
【化５４】

(30) 

【０１０４】
で示されるものである。
【０１０５】
式中、
R_{33}は、ヒドロキシ又はC_1～C_4アルコキシ、好ましくはメトキシ若しくはエトキシであり；
R_{34}は、水素又はC_1～C_4アルキル、好ましくはメチル若しくはエチルであり；
R_{35}は、－（ＣＯＮＨ）$_m$－フェニル（ｍは、０又は１であり、フェニル基は、場合によっては、ＯＨ、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ又は$CO-OR_4$（R_4は、C_1～C_4アルキルである）から選択される１、２又は３個の置換基によって置換されている）である。

【０１０６】
好ましくは、R_{35}は、フェニル、４－メトキシフェニル又はフェニルアミノカルボニル基である。
【０１０７】
スルホン化ベンズイミダゾール微粉化有機ＵＶ吸収剤の好ましいクラスは、式（３１）
【０１０８】
【化５５】



【０１０９】
で示されるものである。
【０１１０】
式中、
Ｍは、水素又はアルカリ金属、好ましくはナトリウム、アルカリ土類金属、例えばマグネシウム若しくはカルシウム、又は亜鉛である。
【０１１１】
本発明に使用される微粉化又は超微粉砕性ＵＶ吸収剤の更に好ましいクラス：
ｐ－アミノ安息香酸誘導体、典型的には２－エチルヘキシル－４－ジメチルアミノベンゾエート；
サリチル酸誘導体、典型的には２－エチルヘキシルサリチレート；ホモサレート；及びイソプロピルシリチレート；
ベンゾフェノン誘導体、典型的には２－ヒドロキシ－４－メトキシベンゾフェノン；
ジベンゾイルメタン誘導体、典型的には１－（４－tert－ブチルフェニル）－３－（４－メトキシフェニル）－プロパン－１，３－ジオン；
ジフェニルアクリレート、典型的には２－エチルヘキシル－２－シアノ－３，３－ジフェニルアクリレート及び３－（ベンゾフラニル）－２－シアノアクリレート；
３－イミダゾル－４－イル－アクリル酸及び３－イミダゾル－４－イル－アクリレート；
ベンゾフラン誘導体、好ましくは、ＥＰ－Ａ－５８２，１８９、ＵＳ－Ａ－５３３８５３９、ＵＳ－Ａ－５５１８７１３及びＥＰ－Ａ－６１３８９３に開示されている２－（ｐ－アミノフェニル）ベンゾフラン誘導体；
ポリマーＵＶ吸収剤、例えば、とりわけＥＰＡ－７０９０８０に記載されているベンジリデンマロネート誘導体；
ケイ皮酸誘導体、典型的には、とりわけＵＳ－Ａ－５６０１８１１及びＷＯ９７／００８５１に開示されている２－エチルヘキシル－４－メトキシシンナメート若しくはイソアミレート又はケイ皮酸誘導体；
ショウノウ誘導体、典型的には３－（４′－メチル）ベンジリデンボルナン－２－オン、３－ベンジリデン－ボルナン－２－オン、Ｎ－〔２（及び４）－２－オキシボルン－３－イリデンメチル）ベンジル〕アクリルアミドポリマー、３－（４′－トリメチルアンモニウム）ベンジリデンボルナン－２－オンメチルスルフェート、３，３′－（１，４－フェニレンジメチン）－ビス（７，７－ジメチル－２－オキソビシクロ－〔２．２．１〕ヘプタン－１－メタンスルホン酸）及びそれらの塩、３－（４′－スルホ）ベンジリデンボルナン－２－オン及びそれらの塩；
２－フェニルベンズイミダゾール－５－スルホン酸及びそれらの塩；並びに
メンチル－ｏ－アミノベンゾエート。
【０１１２】
式（１）～（３０）の化合物では、C_1～C_{12}アルキル基は、メチル、エチル、ｎ－プロ

ピル又はイソプロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、イソオクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシルであることができ、メチルが好ましく、そしてC$_1$～C$_3$アルコキシ基は、メトキシ、エトキシ、プロポキシ及びイソプロポキシを含み、メトキシ及びエトキシが好ましい。

【０１１３】

C$_2$～C$_4$カルボキシアルキルは、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル及びカルボキシイソプロピルを含み、カルボキシメチルが好ましい。

