

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号

特許第7286907号

(P7286907)

(45)発行日 令和5年6月6日(2023.6.6)

(24)登録日 令和5年5月29日(2023.5.29)

(51)国際特許分類

F I

A 6 1 K 8/60 (2006.01)

A 6 1 K 8/60

A 6 1 K 8/368(2006.01)

A 6 1 K 8/368

A 6 1 Q 5/02 (2006.01)

A 6 1 Q 5/02

A 6 1 Q 5/12 (2006.01)

A 6 1 Q 5/12

A 6 1 Q 19/10 (2006.01)

A 6 1 Q 19/10

請求項の数 14 (全22頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2019-570503(P2019-570503)

(86)(22)出願日 平成30年6月28日(2018.6.28)

(65)公表番号 特表2020-525428(P2020-525428
A)

(43)公表日 令和2年8月27日(2020.8.27)

(86)国際出願番号 PCT/EP2018/067365

(87)国際公開番号 WO2019/007789

(87)国際公開日 平成31年1月10日(2019.1.10)

審査請求日 令和3年2月5日(2021.2.5)

(31)優先権主張番号 17180054.3

(32)優先日 平成29年7月6日(2017.7.6)

(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)

(73)特許権者 503220392

ディーエスエム アイピー アセッツ ビ
ー・ブイ・

DSM IP ASSETS B.V.

オランダ国, 6411 テーイーヘ

ーレン, ヘット オーバールーン 1

Het Overloon 1, NL -

6411 TE Heerlen, Net

herlands

(74)代理人 100107456

弁理士 池田 成人

(74)代理人 100128381

弁理士 清水 義憲

(74)代理人 100162352

弁理士 酒巻 順一郎

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 局所用組成物

(57)【特許請求の範囲】

【請求項 1】

エリトルロース及びヒドロキシアセトフェノンを含む局所用組成物であって、ヒドロキシアセトフェノンの量が、前記組成物の総重量を基準にして、0.01重量%～2重量%の範囲で選択される、エリトルロース及びヒドロキシアセトフェノンを含む局所用組成物。

【請求項 2】

エリトルロースの量が、前記組成物の総重量を基準にして、0.005～5重量%の範囲で選択される、請求項 1 に記載の局所用組成物。

【請求項 3】

前記ヒドロキシアセトフェノンが p - ヒドロキシアセトフェノンである、請求項 1 に記載の局所用組成物。

【請求項 4】

前記組成物が化粧用組成物又は医薬組成物である、請求項 1 に記載の局所用組成物。

【請求項 5】

前記組成物が、シャンプー製剤、ヘアコンディショナー、O/Wエマルション、W/Oエマルション又はゲルである、請求項 4 に記載の局所用組成物。

【請求項 6】

前記組成物が、水、並びに界面活性剤、乳化剤、増粘剤及び油からなる群から選択される少なくとも1種の作用剤をさらに含む、請求項 1 に記載の局所用組成物。

【請求項 7】

10

20

マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母、プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*) 及び / 又はカビを、死滅させる、及び / 又は阻害する、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の局所用組成物。

【請求項 8】

前記マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母が癬風菌 (*Malassezia furfur*) であり、及び / 又は、前記カビがアスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) である、請求項 7 に記載の局所用組成物。

【請求項 9】

皮膚及び / 又は頭皮を、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の局所用組成物に接触させるステップを含む、前記皮膚及び / 又は頭皮を処置する方法。

10

【請求項 10】

マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母、プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*) 及び / 又はカビを、死滅させる、及び / 又は阻害する方法であって、前記酵母、プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*) 及び / 又はカビをエリトルコースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せに接触させるステップを含む方法。

【請求項 11】

前記マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母が癬風菌 (*Malassezia furfur*) であり、前記カビが、アスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) である、請求項 10 に記載の方法。

20

【請求項 12】

エリトルコースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せを含む、マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母、プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*)、及び / 又はカビに対する抗微生物剤。

【請求項 13】

前記マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母が癬風菌 (*Malassezia furfur*) であり、及び / 又は、前記カビがアスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) である、請求項 12 に記載の抗微生物剤。

30

【請求項 14】

化粧用組成物、家庭用品、プラスチック製品、紙及び / 又は塗料の群から選択される製品において、エリトルコースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せを含有しない製品と比較して防腐を向上させるために、アスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) の増殖を阻害するための、エリトルコースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せの使用。

【発明の詳細な説明】

【0001】

本発明は、エリトルコース及びヒドロキシアセトフェノンを含む局所用組成物、並びにマラセチア属 (*Malassezia*) 酵母又はプロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*) に関連する病気の防止及び / 又は処置のための当該局所用組成物の使用、並びに特にアスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) などのカビに対する当該局所用組成物の保護に関する。

