

【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20年3月6日(2008.3.6)

【公開番号】特開2005-336196(P2005-336196A)

【公開日】平成17年12月8日(2005.12.8)

【年通号数】公開・登録公報2005-048

【出願番号】特願2005-175024(P2005-175024)

【国際特許分類】

A 6 1 K 8/00 (2006.01)

A 6 1 Q 5/00 (2006.01)

A 6 1 K 8/72 (2006.01)

A 6 1 K 8/06 (2006.01)

B 0 1 F 17/42 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 7/06

A 6 1 K 7/00 J

A 6 1 K 7/00 N

B 0 1 F 17/42

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 47/34

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月18日(2008.1.18)

【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

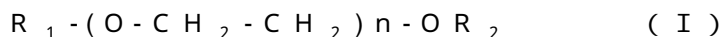
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

少なくとも一種の油と少なくとも一種の両親媒性脂質とを、前記両親媒性脂質の量に対する前記油の量の重量比率が 1 . 5 から 1 0 の間となるように含有する増粘した水中油型ナノエマルションの調製方法であって、

- ・水相と油相とを混合する工程、
- ・得られた混合物を 4 5 未満の周囲温度でかつ  $6 \times 10^{-7} \sim 18 \times 10^{-7}$  Pa の範囲の圧力でホモジナイズする工程、かつ
- ・得られた混合物に下記式：



(上記式中：

$R_1$  は 1 2 から 2 0 の炭素原子を含むアシル基を示し、それは直鎖状又は分岐状で飽和又は不飽和であり、

$R_2$  は水素原子、1 2 から 2 0 の炭素原子を含むアシル基であって、直鎖状又は分岐状で飽和又は不飽和であるものを示し、

$n$  は 1 0 0 から 3 0 0 の間の数である)

を有する少なくとも一種のポリエチレングリコールエステルを添加する工程を含む方法。

【請求項 2】

親水性部分 (  $-(O-CH_2-CH_2)_n-O$  ) と疎水性部分 (  $R_1$  及び / 又は  $R_2$  ) の間の重量比率が 8 から 1000 の間であることを特徴とする請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

油の量と両親媒性脂質の量との間の重量比率が 1.5 から 6 であることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の方法。

【請求項 4】

式 ( I ) の PEG エステルの量が、組成物全重量に対して 0.01 ~ 20 重量%であることを特徴とする請求項 1 から 3 の何れか一項に記載の方法。

【請求項 5】

前記両親媒性脂質が少なくとも一種の非イオン性の両親媒性脂質及び / 又は少なくとも一種のアニオン性の両親媒性脂質を含むことを特徴とする請求項 1 から 4 の何れか一項に記載の方法。

【請求項 6】

非イオン性の両親媒性脂質が、

- 1 / シリコン界面活性剤；
- 2 / 45 以下の温度で液体であり、1 から 60 のエチレンオキシド単位を含むポリエチレングリコール、ソルビタン、2 から 30 のエチレンオキシド単位を含むグリセロール、2 から 15 のグリセロール単位を含むポリグリセロールによって形成される群から選択される少なくとも一種のポリオールと、少なくとも 1 つの飽和又は不飽和の、直鎖状又は分岐状の  $C_8 - C_{22}$  アルキル鎖を含む少なくとも一種の脂肪酸とのエステルから選択される両親媒性脂質；
- 3 / 脂肪酸又は脂肪アルコール、カルボン酸及びグリセロールの混合エステル；
- 4 / 糖の脂肪酸エステル及び糖の脂肪アルコールエーテル；
- 5 / 45 以下の温度で固体であり、グリセロールの脂肪エステル、ソルビタンの脂肪エステル及びソルビタンのオキシエチレン化された脂肪エステル、エトキシ化された脂肪エーテル及びエトキシ化された脂肪エステルから選択される界面活性剤；
- 6 / エチレンオキシド ( A ) とプロピレンオキシド ( B ) のブロックコポリマーから選択されることを特徴とする請求項 1 から 5 の何れか一項に記載の方法。

【請求項 7】

非イオン性の両親媒性脂質が、

- ポリエチレングリコールイソステアレート ( 8 モルのエチレンオキシド ) ；
- ジグリセリルイソステアレート ；
- 10 グリセロール単位を含むポリグリセリルモノラウレート及びモノステアレート ；
- ソルビタンオレアート ；
- ソルビタンイソステアレート

から選択されることを特徴とする請求項 5 又は 6 に記載の方法。

【請求項 8】

アニオン性の両親媒性脂質が、

- アルキルエーテルシトレート ；
- アルコキシ化アルケニルスクシナート ；
- アルコキシ化グルコースアルケニルスクシナート ；
- アルコキシ化メチルグルコースアルケニルスクシナート

から選択されることを特徴とする請求項 5 から 7 の何れか一項に記載の方法。

【請求項 9】

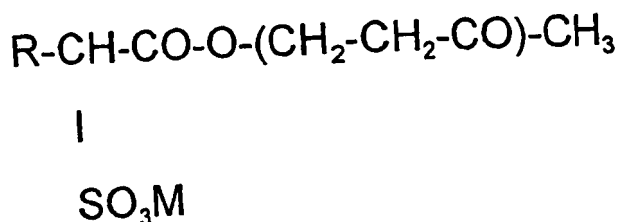
両親媒性脂質の量が、ナノエマルジョンの全重量に対して 0.2 ~ 15 重量%の範囲であることを特徴とする請求項 1 から 8 の何れか一項に記載の方法。