【０１１４】

C$_5$～C$_8$シクロアルキルは、シクロペンチル、シクロヘキシル及びシクロオクチルを含む。

【０１１５】

式（１）～（３０）の化合物は既知である。

【０１１６】

好ましくは、新規な日焼け止め剤の成分（ａ）である微粉化有機ＵＶ吸収剤は、０．０１～２μｍ、より好ましくは０．０２～１．５μｍ、特に好ましくは０．０５～１．０μｍの平均粒径を有している。

【０１１７】

日焼け止め配合物は又、微粉化されていない油溶性有機ＵＶ吸収剤をオプション成分として含むことができる。これは、いかなる既知の油溶性有機ＵＶ吸収剤、特に化粧品用に既に認められ、販売されているものであることができる。このような油溶性有機ＵＶ吸収剤は、例えば"Sunscreens", Development, Evaluation and Regulatory Aspects, Eds.: N. J. Lowe and N. A. Shaath, M. Dekker Inc., New York and Basel, 1990；及びKen Klein, Encyclopedia of UV absorbers for sunscreen products, Cosmetics & Toiletries 107 45-64(1992)に記載されている。

【０１１８】

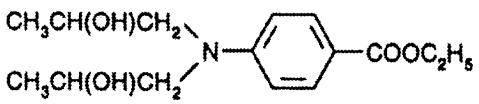
油溶性で非微粉化ＵＶ吸収剤は、例えば、ｐ－アミノ安息香酸誘導体、例えばｐ－アミノ安息香酸のエステル、塩又はアミン改質誘導体；サリチル酸誘導体、例えばそのエステル又は塩；ベンゾフェノン誘導体；ジベンゾイルメタン誘導体；ジフェニルアクリレート誘導体；ベンゾフラン誘導体；１個以上のシリコ有機残基を含有するポリマーＵＶ吸収剤；ケイ皮酸のエステル；ショウノウ誘導体；フェニルベンズイミダゾールスルホン酸及びその塩；ウロカニン酸（３－イミダゾル－４－イル－アクリル酸）又はそのエチルエステル；或いはアメンチルアントラニレートであることができる。

【０１１９】

ｐ－アミノ安息香酸誘導体の具体例は、４－アミノ安息香酸（ＰＡＢＡ）、式

【０１２０】

【化５６】

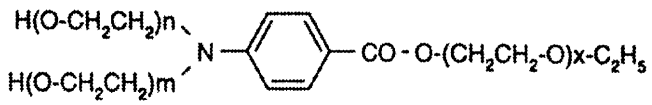


【０１２１】

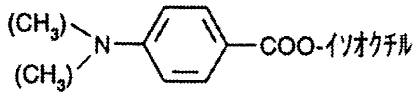
で示されるエチルジヒドロキシプロピルＰＡＢＡ、式

【０１２２】

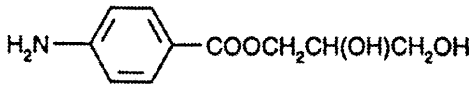
【化５７】



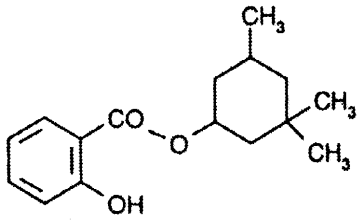
【０１２３】
（式中、ｍ、ｎ及びｘは、同じであり、それぞれ約２５である）
で示されるＰＥＧ－２５　ＰＡＢＡ、式
【０１２４】
【化５８】



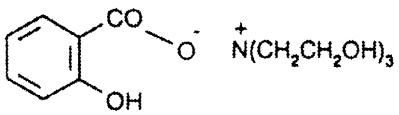
【０１２５】
で示されるオクチルジメチルＰＡＢＡ及び式
【０１２６】
【化５９】



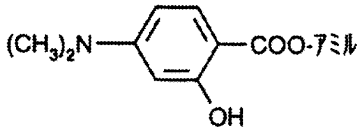
【０１２７】
で示されるグリセリルアミノベンゾエートを含む。
【０１２８】
サリチル酸誘導体の具体例は、式
【０１２９】
【化６０】



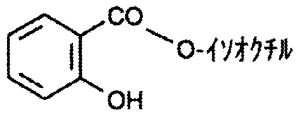
【０１３０】
で示されるホモサレート（ホモメンチルサリチレート）、式
【０１３１】
【化６１】



