

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第4925383号
(P4925383)

(45) 発行日 平成24年4月25日 (2012. 4. 25)

(24) 登録日 平成24年2月17日 (2012. 2. 17)

(51) Int. Cl.	F I
A 6 1 K 8/26 (2006. 01)	A 6 1 K 8/26
A 6 1 K 8/41 (2006. 01)	A 6 1 K 8/41
A 6 1 Q 15/00 (2006. 01)	A 6 1 Q 15/00

請求項の数 20 (全 12 頁)

(21) 出願番号	特願2000-568466 (P2000-568466)	(73) 特許権者	590003065
(86) (22) 出願日	平成11年8月4日 (1999. 8. 4)		ユニリーバー・ナームローゼ・ベンノート
(65) 公表番号	特表2002-524404 (P2002-524404A)		シヤープ
(43) 公表日	平成14年8月6日 (2002. 8. 6)		オランダ国、3 O 1 3・エイエル・ロッテ
(86) 国際出願番号	PCT/EP1999/005613		ルダム、ヴェーナ 4 5 5
(87) 国際公開番号	W02000/013657	(74) 代理人	100062007
(87) 国際公開日	平成12年3月16日 (2000. 3. 16)		弁理士 川口 義雄
審査請求日	平成18年6月2日 (2006. 6. 2)	(74) 復代理人	100103920
審査番号	不服2008-25476 (P2008-25476/J1)		弁理士 大崎 勝真
審査請求日	平成20年10月3日 (2008. 10. 3)	(72) 発明者	ハフ, ゴードン・チャールズ
(31) 優先権主張番号	9819366. 7		イギリス国、マージサイド・シー・エイ
(32) 優先日	平成10年9月4日 (1998. 9. 4)		チ・6 3・3・ジエイ・ダブリュ、ウイラ
(33) 優先権主張国	英国 (GB)		ル、ペビントン、クオーリー・ロード・イ
			ースト、ユニリーバー・リサーチ・ポート
			・サンライト (番地なし)
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 制汗性物質及び前記制汗性物質を含む組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

メチルプロパノールアミンで表面処理されてなる粒状制汗性物質であって、前記制汗性物質が、塩基性塩化アルミニウムからなるものである制汗性物質。

【請求項 2】

粒状制汗性物質が 0. 2 ～ 8 重量%のメチルプロパノールアミンを保持している請求の範囲第 1 項に記載の制汗性物質。

【請求項 3】

粒状制汗性物質が 0. 4 ～ 2. 5 重量%のメチルプロパノールアミンを保持している請求の範囲第 2 項に記載の制汗性物質。

【請求項 4】

物質が 1 0 ～ 7 0 μ m の範囲の平均粒径を有する請求の範囲第 1 項～第 3 項のいずれかに記載の制汗性物質。

【請求項 5】

粒状制汗性物質の表面処理方法であって、前記制汗性物質を液体媒体中でメチルプロパノールアミンと接触させ、メチルプロパノールアミンの少なくとも一部が制汗性物質の表面上に付着または該表面内に吸収されるまで接触させ続けることを含み、前記制汗性物質が、塩基性塩化アルミニウムからなるものである前記方法。

【請求項 6】

メチルプロパノールアミンを溶融形態または溶液状の制汗性物質と接触させる請求の範

図第 5 項に記載の方法。

【請求項 7】

制汗性物質及び担体を含む液相からなる制汗剤組成物であって、前記制汗性物質がメチルプロパノールで表面処理されてなる粒状制汗性物質からなり、前記制汗性物質が、塩基性塩化アルミニウムからなるものである前記組成物。

【請求項 8】

担体がポリグリコールエーテルを含む請求の範囲第 7 項に記載の組成物。

【請求項 9】

ポリグリコールエーテルがポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコールまたはポリブチレングリコールのエーテルからなる請求の範囲第 8 項に記載の組成物。

10

【請求項 10】

ポリグリコール部分は 5 ～ 24 個のポリグリコール単位を含む請求の範囲第 9 項に記載の組成物。

【請求項 11】

ポリグリコールエーテルが C₃ ～ C₈ 脂肪族アルコールのポリグリコールエーテルからなる請求の範囲第 8 項～第 10 項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 12】

