

【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21年3月12日 (2009.3.12)

【公開番号】特開2007-254346(P2007-254346A)

【公開日】平成19年10月4日 (2007.10.4)

【年通号数】公開・登録公報2007-038

【出願番号】特願2006-80406(P2006-80406)

【国際特許分類】

A 6 1 K 8/06 (2006.01)

A 6 1 K 8/25 (2006.01)

A 6 1 K 8/60 (2006.01)

A 6 1 K 8/63 (2006.01)

A 6 1 K 8/55 (2006.01)

A 6 1 K 8/891 (2006.01)

A 6 1 K 8/894 (2006.01)

A 6 1 Q 19/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 8/06

A 6 1 K 8/25

A 6 1 K 8/60

A 6 1 K 8/63

A 6 1 K 8/55

A 6 1 K 8/891

A 6 1 K 8/894

A 6 1 Q 19/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年1月23日 (2009.1.23)

【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】

1) 有機変性粘土鉱物と 2) スフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体とを含有することを特徴とする、油中水乳化剤形の皮膚外用剤。

【請求項 2】

前記スフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体がマイクロエマルションの形態で含有されていることを特徴とする、請求項 1 に記載の皮膚外用剤。

【請求項 3】

前記マイクロエマルションが、リン脂質によって形成されたマイクロエマルションであることを特徴とする、請求項 2 に記載の皮膚外用剤。

【請求項 4】

更に、ジメチコン乃至はシクロメチコンを 15～30 質量%含有することを特徴とする、請求項 1～3 何れか 1 項に記載の皮膚外用剤。

【請求項 5】

更に、ポリエーテル変性メチルポリシロキサンを 1～10 質量%含有することを特徴とする、請求項 1～4 何れか 1 項に記載の皮膚外用剤。

## 【請求項 6】

肌荒れ用の化粧料であることを特徴とする、請求項 1～5 何れか 1 項に記載の皮膚外用剤。

## 【請求項 7】

前記肌荒れが、手足のヒビ及び／又はあかぎれであることを特徴とする、請求項 1～6 何れか 1 項に記載の皮膚外用剤。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0006

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0006】

この様な状況に鑑みて、本発明者らは、油中水乳化剤形の皮膚外用剤において、過酷な条件として、斜面を形成させて 0℃を下回る保存条件で保存した場合、斜面に不連続相である水相を遊離させるのを防ぐ手段を求めて、鋭意研究努力を重ねた結果、スフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体等で内相の構造を強化することにより、この様な離水現象を防ぐことができることを見だし、発明を完成させるに至った。

(1) 1) 有機変性粘土鉱物と 2) スフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体とを含有することを特徴とする、油中水乳化剤形の皮膚外用剤。

(2) 前記スフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体がマイクロエマルションの形態で含有されていることを特徴とする、(1)に記載の皮膚外用剤。

(3) 前記マイクロエマルションが、リン脂質によって形成されたマイクロエマルションであることを特徴とする、(2)に記載の皮膚外用剤。

(4) 更に、ジメチコン乃至はシクロメチコンを 15～30 質量%含有することを特徴とする、(1)～(3) 何れかに記載の皮膚外用剤。

(5) 更に、ポリエーテル変性メチルポリシロキサンを 1～10 質量%含有することを特徴とする、(1)～(4) 何れかに記載の皮膚外用剤。

(6) 肌荒れ用の化粧料であることを特徴とする、(1)～(5) 何れかに記載の皮膚外用剤。

(7) 前記肌荒れが、手足のヒビ及び／又はあかぎれであることを特徴とする、(1)～(6) 何れかに記載の皮膚外用剤。

## 【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0008】

(1) 本発明の皮膚外用剤の必須成分である有機変性粘土鉱物

本発明の皮膚外用剤は有機変性粘土鉱物を必須成分として含有することを特徴とする。ここで有機変性とは、粘土鉱物の一部に有機化合物の一部の間に、共有結合乃至はイオン結合を介して強固乃至は緩やかな結合を生ぜしめ、有機化合物の性質の一部乃至は全部を粘土鉱物に付与させることを意味し、この様な変性としては 4 級アミン基と粘土鉱物のアニオン部分を結合させる方法、カルボキシル基と粘土鉱物のカチオン部分を結合させる方法等が例示でき、4 級アミン基と粘土鉱物のアニオン部分を結合させる方法が特に好ましく例示できる。

