

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6765308号
(P6765308)

(45) 発行日 令和2年10月7日(2020.10.7)

(24) 登録日 令和2年9月17日(2020.9.17)

(51) Int.Cl.	F 1
A 6 1 K 8/31 (2006.01)	A 6 1 K 8/31
A 6 1 K 8/11 (2006.01)	A 6 1 K 8/11
A 6 1 K 8/25 (2006.01)	A 6 1 K 8/25
A 6 1 K 8/891 (2006.01)	A 6 1 K 8/891
A 6 1 K 8/37 (2006.01)	A 6 1 K 8/37

請求項の数 13 (全 13 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2016-569580 (P2016-569580)
(86) (22) 出願日	平成27年2月18日 (2015.2.18)
(65) 公表番号	特表2017-505825 (P2017-505825A)
(43) 公表日	平成29年2月23日 (2017.2.23)
(86) 國際出願番号	PCT/US2015/016267
(87) 國際公開番号	W02015/126874
(87) 國際公開日	平成27年8月27日 (2015.8.27)
審査請求日	平成30年2月5日 (2018.2.5)
(31) 優先権主張番号	61/941,200
(32) 優先日	平成26年2月18日 (2014.2.18)
(33) 優先権主張国・地域又は機関	米国(US)

(73) 特許権者	515135228 アール. ピー. シェーラー テクノロジー ズ、エルエルシー アメリカ合衆国、89119 ネバタ州、 ラス ベガス、2215 ルネッサンス ドライブ、スイート ピー
(74) 代理人	100104411 弁理士 矢口 太郎
(72) 発明者	マリギャーノ、イラーリア イタリア共和国、アイ-00175 ローマ、ヴィアーレ マルコ フルヴィオ ノ ベリオ、43

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】紫外フィルターのための外用無水充填製剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

外用剤の無水充填組成物を含むカプセルであって、前記充填組成物は、1 分子あたり 9 ~ 16 炭素原子を有する分岐鎖炭化水素ベースオイルと、
0.1 ~ 7 重量 % の少なくとも 1 つの合成ワックス及び 0.1 ~ 2 重量 % の少なくとも 1 つの粘土ベースの粘度調整剤と組み合わせた 4.0 ~ 16 重量 % の少なくとも 1 つのシリコーンエラストマーを含む粘度調整剤であって、前記重量 % は前記無水充填組成物の総重量に基づくものである、粘度調整剤と、

トリアジン誘導体を除く 1 またはそれ以上の UV フィルターと
を有し、

前記少なくとも 1 つの粘土ベースの粘度調整剤は、第四アンモニウム塩とヘクトライトまたはベントナイトとの反応の生成物であり、

前記無水充填組成物は、実質的に均質である皮膚上にフィルムを形成することが可能であり、

前記無水充填組成物は、10,000 cP ~ 60,000 cP の粘度を有し、および
前記カプセルは、0.09 mL ~ 4.5 mL の単位容量を提供するようにサイズ化され
るソフトゲルカプセルである、

カプセル。

【請求項 2】

請求項 1 記載のカプセルにおいて、前記ベースオイルはイソドデカンであり、前記シリ

10

20

コーンエラストマー粘度調整剤は架橋シロキサンポリマーである、カプセル。

【請求項 3】

請求項 1 記載のカプセルにおいて、前記ベースオイルはイソドデカンである、カプセル。

【請求項 4】

請求項 1 記載のカプセルにおいて、前記分岐鎖炭化水素ベースオイルは、30～65重量%の量で存在し、前記1またはそれ以上のUVフィルターは、8～20重量%の量で存在し、UV安定剤は、0.5～10重量%の量で存在し、皮膚調整剤は、5～20重量%の量で存在し、前記各重量%は前記無水充填組成物の総重量に基づくものである、カプセル。

10

【請求項 5】

請求項 1 記載のカプセルにおいて、前記1またはそれ以上のUVフィルターはメトキシケイヒ酸アルキルを有するものである、カプセル。

【請求項 6】

請求項 1 記載のカプセルにおいて、前記1またはそれ以上のUVフィルターは、メトキシケイヒ酸エチルヘキシル、メトキシケイヒ酸オクチル、メトキシケイヒ酸イソアミル、およびそれらの組み合わせから成る群から選択されるものである、カプセル。

【請求項 7】

請求項 1 記載のカプセルにおいて、前記1またはそれ以上のUVフィルターは、メトキシケイヒ酸エチルヘキシル、メトキシケイヒ酸オクチル、メトキシケイヒ酸イソアミル、オキシベンゾン、ホモサラート、オクトクリレン、サリチル酸オクチル、アヴォベンゾン、二酸化チタン、酸化亜鉛、ジエチルアミノヒドロキシベンゾイル安息香酸ヘキシル、およびそれらの組み合わせから成る群から選択されるものである、カプセル。