アルコールがプロパノールまたはブタノールである請求の範囲第 11 項に記載の組成物。

【請求項 13】

20

ポリグリコールエーテルが 10 ～ 16 個のポリプロピレングリコール単位を含むポリプロピレングリコールブチルエーテルからなる請求の範囲第 12 項に記載の組成物。

【請求項 14】

ポリグリコールエーテルが液相の 5 ～ 95 重量%を占める請求の範囲第 8 項～第 13 項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 15】

ポリグリコールエーテルが液相の 40 ～ 60 重量%を占める請求の範囲第 8 項～第 14 項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 16】

ポリグリコールエーテル及びメチルプロパノールアミンが 30 : 1 ～ 120 : 1 の重量比で存在する請求の範囲第 8 項～第 15 項のいずれかに記載の組成物。

30

【請求項 17】

担体が揮発性または不揮発性シリコン油を含む請求の範囲第 7 項～第 16 項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 18】

懸濁剤を更に含み、懸濁剤がクレーまたはシリカからなるものである請求の範囲第 7 項～第 17 項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 19】

1 つ以上の懸濁助剤、皮膚緩和剤または芳香剤を含む請求の範囲第 7 項～第 18 項のいずれかに記載の組成物。

40

【請求項 20】

請求の範囲第 7 項～第 19 項のいずれかに記載の組成物をヒトの皮膚に局所的に適用することを含む発汗抑制方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

本発明は、制汗性物質、該物質の製造方法及び該物質を含む制汗剤組成物に関する。

【0002】

(背景技術及び従来技術)

大部分の制汗剤組成物では、制汗性活性物質は粒状で存在している。前記した多くの組成物では、分配を容易にするために、制汗性活性物質は大抵懸濁剤または懸濁助剤を用いて

50

液体担体相中に懸濁または分散されている。制汗性物質が適度に懸濁していないと、例えば貯蔵中または使用の間に組成物用容器の底部に沈降するなどして制汗性物質が液体担体から分離する傾向を示す恐れがある。使用者が例えば使用前にアプリケーションータを手で振盪することにより沈降した物質が容易に再分散され得る場合には、固体の沈降は重大な問題ではなく、ちょっと不便だけである。しかしながら、沈降により手で再分散させることが非常に困難であるかまたは不可能でさえある圧縮した層が生ずる場合には、この問題は重大となる。なぜならば、製剤から有効量の制汗性活性物質が損失するのを防止したり低減させることが非常に望ましいからである。当然ながら、貯蔵中に活性物質が損失すると、組成物を均一に適用することができず、組成物を使用している間発汗が効果的に乃至ほぼ効果的に抑制されないことがある場合がある。

10

【0003】

制汗剤組成物の液相の少なくとも一部としてポリグリコールエーテルを配合することにより有利な皮膚感覚が得られ得ることが判明した。実際に粒状制汗剤を液体担体中に懸濁させるには、懸濁助剤、大抵はクレーのような無機物質を配合している。しかしながら、担体がポリグリコールエーテルからなる場合には、クレーまたは類似の懸濁剤の粒状制汗性物質を担体液体中に懸濁または再懸濁させる能力がかなり損なわれることも判明した。

【0004】

他の目的ではあるが、他の分野、特に顔料及び日焼け止め剤の分野で粒状無機物質を表面処理することは公知である。例えば、英国特許出願公開第1602428号明細書では、二酸化チタン顔料がエステルまたはアミンで表面処理されており、こうすると顔料を含む塗膜の乾燥速度が変化する。欧州特許出願公開第0559319号明細書では、水性エマルションへの懸濁を助けるために金属酸化物粒子、特に二酸化チタン及び酸化亜鉛粒子を表面被覆している。この技術は、本発明のほぼ無水の組成物には該当しない。同様に、米国特許第5,573,753号明細書には、水性エマルション中に表面処理した粒状酸化チタン及び酸化亜鉛を含む分散液が記載されている。米国特許第4,318,843号明細書（欧州特許出願公開第0021262号明細書）には、光沢及びラッカー結合剤中の分布を改良するために無機顔料（ TiO_2 が例示されている）を表面処理することが記載されている。米国特許第5,776,440号明細書では、局所適用したときにUV線を遮断するための金属酸化物の有効性を金属酸化物を各種有機化合物で被覆することにより高めている。 TiO_2 の処理が例示されている。