## 【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0011

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0011】

本発明の皮膚外用剤に含有される4級アミノ基を有する化合物で変性された粘土鉱物の製造方法の一例を以下に説明する。

前記未変性粘土鉱物を分散媒に分散させる。該分散媒は水系の溶媒であることが好ましく、水であってもよい。分散未変性粘土鉱物を含む分散液に、さらに4級アミノ基を有する化合物を加え、よく攪拌する。4級アミノ基を有する化合物は、水に溶解されて加えられてもよい。加えられる4級アミノ基を有する化合物の量は、分散未変性粘土鉱物の量に対して0.1～20質量%であることが好ましく、0.5～15質量%であることがより好ましい。このような構成を採ることにより、乳化系において、好ましい使用感を呈するためである。攪拌後、分散質を濾取し、脱水、乾固することにより本発明における変性粘土鉱物を得ることができる。あるいは、分散質を濾取することなく、減圧濃縮することにより分散媒を除去して乾固させることにより、本発明における変性粘土鉱物を得ることができる。得られた変性粘土鉱物は、好ましくは所望のサイズ（粒径が1～1000 μmであることが好ましい）に粉碎され、本発明の皮膚外用剤に含有される。

## 【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0014】

(2) 本発明の皮膚外用剤の必須成分であるスフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体

本発明の皮膚外用剤はスフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体を必須成分として含有することを特徴とする。スフィンゴ糖脂質は次に示す一般式(1)乃至は(2)に表される構造を有し、式中の糖残基としてはグルコース残基が好ましく、植物例えば米糠、ふすま（小麦胚芽）、粟、稗、大豆、高粱、トウモロコシ等に存在しており、これら植物原料を公知の方法に従って、前処理により脂肪や糖類などを除去した後、ヘキサン、石油エーテル、クロロホルムなどの有機溶媒により抽出し、更にカラムクロマトグラフィーなどの精製手段により精製することにより得ることができる。フィトステロールは、植物性ステロール類の総称であり、植物性のステロール類には、スチグマスタノール、カンベステロール、シトステロールなどが存し、これらを一括して、フィトステロールと総称している。フィトステロールとしては小麦胚芽などの植物体から、複数のフィトステロールを含有するステロール分画を取り出して用いることができる。かかるフィトステロールの配糖体、具体的には、フィトステロールグルコシドなども、植物体中に存在し、スフィンゴ糖脂質と類似の分画に存することが多いし、植物体の種類と部位もスフィンゴ糖脂質と類似している。スフィンゴ糖脂質を分画、精製する際に混入してくることが多く、本発明の皮膚外用剤では、このようなスフィンゴ糖脂質とフィトステロール配糖体との混合抽出物を使用することもできる。本発明の皮膚外用剤においては、このようなスフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体は、油性成分にも、水性成分にも溶解性が低いため、予め、多価アルコールとリン脂質とでマイクロエマルジョンを形成させて含有させることが好ましい。植物由来スフィンゴ糖脂質及びフィトステロール配糖体に対し、ホスファチジルイノシトール、ホスファチジルグリセロール、ホスファチジルエタノールアミン、レシチン或いはこれらのリゾ体等のリン脂質を0.3～3倍重量、エタノールなどの一価アルコールを5～20倍重量、1,3-ブタンジオール、ジプロピレングリコール、イソプレングリコール、1,2-ペンタンジオール、1,2-ヘキサジオールなどの二価アルコールを5～30倍重量用い、スフィンゴ糖脂質とフィトステロール配糖体とを水系中に溶解してマイクロエマルジョンを形成させて、これを含ませることが好ましい。このようなマイクロエマルジョンについては、このような形態に加工した化粧料用原料が存し、かかる化粧料原料を購入して利用することができる。このような市販の化粧料用原料としては、岡安商店株式会社から販売されている「FR-1」が存する。このものは、スフィンゴ糖脂

