



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2012년06월13일
(11) 등록번호 10-1153757
(24) 등록일자 2012년05월31일

(51) 국제특허분류(Int. C1.)
A61K 9/107 (2006.01) *A61K 47/10* (2006.01)
A61K 47/24 (2006.01)

(21) 출원번호 10-2005-7009707
(22) 출원일자(국제) 2003년11월25일
심사청구일자 2008년10월15일
(85) 번역문제출일자 2005년05월27일
(65) 공개번호 10-2005-0096919
(43) 공개일자 2005년10월06일
(86) 국제출원번호 PCT/DE2003/003887
(87) 국제공개번호 WO 2004/047791
국제공개일자 2004년06월10일
(30) 우선권주장
102 55 195.2 2002년11월27일 독일(DE)

(56) 선행기술조사문헌

DE000019940227 A

전체 청구항 수 : 총 9 항

심사관 : 송건형

(54) 발명의 명칭 유화성 수용성 농축액

(57) 요 약

본 발명은, 미용, 식이 및 약학 제품에 사용되는 수용성의 애밀선성 투명 농축액을 수득하기 위하여, 레시틴/폴리올 매트릭스 또는 레시틴/탄수화물 매트릭스를 이용하여, 바람직하게는, 지질, 스테로이드, 테르펜(terpene) 및 극성 지질로 이루어진 군에서 선택되는 친유성 물질을 가용화시키는 것에 관한 것이다.

특허청구의 범위

청구항 1

인지질 또는 레시틴 및 폴리올 또는 탄수화물의 고농축 수용액의 조합 및 지방산, 왁스, 왁스 에스테르, 파라핀, 지방 알콜, 지방 알데하이드 및 그리세리드로 이루어진 군으로부터 선택된 지질을 포함한 지방성 물질의 수용성 에멀션 농축액으로서, 폴리올 또는 탄수화물의 용액의 농도는 30 질량% 내지 99 질량%이고, 레시틴이 선택되는 경우, 레시틴:지질의 질량비가 1:1 내지 1:12이고, 폴리올 또는 탄수화물 용액 중의 레시틴 및 지질 혼합물의 농도는 10 질량% 내지 90 질량%인 수용성 에멀션 농축액.

청구항 2

제 1 항에 있어서, 상기 가해진 인지질 또는 레시틴은 불포화, 수소화 또는 히드록실화되고, 이때 상기 레시틴 또는 인지질은 콩, 포도 (rape), 생선, 우유 또는 계란으로부터 추출되고, 레시틴의 분획은 포스파티딜콜린 부분이 10 질량% 내지 100 질량%인 오일 없는 (oil-free) 분획으로 형성되는 것을 특징으로 하는 수용성 에멀션 농축액.

청구항 3

제 1 항에 있어서, 레시틴이 글리세린포스파티드 (glycerinphosphat id), 스팽고포스파티드 (spingophosphat id), 스팽고글리코리피드 (spingoglycolipid), 글리세린글리코리피드 (glyceringlycolipid) 및 아미노리피드 (aminolipid)로 이루어진 군으로부터 선택된, 아세톤에 비가용성 물질인 극성 지질을 50 종량-% 이상 함유하는 것을 특징으로 하는 수용성 에멀션 농축액.

청구항 4

제 1 항에 있어서, 사슬길이가 C₃ 내지 C₆인 폴리올로서, 다수소-함유 (multi-hydric) 알콜을 사용하는 것을 특징으로 하는 수용성 에멀션 농축액.

청구항 5

제 1 항에 있어서, 탄수화물로서, 단당류, 이당류, 말티톨 (maltitol) 및 말토덱스트린을 사용하는 것을 특징으로 하는 수용성 에멀션 농축액.

청구항 6

제 1 항에 있어서, 고압 균질화기에서의 제조를 위해 초음파 또는 로터-스테터 믹서 (rotor-stator mixer)를 사용하는 것을 특징으로 하는 수용성 에멀션 농축액.

청구항 7

제 1 항에 있어서, 이소프레노이드 (isoprenoid) (테르펜 (terpene) 및 스테로이드), 극성 지질 (세라마이드 (ceramide), 스팽고리피드 (sphingolipids), 글리코리피드), 오일 가용성 UV-A 및 UV-B 필터 및 실리콘 오일로 이루어진 군에서 선택되는 물질을 추가로 포함함을 특징으로 하는 수용성 에멀션 농축액.

청구항 8

미용, 약학 또는 식이에의 응용을 위한 제 1 항 내지 제 7 항 중 어느 한 항에 따른 수용성 에멀션 농축액.

청구항 9

제 8 항에 있어서, 상기 미용, 약학 또는 식이에의 응용이 국소의, 경구 또는 비경구적 응용을 특징으로 하는 수용성 에멀션 농축액.

청구항 10

삭제

청구항 11

삭제

명세서

기술분야

[0001]

본 발명은 특허청구범위 제 1 항의 특징에 따른 에멀션성 (emulsion-like) 투명 내지 반투명 수용성 농축액 및 이들의 미용, 약학 또는 식이 제품에서의 용도에 관한 것이다.