20

【請求項 8】

請求項 1 記載のカプセルであって、さらに、1またはそれ以上の光安定剤を有する、カプセル。

【請求項 9】

請求項 8 記載のカプセルにおいて、前記1またはそれ以上の光安定剤は、ジエチルアミノヒドロキシベンゾイル安息香酸ヘキシル、エチルヘキシルメトキシクリレン、およびマロン酸ジエチルヘキシルシリングリデンから選択される少なくとも1つの光安定剤を有するものである、カプセル。

30

【請求項 10】

請求項 1 記載のカプセルであって、さらに、少なくとも1つのUV防御促進剤を有する、カプセル。

【請求項 11】

請求項 10 記載のカプセルにおいて、前記少なくとも1つのUV防御促進剤は、光安定剤、フィルム形成剤、および酸化防止剤から選択されるものである、カプセル。

【請求項 12】

請求項 1 記載のカプセルであって、さらに、少なくとも1つのシリカベースの粘度調整剤を有するものである、カプセル。

40

【請求項 13】

請求項 1 記載のカプセルにおいて、前記少なくとも1つのシリコーンエラストマー粘度調整剤は、INC1ポリシリコーン-11、INC1ビニルジメチル/トリメチルシロキシシリケート/ジメチコンクロスポリマー、INC1ジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマー、およびINC1ジメチコンクロスポリマーから成る群から選択されるものである、カプセル。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、紫外(UV)フィルターおよび選択的に1つまたはそれ以上のUV防御促進

50

剤のための安定した無水性媒材を提供する充填製剤に関する。特に、充填製剤はカプセル、パール、およびドロップ単位服用量技術と適合性のあるスキンケア製剤中に日焼け防止を含有可能にすることを提供する。

【背景技術】

【0002】

老化に関しては多くの理論があり、いくつかの定着した理論は、一連の内因性現象（年代老化）と同様に遺伝子的、構造的要因に関連する経時の役割ばかりでなく、皮膚老化（紫外線による老化）を加速させ、早める光によって誘起された遊離基の役割が考えられる。紫外線による老化は主に日光露出の程度および皮膚色素（光線タイプ）による。

【0003】

10

日光から皮膚を毎日保護することが重要であるのはよく知られている。ビーチで一日を過ごすにしても、用事で走り回るにしても、紫外線対策は必要不可欠である。衣服で覆われない皮膚全体にはサンスクリーンを毎日適用するべきである。多種の日焼け止め製品は、次第に、日常的な保護のために作られた SPF を有するようになっている。

【0004】

UV フィルターを含有する外用製剤をカプセル化するソフトゼラチン、非ゼラチンベースのカプセル（Vegi caps（商標）カプセルまたはOpti Shell（商標）カプセルとしても知られている）を有することは重要であるだろう。

【0005】

20

多種多様な形状の日焼け防止の製品は現在市場で需要がある。しかしながら、そのような日焼け防止製品は最小限の日焼け防止指数（SPF）を提供しなければならず、通常では少なくとも SPF 15 が必要とされる。しかしながら、ゼラチンベースのカプセルおよびVegi caps（商標）カプセル、またはOpti Shell（商標）カプセルのようなカプセルシェル技術に適合可能で、且つUV フィルターおよびUV 防御促進剤を含む製品の実際の市場要件を満たす外用剤の製品は、多くの困難に直面している。

【0006】

一つの課題は粘度の低下が、特に無水製剤においてUV フィルターが加えられた際に見られるということである。粘度の低下は、製品の質感および肌触りにおいてマイナス効果を持ち、また皮膚に適用される際に製剤の特性を形成するフィルムに影響を与える。また、製品の粘度は、製剤を再生産的にカプセル化する能力と同様に製剤の物理的安定性にも影響を及ぼす。フィルム形成および質感特性は、日焼け防止指数を有する外用ケア剤および日焼け止め製品にとって重要であり得る。例えば、製剤のフィルム形成特性は、皮膚に適用する際に製品によって提供される日焼け防止指数に影響を与える。質感や肌触りの特性は、製品に対する需要者承認のために重要である。さらに、適切な製剤は製剤内に他のスキンケア活性が含有可能であることが理想的である。

