

(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2012-136552

(P2012-136552A)

(43) 公開日 平成24年7月19日(2012.7.19)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 47/24 (2006.01)	A 6 1 K 47/24	4 B O 1 8
A 6 1 K 9/107 (2006.01)	A 6 1 K 9/107	4 C O 7 6
A 6 1 K 47/10 (2006.01)	A 6 1 K 47/10	
A 6 1 K 47/26 (2006.01)	A 6 1 K 47/26	
A 6 1 K 47/12 (2006.01)	A 6 1 K 47/12	
審査請求 有 請求項の数 10 O L (全 7 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2012-62525 (P2012-62525)	(71) 出願人	505197115
(22) 出願日	平成24年3月19日 (2012.3.19)		リポイト ゲゼルシャフト ミット ベシ
(62) 分割の表示	特願2004-554223 (P2004-554223)		ュレンクテル ハフツング
	の分割		L i p o i d G m b H
原出願日	平成15年11月25日 (2003.11.25)		ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフ
(31) 優先権主張番号	102 55 195.2		ェン フリーゲンシュトラーセ 4
(32) 優先日	平成14年11月27日 (2002.11.27)		F r i g e n s t r a s s e 4, D -
(33) 優先権主張国	ドイツ (DE)		6 7 0 6 5 L u d w i g s h a f e n ,
			G e r m a n y
		(74) 代理人	100099483
			弁理士 久野 琢也
		(74) 代理人	100114890
			弁理士 アインゼル・フェリックス＝ライ
			ンハルト
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 エマルション様水溶性濃縮物

(57) 【要約】

【課題】本発明の課題は、脂質、ステロイド、テルペンおよび極性脂質の群からの親油性物質を、レシチン／ポリオールマトリックスまたはレシチン／炭水化物マトリックスを用いて可溶化する方法を提供することである。

【解決手段】本発明の課題は、ポリオール溶液または炭化水素溶液の濃度が30質量％～99質量％であり、レシチン：脂質の比が1：1～1：12であり、かつポリオール溶液または炭水化物溶液中のレシチン／脂質混合物の濃度が10質量％～90質量％である、脂肪様物質のエマルション様水溶性濃縮物およびその使用により達成される。

【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

リン脂質またはレシチンと、ポリオールまたは炭水化物の高濃度水溶液との組合せ物を用いての、脂肪様物質のエマルジョン様水溶性濃縮物において、ポリオール溶液または炭水化物溶液の濃度が 30 質量%～99 質量%であり、レシチン：脂質の比が 1：1～1：12 であり、かつポリオール溶液または炭水化物溶液中のレシチン／脂質混合物の濃度が 10 質量%～90 質量%である、脂肪様物質のエマルジョン様水溶性濃縮物。

【請求項 2】

使用されたリン脂質またはレシチンのいずれかが不飽和であるか、水素化されているか、加水分解されているかヒドロキシ化されており、その際、レシチンまたはリン脂質は、大豆、ナタネ、魚、牛乳または卵から得られたものであって、かつ、レシチン画分が、ホスファチジルコリン含量 10 質量%～100 質量%を有する脱脂画分から形成されている、請求項 1 に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物。

10

【請求項 3】

レシチンが、少なくとも 50 質量%のアセトン不溶性物質を含有し、この場合、これらは、主に極性脂質、たとえばグリセリンホスファチド、スフィンゴホスファチド、スフィンゴグリコリピド、グリセリングリコリピドまたはアミノリピドの群からのものである、請求項 1 に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物。

【請求項 4】

ポリオールとして、好ましくは多価アルコールを使用し、その際、 $C_3 \sim C_6$ の炭素鎖を有するもの、たとえばグリセロール、トレイトール、ペンチトールまたはヘキシトールを使用する、請求項 1 に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物。

20

【請求項 5】

炭水化物として、モノサッカリド、ジサッカリド、マルチトールまたはマルトデキシトリンを使用する、請求項 1 に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物。

【請求項 6】

一価の易揮発性アルコール（VOC）および／またはエトキシ化界面活性剤または他の合成界面活性剤を使用しない、請求項 1 に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物。

【請求項 7】

保存剤を使用しない、請求項 1 に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物。

30

【請求項 8】

高圧ホモジナイザー、超音波またはローターステーターミキサを使用する、請求項 1 に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物。