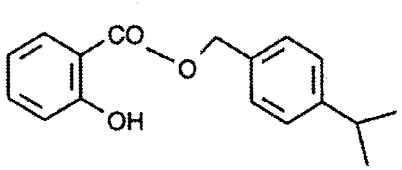
【０１３２】
で示されるトリエタノールアミンサリチレート、式
【０１３３】
【化６２】



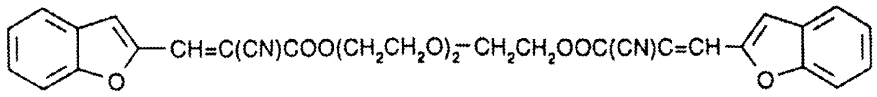
【０１３４】
で示されるアミル　ｐ－ジメチルアミノベンゾエート、式
【０１３５】
【化６３】



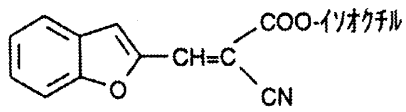
【０１３６】
で示されるオクチルサリチレート、式
【０１３７】
【化６４】



【０１３８】
で示される４－イソプロピルベンジルサリチレートを含む。
【０１３９】
ベンゾフェノン誘導体の具体例は、ベンゾフェノン－３－（２－ヒドロキシ－４－メトキシベンゾフェノン）、ベンゾフェノン－４（２－ヒドロキシ－４－メトキシベンゾフェノン－５－スルホン酸）及びベンゾフェノン－８－（２，２′－ジヒドロキシ－４－メトキシベンゾフェノン）を含む。
【０１４０】
ジベンゾイルメタン誘導体の具体例は、ブチルメトキシジベンゾイルメタン〔１－（４－tert－ブチル）－３－（４－メトキシフェニル）プロパン－１，３－ジオン〕である。
【０１４１】
ジフェニルアクリレート誘導体の具体例は、オクトクリレン（２－エチルヘキシル－２－シアノ－３，３′－ジフェニルアクリレート）及びエトクリレン（エチル－２－シアノ－３，３′－ジフェニルアクリレート）である。
【０１４２】
ベンゾフラン誘導体の具体例は、ＵＳ５３３８５３９又はＥＰ５８２１８９に記載されている３－（ベンゾフラニル）－２－シアノアクリレート、特に、式
【０１４３】
【化６５】



；

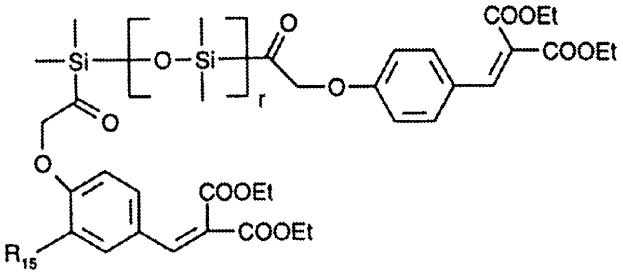


【０１４４】
で示される化合物、ＵＳ５５１８７１３に記載されている２－（２－ベンゾフラニル）－５－tert－ブチルベンズオキサゾール類及びＵＳ５３６２４８１に記載されている２－（ｐ－アミノフェニル）ベンゾフラン類を含む。
【０１４５】