30

【0007】

UV 成分を含む外用製剤を供給するソフトゼラチンやVegi caps（商標）カプセルの使用は、SPF 割合を潜在的に提供するUV 成分を含む充填組成物を調剤するために魅力的で便利な使い切りのオプションを提供する。通常は、これらのカプセルは充填材料約 0.09 ml ~ 約 4.5 ml の単位用量を含有し、充填材料を調合するための「ねじ切り」、または他の一方の端で取り外し可能な形状を有する。そのようなソフトゼラチンやVegi caps（商標）カプセルは、経口投薬製剤のソフトゲルの調製で良く知られた方法、例えば、ソフトゲルの理想的な形を形成するために表面に空洞部分が成形された 1 ペアの円筒金の間を通過する時点で 2 枚のゼラチンシート間で充填材料をカプセル化することによって調製され得る。

40

【0008】

標準的な他のカプセル化技術と適合する製剤、およびJintan（商標）および液体が詰まった 2 個の部分から成るハードシェルカプセル技術を含むカプセル形状を提供することも理想的である。

【0009】

50

本発明は SPF をサポートする UV 成分が包含された製剤を提供し、且つ異なったカプセル化技術およびカプセル形状との適合性を提供する。

この出願の発明に関連する先行技術文献情報としては、以下のものがある（国際出願日以降国際段階で引用された文献及び他国に国内移行した際に引用された文献を含む）。

（先行技術文献）

（特許文献）

- （特許文献 1）米国特許第 5,082,661 号明細書
 （特許文献 2）米国特許第 6,248,339 号明細書
 （特許文献 3）米国特許出願公開第 2004/0005279 号明細書
 （特許文献 4）米国特許出願公開第 2004/0228821 号明細書
 （特許文献 5）米国特許出願公開第 2010/0330011 号明細書
 （特許文献 6）米国特許出願公開第 2012/0189676 号明細書
 （特許文献 7）国際公開第 2012/143344 号
 （特許文献 8）特開 2003-063927 号公報
 （特許文献 9）米国特許第 6,124,348 号明細書
 （特許文献 10）米国特許出願公開第 2010/0010091 号明細書
 （特許文献 11）米国特許出願公開第 2011/0200543 号明細書
 （特許文献 12）米国特許出願公開第 2012/0128611 号明細書
 （特許文献 13）米国特許出願公開第 2012/0321576 号明細書
 （特許文献 14）米国特許出願公開第 2013/0071341 号明細書
 （特許文献 15）米国特許出願公開第 2013/0230474 号明細書
 （特許文献 16）欧州特許出願公開第 2127633 号明細書
 （特許文献 17）欧州特許出願公開第 2266527 号明細書

10

- （非特許文献）
- （非特許文献 1）"Universal UV Shield SPF 30", Mintel; XP002770531; September 2009; retrieved from www.gnpd.com; Database Accession No. 1159837;

20

- （非特許文献 2）"Natural Sunblock SPF 50", Mintel; XP002770532; September 2009; retrieved from www.gnpd.com

30

- （非特許文献 3）"Resistantiel UV AGXpert SPF 50 / PA+++", Mintel; XP002770533; April 2013; retrieved from www.gnpd.com; Database Accession No. 2056785.

- （非特許文献 4）"Quickies Pocket Packs Photo Age Protection Gel", Mintel; XP002770534; February 2005; retrieved from www.gnpd.com; Database Accession No. 10207971.

40

- （非特許文献 5）"Everyday Protective Base", Mintel; XP002770535; February 2005; retrieved from www.gnpd.com; Database Accession No. 336297.

- （非特許文献 6）"Glymed Plus - Body Sun Gel", Mintel; XP002770536; August 2004; retrieved from www.gnpd.com; Database Accession No. 10184368.

- （非特許文献 7）"Krem Ochronny do Cery Fotowrazliwej Body Cream", Mintel; XP002770537; August 2003; retrieved from www.gnpd.co

50

m ; Database Accession No. 223494.

(非特許文献8) European Search Report; Mailed 2017-06-26 for EP Application No. EP15752673.3

(非特許文献9) International Search Report and Written Opinion; Mailed 2015-05-28 for PCT/US2015/016267

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0010】

1つの観点によれば、本発明は、9～16炭素原子および粘度調整剤を有する分岐炭化水素ベースのオイルから成る無水ベースの組成物を提供する。

【0011】

2つ目の観点によれば、本発明は、多種多様のカプセル技術に適合可能な保存に安定した無水充填製剤を提供し、またはUVフィルターや選択的に1もしくはそれ以上のUV防御促進剤のような1もしくはそれ以上のUV成分ばかりでなく、ベースオイルおよび粘度調整剤を含む無水ベース組成物を含む。

【0012】

3つ目の観点によれば、本発明は、ソフトゼラチンカプセルおよびシェル内の無水充填材料から成るUVフィルターを含むソフトカプセル製剤を提供し、または調剤する際に1もしくはそれ以上の日焼け防止含有量を含むフィルムを提供する。充填材料は本発明に基づく充填材料であっても良く、また粘度の高い炭化水素オイル、UVフィルター、および選択的に1もしくはそれ以上のUV防御促進剤を含んでも良い。