【請求項 9】

脂質（たとえば、脂肪酸、ワックス、ワックスエステル、パラフィン、脂肪族アルコール、脂肪族アルデヒド、グリセリド等）、イソプレノイド（テルペンおよびステロイド：たとえば、A-ビタミン、E-ビタミン、D-ビタミン、K-ビタミン、ビスボロール、メントール、グルココルチコイド、エッセンシャルオイル、コレステロール、シトステロール、コエンザイム Q10 等）、極性脂質（セラミド、スフィンゴ脂質、グリコリピド等）ならびに油溶性 UV-A および UV-B フィルターおよびシリコンオイルを使用する、請求項 1 に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物。

40

【請求項 10】

化粧品、医薬品または食品のための、請求項 1 から 9 までのいずれか 1 項に記載のエマルジョン様水溶性濃縮物の使用。

【請求項 11】

局所、経口または非経口適用による、請求項 9 に記載の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、請求項 1 に記載の特徴を有する、エマルジョン様の透明～半透明の水溶性濃

50

縮物、ならびにその化粧品、医薬または食品のための使用に関する。

【背景技術】

【0002】

医薬、化粧品および食品分野における親油性または脂肪様の物質は、通常は、問題のない適用形で使用されなければならない。この問題のない適用形とは、乳化剤により、脂肪滴の界面における表面張力を減少させる古典的なエマルジョンであり、これによって、水中での脂肪の良好かつ安定な分散を提供する。適用分野に依存して、クリーム状～ミルク状のコンテステンシーを有するエマルジョンが生じ、その際、0.5～10% (w/w) の乳化剤量で添加する。常用のエマルジョンの脂肪滴の粒径は、多くの要因、たとえば脂肪、乳化剤、適用エネルギーに依存し、かつ通常は、3桁のnm-範囲(100～1000nm)の範囲内である。

10

【0003】

特別な事情および適用の場合には、1～2桁のnm-範囲(5～100nm)の液滴の粒径を有する、透明～不透明の生成物が必要とされる。このような配合物は、ミセル可溶化剤を用いてのみ製造することができる。混合ミセルの形で、親油性材料は、適した可溶化剤(乳化剤)および補助乳化剤と一緒にあって、透明な配合物に可溶化される。

【0004】

化粧品および皮膚化学の分野において、審美的製品は、低い水溶性物質を部分的に高い濃度で含有することが必要とされる。外観は、このような生成物は、優れた物理的安定性を有していなければならない。たとえば、化粧品および皮膚化学製品における透明なバスオイルであり、その際、脂肪様成分としてトリグリセリド、パラフィンオイルおよびエッセンシャルオイルが含まれる。

20

【0005】

香油は、主に、脂肪様のフレグランスを明瞭に透明な形で溶解された形で含有する。同様に、難水溶性の医薬を経口または非経口適用する際には、透明な配合物に加工される。

【0006】

局所、経口または非経口適用される生成物に、親油活性物質を使用することは、本発明の対象である。乳化剤または補助乳化剤は望ましくないが、これらは今日まで技術的に必要不可欠な補助物質であった。

【0007】

技術水準においては、前記に示された適用分野で、脂肪様物質の透明系への可溶化は、エトキシ化界面活性剤または高いHLB値を示す界面活性剤および／またはアルコールを用いてのみ実施可能であった。しかしながら、これらの可溶化剤は、以下の重大な欠陥を有する：

30

－易揮発性アルコール－VOC－(エタノール、イソプロパノール)が、強い細胞毒性を有すること、および

－これらは、大気の保護を考慮すると、多くの配合物において望ましくないことである。

－乳化剤を、可溶化のために多量に使用しなければならないために、供給される作用物質の適用に関して、常に著量の添加剤を必要とすることである。一般的な方法において、たとえば1gのラベンダー油を可溶化するために、5gのPEG40水素化ヒマシ油を25% (w/w) エタノール性溶液中で必要とするか；さもなければ、一般的な方法において、たとえば20gのビタミンE-アセテートを可溶化するために、44gのPEG36水素化ヒマシ油および25gのプロピレングリコールを水溶液中で必要とする。さらに、親油性ビタミンA、EおよびDを一般的な方法で可溶化するためには、グリコール酸およびホスファチジルコリンの混合物の約10倍の過剰量を必要とする。

40

【0008】

DE-19859427A1では、マイクロエマルジョンの形で、透明な系中のミセル状に溶解された脂肪様物質の製造方法を開示している。その際、乳化剤－補助乳化剤系としては、専ら、レシチンおよびエトキシ化乳化剤から成る混合物、高いHLB値を示すレシチン／乳化剤またはレシチン／易揮発性アルコールが使用される。

50

【0009】

DE19922193では、水素化レシチン、エッセンシャルオイルおよび水から成るミルク状の古典的脂質エマルジョンおよび視覚的に透明な濃縮物の製造方法が記載されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0010】