20

30

【0005】

本発明の目的は、上記した問題または欠点の1つ以上を改良または解消することにある。

【0006】

（発明の要旨）

本発明によれば、アルコールで表面処理されてなる粒状制汗性物質が提供される。

【0007】

本発明の関連態様によれば、粒状制汗性物質を表面処理する方法が提供され、その方法は前記制汗性物質を液体媒体中でアルコールアミンと接触させ、アルコールアミンの少なくとも一部が制汗性物質の表面上に付着または該表面内に吸収されるまで接触させ続けることを特徴とする。

40

【0008】

粒状制汗性物質をアルコールアミンで表面処理することにより、ポリグリコールエーテル及び懸濁剤を含む液体担体相から分離する傾向の少ない粒状物質が得られることが判明した。

【0009】

本発明の表面処理は、表面処理剤を基材、すなわち制汗性物質の表面または外層と緊密に接触させることにより、表面処理剤を表面上に付着させて例えば基材表面上に表面処理剤の層もしくはコーティングを形成するか、または表面処理剤の少なくとも一部を基材の外層内に吸収させることを示す。

【0010】

50

本発明の別の態様では、制汗性物質及び担体を含む液相からなる制汗剤組成物が提供され、前記制汗性物質がアルカノールアミンで表面処理されてなる粒状制汗性物質からなることを特徴とする。

【0011】

組成物に関して「含む（からなる）」とは、組成物が組成物の特定成分以外に1つ以上の更なる成分を含み得ることを意味する。

【0012】

（発明の詳細な説明）

本発明は、粒状の表面処理されてなる制汗性活性物質、前記物質を含む制汗剤組成物、特にポリグリコールエーテル及び懸濁剤を含む組成物を提供する。

10

【0013】

制汗性物質

制汗性物質は、ヒトの皮膚に適用したときに発汗を減じたりまたは抑制することができる任意の粒状物質からなり得る。本発明は、局所適用したときにエクリン腺に浸透し、その後エクリン腺に堆積し、その管をブロックし、汗の排出を防ぐ制汗性活性物質に関する。従って、前記制汗性物質は通常収斂性塩からなる。制汗剤は、しばしばアルミニウム塩、ジルコニウム塩、混合アルミニウム／ジルコニウム塩、チタニウム塩からなり、この中には無機塩、有機塩及び複合体も含まれる。好ましい制汗性塩には、アルミニウム、ジルコニウム及びアルミニウム／ジルコニウムのハロゲン化物び塩基性ハロゲン化物（例えば、塩基性塩化物）が含まれる。数種の特に好ましい塩基性ハロゲン化物は、欧州特許出願公開第6739号明細書（Unilever NVら）に記載されているような活性化塩基性塩化アルミニウムからなり、他の活性物質は欧州特許出願公開第28853号明細書に記載されている。これらの公開明細書の開示内容は援用により本明細書に含まれるとする。アルミニウム、ジルコニウム、チタンまたは亜鉛から誘導される金属酸化物は制汗剤と見做されないことに留意されたい。

20

【0014】

制汗性アルミニウム塩には、塩化アルミニウム、及び一般式 $Al_2(OH)_x Q_y \cdot XH_2O$ （式中、Qは塩素、臭素またはヨウ素であり、 $x + y = 6$ の条件でxは2～5であり、x及びyは整数または非整数であり、Xは0～6である）を有する塩基性ハロゲン化アルミニウムが含まれる。

30

【0015】

本発明の制汗剤組成物に使用され得る多くのジルコニウム塩は、実験一般式 $ZrO(OH)_{2n-n_z} B_z$ （式中、zは0.9～2.0の範囲の整数または非整数であり、nはBの原子価であり、 $2 - n_z$ は少なくとも0であり、Bはクロリドを含めたハライド、スルファメート、スルフェート及びその混合物からなる群から選択される）で表される。

【0016】

アルミニウム塩及びジルコニウム塩について上記した式は非常に簡略化されており、各種量の配位水及び／または結合水を含む化合物、ポリマー種及び混合物や複合体も包含される。

