

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7637766号
(P7637766)

(45)発行日 令和7年2月28日(2025.2.28)

(24)登録日 令和7年2月19日(2025.2.19)

(51)国際特許分類

F I

A 6 1 K 8/67 (2006.01)

A 6 1 K 8/67

A 6 1 K 8/49 (2006.01)

A 6 1 K 8/49

A 6 1 Q 19/00 (2006.01)

A 6 1 Q 19/00

A 6 1 Q 19/08 (2006.01)

A 6 1 Q 19/08

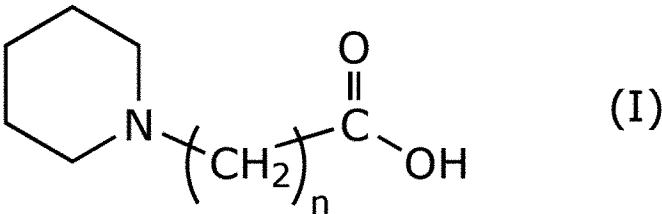
請求項の数 8 (全10頁)

(21)出願番号	特願2023-515953(P2023-515953)	(73)特許権者	000001959
(86)(22)出願日	令和3年4月21日(2021.4.21)		株式会社 資生堂
(86)国際出願番号	PCT/JP2021/016197		東京都中央区銀座7-5-5
(87)国際公開番号	WO2022/224380	(74)代理人	100120031
(87)国際公開日	令和4年10月27日(2022.10.27)		弁理士 宮嶋 学
審査請求日	令和6年2月21日(2024.2.21)	(74)代理人	100120617
			弁理士 浅野 真理
		(74)代理人	100187159
			弁理士 前川 英明
		(74)代理人	100152423
			弁理士 小島 一真
		(72)発明者	駒井 亮太
			東京都中央区銀座7丁目5番5号 株式
			会社資生堂内
		審査官	外川 敬之

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 化粧料

(57)【特許請求の範囲】
【請求項1】
(A) レチノール、および
(B) 下記一般式 (I) :
【化1】



10

(式 (I) 中、n は 2 ～ 5 の整数を表す。)
で表される有機酸またはその塩
を含む化粧料。

【請求項2】
前記レチノールの配合量が、前記化粧料の総質量を基準として、0.01～0.5質量

20

%である、請求項 1 に記載の化粧料。

【請求項 3】

前記有機酸またはその塩の配合量が、前記化粧料の総質量を基準として、0.005～5質量%である、請求項 1 または 2 に記載の化粧料。

【請求項 4】

前記有機酸またはその塩の配合量に対する前記レチノールの配合量の質量比が0.005～1である、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化粧料。

【請求項 5】

前記有機酸が 1-ピペリジンプロピオン酸である、請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の化粧料。

【請求項 6】

ビタミン C またはその誘導体をさらに含む、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の化粧料。

【請求項 7】

前記ビタミン C またはその誘導体の配合量が、前記化粧料の総質量を基準として0.005～1質量%である、請求項 6 に記載の化粧料。

【請求項 8】

前記有機酸の配合量に対する前記前記ビタミン C またはその誘導体の配合量の質量比が1/300～1である、請求項 6 または 7 に記載の化粧料。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、刺激感を抑制しながら十分なシワ改善効果を得ることができる化粧料に関するものである。

【背景技術】

【0002】

老化防止はスキンケア化粧品の大きな目標の一つであり、その中でも美容上の見地からシワは最も関心が高い皮膚老化現象である。近年、皮膚のシワ改善効果を有する化粧品用薬物としてレチノール等が注目され、レチノイドの一種であるレチノール（ビタミン A）やレチノイン酸等の皮膚化粧料への応用が検討されるようになった。これらはセラチノサイトに作用してヒアルロン酸合成促進効果を発現し、角質層水分を増加する効果により、シワ改善効果を発揮することが知られている。特にレチノールは、レチノイン酸に比べて効果が穏やかで強い副作用を示さないため、化粧品用薬剤として優れている。しかし、レチノールおよびその誘導体は肌に適用したときに肌への刺激感があることが知られている。したがって、化粧料にレチノールまたはその誘導体を配合する場合にもその配合量を多くすることができず、十分なシワ改善効果を付与することが難しかった。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【文献】特許第 4865251 号明細書

