

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 19 年 7 月 5 日 (2007.7.5)

【公開番号】特開 2002-47124 (P2002-47124A)

【公開日】平成 14 年 2 月 12 日 (2002.2.12)

【出願番号】特願 2000-235297 (P2000-235297)

【国際特許分類】

A 6 1 K 8/49 (2006.01)

A 6 1 K 8/60 (2006.01)

A 6 1 K 8/72 (2006.01)

A 6 1 K 8/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/30 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 7/00 D

A 6 1 K 7/00 F

A 6 1 K 7/00 J

A 6 1 K 7/00 R

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/30

A 6 1 K 47/36

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 5 月 22 日 (2007.5.22)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 3】

一方、後記一般式 (I) に示される化合物乃至はその塩としては、化合物 1 が化粧料用の添加物として市販されているが、このものと増粘剤とを組み合わせると、安定性に優れた製剤が得られることは知られていなかった。又、皮膚外用製剤においてこのような組み合わせも全く知られていなかった。又、化合物 1 以外の一般式 (I) に表される化合物は何れも既知物質であり、試薬として市販されている、2 - (2 - ヒドロキシ - 3 - アルキル - 5 - ターシャリーブチルフェニル) ベンゾトリアゾールを硫酸中で脱イソブチレン、スルホン化反応を行うことにより、容易に製造できるが、これらのものを皮膚外用剤に含有させる技術はまだ知られていない。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 8】

【発明の実施の形態】

(1) 本発明の皮膚外用剤の必須成分である一般式 (I) に表される化合物及び / 又は

その塩

本発明の皮膚外用剤は、上記一般式（Ⅰ）に表される化合物及び／又はその塩を必須成分として含有することを特徴とする。ここで、一般式（Ⅰ）に表される化合物及びその塩の内、3位のアルキル基がイソブチル基であるもののナトリウム塩である、上記化合物1に示す構造を有する、3-（2H-ベンゾトリアゾール-2-イル）-5-セカンダリーブチル-4-ヒドロキシベンゼンスルホン酸ナトリウムはチバ・ガイギー株式会社より「チバファースト」Hリキッドの名で、化粧品原料として市販されている。又、これ以外の化合物については、対応するアルキル基を有する、2-（2-ヒドロキシ-3-アルキル-5-ターシャリーブチルフェニル）ベンゾトリアゾールを硫酸中、脱イソブチレン化・スルホン化反応を行うことによって製造でき、これを中性域にまでアルカリにより中和すると、スルホン酸部分の水素原子のみが、かかるアルカリによって置換された一般式（Ⅰ）の化合物の塩を得ることができる。一度この様な塩の形態にすることにより、結晶性が向上し、精製が容易になることから、スルホン酸のものを得るにも、一度この様な塩にして精製した後、酸などによりスルホン酸に戻して使用することが好ましい。この様な塩は更にアルカリを加えることにより、フェノール性水酸基の部分も塩を形成するが、この様な水酸基が塩になったものも本発明の皮膚外用剤の必須成分である一般式（Ⅰ）に表される化合物の塩に含まれる。本発明の皮膚外用剤の必須成分である一般式（Ⅰ）に表される化合物の塩としては、通常医薬や化粧料などの皮膚外用剤で使用されているものであれば特段の限定を受けず適用でき、例えば、ナトリウム塩やカリウム塩などのアルカリ金属塩、カルシウム塩やマグネシウム塩などのアルカリ土類金属塩、アンモニウム塩、トリエチルアミン塩やトリエタノールアミン塩等の有機アミン塩、リジン塩やアルギニン塩等の塩基性アミノ酸塩等が好ましく例示できる。この様な、一般式（Ⅰ）に表される化合物及びその塩の中で特に好ましいものは、既に市販されている化合物1である。本発明の皮膚外用剤においてはこれら一般式（Ⅰ）に表される化合物及び／又はその塩は唯一種を含有させることもできるし、二種以上を組み合わせることもできる。この様に組み合わせる場合の好ましい形態は、化合物1、化合物1のフリー体及び化合物1の塩基塩から選ばれる2種の組み合わせである。本発明の皮膚外用剤において、これら一般式（Ⅰ）に表される化合物及びその塩は、光によって増粘剤などが加水分解を受けるのを抑制する作用を有し、以て製剤系を安定化する作用を有する。本発明の皮膚外用剤において、この様な一般式（Ⅰ）に表される化合物及び／又はその塩の好ましい含有量は、皮膚外用剤全量に対して、総量で0.01～10重量％であり、更に好ましくは、0.02～1重量％である。これは少なすぎると、上記の効果が得られない場合があり、多すぎると結晶析出など物理的に系に安定に存在させることが困難になる場合があるからである。以下に、化合物1関連の物質以外の製造例を示しておく。