【請求項 10】

両親媒性脂質が、

- リン酸ジセチル及びリン酸ジミリスチルのアルカリ塩 ；
- 硫酸コレステリルのアルカリ塩 ；

- リン酸コレステリルのアルカリ塩；
  - アシルグルタミン酸の一ナトリウム又は二ナトリウム塩を含むリポアミノ酸及びその塩；
  - ホスファチジン酸のナトリウム塩；
  - リン脂質；
  - 下記式のアルキルスルホン酸誘導体：
- 【化 1】



（上記式中、RはC<sub>16</sub> - C<sub>22</sub> アルキル基を表し、Mはアルカリ金属又はアルカリ土類金属である）

から選択されるアニオン性両親媒性脂質及びカチオン性両親媒性脂質から形成される群から選択される少なくとも一種の付加的なイオン性の両親媒性脂質をさらに含むことを特徴とする請求項 1 から 9 の何れか一項に記載の方法。

【請求項 11】

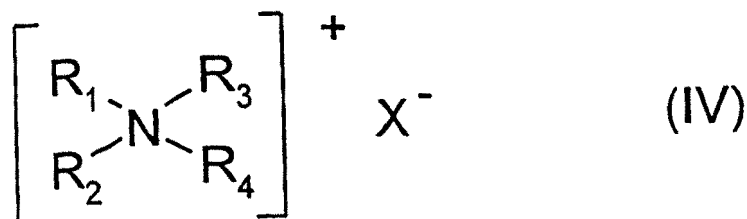
カチオン性の両親媒性脂質が、第 4 級アンモニウム塩及び脂肪アミンからなる群から選択されることを特徴とする請求項 10 に記載の方法。

【請求項 12】

第 4 級アンモニウム塩が、

- 下記一般式（IV）：

【化 2】



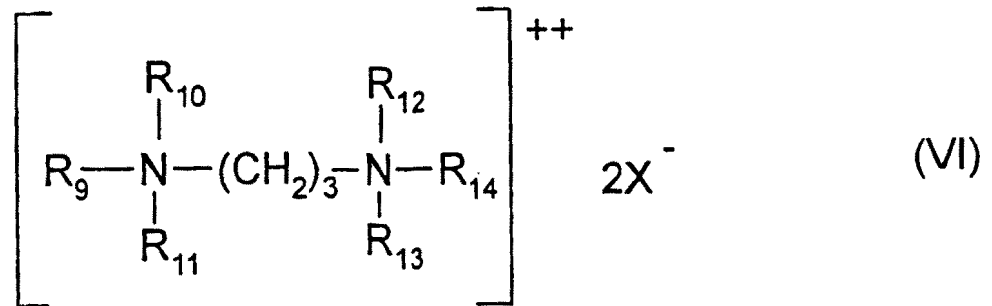
（上記式中、基 R<sub>1</sub> ~ R<sub>4</sub> は、同一でも異なってもよく、1 から 30 の炭素原子を含む直鎖状又は分岐状の脂肪族基、又はアリール又はアルキルアリールを含む芳香族基を表し、X は、ハライド、ホスファート、アセタート、ラクタート、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルファート及びアルキル-又はアルキルアリールスルホナートの群から選択されるアニオンである）

の第 4 級アンモニウム塩；

- イミダゾリニウムの第 4 級アンモニウム塩；

- 下記式（VI）：

## 【化 3】



(上記式中、 $R_9$  は約 16 から 30 の炭素原子を含む脂肪族基を示し、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$  及び  $R_{14}$  は、同一でも異なってもよく、水素及び 1 から 4 の炭素原子を含むアルキル基から選択され、そして  $X$  は、ハライド、アセタート、ホスファート、ニトラート及びメチルスルファートの群から選択されるアニオンである)

の第 4 級ジアンモニウム塩；

-少なくとも 1 つのエステル官能基を含む第 4 級アンモニウム塩

から選択されることを特徴とする請求項 11 に記載の方法。

## 【請求項 13】

前記付加的なカチオン性又はアニオン性の両親媒性脂質が、ナノエマルジョン中に、ナノエマルジョンの全重量に対して 0.01 ~ 10 重量%の範囲の濃度で存在することを特徴とする請求項 10 から 12 の何れか一項に記載の方法。

## 【請求項 14】

油が、植物油、動物油、合成油、鉱油、ハロゲン化油、鉱酸とアルコールのエステル、液体カルボン酸エステル及びシリコンから選択されることを特徴とする請求項 1 から 13 の何れか一項に記載の方法。

## 【請求項 15】

油の量が、ナノエマルジョンの全重量に対して 2 ~ 40 重量%の範囲であることを特徴とする請求項 1 から 14 の何れか一項に記載の方法。

## 【請求項 16】

ナノエマルジョンが水溶性又は脂溶性の化粧品用又は皮膚医薬用の活性剤を含有することを特徴とする請求項 1 から 15 の何れか一項に記載の方法。

## 【請求項 17】

ナノエマルジョンの油小滴が 30 nm ~ 100 nm の平均サイズを有することを特徴とする請求項 1 から 16 の何れか一項に記載の方法。

## 【請求項 18】

ナノエマルジョンが 60 NTU から 600 NTU の濁度を有することを特徴とする請求項 1 から 17 の何れか一項に記載の方法。