배경기술

[0002]

약학, 미용 또는 식이 분야에서 친유성 (lipophile) 또는 지방성 (fatlike) 물질은 보통 문제 없는 (problem-free) 응용 형태 내로 수송되어야 한다. 실제 문제 없는 응용 형태는 에멀션화제가 지방방울 (fat droplet)의 경계층에서의 장력을 감소시켜 수중에서 미세하고 안정한 지방 분포를 제공하는 에멀션이다. 응용분야에 따라 에멀션화제가 0.5 내지 10 % (w/w)의 양으로 존재하는 크림상에서부터 유상 (milky) 점조도 (consistency)의 에멀션이 있다. 통상적인 에멀션의 지방방울의 입자 크기는, 지방, 에멀션화제, 가해진 에너지 등 다수의 요인에 좌우되며, 보통 세자리 수 nm 범위 (100 내지 1000 nm) 내에 있다.

[0003]

특수한 수요품 및 외용약은 방울의 크기가 한자리 내지 두자리 수 nm 범위 (5 내지 100 nm)인 투명 내지 반투명 제품을 요구한다. 이러한 제형물은 미셀성 가용화로만 제조될 수 있다. 친유성 물질은 적당한 가용화제 (에멀션화제) 및 보조에멀션화제의 혼합물과 함께 혼합 미셀 형태로 용해되어 투명한 제형물로 된다.

[0004]

미용 및 피부병학 분야에서는, 수용성이 낮은 물질들을 부분적으로 고농도로 함유한 외관상 심미적인 제품들이 요구된다. 상기 외관 외에도, 이러한 제품들은 우수한 물리적 안정성을 갖는 것으로 추정된다. 예로서, 지방성 물질로서 중성지방 (triglyceride), 광유 및 정유 (essential oil)를 가진, 미용 및 피부병학에서의 투명 바스 오일 (bath oil)이 있다.

[0005]

향수는 또한 맑은 투명 형태로 용해된 지방성 향기 (fragrance)를 주로 함유한다. 수중에 용해하기 어려운 약제품들은 경구 또는 비경구적 응용을 위해 투명 제형물로 가공된다.

[0006]

친유성 활성 물질을 사용하는 것이 경구 또는 비경구 국소 적용 제품의 목적이다. 에멀션화제 또는 보조에멀션화제는 바람직하지 않지만, 현재까지 기술적으로 필요한 보조 물질이다.

[0007]

상기 언급한 응용 분야에서 지방성 물질의 투명한 계로의 가용화가 오로지 에톡실화된 (ethoxylated) 텐시드 (tenside) 또는 높은 HLB-값을 갖는 텐시드 및/또는 알콜로만 이루어질 수 있는 것이 당업계의 상황이다. 그러나, 이들 가용화제는 하기의 심각한 결함을 갖고 있다:

[0008]

- 고도 휘발성 알콜 -VOC- (에탄올, 이소프로판올)은 강력한 세포독소 (cytotoxin)이고,

[0009]

- 이들은, 대기 보호에 관련하여, 많은 제형물에서 원치 않는 것이다.

[0010]

- 에멀션화제는 가용화를 위해서 다량으로 가해져야 하고, 따라서 상기 실제 활성 물질의 적용은 상당한 양의 보조 물질을 필요로 한다. 예를 들어 1 g의 라벤더 오일을 보통의 방식으로 가용화시키기 위해서는, 25% (w/w) 에탄올계 용액 중의 5 g의 PEG 40 수소화 (hydrogenated) 캐스터 오일이 필요하다. 또는, 예를 들어 20 g의 비타민 E-아세테이트를 보통의 방식으로 가용화시키기 위해서는 수용액 중의 44 g의 PEG 36 수소화 캐스터 오일 및 25 g의 프로필렌글리콜이 필요하다. 또한, 친유성 비타민 A, E 및 D를 보통의 방식으로 가용화시키기 위해서는, 예를 들어, 10 배 초과량의 글리코콜산 (glycocholic acid) 및 포스파티딜콜린 혼합물이 필요하다.

[0011]

DE-198 59 427 A1은 투명계에 대한 미셀성 용해된 지방성 물질의 마이크로에멀션 형태로의 제조를 개시한다. 에멀션화제-/보조에멀션화제 시스템으로서, 배타적으로 레시틴 및 에톡실화 에멀션화제 혼합물, 레시틴/높은 HLB-값을 가진 에멀션화제 또는 레시틴/고휘발성 알콜이 사용된다. DE 199 22 193은 수소화 레시틴, 정유 및 물의 전형적인 유상의 지방 에멀션 (fat emulsion)의 제조 및 가시적으로 투명한 농축액의 제조를 기술한다.