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

上記のような問題を解決するために、化粧料におけるレチノールの配合量を多くしても、肌への刺激感を抑制することができる技術の開発が望まれていた。

【課題を解決するための手段】

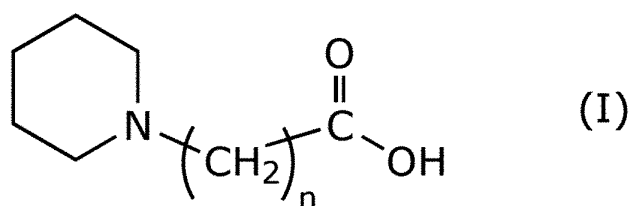
【0005】

本発明によれば、以下の発明が提供される。

【1】 (A) レチノール、および

(B) 下記一般式 (I) :

【化 1】



(式 (I) 中、 n は 2 ～ 5 の整数を表す。)

で表される有機酸またはその塩を含む化粧料。

〔2〕 前記レチノールの配合量が、前記化粧料の総質量を基準として、0.01 ～ 0.5 質量%である、〔1〕に記載の化粧料。

〔3〕 前記有機酸またはその塩の配合量が、前記化粧料の総質量を基準として、0.005 ～ 5 質量%である、〔1〕または〔2〕に記載の化粧料。

〔4〕 前記有機酸またはその塩の配合量に対する前記レチノールの配合量の質量比が 0.005 ～ 1 である、〔1〕～〔3〕のいずれかに記載の化粧料。

〔5〕 前記有機酸が 1-ピペリジンプロピオン酸である、〔1〕～〔4〕のいずれかに記載の化粧料。

〔6〕 ビタミン C またはその誘導体をさらに含む、〔1〕～〔5〕のいずれかに記載の化粧料。

〔7〕 前記ビタミン C またはその誘導体の配合量が、前記化粧料の総質量を基準として 0.005 ～ 1 質量%である、〔6〕に記載の化粧料。

〔8〕 前記有機酸の配合量に対する前記前記ビタミン C またはその誘導体の配合量の質量比が 1/300 ～ 1 である、〔6〕または〔7〕に記載の化粧料。

【発明の効果】

【0006】

本発明によれば、肌への刺激感が抑制された、シワ改善効果の高いレチノールの配合量が多い化粧料が提供される。

【発明を実施するための形態】

【0007】

以下、本発明の実施の形態について、詳細に説明する。

【0008】

本発明による化粧料は、(A) レチノール、および (B) 特定の有機酸を必須成分として含むものである。

【0009】

〔レチノール〕

本発明による化粧料はレチノールを含むものである。レチノールは、化粧品、医薬品、医薬部外品等の分野において利用されるものであり、本発明においてもそれらの中から任意に選択することができる。

【0010】

レチノール（別名：ビタミン A）は、 α -1-トランス型、13-シス型、9-シス型などのいくつかの立体異性体が存在するが、そのいずれを用いることもできる。

【0011】

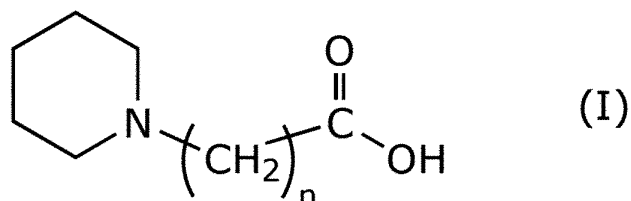
レチノールの配合量は、当該成分の効果を発揮し得るに有効な量であれば特に限定されるものでないが、通常、化粧料の総質量を基準として、0.01 ～ 0.5 質量%であることが好ましく、0.02 ～ 0.1 質量%であることがより好ましい。レチノールの含有量をこのような範囲にすることで、刺激感を抑制しながら十分はシワ改善効果が得られる。