【特許文献1】DE19859427A1

【特許文献2】DE19922193

【発明の概要】

10

【発明が解決しようとする課題】

【0011】

本発明は、難水溶性物質の透明または半透明のエマルジョン様水溶性濃縮物への溶解方法およびこれらの濃縮物の使用に関する。

【課題を解決するための手段】

【0012】

本発明の目的は、請求項1に記載の特徴を有する本発明によるエマルジョン様の水溶性濃縮物および請求項10に記載の特徴を有するこれらのエマルジョン様水溶性濃縮物の使用により達成された。

【0013】

20

従来のミセル系とは対照的に、本発明により特定のマトリックスを用いて、第2の乳化剤ならびに一価または二価のアルコールの使用を完全に排除することは有利である。さらに驚くべきことに、本発明を用いた場合には、親油性物質に関してはリン脂質を欠いていてもよく、したがって、従来の一般的な可能性を考慮した場合に、可溶化を達成するものである。

【0014】

本発明によれば、エトキシ化界面活性剤または他の強い可溶化剤は、天然物質の系（レシチン／リン脂質／ポリオール）によって置換されてもよく、この場合、これらの天然物質は、健康および環境安全性に関して問題のないものである。

【0015】

30

本発明によれば、可溶化のために5～100%（w/w）に過ぎない親油性物質が可溶化剤として必要とされる。従来の方法の場合には、この割合は逆である。

【0016】

本発明によれば、易揮発性有機溶剤（エタノール、イソプロパノール等）の使用を排除することができる。

【0017】

本発明によるエマルジョン様濃縮物は、単一製造工程によって製造され、この場合、これらの方法は、水で希釈した後に、不透明～透明の微細に分散されたエマルジョンを生じるものであり、この場合、このようなエマルジョンは、エマルジョン様濃縮物を回避する場合には、製造不可能であるか、あるいは困難性を伴ってのみ製造可能である。

40

【0018】

これらの新規濃縮物は、高圧ホモジナイザーを用いて最適に製造することができる。

【0019】

ローターステーターミキサは、わずかな透明性を有する濃縮物を生じる。DE19859427の欠点は、高圧ホモジナイズによる金属研磨によって生じるが、これは、ホモジナイズのための相当する装置において、セラミックを用いることにより取り除く。

【0020】

本発明による濃縮物は、直接的に生成物として、たとえば医薬品または化粧品としてのバスオイル、マウスウォッシュ、香油、飲料または食品補助食品にか、あるいは、水または他の水性溶液（たとえば、ジュース）を用いて希釈することによって、微細に分散され

50

た透明～不透明のO/Wエマルション（ナノエマルション）にし、この場合、これらは2～3桁のnm範囲の極めて小さい粒度分布を有するものである。極めて良好な水溶性によって、これらの透明なエマルション様濃縮物は、化粧品（ゲル、クリーム、ローション等）、医薬品または食品中で問題なく添加することができる。

【0021】

レシチンおよび／またはリン脂質、脂質ならびにポリオールまたは炭水化物の高濃度溶液から成るエマルション様濃縮物の製造は、以下のようにおこなわれる：

－レシチン／リン脂質と脂肪様物質との比は、問題なく水で希釈される透明な濃縮物が得られるように選択すべきであり、かつ、

－ポリオールまたは炭水化物溶液の含水量は、透明な濃縮物が得られるばかりでなく、水の低い値に基づいて自己保存系（selbstkonservierendes System）が得られるように選択すべきであり、それによって、合成または同様に天然の保存剤の使用を回避することができる。

－工程温度は、使用されたレシチン／リン脂質または可溶化すべき脂質に適合させるべきである。水素化されたレシチン／リン脂質は、通常は、40～80℃の工程温度を必要とし、不飽和のレシチン／リン脂質の場合には室温で処理されてもよく、その際、レシチン／リン脂質を好ましくは極性相中で、すなわちポリオール溶液または炭水化物溶液中に添加する。

【実施例】

【0022】

本発明は、好ましい実施例によって示される。

【0023】

例1：

PC-含量70%を有する大豆からのリン脂質画分5gを、86%グリセリン 75g中で攪拌することによって分散した。ビタミンE-アセテート20gを添加し、かつ連続的攪拌によって分散させた。これらの粗く分散された不均一な混合物を、高圧ホモジナイザーによってホモジナイズした。高粘度を有する透明なエマルション様溶液が得られた。

【0024】

例2：

PC-含量70%を有する大豆からのリン脂質画分5gを、70%フルクトース溶液 75g中に攪拌することによって分散した。中鎖トリグリセリド 20gの添加後に、この混合物を高圧ホモジナイズすることによって、蜂蜜様の粘度を有する透明なエマルション様溶液が得られた。