【図面の簡単な説明】

【0013】

【図1】図1は、実施例1の製品の短期的な効果の主観的評価の結果を示す。

【発明を実施するための形態】

【0014】

説明の目的のため、以下本発明の原理がさまざまな例示的な実施形態を参照して解説される。特定の実施形態がここで具体的に述べられているが、当業者であれば同じ原理が他の手段および方法に同様に応用可能であり、使用できることが容易に認識出来るはずである。本発明について開示する実施形態を詳細に説明する前に、示されているどの特定の実施形態の詳細にも本発明の利用を限定しないことが理解されるべきである。さらに、ここで用いられる用語は説明のためのものであり限定のためのものではない。また、ここで示される特定の順序の工程に触れているいくつかの手法については、多くの場合、これらの工程が当業者によって認識されるようなどの順序によってでも実行可能なものであり、よって本新規手法はここに開示される特定の工程順序に限定されるものではない。

【0015】

ここおよび特許請求の範囲にて用いられる、単数形の「a」、「a n」、および「t h e」は文脈から明らかにそうでない限り、複数の対象を含むものとする。さらに、「a」、「(または「a n」)」、「one or more」および「at least one」の表現は互換可能に用いられる。「comprising」、「including」、「having」および「constructed from」などの表現もまた互換可能に用いられるものとする。

【0016】

ここで用いられる「カプセル」は2個のハードシェルまたはソフトゼラチンおよび/またはロータリー式ダイマシーンを利用して製造される非ゼラチンカプセルを示す。

【0017】

ここで用いられる「単位容量」は、約0.09mlから4.5mlの量を示す。

【0018】

10

20

30

40

50

一つの実施形態において、本発明は粘度の高い炭化水素成分およびUV成分を含む充填製剤のベースに関連する。UV成分は1もしくはそれ以上のUVフィルターおよび選択的に1もしくはそれ以上のUV防御促進剤を含んでも良い。このベースは、日焼け止め成分を含む製剤および様々なタイプのアンチエイジング製品の使用のために設計された製剤を含む広範囲の製剤に使用され得る。

【0019】

別の実施形態において、本発明は単回使用分の容器を使って単回使用分のアプリケーションに適用される充填製剤に関連する。充填製剤は1もしくはそれ以上のUV材料を含む。充填製剤は保存に安定しており、アプリケーションによりフィルム形成可能で、ソフトゲルカプセルおよびハードシェルカプセルを含む多種多様な単回使用の容器技術に適合可能である。

10

【0020】

別の実施形態において、本発明は充填内に1もしくはそれ以上のUV材料を含むソフトゲルカプセル製剤に関連する。この発明による製剤は安定しており、美容上受け入れ可能な外用組成物を提供し、パールおよびドロップに適合可能であると同様にソフトゲルまたはVegi caps（商標）カプセルを含むがそれに限定されないソフトゲルカプセルの安定性を損なわず、本発明はUVフィルターおよびサンスクリーン、便利な単回使用容器中に選択的に1もしくはそれ以上のUV防御促進を含む魅力的な外用製剤を提供する。本発明の単回投与製剤はまた他の無水充填／油状充填の適合システム、例えば、2つのハードシェルカプセル、ジンタンカプセル、動物のおよび非ゼラチンベースのカプセルシェル技術、およびVegi caps（商標）カプセル製剤においても使用可能である。

20

【0021】

充填製剤とUV成分およびカプセル技術の適合力によって皮膚上に均質のフィルムを形成することが可能な組成物を単位用量形式で提供することが可能になる。結果として、その組成物は、皮膚に対して他の好ましい製品特性を提供できるばかりでなく、日焼け防止指数（SPF）の媒体としても使用され得る。本発明の製剤の質感は、少なくともUVフィルターおよび1もしくはそれ以上のUV防御促進剤を含むUV成分の含有を許容し、それが今度はカプセルのような単位用量納入形式によって提供されたものを含む広範囲の日焼け止め製剤でSPF使用可能性を提供することになる。

30

【0022】

本発明のベース組成物は様々な成分を含み得る。一つの実施形態では、ベース組成物1もしくはそれ以上のUVフィルターおよび1もしくはそれ以上のUV防御促進剤を補助する粘度の高い炭化水素ベースを含む。粘度の高い炭化水素ベースは、無水外用剤の形状である充填組成物を形成するために使用される。