１個以上のシリコ有機残基を含むポリマーＵＶ吸収剤の具体例は、ＥＰ７０９０８０に開示されているベンジリデンマロネートシリコーン誘導体、特に、式

【０１４６】

【化６６】



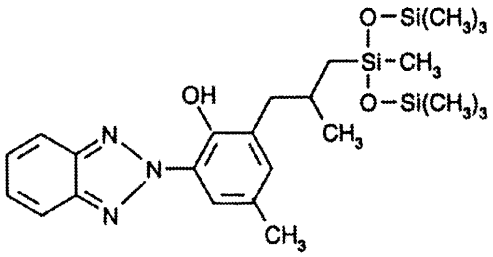
【０１４７】

（式中、R_{15}は、Ｈ又はＯＭｅであり、ｒは、約７である）

で示される化合物；及びＷＯ９４／０６４０４に記載されているベンゾトリアゾールシリコーンタイプのポリマー、特に式

【０１４８】

【化６７】



【０１４９】

で示される化合物である。

【０１５０】

ケイ皮酸エステルの具体例は、オクチルメトキシシンナメート（４－メトキシ－ケイ皮酸２－エチルヘキシルエステル）、ジエタノールアミンメトキシシンナメート（４－メトキシケイ皮酸のジエタノールアミン塩）、イソアミル　ｐ－メトキシシンナメート（４－メトキシケイ皮酸２－イソアミルエステル）、２，５－ジイソプロピルメチルシンナメート、ＵＳ５６０１８１１に開示されているシンナミド誘導体及びＷＯ９７／００８５１に記載されている誘導体を含む。

【０１５１】

ショウノウ誘導体の具体例は、４－メチル－ベンジリデンカンファー〔３－（４′－メチル）ベンジリデン－ボルナン－２－オン〕、３－ベンジリデンカンファー（３－ベンジリデン－ボルナン－２－オン）、ポリアクリルアミドメチルベンジリデンカンファー｛Ｎ－〔２（及び４）－２－オキシボルン－３－イリデン－メチル）ベンジル〕アクリルアミドポリマー｝、トリモニウムベンジリデンカンファースルフェート〔３－（４′－トリメチルアンモニウム）－ベンジリデン－ボルナン－２－オン　メチルスルフェート〕、テレフタリデンジカンファースルホン酸｛３，３′－（１，４－フェニレンジメチン）－ビス－（７，７－ジメチル－２－オキソ－ビシクロ－〔２．２．１〕ヘプタン－１－メタンスルホン酸｝及びそれらの塩並びにベンジリデンカンファースルホン酸〔３－（４′－スルホ）ベンジリデン－ボルナン－２－オン〕及びそれらの塩である。

【０１５２】

トリアニリノ－ｓ－トリアジン誘導体の具体例は、オクチルトリアジン〔２，４，６－トリアニリノ－（ｐ－カルボ－２′－エチル－１′－オキシ）－１，３，５－トリアジン、ＵＳ５３３２５６８に開示されているトリアニリノ－ｓ－トリアジン誘導体、ＥＰ５１７

１０４に記載されているトリアニリノ－ｓ－トリアジン誘導体、ＥＰ５７０８３８に開示されているトリアニリノ－ｓ－トリアジン誘導体、ＵＳ５２５２３２３に記載されているトリアニリノ－ｓ－トリアジン誘導体、ＷＯ９３／１７００２－Ａ１に記載されているトリアニリノ－ｓ－トリアジン誘導体及びＷＯ９７／０３６４２－Ａ１に開示されているトリアニリノ－ｓ－トリアジン誘導体を含む。

【０１５３】

ベンゾトリアゾールの具体例は、２－（２－ヒドロキシ－５－メチル－フェニル）ベンゾトリアゾールである。

【０１５４】

ヒドロキシフェニルトリアジン誘導体の具体例は、例えば、ＥＰ－Ａ１－７７５，６９８に記載されているもの、例えば２，４－ビス－｛〔４－（２－エチル－ヘキシルオキシ）－２－ヒドロキシ〕－フェニル｝－６－（４－メトキシフェニル）－１，３，５－トリアジンを含む。

【０１５５】

ビス－レゾルシノール－ジアルキルアミノトリアジン類の具体例は、例えば、ＥＰ－Ａ１－７８０，３８２に記載されているものである。

【０１５６】

本発明の日焼け止め組成物は、油中水滴型又は水中油滴型分散液、油若しくは油－アルコールローション、イオン性若しくは非イオン性の両親媒性脂質の小胞性分散液、ゲル、固体スチック又はエアロゾル配合物として配合することができる。

【０１５７】

油中水滴型又は水中油滴型分散液として配合された場合、化粧品的に許容し得るキャリヤは、好ましくは、キャリヤの全重量基準で、油相：５～５０重量％、乳化剤：５～２０重量％及び水３０～９０重量％を含む。

【０１５８】

油相は、化粧品配合に従来から使用される油、特に皮膚軟化剤、例えば脂肪アルコール；炭化水素油；天然又は合成トリグリセリド；長鎖酸とアルコールとのエステル、及びワックス様性質を有する化合物を含むワックス；シリコーン油；脂肪酸エステル若しくは脂肪アルコール；並びにラノリン含有生成物の１種以上を含むことができる。