【0017】

上記した収斂性塩を主成分とする制汗性複合体は公知であり、本発明でも使用可能である。例えば、アルミニウム、ジルコニウム及びアミノ酸（例えば、グリシン）からなる複合体は米国特許第3,792,068号明細書（Lueddersら）に記載されている。これらの複合体または関連構造を有する幾つかの複合体は文献においてZAGと通常呼称されている。ZAGのような構造を呈する望ましいクラスの複合体は、式 $Al(OH)_5 Cl \cdot 2H_2O$ を満たすような塩基性塩化アルミニウムとアミノ酸または他の複合体形成剤との複合体からなる。ZAGのような構造を呈するジルコニウムベースの複合体の好ましいクラスは、実験式 $ZrO(OH)_{2-a} Cl_2 \cdot nH_2O$ （式中、aは1.5～1.87の範囲の非整数であり、nは1～7である）を有する塩基性塩化ジルコニウムとアミノ酸または他の複合体形成剤との複合体からなる。米国特許第5,486,347（Ca

40

50

l l a g h a nら)に記載されているような活性化Z A G複合体を本発明において制汗性活性物質として使用することができる。

【0018】

本発明に従って作成及び／または分配される組成物中に適当ならば使用することが考えられ得る他の活性物質は、粒状チタン塩、例えばクエン酸塩や乳酸塩のようなヒドロキシカルボン酸塩からなる。

【0019】

特に制汗性塩をエアゾールの形態で適用しようとする場合には、ジルコニウム非含有塩、例えばアルミニウム塩または可能ならばチタン塩、特に塩基性塩化アルミニウム (A C H) 及び活性化塩基性塩化アルミニウム (A A C H) を使用することが好ましい。

10

【0020】

本発明において使用される制汗性塩の粒径は、大抵1～200 μmの範囲である。多くの望ましい製剤、特にエアゾールにより適用される製剤における制汗性塩の平均粒径は5～50 μm、特に15～30 μmの範囲である。

【0021】

アルカノールアミン

アルカノールアミンは、アミン及びヒドロキシル官能基を含む脂肪族化合物からなり得る。例えば最高12個の炭素原子を含むような低分子量を有するものが望ましく、直鎖もしくは分枝鎖アルキル基を含み得る。アルカノール部分は、好ましくはヒドロキシプロピルアミンまたはヒドロキシブチルアミンのようにC₃またはC₄アルキル部分を含む。アミンは1級、2級または3級のいずれでもよい。アミン置換基のすべてがアルカノールアミン置換基からなり得、2級または3級アミンではそれぞれ1つの置換基または2つの置換基のうちの1つがC₁～C₄のようなアルキル基からなり得る。1級アミンの例にはプロパノールアミン、2級アミンの例にはメチルプロパノールアミン、3級アミンの例にはトリイソプロパノールアミンが含まれる。多くの場合、アルカノールアミンは単一アミンからなり、他の場合には特定のアルカノール基中の通常2つ以下のヒドロキシル置換基を介して1～3個のヒドロキシル基を含む。2つ以上の前記アルカノールアミンの混合物を使用することもできる。制汗性物質を流体形態のアルカノールアミンと接触させることにより表面処理することが好都合であり得る。例えば、アルカノールアミンを所要によりその融点以上に加熱しても、または適当な溶媒に溶解させてもよい。このとき、溶媒はシリコン油または炭化水素油のような疎水性液体からなり得る。所望重量のアルカノールアミンが制汗剤により、通常制汗剤上の表面層または制汗剤のコーティングとして保持されるか、或いは制汗剤の外層内に吸収されるまで、制汗剤及びアルカノールアミンを接触させたままにすることが望ましい。アルカノールアミンを溶液状で制汗剤に適用する場合には、制汗剤が所望量のアルカノールアミンを担持したときに分離する代わりに、前記溶液を所要により制汗剤と永久的に接触させることができる。この場合、その後アルカノールアミンに対する溶媒を制汗剤組成物中の液体担体またはその成分として機能させる。前記組成物では、アルカノールアミンの一部は液体担体内に残留させてもよい。

20

30

【0022】

制汗剤固体の表面処理は別個のステップで、例えば制汗性活性物質を制汗剤組成物に配合する前に実施し得、または組成物がアルカノールアミン及び制汗性活性物質を両者を相互に接触させ得る流体媒体中に含むならばその場で形成し得ると理解されたい。

40

【0023】

制汗性物質は通常0.2～8重量%のアルカノールアミンと接触させ、多くの場合、アルカノールアミンの量は制汗剤の重量に基づいて0.4～2.5重量%の範囲で選択される。特に有利には、制汗剤に基づいて0.75～1.5重量%のアルカノールアミンの範囲である。