【0023】

本発明のベース組成物は、1もしくはそれ以上の部分的に軽い揮発性油を含んでも良い。適切な油は炭素および水素のみ含む炭化水素である。一つの実施形態では炭化水素の油は9～16炭素原子を有する分岐脂肪族炭化水素であっても良い。炭化水素油の一つの実施例はイソドデカンである。

40

【0024】

本発明に使用可能な他の揮発性油の種類は、例えば、ジシロキサン、トリシロキサン、およびジメチコンのような低粘性直鎖シロキサンを含む。いくつかの実施形態では揮発性油は下記に記された粘度調整剤の溶媒としての役割を果たす。

【0025】

炭化水素油の粘度は、1もしくはそれ以上の適切な粘度調整剤を使って調整される。ある実施形態では、炭化水素油の成分は粘度の高く、ゲル状のものであり、増粘剤の一つのみまたは組み合わせである1もしくはそれ以上の粘度調整剤を使ってその粘度を高めている。適切な粘度調整剤は、例えば、シリカ、ヒュームドシリカ、およびシリル化シリカ、ジメチルシリル化シリカ、ジメチコンシリル化シリカ、および他の無水粘度調整剤のような反応生成物を含む。例えば、第四アンモニウム塩とジステアルジモニウムヘクトライト

50

、ステアラルコニウムベントナイトおよびステアラルコニウムヘクトライトのようなヘクトライトまたはベントナイトとの反応によって得られる。ヘクトライトは、ベネトナイト粘土の主要な構成要素であるモンモリロナイトミネラルの一つである。ベネトナイトは、天然の含水コロイド状ケイ酸アルミニウム粘土である。他の適切な粘度調整剤は、例えば、プロピレンカーボネート、ジカプリルカーボネート、架橋シロキサンポリマー、ポリジメチルシロキサン、ポリエチレンポリマーのような合成ワックスのように大部分が少なくとも30もしくはそれ以上の炭素原子を有するポリマー単位で作られたカーボネートを含む。ポリエチレンは、50～120の融点範囲を有しても良い。

【0026】

いくつかの実施形態では、粘度、安定性、皮膚感触、フィルム形成力および材料をカプセル化する能力の間でのバランスを提供するために2もしくはそれ以上の粘度調整剤を組み合わせて使用することが望ましい。この目的で使用する粘度調整剤の一つの種類は、シリコンエラストマーである。シリコンエラストマーは、1もしくはそれ以上の他の種類の粘度調整剤を組み合わせて使用され得る。例えば、1もしくはそれ以上のシリコンエラストマーと1もしくはそれ以上の合成ワックスとを組み合わせて使用されても良い。他の組み合わせはシリコンエラストマーと1もしくはそれ以上の粘土ベースの粘度調整剤、またはシリコンエラストマー、合成ワックスおよび粘土ベースの粘度調整剤の組み合わせ、または合成ワックスおよび粘土ベースの粘度調整剤の組み合わせを含む。前述の夫々の組み合わせは、さらに1もしくはそれ以上のシリカベースの粘度調整剤と組み合わせても良い。

10

【0027】

シリコンエラストマー粘度調整剤は、例えば、架橋シロキサンポリマーおよびポリジメチルシロキサンを含む。より具体的な例は、INCIポリシリコン-11、溶媒の存在下でのビスピニルジメチコンおよびハイドロゲンジメチコンの反応によって形成される架橋ジメチルシロキサンを含む。ビスピニルジメチコンはジメチコンの誘導体であり、その1つのメチル基のシロキサン鎖の夫々の末端でビニル基に置換される。ハイドロゲンジメチコンはジメチコンの誘導体であり、そのメチル基のいくつかは水素原子で置換される。INCIは化粧品成分の国際的表示名称 (International Nomenclature for Cosmetic Ingredients) を意味する。

【0028】

他の適切な架橋シロキサンポリマーは架橋ハイドロゲンジメチコンとビニルジメチル/トリメチルシロキシシリケートによって形成されるINCIビニルジメチル/トリメチルシロキシシリケート/ジメチコンクロスポリマーである。

20

【0029】

他の適切な架橋シロキサンポリマーは、ハイドロゲンジメチコンおよびビニルジメチコンの反応によって形成される架橋ジメチルシロキサンポリマーであるINCIジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマーである。ビニルジメチコンはいくつかのメチル基がビニル基によって置換されるジメチコンの誘導体である。ビニル基はシロキサン鎖の末端またはシロキサン鎖に側鎖して存在し得る。

【0030】

他の適切な架橋シロキサンポリマーはINCIジメチコンクロスポリマーであり、それはアルキル基と架橋されたジメチコンのポリマーであり、Dow Corning EL 8040IDとして利用可能である。2もしくはそれ以上のこれらのシリコンエラストマーの混合物は、単体で使用されても良く、または他の粘度調整剤との組み合わせで使用しても良い。