【０１５９】

脂肪アルコールの例は、セチルアルコール、ステアリルアルコール、オクチルドデカノール、セテアリールアルコール及びオレイルアルコールを含み；炭化水素油の例は、例えば鉱油（軽質又は重質）、ペトロラタム（黄又は白）、ポリエチレン、パラフィン、スクアラン、微晶質ワックス、セレシン、ポリブテン及び水素化ポリイソブテンであり；天然又は合成トリグリセリドの例は、ヒマシ油、カプリル／カプリントリグリセリド、木ロウ、水素化植物油、スイートアーモンド油、小麦麦芽油、ゴマ油、水素化綿実油、ココナツ油、小麦麦芽トリグリセリド、アボカド油、トウモロコシ油、トリラウリン、水素化ヒマシ油、シアバター、ココアバター、大豆油、ミンク油、ヒマワリ油、ベニバナ油、マカダミアナッツ油、オリーブ油、水素化獣脂、アプリコット仁油、ヘーゼルナッツ油及びルリチシャ油を含み；長鎖酸とアルコールとのエステル及びワックス様性質を有する化合物を含むワックスの例は、例えば、カルナバワックス、蜜ロウ（白又は黄）、ラノリン、カンデリラワックス、地ロウ、ラノリン油、パラフィン、木ロウ、微晶質ロウ、セレシン、ホホバ油、セテアリールエステルワックス、合成ホホバ油、合成蜜ロウ及びラノリンワックスであり、シリコーン油は、例えばジメチコーン又はシクロメチコーンであり；脂肪酸エステル又は脂肪アルコールの例は、イソプロピルミリステート、イソプロピルパルミテート、オクチルパルミテート、イソプロピルラノレート、アセチル化ラノリンアルコール、C_{12}～C_{15}アルコールのベンゾエート、セテアリールオクタノエート、セチルパルミテート、ミリスチルミリステート、ミリスチルラクテート、セチルアセテート、プロピレングリコールジカプリレート／カプレート、デシルオレエート、デシルオレエート、アセチル化ラノリン、ステアリルヘプタノエート、ジイソステアリルマレート、オクチルヒドロキシ

ステアレート、オクチルヒドロキシステアレート及びイソプロピルイソステアレートを含み；ラノリン含有生成物の例は、ラノリン、ラノリン油、イソプロピルラノレート、アセチル化ラノリンアルコール、アセチル化ラノリン、ヒドロキシル化ラノリン、水素化ラノリン及びラノリンワックスを含む。

【０１６０】

乳化剤は、化粧品配合に従来から使用される乳化剤、例えば、天然油誘導体のエトキシル化エステル、例えば水素化ヒマシ油のポリエトキシル化エステル；シリコーン油乳化剤、例えばシリコーンポリオール；オプション的にエトキシル化された脂肪酸石鹸；エトキシル化脂肪アルコール；オプション的にエトキシル化されたソルビタンエステル；エトキシル化脂肪酸；又はエトキシル化グリセリドの１種以上を含むことができる。

【０１６１】

本発明の日焼け止め組成物は又、日焼け止め組成物において有用な機能を果たすことが知られている更なる成分を含むことができる。そのような更なる成分の例は、例えば、皮膚軟化剤、皮膚加湿剤、日焼け促進剤、酸化防止剤、乳化安定剤、増粘剤、例えばキサンタン、保湿剤、例えばグリセリン、膜形成剤、防腐剤、香料及び着色剤を含む。

【０１６２】

本発明の日焼け止め組成物は、安全な皮膚の日焼けを許しながら太陽光の損傷効果に対する優れた保護を提供する。その上、本発明の日焼け止め組成物は、皮膚防水効果を有している。