質とフィトステロール配糖体の 80 : 20 ~ 90 : 10 の質量比の混合物 1 質量% を 0.5 質量% の大豆レシチンと、10 質量% の 1, 3-ブタンジオールと、8 質量% のエタノールによって、残余の水にマイクロエマルジョンとして分散させたものである。又、岡安商店株式会社より、フィトステロール配糖体とスフィンゴ糖脂質の 80 : 20 ~ 90 : 10 の質量比の混合物である「フィトステサイド」も販売されており、かかる成分を用いても、或いは、かかる成分をリン脂質、1, 3-ブタンジオール、エタノール、水でマイクロエマルジョンを形成させ、これを用いても良い。かかる成分は、本発明の皮膚外用剤においては、油中水乳化系の非連続相である乳化粒子の構造を強化し、油中水乳化構造から水相がはみ出すのを防ぐ作用を有する。このような効果を奏するためには、前記スフィンゴ糖脂質及び／又はフィトステロール配糖体を総量で 0.0005 ~ 0.1 質量% 含有することが好ましく、0.001 ~ 0.01 質量% 含有することがより好ましい。これは少なすぎると、前記効果を奏さない場合が存し、多すぎると、系に包含されずに結晶析出する場合が存するためである。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

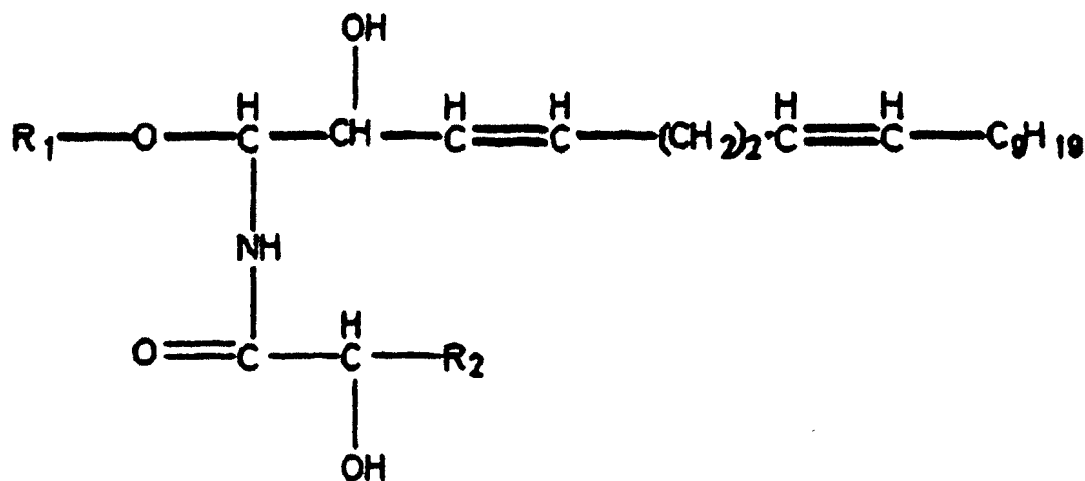
【補正対象項目名】0015

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0015】

【化 1】



一般式 (1)

(但し式中 R 1 は糖残基を表し、R 2 は炭素数 12 ~ 24 のアルキル基を表す。)