30

【0031】

充填組成物において使用されるシリコンエラストマー粘度調整剤の量は約4.0～約16.0wt%であっても良く、より好ましくは約5～約14wt%である。

【0032】

合成ワックス粘度調整剤は、例えば、ポリエチレンポリマーを含み、それは大部分が少

40

50

なくとも30もしくはそれ以上の炭素原子を有するポリマー単位から成る。好ましいポリエチレンワックスは0.1~10%間、より好ましくは60~80の融点範囲を有する26もしくはそれ以上の炭素原子を有する0.5~5%間のポリマー単位のように低レベルを含むものである。粘度が高く、フィルム形成が可能で、且つ製品の皮膚触感を改善できるのでポリエチレンが好ましい。2もしくはそれ以上の合成ワックス材料の混合物は単体で使用されても良く、また他の粘度調整剤との組み合わせで使用されても良い。充填組成物において使用される合成ワックス粘度調整剤の量は、約0.1~約7wt%であっても良く、より好ましくは約0.5~約5wt%である。

【0033】

粘土ベースの粘度調整剤は、例えば第四アンモニウム塩と、ジステアルジモニウムヘクトライト、ステアラルコニウムベントナイトおよびステアラルコニウムヘクトライトのようなヘクトライトまたはベネットライトの反応によって得られた粘度調整剤を含む。ヘクトライトはベネットナイト粘土の主要な構成要素であるモンモリロナイトミネラルの一つである。ベネットナイトは、天然の含水コロイド状ケイ酸アルミニウム粘土である。2もしくはそれ以上のこれらのミネラルの組み合わせは、単体で使用されても良く、または他の粘度調整剤との組み合わせで使用されても良い。充填組成物において使用される粘土ベースの粘度調整剤の量は、約0.1~約2wt%であっても良く、より好ましくは約0.15~約1wt%である。

【0034】

シリカベースの粘度調整剤は、例えば、シリカ、ヒュームドシリカ、およびシリル化シリカ、ジメチルシリル化シリカ、ジメチコンシリル化シリカ、および他の無水粘度調整剤のような反応生成物を含む。2もしくはそれ以上のこれらのミネラルの混合物は単体で使用されても良く、または他の粘度調整剤との組み合わせで使用されても良い。充填組成物において使用されるシリカベースの粘度調整剤の量は、約0.01~約5wt%であっても良く、より好ましくは約0.02~約3.5wt%である。

【0035】

一つの特に適切なベースオイル組成物は、INCIPOLシリコン-11、INCIPOLビニルジメチル/トリメチルシロキシシリケート/ジメチコンクロスopolマー、INCIPOLジメチコン/ビニルジメチコンクロスopolマーおよびINCIPOLビニルジメチコンクロスopolマーのような架橋シロキサンopolマーと粘度の高いイソドデカンのような粘度の高い炭化水素油組成物である。

【0036】

本発明はまた、他の種類の外用剤ばかりでなく、美容剤、日焼け止め製品、市販(OTC)の外用剤、医療外用剤、医薬製品として使用する充填製剤に関連する。本発明の充填製剤は、上記のベース組成物、およびUVフィルター、および選択的に1もしくはそれ以上のUV防御促進剤のようなUV成分から成っても良い。充填製剤はさらに選択的に1もしくはそれ以上の付加的UVフィルターから成る。本発明に基づく典型的な充填製剤は例えば下記の表1に示される成分を含んでも良い。

【0037】

【表1】

表1

成分	Wt.%	好ましい Wt%	より 好ましい Wt.%
増粘剤および/または粘度調整剤	5-70	8-40	10-20
炭化水素油	20-70	30-65	40-60
UVフィルター	7-30	8-20	8-15
UV安定剤	0.0-10	0.5-10	3-8
皮膚調整剤	0-20	5-20	10-20

【0038】

10

20

30

40

50

UV フィルターは UV 波長領域内で、特に 290 ~ 400 の波長で放射線を吸収し、反射し、散乱させる成分である。本発明の充填組成物は 1 もしくはそれ以上の UV フィルターを含んでも良い。本発明で使用され得る UV フィルターの一つの種類は、トリアジン誘導体に基づく UV フィルター物質である。本発明で使用され得る一つの分類は、メトキシケイヒ酸エチルヘキシル、メトキシケイヒ酸オクチル、メトキシケイヒ酸イソアミルのようなメトキシケイヒ酸アルキルを含む。本発明で使用され得る他の UV フィルターは、オキシベンゾン、ホモサラート、オクトクリレン、サリチル酸オクチル、アヴォベンゾン、二酸化チタン、酸化亜鉛を含む。ジエチルアミノヒドロキシベンゾイル安息香酸ヘキシルもまた UV フィルター物質に使用され得る。