【０１６３】

【実施例】

以下の例が本発明を更に説明する。別段指定しない限り、例中に示された部及び％値は重量基準である。

【０１６４】

例１：Ｏ／Ｗ日焼け止めローションの調製

【０１６５】

【表１】

成分（％ b.w.）：

A	ﾎﾟﾘｸﾞﾘｾﾘﾙ-3 ﾒﾁﾙｸﾞﾙｺｰｽｼﾞｽﾃｱﾚｰﾄ	2.0
	ﾃﾞｼﾙｵﾚｴｰﾄ	5.7
	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙﾊﾟﾙﾐﾃｰﾄ	5.0
	ｶﾌﾟﾘﾙ/ｶﾌﾟﾘﾝﾄﾘｸﾞﾘｾﾘﾄﾞ	6.5
	ｵｸﾁﾙﾒﾄｷｼｼﾝﾅﾒｰﾄ	5.0
B	ｸﾞﾘｾﾘﾝ	3.0
	ﾌｪﾉﾆｯﾌﾟ® (phenonip®)	0.5
	水	62.9
C	ｶｰﾎﾞﾏｰ	0.2
	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙﾊﾟﾙﾐﾃｰﾄ	0.8
D	微粉化 2,2'-ﾒﾁﾚﾝ-ﾋﾞｽ-[6-(2H-ﾍﾞﾝｽﾞﾄﾘｱｿﾞﾙ-2-ｲﾙ)-4-(1,1,3,3-ﾃﾄﾗﾒﾁﾙﾌﾞﾁﾙ)-ﾌｪﾉｰﾙの 50％水性懸濁液 (d50 = 200 nm)	8.0
E	NaOH (10％)	任意

【０１６６】
水性粉砕によって調製した微粉化有機ＵＶ吸収剤（Ｄ）を油相（Ａ）に加えた。真空下で水を除去して、該微小粒子が油相中に移行するようにした。次に、均質化した油相（Ａ）及び水相（Ｂ）をそれぞれ８０℃まで加熱し、合わせて攪拌した。次に、相（Ｃ）を加え、激しく均質化した。攪拌しながら室温まで冷ました後、１０％ＮａＯＨ溶液で該エマルションをｐＨ６．５～７に調節した。
【０１６７】
該エマルションのＳＰＦ（試験管内（in vitro）。以下、同様：ＳＰＦアナライザー２９０）は３４であった。
【０１６８】
該微粉化ＵＶ吸収剤の水性懸濁液を、更なる相として、水相に加えるか、乳化工程の最後で別に加える方法で該エマルションを調製したならば、試験管内ＳＰＦはわずか１２であった。
【０１６９】
例２：Ｏ／Ｗ日焼け止めローション
【０１７０】
【表２】

成分（％ b.w.）：

A	ﾎﾟﾘｸﾞﾘｾﾘﾙ-3 ﾒﾁﾙｸﾞﾙｺｰｽｼﾞｽﾃｱﾚｰﾄ	2.0
	ﾃﾞｼﾙｵﾚｴｰﾄ	5.7
	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙﾊﾟﾙﾐﾃｰﾄ	5.0
	ｶﾌﾟﾘﾙ/ｶﾌﾟﾘﾝﾄﾘｸﾞﾘｾﾘﾄﾞ	6.5
	ｵｸﾄｸﾘﾚﾝ	2.0
	ｵｸﾁﾙﾒﾄｷｼｼﾝﾅﾒｰﾄ	5.0
B	ｸﾞﾘｾﾘﾝ	3.0
	ﾃﾚﾌﾀﾘﾃﾞﾝｼﾞｶﾝﾌｧｰｽﾙﾎﾝ酸	0.5
	ﾌｪﾉﾆｯﾌﾟ® (phenonip®)	0.5
	水	61.5
C	ｶｰﾎﾞﾏｰ	0.2
	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙﾊﾟﾙﾐﾃｰﾄ	0.8
D	乾燥微粉化 2,2'-ﾒﾁﾚﾝ-ﾋﾞｽ-[6-(2H-ﾍﾞﾝｽﾞﾄﾘｱｿﾞﾙ-2-ｲﾙ)-4-(1,1,3,3-ﾃﾄﾗﾒﾁﾙﾌﾞﾁﾙ)-ﾌｪﾉｰﾙ (d50 = 200 nm)	8.0
E	NaOH (10％)	任意

【０１７１】
乾燥微粉化２，２′－メチレン－ビス－〔６－（２Ｈ－ベンズトリアゾル－２－イル）－４－（１，１，３，３－テトラメチルブチル）－フェノール（Ｄ）を、混合操作をし、超音波を使用することにより、油相中に激しく懸濁させた。次に、相（Ａ）及び（Ｂ）を別々に８０℃まで加熱し、攪拌せずに合わせた。（Ｃ）を加えた後、それを激しく均質化し、攪拌しながら室温まで冷ました。最後に、（Ｅ）で所望のｐＨに調節した。
【０１７２】
該エマルションのＳＰＦ（試験管内：ＳＰＦアナライザー２９０）は３０であった。
【０１７３】
例３：Ｏ／Ｗ日焼け止めローション
【０１７４】
【表３】