【手続補正 7】

【補正対象書類名】明細書

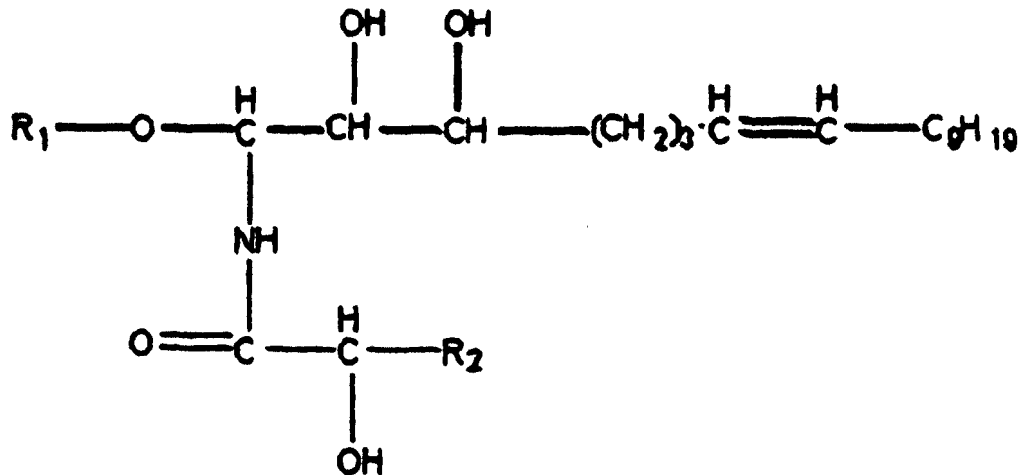
【補正対象項目名】0016

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0016】

【化 2】



一般式（2）

（但し式中 R 1 は糖残基を表し、R 2 は炭素数 12～24 のアルキル基を表す。）

【手続補正 8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0017】

（3）本発明の皮膚外用剤

本発明の皮膚外用剤は、前記必須成分を含有することを特徴とする。本発明の皮膚外用剤は、油中水乳化剤形である。これは、必須成分である有機変性粘土鉱物が、油中水乳化剤形の組成物を作るのに非常に好適であるためである。殊に、高内相の油中水乳化剤形が好適である。ここで、高内相の油中水乳化剤形とは、水の質量と、エタノールの質量と、多価アルコールの質量との和が、50質量%を超えるものを意味する。又、前記の如くに、油中水乳化剤形の使用感、仕上がり感の欠点を補うために、シリコーンを含有することが好ましく、該シリコーンの含有量としては、10～35質量%含有することが好ましく、より好ましくは、20～30質量%である。この内、ジメチコン乃至はシクロメチコンは10～30質量%が好ましく、15～25質量%がより好ましい。特にジメチコン及びシクロメチコンの質量の和に対して、シクロメチコンの質量が50%以上であることが好ましい。ジメチコン、シクロメチコン以外のシリコーンとしては、POE変性メチルポリシロキサン、POP変性メチルポリシロキサン、POP・POE変性メチルポリシロキサン等のポリエーテル変性メチルポリシロキサンが好適に例示でき、かかる成分を含有することが油中水乳化系を安定化できるので好ましい。かかるポリエーテル変性メチルポリシロキサンの好ましい含有量は、0.5～5質量%、1～3質量%がより好ましい。

【手続補正 9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0018】

前記の成分以外に、本発明の皮膚外用剤においては、通常皮膚外用剤で使用される任意成分を含有することができる。この様な任意成分としては、例えば、マカデミアナッツ油、アボガド油、トウモロコシ油、オリーブ油、ナタネ油、ゴマ油、ヒマシ油、サフラワー油、綿実油、ホホバ油、ヤシ油、パーム油、液状ラノリン、硬化ヤシ油、硬化油、モクロウ、硬化ヒマシ油、ミツロウ、キャンデリラロウ、カルナウバロウ、イボタロウ、ラノリ