【0039】

10

UV 防御促進剤は、製剤効率を改善する成分、光安定剤、塗膜形成剤、酸化防止剤、および UV フィルターの溶解力を改善する成分のような成分である。充填製剤は UV 促進剤の混合物ばかりでなく、選択的に 1 もしくはそれ以上のこれら夫々の UV 促進剤を含む。

【0040】

光安定剤は光によって誘発される化学的または物理的劣化から製品を保護するために化粧品に使用される。多くの製品において、UV フィルターと光安定剤の組み合わせは紫外線から皮膚や髪を保護するために利用される。本発明の充填組成物は光安定剤または 1 もしくはそれ以上の UV フィルターおよび 1 もしくはそれ以上の光安定剤の組み合わせを含んでも良い。適切な光安定剤は、例えば、ジエチルアミノヒドロキシベンゾイル安息香酸ヘキシル、エチルヘキシルメトキシクリレンおよびマロン酸ジエチルヘキシルシリングリデンを含んでも良い。

【0041】

20

UV フィルターおよび光安定剤の特に有用な組み合わせは、ジエチルアミノヒドロキシベンゾイル安息香酸ヘキシルと組み合わせたメトキシケイヒ酸エチルヘキシルである。この組み合わせは単体、または他の光安定剤との組み合わせ、ISO 24444 の方法および 7.2 の UVA 防御指数 (PF) を使ってインビボ測定で測られた時、ISO 24443 の方法を使ってインビボ測定で測られた時に 15 の SPF または 20 以上の SPF を提供し得る。

【0042】

30

充填製剤の最終的な粘度範囲は 10,000 cP (センチポイズ) ~ 60,000 cP または 20,000 cP ~ 50,000 cP である。

【0043】

充填製剤は、例えば、光保護効果、皮膚光沢剤、外観を改善し、柔軟性を復元し、皮膚を保護するための皮膚調整剤、皮膚平滑原料、皮膚平滑剤、保湿剤、メラニン抑制剤、フリーラディカル消光剤、抗炎症薬、およびそれらの混合物を有する化合物のような他の選択的な成分を含む。これらの追加材料は、これらの成分を使用する製品の当業者に周知である従来の量で利用され得る。

【0044】

40

本願の充填製剤は、日光によるダメージから皮膚を保護するのを助け、選択的に早い段階で皮膚老化を防ぐのを助ける日焼け止め製品の形状で日常的に使用され得る。これらの製品は、単位投与量でのソフトゲルまたは V e g i c a p s (商標) カプセルで便利に提供され得る。充填製剤は、投薬される際にアプリケーションによりその製品の SPF を強化し得るので、実質的に均質である皮膚上にフィルムを形成するように作られる。

【0045】

本発明の製剤は、日焼け防止を提供するために、例えば、少なくとも 15 の SPF または少なくとも 20 の SPF を提供するために利用され得る。1 もしくはそれ以上の UV フィルターおよび選択的に 1 もしくはそれ以上の UV 防御促進剤は、必要に応じて SPF 15 または 20 を提供するように利用される。

【0046】

本発明に基づくアンチエイジング、スキンケア薬理学的なまたは化粧品製剤はしわを軽

50

減し、特に短期間で、皮膚を明るくし、メラニンの黒ずんだ部分を軽減したり防いだりするのを助け、および／またはフリーラディカル保護を提供する。一つの実施形態では、本発明は短期間のしわ軽減効果および日焼け防止を、長期間の皮膚を明るくする効果と組み合わせて作られる日常使用の製品を提供する。

【0047】

さらなる形態において、本発明は上記のように充填製剤を含むカプセルに関連する。カプセルは、例えば、ソフトゲルまたはVegi caps（商標）カプセルであっても良い。他の実施形態では、カプセルはハードシェルカプセルであっても良い。いくつかの実施形態では、カプセルはゼラチンから成り、他の実施形態ではカプセルはカプセル組成物内にゼラチンを使用する。一つの実施形態では、カプセルは充填製剤の単位投薬量を提供するように製造される。

10

【0048】

本明細書において記載されたサイズ範囲およびそれに類似したもののような数字範囲は、特に記載がなければ適宜検討されるべきである。成分名はINCI web based international cosmetic Ingredient Dictionary & HandbookおよびCosIng cosmetic ingredients databaseから抽出される。

【0049】

実施例1

次の実施例は、本開示の方法と組成物の具体例であるが、それに制限されない。本分野で通常直面する、および当業者にとっては明白である様々な状態およびパラメーターの他の適切な変更や適応は本開示の範囲内である。