【0024】

表面処理された制汗性物質は、しばしば液体担体を含む組成物に配合される。制汗性物質の割合は通常無水塩基準で重量で計算される。すなわち、水和水または存在する可能性の

50

ある複合体形成剤の重量は除外され、表面処理剤の重量も除外される。

【0025】

液体担体

本発明の重要な態様において、液体担体はポリグリコールエーテルを含み、このポリグリコールエーテルは好ましくは液相の5～95重量%、特に30～75重量%、更には40～60重量%を占める。前記組成物は、そのまま使用され得るかまたは例えばエアゾール組成物を作成すべく追加成分が添加され得るベース組成物として使用され得る通常のベース組成物に相当する。ポリグリコールエーテルを存在させると、有利な皮膚緩和作用が得られ、組成物をヒトの皮膚に局所適用したときに目に見える付着物の量を少なくすることができる。

10

【0026】

ポリグリコールエーテルは、通常低分子量グリコール、特にC₂～C₄グリコール（例えば、エチレングリコール、プロピレングリコールまたはブチレングリコール）から誘導され、特にポリプロピレングリコールエーテルである。望ましくは、ポリグリコール部分は5～24個のグリコール単位を含み、多数の好ましいエーテルでは10～16個のグリコール単位、特に10～16個のプロピレングリコール単位を含む。エーテル部分は好ましくは低分子量脂肪族アルコール、特に最高8個、特に3～8個の炭素原子を含むアルカノールから誘導され得る脂肪族である。アルカノールは大抵プロパノールまたはブタノールである。ポリグリコール部分が10～16個のプロピレングリコール単位、例えば13個または14個のプロピレングリコール単位を含むポリプロピレングリコールブチルエーテルが特に好適である。

20

【0027】

実際、組成物中のポリグリコールエーテル対アルカノールアミンの比率を20：1～150：1、特に30：1～120：1、好ましくは45：1～80：1の重量比で選択することが望ましい。

【0028】

上記した範囲、特に好ましい範囲内でポリグリコールエーテルとアルカノールアミンの相対比を選択することにより、懸濁剤の存在下でポリグリコールエーテル担体流体中での粒状制汗性物質の懸濁を改善させることができる。アルカノールアミンを存在させないと、前記組成物において手で振盪して再分散させることが非常に困難であるかまたは不可能である粒状物質の層が貯蔵中に沈降する傾向を示す。制汗剤と緊密に接触させるようにしてアルカノールアミンを配合すると、前記した非常に再分散しにくい層が形成する傾向が防止または実質的に排除され得る。粒状物質の一部または全部が沈降しても、アルカノールアミンを組成物に配合した場合には例えば手で振盪することにより容易に再分散させることができる。

30

【0029】

アルカノールアミンを制汗性物質に対する表面処理剤として組成物中に存在させることができ、またアルカノールアミンの一部は液体担体中に溶液状態で維持させ得ることが認められた。

【0030】

本発明の多数の特に望ましい実施態様では、粒状制汗性物質、アルカノールアミン、ポリグリコールエーテルを含む液体担体及び懸濁剤からなる制汗剤組成物が提供される。

40

【0031】

懸濁剤

上記組成物において、懸濁剤は好適には無機物質であり、特にクレーまたはシリカである。クレーは大抵モンモリロナイトであり、クレーを疎水性にすべくアミンのような有機物質で表面処理されていることが有利であり得る。モンモリロナイトの例には、ベントナイト、ヘクトライト及びコロイド状ケイ酸アルミニウムマグネシウムが含まれる。特に適当な表面処理クレーは表面処理ベントナイトからなり、これはRheoxからBentoneの商品名、例えばBentone 27、Bentone 34、Bentone 3

50

8 及び B e n t o n e L T から市販されている。好適なシリカには、ヒュームドシリカ、特に微粒子のもの、例えば C a b - o - s i l 及び A E R O S I L の商品名で市販されているものが含まれる。特に望ましい懸濁剤は疎水性に表面処理されてなるクレーである。