【0012】

〔有機酸またはその塩〕

本発明による化粧品は、特定の有機酸またはその塩を含む。この有機酸は下記一般式（I）で表されるものである。

【化2】



10

（式（I）中、 n は2～5の整数を表す。）

この有機酸は、 n の数によって、1-ピペリジンプロピオン酸（ $n=2$ ）、4-（1-ピペリジニル）ブタン酸（ $n=3$ ）、5-（1-ピペリジニル）ペンタン酸（ $n=4$ ）、6-（1-ピペリジニル）ヘキサン酸（ $n=5$ ）があるが、これらのうち1-ピペリジンプロピオン酸は、レチノールに起因する刺激感を抑制するばかりでなく、肌荒れしにくい肌に肌質を改善するとともに、シワ形成抑制の効果を有するので特に好ましい。

20

【0013】

また、このような有機酸の塩としては、特に限定されないが、例えば、無機塩としては、塩酸塩、硫酸塩、リン酸塩、臭化水素酸塩、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、カルシウム塩、アンモニウム塩等が挙げられる。有機塩としては、酢酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、酒石酸塩、クエン酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、トリエタノールアミン塩、ジエタノールアミン塩、アミノ酸塩等が挙げられる。

【0014】

有機酸またはその塩の配合量は特に限定されるものではないが、化粧料の総質量を基準として、0.005～5質量%であることが好ましく、0.01～4質量%であることがより好ましい。有機酸またはその塩の配合量がこの範囲にあることで、刺激感を抑制することができるとともに、保湿感に優れ、べたつき感などが少ない、使用感に優れた化粧料とすることができる。

30

【0015】

また、本発明において、レチノールによるシワ改善効果と、有機酸またはその塩による刺激感抑制効果とのバランスを最適に保つために、有機酸またはその塩の配合量（ b ）に対する前記レチノールの配合量（ a ）の質量比（ $a \cdot b$ ）が0.005～1であることが好ましく、0.01～0.5であることがより好ましい。

【0016】

〔その他の成分〕

本発明による化粧品は、上記したレチノールと、有機酸またはその塩とを必須成分として含むものであるが、必要に応じてその他の成分を含むことができる。

40

【0017】

そのような成分のうち、本発明による化粧品に配合するのが好ましい成分として、ビタミンCまたはその誘導体を上げることができる。ビタミンCは栄養素として知られ、化合物としてはL-アスコルビン酸に相当する。化粧品において、ビタミンCまたはその誘導体は一般的に使用されるものである。ビタミンCまたはその誘導体は、美白効果などを示すことが知られているが、本発明においては、上記した有機酸またはその塩による、刺激感抑制効果を補う効果を示す。

【0018】

50

ビタミンCは水溶性であるが、その誘導体としては、水溶性、油溶性、両親媒性のものが知られているが、水溶性の物が好ましく用いられる。具体的には、2-O-エチルアスコルビン酸、3-O-エチルアスコルビン酸、アスコルビルリン酸Na、リン酸アスコルビルMg、アスコルビルグルコシド、グリセリルアスコルビン酸、3-グリセリルアスコルビン酸、ビスグリセリルアスコルビン酸、およびL-アスコルビン酸パルミチン酸エステルなどをあげることができる。

【0019】

ビタミンCまたはその誘導体の配合量は特に限定されるものではないが、化粧料の総質量を基準として、0.005~1質量%であることが好ましく、0.008~0.2質量%であることがより好ましい。ビタミンCまたはその誘導体の配合量がこの範囲にあることで、シワ改善効果に優れ、刺激感も少ない、使用感に優れた化粧料とすることができる。

10

【0020】

また、本発明において、シワ改善効果と、刺激感抑制効果とのバランスを最適に保つために、有機酸またはその塩の配合量(b)に対する前記ビタミンCまたはその誘導体の配合量(c)の質量比(c/b)が1/300~1であることが好ましく、1/200~1/3であることがより好ましい。