20

【0050】

表2の製剤は日常の日焼け止め製品の日焼け防止指数 $>/ = 15$ を提供するために利用された。製剤の基本成分は、製剤の総量に基づいて重量百分率で定められた量で下記の表2に記される。製剤はベースオイルとしてイソデカン、および粘度調整剤としてポリエチレン、シリカ、ジメチコンクロスポリマー、ステアラルコニウムヘクトライト、ポリビレンカーボネット、およびジカプリルカーボネットを含む。製剤は、日光のダメージから皮膚を保護し、紫外線による老化を防ぐのを助ける目的でジエチルアミノヒドロキシベンゾイル安息香酸ヘキシル、エチルヘキシルメトキシクリレンおよびマロン酸ジエチルヘキシルシリングリデンばかりでなくメトキシケイヒ酸エチルヘキシルUVフィルターを含む。

30

【0051】

【表2】

表 2

成分	pph
イソデカン	50.2600
ジメチコンクロスポリマー	7.0400
メキシケイヒ酸メチルヘキシル	7.0000
ネオペンチルグリコールジヘプタノエート	5.7000
シリカ	4.0000
エチルヘキシルメキシクリレン	4.0000
ポリエチレン	4.0000
C12-15アルキルベンゾエート	4.0000
ジエチルアミノヒドロキシベンゾイル安息香酸ヘキシル	3.5000
トリ(カプリル酸／カプリン酸)グリセリル	3.1946
ジカプリルカーボネット	2.6100
マロン酸ジエチルヘキシルシリングリデン	1.8000
エチルヘキシルパルミテート	0.9530
ステアラルコニウムヘクトライト	0.3000
プロピレンカーボネット	0.0900
ジメチルシリル化シリカ	0.0250

40

【0052】

表2の組成物はUV防止指數が検査され、その結果は下記の表3で示される。

【0053】

【表3】

表 3

SPF - UVB 保護 インビボ測定 – ISO24444	24.2
UVA PF (保護指數) インビトロ測定 – ISO24443	7.2
照射前 インビトロ臨界波長評価 COLIPA 2011 方法 : 372 nm	

10

20

【0054】

表2の製品の主観評価は18歳～55歳の30人のボランティアのテスト被験者に製品を提供することによって実行された。製品の日常的なアプリケーションは、実際に、テスト被験者らにより通常の使用条件下で自宅にて実行された。最初のアプリケーション後少なくとも2時間でボランティアらは製品の主観評価を提供した。主観評価の結果は図1に示される。図1の主観評価は、製品がボランティア被験者らにとって非常に好評であったことを示す。

【0055】

本発明の多くの特徴および利点を、本発明の構造および機能の詳細と共に上述の説明で明らかにしてきたが、本開示は例示に留まり特に要素の形状、サイズおよび配置などの態様については、本発明の原理の枠内かつ添付の特許請求の範囲で用いられる言葉がとりうる意味を最大限に用いて変更が加えられることが可能である。

30

【図1】

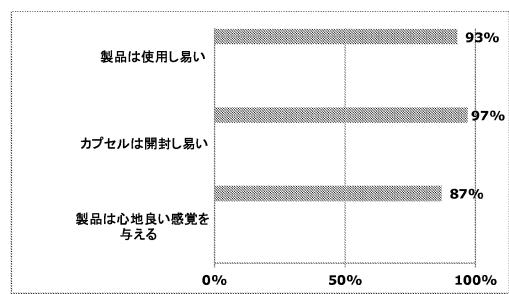


図 1

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
A 6 1 Q 17/04 (2006.01) A 6 1 Q 17/04

(72)発明者 ピローニ、ラウラ
イタリア共和国、アイ - 0 0 1 4 4 ローマ、ヴィアーレ チェサレ パヴェーゼ、1 4 1

審査官 駒木 亮一

(56)参考文献 特開2 0 1 1 - 1 2 1 9 4 7 (JP, A)
特表2 0 1 0 - 5 3 2 4 1 3 (JP, A)
米国特許出願公開第2 0 1 3 / 0 2 3 0 4 7 4 (US, A 1)
米国特許第0 5 0 8 2 6 6 1 (US, A)
特表平0 8 - 5 0 2 6 7 2 (JP, A)
特開2 0 1 3 - 1 0 3 8 8 5 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A 6 1 K 8 / 0 0 - 8 / 9 9
A 6 1 Q 1 / 0 0 - 9 0 / 0 0
A 6 1 K 9 / 0 0 - 9 / 7 2
A 6 1 K 4 7 / 0 0 - 4 7 / 6 9
J S T P l u s / J M E D P l u s / J S T 7 5 8 0 (J D r e a m I I I)