【0032】

懸濁剤は、大抵本発明の組成物の 0.1～15 重量%、特にベース組成物（すなわち、エアゾールを作成すべく例えば噴射剤と共に処方される前の制汗性活性物質、担体液体、アルカノールアミン及び懸濁剤のみを含む組成物）の 3～10 重量%の量で配合されている。本発明の好ましい製剤では、懸濁剤に対する制汗剤の重量比は大抵 2.5：1～20：1 の範囲で選択される。

10

【0033】

他の成分

液体担体は通常無水である。すなわち、液体担体は遊離水を含まず、特に水性相を含まない。実際、これは前記担体を含む組成物が無水であることを意味する。液体担体は、ポリグリコールエーテルに加えて、1つ以上の疎水性流体（シリコン油を含む）及び液体炭化水素を更に含み得る。液体担体は大抵組成物の 5～80 重量%を占める。組成物がエアゾール組成物を作成すべく噴射剤で増量されるベース組成物をなす場合には、液体担体の割合は特にベース組成物の 30～70 重量%である。液体担体またはその混合物は通常ベース組成物中の液相の 70～99 重量%、特に 80～95 重量%を占める。この場合、皮膚緩和薬として配合した液体成分も担体として機能すると考えられる。組成物中の他の担体の全量に対するポリグリコールエーテルの比率は大抵 10：1～1：10 の範囲から選択され、多くの好ましい組成物では 2：1～1：2 の範囲である。

20

【0034】

シリコン油が組成物の好ましい成分であり、本発明で使用可能なシリコン油は通常ポリシロキサン（特に、ポリアルキルシロキサン）またはシリコングリコールから選択される。シリコン油は揮発性及び／または不揮発性であり得るが、好ましくは揮発性油がシリコン油の大部分を占める。

【0035】

揮発性シリコンは大抵、シクロメチコンとも呼ばれる、式 $[-SiR R' -]_n -$ （式中、R 及び R' はアルキル、好ましくはメチル基を表し、n は 3～8、特に 4～5 である）を有する環状ポリシロキサンから選択される。他の好適な揮発性シリコンは、式 $SiR R' R'' - [-SiR R' -]_m - SiR R' R''$ （式中、R、R' 及び R'' はそれぞれアルキル、好ましくはメチル基を表し、m は 1～7、特に 2 または 3 である）を有する低分子量線状ポリシロキサンから選択され得る。揮発性シリコン油は通常 25℃で約 1～10 cSt の粘度を有する。揮発性シリコンとしては、ダウコーニング 225、244、245、344、345、1732、5732 及び 5750（いずれも、Dow Corning Corp. から市販されている）やシリコン GE7207、GE7158、SF1202、SF1173、SF96 及び SF1066（いずれも、米国の General Electric Co. から市販されている）が例示される。

30

【0036】

本発明の組成物に配合するのに適した不揮発性シリコン油は、典型的には 25℃で 10 cSt 以上の粘度を有する、ポリアルキルシロキサン、ポリアルカアリアルシロキサンまたはポリエーテルシロキサンコポリマーからなり得る。多くの不揮発性シリコン油は大抵約 2,000 cSt 以下の粘度を有し、他の不揮発性シリコン油はそれ以上、例えば最高約 $10^6 \sim 5 \times 10^6$ cSt の高粘度を有する。好適な不揮発性ポリアルキルシロキサンの例は、Dow Corning から 200 シリーズで市販されているものである。好適なポリアルカアリアルシロキサンは 25℃で約 15～65 cSt の粘度を有するポリメチルフェニルシロキサンからなり、例えば Dow Corning から 556 フリッドとして市販されているものである。好適なポリエーテルシロキサンは大抵 25℃で 1,200～1,500 cSt の粘度を有するジメチルポリオキシアルカレンエーテルコポリマ

40

50

ー（ジメチコンコポリマー）からなり、例えばポリシロキサンエチレングリコールエーテルコポリマーである。他の好適な不揮発性シリコン油はジメチコン／アルコールポリマー（ジメチコノール）からなるかまたは含む。