【手続補正書】

【提出日】平成24年4月17日(2012.4.17)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の工程：

リン脂質またはレシチンと、 $C_3 \sim C_6$ の炭素鎖を有する多価アルコールまたは炭水化物からの高濃縮水溶液を組合せ、その際、 $C_3 \sim C_6$ の炭素鎖を有する多価アルコールまたは炭水化物からなる溶液の濃度が30質量%～99質量%であり、

この組合せ物を、攪拌により分散させ、

脂肪様物質を添加し、その際、レシチン：脂肪様物質の比は1：1～1：12であり、かつ、 $C_3 \sim C_6$ の炭素鎖を有する多価アルコールまたは炭水化物から成る高濃縮水溶液中のレシチン：脂肪様物質の混合物の濃度は10～90質量%であり、

この組合せ物および脂肪様物質を攪拌し、かつ高圧下でホモジナイズする、により製造された、脂肪様物質のエマルション様水溶性濃縮物。

【請求項 2】

使用されたリン脂質またはレシチンが不飽和であるか、水素化されているか、加水分解されているかヒドロキシ化されており、その際、レシチンまたはリン脂質は、大豆、ナタネ、魚、牛乳または卵から得られたものであって、かつ、レシチン画分が、ホスファチジルコリン含量 10 質量%～100 質量%を有する脱脂画分から形成されている、請求項 1 に記載のエマルション様水溶性濃縮物。

【請求項 3】

レシチンが、少なくとも 50 質量%のアセトン不溶性物質を含有し、この場合、これらは、主に極性脂質、たとえばグリセリンホスファチド、スフィンゴホスファチド、スフィンゴグリコリピド、グリセリングリコリピドまたはアミノリピドの群からのものである、請求項 1 に記載のエマルション様水溶性濃縮物。

【請求項 4】

C₃～C₆の炭素鎖を有する多価アルコールとして、グリセロール、トレイトール、ペンチトールまたはヘキシトールを使用する、請求項 1 に記載のエマルション様水溶性濃縮物。

【請求項 5】

炭水化物として、モノサッカリド、ジサッカリド、マルチトールまたはマルトデキストリンを使用する、請求項 1 に記載のエマルション様水溶性濃縮物。

【請求項 6】

一価の易揮発性アルコール（VOC）および／またはエトキシ化界面活性剤または他の合成界面活性剤を使用しない、請求項 1 に記載のエマルション様水溶性濃縮物。

【請求項 7】

保存剤を使用しない、請求項 1 に記載のエマルション様水溶性濃縮物。

【請求項 8】

脂質（たとえば、脂肪酸、ワックス、ワックスエステル、パラフィン、脂肪族アルコール、脂肪族アルデヒド、グリセリド等）、イソプレノイド（テルペンおよびステロイド：たとえば、A-ビタミン、E-ビタミン、D-ビタミン、K-ビタミン、ビサボロール、メントール、グルココルチコイド、エッセンシャルオイル、コレステロール、シトステロール、コエンザイム Q10 等）、極性脂質（セラミド、スフィンゴ脂質、グリコリピド等）ならびに油溶性 UV-A および UV-B フィルターおよびシリコーンオイルの群からの物質を使用する、請求項 1 に記載のエマルション様水溶性濃縮物。

【請求項 9】

化粧品、医薬品または食品のための、請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項に記載のエマルション様水溶性濃縮物の使用。

【請求項 10】

局所、経口または非経口適用による、請求項 9 に記載の使用。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K	47/46	(2006.01)	A 6 1 K 47/46
A 6 1 K	47/08	(2006.01)	A 6 1 K 47/08
A 6 1 K	47/22	(2006.01)	A 6 1 K 47/22
A 6 1 K	47/28	(2006.01)	A 6 1 K 47/28
A 6 1 K	47/34	(2006.01)	A 6 1 K 47/34
A 2 3 L	1/30	(2006.01)	A 2 3 L 1/30 Z
A 2 3 L	1/303	(2006.01)	A 2 3 L 1/303

(72)発明者 ルディ ヴァイダ

ドイツ連邦共和国 マンハイム オットー・ベック・シュトラッセ 10

Fターム(参考) 4B018 LE04 MD07 MD08 MD14 MD23 MD24 MD26 MD28 MD29 MD32
 MD36 MD45 MD46 ME14 MF02
 4C076 AA17 BB01 BB21 DD34 DD37 DD38F DD40 DD41 DD46 DD52
 DD59 DD60 DD63F DD67F DD69F DD70F EE55 FF15 FF16 GG41