成分（％ b.w.）：

A	ﾎﾟﾘｸﾞﾘｾﾘﾙ-3 ﾒﾁﾙｸﾞﾙｺｰｽｼﾞｽﾃｱﾚｰﾄ	2.0
	ﾃﾞｼﾙｵﾚｴｰﾄ	5.7
	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙﾊﾟﾙﾐﾃｰﾄ	5.0
	ｶﾌﾟﾘﾙ/ｶﾌﾟﾘﾝﾄﾘｸﾞﾘｾﾘﾄﾞ	6.5
	ｵｸﾄｸﾘﾚﾝ	2.0
	ｵｸﾁﾙﾒﾄｷｼｼﾝﾅﾒｰﾄ	5.0
B	ｸﾞﾘｾﾘﾝ	3.0
	ﾌｪﾉﾆｯﾌﾟ® (phenonip®)	0.5
	水	62.9
C	ｶｰﾎﾞﾏｰ	0.2
	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙﾊﾟﾙﾐﾃｰﾄ	0.8
D	微粉化 2,2'-ﾒﾁﾚﾝ-ﾋﾞｽ-[6-(2H-ﾍﾞﾝｽﾞﾄﾘｱｿﾞﾙ-2-ｲﾙ)-4-(1,1,3,3-ﾃﾄﾗﾒﾁﾙﾌﾞﾁﾙ)-ﾌｪﾉｰﾙの 50％水性懸濁液 (d50 = 200 nm)	8.0
E	NaOH (10％)	任意

【０１７５】
相（Ａ）及び（Ｂ）を別々に８０℃まで加熱し、攪拌せずに一緒にした。（Ｃ）を加えた後、該配合物を激しく均質化した。攪拌した後、該混合物を室温まで冷ました。相（Ｄ）をクエン酸でｐＨ５．５に調節し、１５分間更に攪拌した。最後に、（Ｅ）で所望のｐＨに調節した。
【０１７６】
調製の直後に１２という試験管内ＳＰＦが計測された。この数値は、３週間の貯蔵後に３７に上昇した。油相中の微小粒子の存在が顕微鏡的に検出された。
【０１７７】
例４：Ｏ／Ｗ日焼け止めローション
【０１７８】
【表４】

成分（％ b.w.）:

（A）	ﾎﾟﾘｸﾞﾘｾﾘﾙ-3-ﾒﾁﾙｸﾞﾙｺｰｽｼﾞｽﾃｱﾚｰﾄ	2.0
	ﾃﾞｼﾙｵﾚｴｰﾄ	5.7
	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙﾊﾟﾙﾐﾃｰﾄ	5.0
	ｶﾌﾟﾘﾙ/ｶﾌﾟﾘﾝﾄﾘｸﾞﾘｾﾘﾄﾞ	6.5
	2,4-ﾋﾞｽ{[4-(2-ｴﾁﾙﾍｷｼﾙｵｷｼ)-2-ﾋﾄﾞﾛｷｼ]ﾌｪﾆﾙ}-6-(4-ﾒﾄｷｼﾌｪﾆﾙ)-1,3,5-ﾄﾘｱｼﾞﾝ	2.0
	ｵｸﾁﾙﾒﾄｷｼｼﾝﾅﾒｰﾄ	5.0
（B）	ｸﾞﾘｾﾘﾝ	3.0
	ﾌｪﾉﾆｯﾌﾟ® (phenonip®)	0.5
	水	62.9
C	ｶｰﾎﾞﾏｰ	0.2
	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙﾊﾟﾙﾐﾃｰﾄ	0.8
D	微粉化 2,2'-ﾒﾁﾚﾝ-ﾋﾞｽ-[6-(2H-ﾍﾞﾝｽﾞﾄﾘｱｿﾞｰﾙ-2-ｲﾙ)-4-(1,1,3,3-ﾃﾄﾗﾒﾁﾙﾌﾞﾁﾙ)-ﾌｪﾉｰﾙの 50％水性懸濁液 (d50 = 200 nm)	8.0
E	NaOH (10％)	任意