【0037】

液体担体は、所望により液体炭化水素、例えば鉱油、パラフィン油、ペトロラタムまたは炭化水素油を含み得る。

【0038】

本発明の組成物の液相は、更に他の液体皮膚緩和薬、例えば酸及びアルコールから誘導され得る（通常少なくとも12個の炭素原子を含有する）長鎖及び（通常2～6個の炭素原子を含有する）短鎖アルキル基を含む大抵炭素数約12～25の液体エステル、例えばミリスチン酸イソプロピルまたはパルミチン酸イソプロピルを含み得る。他の好適なエステルは、アリアルジーもしくはトリカルボン酸の短鎖アルキルエステル、例えばジエチルフタレートまたはジブチルフタレートからなる。他の液体皮膚緩和薬には、しばしば約200～350の分子量を有する液体脂肪アルコール、例えばオクチルドデカノールまたはイソセチルアルコールが含まれる。

【0039】

本発明の組成物は更に1つ以上の懸濁助剤（例えば、プロピレンカーボネート）を懸濁剤の0～50重量%の量で含み得る。組成物の他の任意成分は、酸化防止剤または保存剤であり、これらは時に組成物の0～0.5重量%、特に0.01～0.15重量%を占める。

【0040】

本発明の多くの制汗剤組成物の任意ではあるが重要な成分は芳香剤である。芳香剤は油性形態で配合しても及び／またはカプセル化されていてもよい。多くの本発明の組成物には0.1～3重量%の芳香剤が含まれる。ベース組成物、すなわち例えば液化噴射剤で希釈して使用される組成物には、芳香剤は比較的高量、例えば1.5～8重量%の量存在することが多い。

【0041】

上記組成物の別の任意成分は、粒状充填剤、好ましくは微細なもの、例えばタルク、微細スターチまたはスターチスクシネート誘導体（Dry Flo（商品名））または超微粒ポリエチレン（Acumist（商品名））を通常ベース組成物の0～20重量%の量、特に分配製剤中には0～5%の量含み得る。更に別の任意成分は、抗微生物剤、例えば抗菌剤を含み得、幾つかの組成物には0.1～1重量%の量で配合されている。好適な殺微生物剤には、Cosmosilの商品名で市販されているようなピグアニド塩及び塩素化フェニルエーテル及びピグアニド誘導体を含めた塩素化芳香族物質が含まれ、特にトリクロサン、Triclorban（商品名）及びクロルヘキシジンとして公知の物質が挙げられる。

【0042】

本発明の制汗剤組成物は、例えば粒状物質を1つ以上の液体と混合するために慣用されている装置を用いて成分を混合することにより作成され得る。前記組成物はスプレーまたはロールオン方式により適用するのに特に適している。

【0043】

エアゾール製剤

本発明の1つの特に望ましい態様では、上記組成物はエアゾール製剤を形成すべく噴射剤で希釈される。エアゾール製剤は、大抵40～99重量部、特に50～95重量部の噴射剤を含み、残部（60～1重量部、特に50～5重量部）は制汗剤ベース組成物からなる。

【0044】

噴射剤は通常、沸点が10℃以下、特に0℃以下の液化炭化水素またはハロゲン化炭化水素ガスから選択される。液化炭化水素ガス、特にプロパン、イソプロパン、ブタン、イソブタン、ペンタン及びイソペンタン及びその混合物を含めたC₃～C₆炭化水素を使用す

10

20

30

40

50

ることが特に好ましい。好ましい噴射剤はイソブタン、イソブタン／イソプロパン、イソブタン／プロパン、及びイソプロパン／イソブタン／ブタンである。

【0045】

使用可能な他の噴射剤には、アルキルエーテル（例えば、ジメチルエーテル）または圧縮不活性ガス（例えば、空気、窒素または炭酸ガス）が含まれる。

【0046】

所望により、エアゾール製剤には、固体がスプレーノズルを閉塞するのを防止または最小限とするために慣用量の目詰まり防止剤を配合することができる。

【0047】

エアゾール製剤は、通常該製剤から発生する圧力に耐えることができるエアゾール缶に慣用の充填具及び条件を用いて充填される。缶は通常、計量棒、バルブ及びスプレーノズルを取り付けた市販の金属缶であり得る。エアゾール製剤はスプレーノズルを介して分配される。

10

【0048】

本発明の制汗剤組成物は、発汗を抑制するためにヒトの皮膚に局所適用され得る。

【0049】

本発明を包括的に記載してきたが、本発明の特定実施態様を例として以下詳細に説明する。

【0050】

実施例 1

20

本実施例では、適当な式を有する塩基性塩化アルミニウムを適当に調整した条件下で加熱することにより得た粒径 $10 \sim 70 \mu\text{m}$ の活性化塩基性塩化アルミニウム（以下、AA CHという）（100 g）を攪拌手段を備えた容器に導入することにより、表面処理される制汗性物質を得る。その後、溶融メチルプロパノールアミン（1 g）を添加し、AA CHと数分間十分に混合する。得られた生成物は、メチルプロパノールアミンで表面処理されてなるAA CHから構成されている。