[0012]

삭제

발명의 상세한 설명

- [0013] 본 발명의 목적은 수용성이 낮은 물질들을 투명한 또는 반투명한 에멀션성 수용성 농축액으로 용해시키고 이를 농축액을 응용하는 것이다.
- [0014] 이 목적은 청구항 1의 특징을 가진 본 발명에 따르는 에멀션성 수용성 농축액 및 청구항 10의 특징을 가진 이를 에멀션성 수용성 농축액의 응용으로 성취된다.
- [0015] 현재까지의 미셀성 시스템과는 대조적으로, 본 발명에 따라, 제 2 에멀션화제, 뿐만 아니라 1수소-함유 (dihydric) 알콜을 사용하는 것을 완전히 피할 수 있다는 이점이 성취된다. 게다가, 놀랍게도, 상기 친유성 물질과 관련하여, 인지질을 결여하고도 이것이 수행될 수 있었다. 이는 지금까지 가용화를 이룩할 수 있는 통상적인 가능성과는 반대되는 것이다.
- [0016] 본 발명에 따르면, 에톡실화된 텐시드 또는 기타 강력한 가용화제는, 건강에 중대한 영향을 끼치지 않고 환경에는 안전한 천연 물질계 (레시틴/인지질/폴리올)로 대체할 수 있다.
- [0017] 본 발명에 따르면, 가용화를 위한 가용화제로서 단지 5 내지 100 질량%의 지방 (레시틴/인지질)이 필요하다. 현재까지의 방법들을 이용시, 이 비율은 반대이다.
- [0018] 본 발명에 따르면, 고휘발성 유기 가용화제 (에탄올, 이소프로판올 등)를 피할 수 있다.
- [0019] 본 발명에 따르면, 상기 에멀션성 농축액은 물로의 희석 후 불투명 내지 투명한 미세하게 분산된 에멀션을 생성하는 1 단계 제조 공정으로 생성된다. 이러한 종류의 에멀션은 상기 에멀션성 농축액이 없을 경우 제조되지 않거나 제조되기가 훨씬 더 어려울 것이다.
- [0020] 이 신규한 농축액은 고압 균질화기 (homogenizer)로 최상으로 제조될 수 있다.
- [0021] 로터-스테터 믹서 (rotor-stator mixer)로는 덜 투명한 농축액이 수득된다. DE 198 59 427의 단점은 고압 균질화기 내의 금속의 마모로 유발된 것으로서, 이는 각 장치내에 균질화용 세라믹을 사용함으로써 해결된다.
- [0022] 본 발명에 따른 농축액을, 예컨대 의료용 또는 미용용 오일바스, 구강청결용액 (mouth-wash), 퍼퓸-오일, 음료 또는 식품-첨가물을 위한 제품으로서 직접 사용하거나 또는 물 또는 다른 수용액 (예컨대 쥬스)으로 희석하여, 매우 작은 분포의 입자크기가 두자리 내지 세자리 수 nm 범위인 미세하게 분산된 투명 - 불투명 o/W 에멀션 (나노에멀션)으로 옮길 수 있다. 물에서의 매우 우수한 가용화성에 기인하여, 이를 투명 에멀션성 농축액들은 미용 제품 (젤, 크림, 로션 등), 약학 또는 식이 제품에 문제없이 통합될 수 있다.
- [0023] 레시틴 및/또는 인지질, 지질 및 폴리올 또는 탄수화물의 고도 농축 용액으로부터의 에멀션성의 수용성 농축액 제조는 하기와 같이 일어날 수 있다:
- 지방성 물질에 대한 레시틴/인지질 비율은 투명 농축액이 수중에 문제없이 희석되게 하는 방식으로 선택되어야 하고
 - 폴리올 또는 탄수화물 용액의 물 부분은, 투명 농축액이 또한 - 낮은 값의 물에 기인하여 - 합성의 또는 천연의 보존제 첨가를 피할 수 있는 종류의 자가 보존 시스템을 생성시키는 방식으로 선택되어야 한다.
- [0024] - 상기 공정의 온도는 사용되는 레시틴/인지질에 맞게 또는 상기 가용화된 지질에 맞게 조절되어야 한다. 수화 레시틴/인지질은 본래 40 내지 80 °C의 공정 온도를 필요로 하며, 불포화 레시틴/인지질은 실온에서 가능될 수 있고, 이때 상기 레시틴/인지질은 바람직하게는 극성상 내로, 즉, 상기 폴리올 또는 탄수화물 용액 내로 통합된다.
- [0025] 본 발명은 바람직한 실시예로 제시된다.

실시 예

- [0028] 실시예 1:
- [0029] PC 함량이 70%인 콩 (soy)으로부터의 인지질 분획 5 g을 86% 글리세린 75 g에 교반하면서 분산시킨다. 20 g의 비타민 E-아세테이트를 첨가하고 연속 교반으로 분포시킨다. 이렇게 대충 분산된 비균질성 혼합물을 고압 균질화기를 이용하여 균질화한다. 고점도의 투명한 에멀션성 용액이 수득된다.

[0030] 실시예 2:

[0031] PC 함량이 70% 인 콩으로부터의 인지질 분획 5 g 을 70 % 과당 (fructose) 용액 75 g 에 교반하면서 분산시킨다. 20 g 의 매질-속박 (medium chain) 중성지방을 첨가한 후, 이 혼합물을 고압 균질화하면 별꿀과 유사한 점도를 가진 투명한 애멸션성 용액이 수득될 것이다.