【0021】

本発明による化粧品は、そのほか、通常化粧品や医薬品等に用いられる成分、例えば、水、油分、界面活性剤、粉末、色材、アルコール類、増粘剤、キレート剤、シリコン類、酸化防止剤、紫外線吸収剤、保湿剤、香料、各種薬効成分、防腐剤、pH調整剤、中和剤等必要に応じて適宜配合される。

20

【0022】

本発明による化粧料は、特にシワ改善効果を有する美容液や、乳液の形状とするためには水を多く配合することが好ましい。水としては、化粧品、医薬部外品等に使用される水を使用することができ、例えば、精製水、イオン交換水、水道水等を使用することができる。水の配合量は、その他の成分の配合量によって変化するが、一般的には化粧料の総質量を基準として、20~80質量%であることが好ましく、30~70質量%であることがより好ましい。

【0023】

本発明による化粧料は多価アルコールを含むことができる。このような多価アルコールは、本発明の効果を損なわない範囲で任意に選択できる。具体的には多価アルコールは、グリセリン、ジグリセリン、ポリグリセリン、1,3-ブチレングリコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、ポリエチレングリコール・ポリプロピレングリコール、トリメチロールエタン、トリメチロールプロパン、エリスリトール、ペンタエリスリトール、ソルビタン、グルコース、ソルビトール、マルチトール、スクロース、ラフィノース、ヘキシレングリコール、1,2-ペンタンジオール、およびトレハロースからなる群から選択される1種または2種以上であることが好ましい。

30

【0024】

多価アルコールは、保湿機能や温感付与機能を発揮するものであるが、その目的に応じて配合量が調整される。一般的には、多価アルコールの配合量は化粧料の総質量を基準として、1~30質量%であることが好ましく、5~20質量%であることがより好ましい。

40

【0025】

本発明による化粧料は高級アルコールを含むことができる本発明において、高級アルコールは、化粧品、医薬品、医薬部外品等の分野において使用できるものであれば特に限定されない。具体的には、ラウリルアルコール、ミリスチルアルコール、セチルアルコール、ステアリルアルコール、ベヘニルアルコール等が挙げられる。また、これらの混合物、例えば、ステアリルアルコールとセチルアルコールとの混合物であるセテアリルアルコール(セトステアリルアルコール)などが一般的に知られており、それを用いることもできる。

50

【0026】

高級アルコールを配合する場合には、上記の1種または2種以上を用いることができる。本発明では2種以上の脂肪族アルコールの混合物を用いるのが好ましく、さらに好ましくは、その混合物の融点が60℃以上となるような組み合わせである。この融点は60℃未満であると、処方によっては系の温度安定性が低下する場合がある。本発明では、例えば、ステアシルアルコールとベヘニルアルコールの組み合わせが好ましい。

【0027】

高級アルコールの配合量は、化粧料の総質量に対して、0.1～10質量%が好ましく、0.5～5質量%であることがより好ましい。

【0028】

本発明による化粧料は界面活性剤を含むことができる。界面活性剤は、非イオン性、カチオン性、アニオン性、両性、シリコン系など各種のものが知られているが、それらから任意に選択して用いることができる。界面活性剤の配合量は、水中油型乳化化粧料全量に対して、0.1～20質量%が好ましく、0.3～5質量%であることがより好ましい。

【0029】

本発明による化粧料は、目的に応じて任意の油分を含むことができる。本発明に使用できる油分は特に限定されず、化粧品に用いられているものの中から安定性を損なわない範囲で選択することができる。好ましい油分としては、炭化水素油分、エステル油分などの極性油、シリコン油、液体油脂等を挙げることができる。