【0051】

実施例 2～8

各実施例では、粒状成分を液体成分と混合するための慣用方法を用いてエアゾール組成物を作成するために噴射剤を用いて希釈するのに適したベース組成物を得る。前記組成物を下表 1 に要約する。

30

【0052】

【表 1】

表1

成分	実施例 (重量%)							
	2	3	4	5	6	7	8	
AACH	40		38.46	10	30.8	40	38.5	
ACH		48						
疎水性クレー(Bentone 27)			7.7		3.9			
疎水性クレー(Bentone 38)	4	4.8		3.5		4	3.8	
PPG 13 ブチルエーテル(Fluid AP)	24	20.76	23.07	50	27	24	23.1	
メチルプロパノールアミン(AMP 100)	0.4	0.44	0.39	0.4	0.4	0.4	0.4	
揮発性シリコーン(DC245)	28	22				28.7	27.7	
揮発性シリコーン(DC345)			24.23					
揮発性シリコーン(DC1465)				29.55				
揮発性シリコーン(DC246)					34.8			
ヒュームドシリカ(AER-O-SIL 200)	0.4			0.05				
オクチルドデカノール	1.2							
イソプロピルミリステート					0.8			
プロピレンカーボネート			0.77					
ポリデセン(Silkflo 364)				1.5				
ジエチルフタレート					0.4			
シリコーンガム(Q2-1501)						0.8	1.5	
芳香剤	2	4	5.38	5	1.9	2.6	5	

表1に示した組成物は、沈降して圧縮された固体層の形成に対して良好な抵抗性及び手により振盪したときに沈降した固体をうまく再分散し得る能力を示した。

【0053】

実施例9～15

本実施例では、表1に示したベース組成物を液化炭化水素噴射剤を用いて一般的方法により希釈することによりエアゾール製剤を得た。前記製剤を、計量棒、バルブ及びスプレーヘッドを取り付けた一般的な吹込成形アルミニウムエアゾール缶に充填した。エアゾール組成物を下表2に要約する。CAP40はブチン、イソブタン及びプロパンの混合物であ

10

20

30

40

50

る。

【0054】

【表2】

表 2

	実施例（重量％）						
	9	10	11	12	13	14	15
噴射剤(CAP 40)	75	75	87	80	74.1	75	87
実施例2の組成物	25						
実施例3の組成物		25					
実施例4の組成物			13				
実施例5の組成物				20			
実施例6の組成物					25.9		
実施例7の組成物						25	
実施例8の組成物							13

10

20

フロントページの続き

- (72)発明者 パロット, デイビッド・テレンス
アメリカ合衆国、イリノイ・60008、シカゴ、ローリング・メドウズ、イースト・ゴルフ・ロード・3100、ユニバー・ホーム・アンド・パーソナル・ケア・ユー・エス・エイ
- (72)発明者 レニー, ジョン・ハロルド・スチュワート
イギリス国、チェシャー、・シー・エイチ・3・5・キュー・エル、ビカーズ・クロス、シャフツベリ・アベニュー・18

合議体

審判長 郡山 順

審判官 杉江 渉

審判官 齊藤 真由美

- (56)参考文献 特開昭63-15861 (JP, A)
特開昭56-127306 (JP, A)
特開平10-504302 (JP, A)
特開昭46-7350 (JP, A)
特開昭47-10500 (JP, A)
国際公開第98/35648 (WO, A1)
米国特許第4183911 (US, A)
英国特許出願公告第909220 (GB, A)
特開昭55-2699 (JP, A)
特開昭48-35029 (JP, A)
特開平3-95289 (JP, A)
特開平5-186323 (JP, A)
特開平5-201844 (JP, A)
特表平6-501963 (JP, A)
特開平9-156962 (JP, A)
M u l t a n, J. , C z e c h. 127768, C h e m i c a l A b s t r a c t s, 1969, V o l. 70. p. 219 (Abstract Number 70 : 90513)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A61K8/00-8/99