【０１７９】

２，４－ビス｛〔４－（２－エチルヘキシルオキシ）－２－ヒドロキシ〕フェニル｝－６－（４－メトキシフェニル）－１，３，５－トリアジンをオクチルメトキシシンナメートに溶解し、油相（Ａ）に加えた。相（Ａ）及び（Ｂ）を別々に８０℃まで加熱し、撹拌せずに一緒にした。（Ｃ）の添加の後、該混合物を激しく均質化した。撹拌しながら、該混合物を室温まで冷ました。相（Ｄ）をクエン酸でｐＨ５．５に調節し、注意深く撹拌しながら少しずつ加えた。約１５分間更に撹拌した後、（Ｅ）で所望のｐＨに調節した。

【０１８０】

調製の直後に約２３という試験管内ＳＰＦが計測された。この数値は、３週間の貯蔵後に５４に上昇した。油相中の微小粒子の存在が顕微鏡的に検出された。

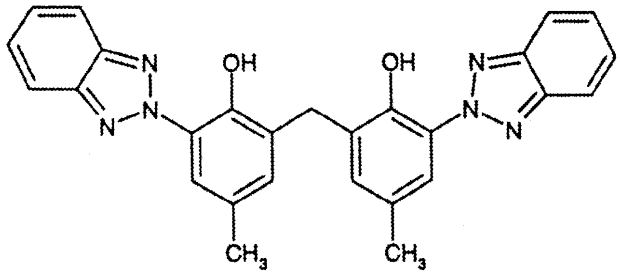
【０１８１】

例５

式

【０１８２】

【化６８】

(101) 

【０１８３】
の化合物６０gを、水１２８g中C_8～C_{16}アルキル－ポリグルコシド（Plantacare（登録商標）2000、Henkel）１２gの溶液中に分散させ、パールミル中、ZrO_2－粉砕パール４０mlを用いて、平均粒径１７０nmまで粉砕した。粉砕助剤を分別した後、得られたナノ分散液（＝ナノ分散液２）に、０．４％１，２－プロピレングリコール中に分散した０．２％キサンタンガムを加えた。
【０１８４】
このナノ分散液を、以下の組成のW／Oエマルションまで更に処理した。
２０g　ナノ分散液２（式（１０１）の化合物を６％含む）
5g　ポリグリセリル－２－ジポリヒドロキシステアレート
1g　グリセリルオレエート
6g　カプリル／カプリントリグリセリド
6g　オクチルドデカノール
5g　セテアリールイソノナノエート
1g　トコフェリルアセテート
１．2g　蜜ロウ
４９．3g　水
5g　グリセリン
０．5g　防腐剤
【０１８５】
ＳＰＦ（試験管内：ＳＰＦアナライザー２９０）は２０．２であった。
【０１８６】
例６
水を犠牲にして２－エチルヘキシル－ｐ－メトキシシンナメート１．5gを例５のナノ分散液２に加えると、予想外の高いＳＰＦ：３６．２が得られた。
【０１８７】
２０g　ナノ分散液２（式（１０１）の化合物を６％含む）
5g　ポリグリセリル－２－ジポリヒドロキシステアレート
1g　グリセリルオレエート
6g　カプリル／カプリントリグリセリド
6g　オクチルドデカノール
5g　セテアリールイソノナノエート
1g　トコフェリルアセテート
１．2g　蜜ロウ
１．5g　２－エチルヘキシル－ｐ－メトキシシンナメート
４７．8g　水
5g　グリセリン
０．5g　防腐剤

フロントページの続き

(72)発明者　ステラン，アルベール
フランス国　エフ－６８１２８　ロズノー　リュ　ドゥ　ブワゲ　６

審査官　原田　隆興

(56)参考文献　国際公開第９７／００３６４３（WO，Ａ１）
国際公開第９８／０２５９２２（WO，Ａ１）
特開平０９－２２７４５８（ＪＰ，Ａ）
特開平１１－１１６４５７（ＪＰ，Ａ）
国際公開第９５／０４５１９（WO，Ａ１）

(58)調査した分野(Int.Cl.，ＤＢ名)
A61K　8/00-8/99
A61Q　1/00-99/00