【0030】

具体的には、

炭化水素油としては、流動パラフィン、スクワラン、スクワレン、パラフィン、イソパラフィン、セレシン、イソヘキサデカン、およびイソドデカン等；

エステル油分などの極性油としては、テトラエチルヘキサン酸ペンタエリスリチル、エチルヘキサン酸セチル、ホホバ油、ラウロイルグルタミン酸ジ（フィトステリル／オクチルドデシル）、トリイソステアリン、ジイソステアリン酸グリセリル、トリエチルヘキサノイン、ダイマージリノール酸（フィトステリル／ベヘニル）、ダイマージリノール酸（フィトステリル／イソステアリル／セチル／ステアリル／イソステアリル／セチル／ステアリル／ベヘニル）、パルミチン酸イソプロピル、マカダミアナッツ脂肪酸フィトステリル、テトラ（ベヘン酸／安息香酸／エチルヘキサン酸）ペンタエリスリチル、パルミチン酸エチルヘキシル、ミリスチン酸ミリスチル、ミリスチン酸イソプロピル、ジピバリン酸トリプロピレングリコール、セバシン酸ジイソプロピル、およびネオペンタン酸イソデシル等；

シリコン油としては、ジメチルポリシロキサン、メチルフェニルポリシロキサン、メチルハイドロジェンポリシロキサン等の鎖状シリコン、オクタメチルシクロテトラシロキサン、デカメチルシクロペンタシロキサン、ドデカメチルシクロヘキサシロキサン等の環状シリコン、3次元網目構造を形成しているシリコン樹脂、およびシリコンゴム等；および

液体油脂としては、アマニ油、ツバキ油、マカダミアナッツ油、トウモロコシ油、ミンク油、オリーブ油、アボカド油、サザンカ油、ヒマシ油、サフラワー油、ナタネ油、大豆油、落花生油、トリグリセリン、トリオクタン酸グリセリン、トおよびリイソパルミチン酸グリセリン等

が挙げられる。なお、これらの油分を含む場合、水中油型化粧料とされることが好ましい。

【0031】

油分の配合量は、特に限定されないが、水中油型乳化化粧料全量に対して、5～40質量%が好ましい。

【0032】

本発明による化粧料は、目的に応じて、さらなる成分を配合することができる。そのような成分としては、アミノ酸、殺菌剤、消炎剤、収斂剤、動植物エキス、ビタミンC以外のビタミン及びその誘導体、キレート剤、色素、抗酸化剤、防腐剤、および香料等を挙げ

10

20

30

40

50

ることができる。

【0033】

〔化粧品〕

本発明による化粧品は、上記した必須成分を含むものであるが、一般的な化粧品がとり得る全ての剤型で用いることができる。例えば、具体的には、美容液、乳液、ローション、クリーム、エアゾール等の剤型とすることができる。いずれの剤型であっても、シワ改善効果を達成しながら、少ない刺激感と優れた使用感を兼ね備えた化粧品とすることができる。

【実施例】

【0034】

〔実施例1～11、比較例1～4〕

表1に示される配合で、各実施例および比較例の化粧料を調製した。

【0035】

さらに、これら化粧品について、使用時の刺激感および保湿感を以下の基準で評価を行った。

【0036】

〔評価方法〕

各例の化粧料を用いて20名の専門パネルによる実使用試験を行った。試験項目は、刺激感のなさ、保湿感である。各試験項目について、以下の評価点基準に基づいて各専門パネルが評価し、その評価点の合計によってランク付けした