ン、還元ラノリン、硬質ラノリン、ホホバロウ等のオイル、ワックス類；流動パラフィン、スクワラン、プリスタン、オゾケライト、パラフィン、セレシン、ワセリン、マイクロクリスタリンワックス等の炭化水素類；オレイン酸、イソステアリン酸、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、ベヘン酸、ウンデシレン酸等の高級脂肪酸類；セチルアルコール、ステアリルアルコール、イソステアリルアルコール、ベヘニルアルコール、オクチルドデカノール、ミリスチルアルコール、セトステアリルアルコール等の高級アルコール等；イソオクタン酸セチル、ミリスチン酸イソプロピル、イソステアリン酸ヘキシルデシル、アジピン酸ジイソプロピル、セバチン酸ジ-2-エチルヘキシル、乳酸セチル、リンゴ酸ジイソステアリル、ジ-2-エチルヘキサノ酸エチレングリコール、ジカプリン酸ネオペンチルグリコール、ジ-2-ヘプチルウンデカン酸グリセリン、トリ-2-エチルヘキサノ酸グリセリン、トリ-2-エチルヘキサノ酸トリメチロールプロパン、トリイソステアリン酸トリメチロールプロパン、テトラ-2-エチルヘキサノ酸ペンタンエリトリット等の合成エステル油類等の油剤類；脂肪酸セッケン（ラウリン酸ナトリウム、パルミチン酸ナトリウム等）、ラウリル硫酸カリウム、アルキル硫酸トリエタノールアミンエーテル等のアニオン界面活性剤類；塩化ステアリルトリメチルアンモニウム、塩化ベンザルコニウム、ラウリルアミンオキサイド等のカチオン界面活性剤類；イミダゾリン系両性界面活性剤（2-ココイル-2-イミダゾリニウムヒドロキサイド-1-カルボキシエチロキシ2ナトリウム塩等）、ベタイン系界面活性剤（アルキルベタイン、アミドベタイン、スルホベタイン等）、アシルメチルタウリン等の両性界面活性剤類；ソルビタン脂肪酸エステル類（ソルビタンモノステアレート、セスキオレイン酸ソルビタン等）、グリセリン脂肪酸類（モノステアリン酸グリセリン等）、プロピレングリコール脂肪酸エステル類（モノステアリン酸プロピレングリコール等）、硬化ヒマシ油誘導体、グリセリンアルキルエーテル、POEソルビタン脂肪酸エステル類（POEソルビタンモノオレート、モノステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン等）、POEソルビット脂肪酸エステル類（POEソルビットモノラウレート等）、POEグリセリン脂肪酸エステル類（POEグリセリンモノイソステアレート等）、POE脂肪酸エステル類（ポリエチレングリコールモノオレート、POEジステアレート等）、POEアルキルエーテル類（POE2-オクチルドデシルエーテル等）、POEアルキルフェニルエーテル類（POEノニルフェニルエーテル等）、プルロニック型類、POE・POPアルキルエーテル類（POE・POP2-デシルテトラデシルエーテル等）、テトロニック類、POEヒマシ油・硬化ヒマシ油誘導体（POEヒマシ油、POE硬化ヒマシ油等）、ショ糖脂肪酸エステル、アルキルグルコシド等の非イオン界面活性剤類；ポリエチレングリコール、グリセリン、1,3-ブチレングリコール、エリスリトール、ソルビトール、キシリトール、マルチトール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ジグリセリン、イソブレングリコール、1,2-ペンタンジオール、2,4-ヘキサジオール、1,2-ヘキサジオール、1,2-オクタンジオール等の多価アルコール類；ピロリドンカルボン酸ナトリウム、乳酸、乳酸ナトリウム等の保湿成分類；表面を処理されていても良い、マイカ、タルク、カオリン、合成雲母、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム、無水ケイ酸（シリカ）、酸化アルミニウム、硫酸バリウム等の粉体類、；表面を処理されていても良い、ベンガラ、黄酸化鉄、黒酸化鉄、酸化コバルト、群青、紺青、酸化チタン、酸化亜鉛の無機顔料類；表面を処理されていても良い、雲母チタン、魚鱗箔、オキシ塩化ビスマス等のパール剤類；レーキ化されていても良い赤色202号、赤色228号、赤色226号、黄色4号、青色404号、黄色5号、赤色505号、赤色230号、赤色223号、橙色201号、赤色213号、黄色204号、黄色203号、青色1号、緑色201号、紫色201号、赤色204号等の有機色素類；ポリエチレン末、ポリメタクリル酸メチル、ナイロン粉末、オルガノポリシロキサンエラストマー等の有機粉体類；パラアミノ安息香酸系紫外線吸収剤；アントラニル酸系紫外線吸収剤；サリチル酸系紫外線吸収剤；桂皮酸系紫外線吸収剤；ベンゾフェノン系紫外線吸収剤；糖系紫外線吸収剤；2-(2'-ヒドロキシ-5'-ヒオキソクチルフェニル)ベンゾトリアゾール、4-メトキシ-4'-ヒオキソブチルジベンゾイルメタン等の紫外線吸収剤類；エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール

類；ビタミンA又はその誘導体、ビタミンB6塩酸塩、ビタミンB6トリパルミテート、ビタミンB6ジオクタノエート、ビタミンB2又はその誘導体、ビタミンB12、ビタミンB15又はその誘導体等のビタミンB類； $\alpha$ -トコフェロール、 $\beta$ -トコフェロール、 $\gamma$ -トコフェロール、ビタミンEアセテート等のビタミンE類、ビタミンD類、ビタミンH、パントテン酸、パンテチン、ピロロキノリンキノン等のビタミン類等；フェノキシエタノール等の抗菌剤などが好ましく例示できる。