【0037】

評価点基準（刺激感、保湿感）：

5点：非常に優れている。

4点：優れている。

3点：普通。

2点：劣っている。

1点：非常に劣っている。

【0038】

刺激感の評価ランク

A+：合計点が90点以上

A：合計点が80点以上

B：合計点が60点以上80点未満

C：合計点が40点以上60点未満

D：合計点が40点未満

【0039】

保湿感の評価ランク

A：合計点が80点以上

B：合計点が60点以上80点未満

C：合計点が40点以上60点未満

D：合計点が40点未満

【0040】

10

20

30

40

50

【表 1 - 1】

表 1 - 1

		実施例							
		1	2	3	4	5	6	7	8
A	レチノール	0.02225	0.0555	0.0555	0.0555	0.083	0.083	0.0555	0.0555
B	1-ピペリジンプロピオン酸	3	0.1	1	3	1	0.1	1	1
C	2-O-エチルアスコルビン酸							0.01	0.05
	グリセリン	7	7	7	7	7	7	7	7
	1,3-ブチレングリコール	7	7	7	7	7	7	7	7
	カルボマー	0.12	0.12	0.12	0.12	0.12	0.12	0.12	0.12
	水酸化K	0.02	0.02	0.02	0.02	0.02	0.02	0.02	0.02
	ベヘネス-20	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7
	セテアリルアルコール	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9
	ベヘニルアルコール	3.3	3.3	3.3	3.3	3.3	3.3	3.3	3.3
	スクワラン	11	11	11	11	11	11	11	11
	ワセリン	2	2	2	2	2	2	2	2
	テトラエチルヘキサン酸ペンタエリスリチル	15	15	15	15	15	15	15	15
	ジメチコン	2	2	2	2	2	2	2	2
	フェノキシエタノール	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
	EDTA-3Na	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
	ジブチルヒドロキシトルエン	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
	水	残余	残余	残余	残余	残余	残余	残余	残余
	質量比a/b	0.00742	0.555	0.0555	0.0185	0.083	0.83	0.0555	0.0555
	質量比c/b	0	0	0	0	0	0	0.001	0.05
評価	刺激感	A	B	A	A	A	B	A+	A+
	保湿感	A	B	A	A	A	B	A	A

【0041】

【表 1 - 2】

表 1 - 2

		実施例			比較例			
		9	10	11	1	2	3	4
A	レチノール	0.0555	0.0555	0.0555	0.02225		0.02225	
B	1-ピペリジンプロピオン酸	1	0.1	3		1		1
C	2-O-エチルアスコルビン酸	0.1	0.1	0.01			0.05	0.05
	グリセリン	7	7	7	7	7	7	7
	1,3-ブチレングリコール	7	7	7	7	7	7	7
	カルボマー	0.12	0.12	0.12	0.12	0.12	0.12	0.12
	水酸化K	0.02	0.02	0.02	0.02	0.02	0.02	0.02
	ベヘネス-20	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7	0.7
	セテアリルアルコール	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9
	ベヘニルアルコール	3.3	3.3	3.3	3.3	3.3	3.3	3.3
	スクワラン	11	11	11	11	11	11	11
	ワセリン	2	2	2	2	2	2	2
	テトラエチルヘキサン酸ペンタエリスリチル	15	15	15	15	15	15	15
	ジメチコン	2	2	2	2	2	2	2
	フェノキシエタノール	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
	EDTA-3Na	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
	ジブチルヒドロキシトルエン	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
	水	残余	残余	残余	残余	残余	残余	残余
	質量比a/b	0.0555	0.555	0.0185	-	-	-	-
	質量比c/b	0.1	1	0.0033	-	-	-	-
評価	刺激感	A+	A+	A+	D	A+	D	A+
	保湿感	A	B	A	D	A	D	A

【0042】

比較例 1 および 3 を比較例 2 や 4 と比較すると、従来報告されているように、レチノールを配合することによって刺激感や保湿感がかなり劣化する傾向にあることがわかる。ところが、実施例においては、比較例 1 または 3 に対してレチノールの配合量を 2.5 倍程

度まで増量しても、レチノールを配合しない場合に匹敵するレベルまで改善されている。一方、比較例 2 および 4 はレチノールを含まないために刺激が少ないものの、本発明の目的のひとつであるシワ改善効果は得られないことは明らかである。以上の結果より、本発明による化粧料は、レチノールが高い配合率で配合することができるので、優れたシワ改善効果を達成できると同時に、刺激感が少なく、優れた保湿感も得られることがわかった。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

- (56)参考文献 特開2011-195510 (JP, A)
 特開2001-181176 (JP, A)
 特開2012-36176 (JP, A)
 国際公開第2020/204191 (WO, A1)
 国際公開第2012/157587 (WO, A1)
- (58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)
- A61K 8/67
 A61K 8/49
 A61Q 19/00
 A61Q 19/08
 C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)
 M i n t e l G N P D