40

【0002】

カビ及び細菌に対して、化粧用組成物、家庭用品、プラスチック製品、紙及び / 又は塗料を保護するために、現在市販されているほとんどの製品は防腐剤を含有している。これらの防腐剤は、細菌及び真菌から保護をするが、研究によると、これらの物質の多くは日常的に曝露されると、皮膚刺激、がん及び / 又は内分泌の問題のリスクの増加に結びつく。したがって、多くの製造者が、防腐剤の量を低減することができ、健康リスクをもたら

50

さないような別の抗微生物活性剤を探し求めている。

【0003】

抗微生物活性化合物はさらに、多くの化粧用途にも重要な役割を果たしている。

【0004】

真菌属のマラセチア属 (*Malassezia*) は、正常な皮膚マイクロバイオータの一部である、脂質依存性及び親油性の酵母種を含む。一般に、マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母は、生存するために脂質に依存するため、体幹、背中、顔、及び頭皮など、皮膚の皮脂に富む領域に最もよく見られる。皮膚掻痒感、癬風、頭部秕糠疹の形成、脂漏性皮膚炎、アトピー性皮膚炎、及び乾癬など、幾つかの皮膚の悪状況は、マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母の個体数過剰に関連している。

10

【0005】

頭部秕糠疹のある期間に、例えば、マラセチア属 (*Malassezia*) のレベルは、その正常レベルの1.5~2倍増加する。オレイン酸に誘発され、表皮の最上層である角質層を通して浸透すると、感受性の人において炎症反応が起こり、これにより恒常性が妨げられ、角質層細胞に不規則な裂開が生じる。

【0006】

マラセチア属 (*Malassezia*) の個体数過剰は、アゾール系抗真菌薬などの局所性抗真菌剤で処置されることが多いが、これは、例えば感作反応、皮膚刺激反応などの重度の副作用、又は耐性の可能性のある菌株の形成をもたらす恐れがある。

【0007】

20

したがって、皮膚の健全な恒常性を維持し、及び/又は皮膚マイクロバイオームの健康を向上させ、このようにして、処置された皮膚及び/又は頭皮領域の掻痒感を軽減するための、ヒト及び動物の皮膚のマラセチア属 (*Malassezia*) 酵母の個体数を低減する、皮膚による耐容性が高い穏やかな処置が絶えず必要である。

【0008】

さらに、アスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) に対する化粧品又は医薬品などの局所用組成物の穏やかな防腐が必要である。

【0009】

驚くべきことに、今般、広く認められている化粧品成分であるエリトルロースが、癬風菌 (*Malassezia furfur*) に対するヒドロキシアセトフェノンの抗微生物活性を相乗的に増強することが発見された。したがって、その組合せを使用して、皮膚及び/又は頭皮のマラセチア属 (*Malassezia*) の個体数を効果的に制御することができ、このようにして、皮膚及び/又は頭皮の癬風菌 (*Malassezia furfur*) の個体数過剰に起因する皮膚掻痒感などの有害作用を克服することができる。

30

【0010】

さらに、エリトルロース及びヒドロキシアセトフェノンは、アスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) (A・ブラジリエンシス (*A. brasiliensis*)) に対して相乗的な抗微生物活性を抜き出すことが発見された。したがって、この組合せは、A・ブラジリエンシス (*A. brasiliensis*) によって引き起こされる微生物汚染それぞれ腐食に対して局所用組成物を保護するのに特に適している。

40

【0011】

したがって、第1の実施形態では、本発明は、エリトルロース及びヒドロキシアセトフェノンを含む局所用組成物に関する。

【0012】

別の実施形態では、本発明は、マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母、特に癬風菌 (*Malassezia furfur*) など、及び/又はカビ、特にアスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) などに対する抗微生物剤としての、エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せの使用に

50

関する。

【0013】

さらなる実施形態では、本発明は、マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母、好ましくは癬風菌 (*Malassezia furfur*) など、プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*)、及び／又はカビ、好ましくはアスペルギルス・ブラジリエンス (*Aspergillus brasiliensis*) などを死滅させる、及び／又はそれらの増殖を阻害する方法であって、前記酵母、プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*)、カビをそれぞれ、エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せ (混合物) に接触させるステップを含む方法に関する。

10

【0014】

マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母に対する抗微生物活性があるため、エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せは、皮膚の恒常性を維持し、及び／又は皮膚マイクロバイオームの健康を向上させることによる、そのような酵母の個体数過剰に関連する皮膚の悪状況の処置にさらに適している。

【0015】

したがって、本発明はまた、特に皮膚掻痒感の処置、防止及び／又は予防のために、並びに皮膚の恒常性及び／又は皮膚マイクロバイオームのバランスを維持するために、皮膚及び／又は頭皮をエリトルロース及びヒドロキシアセトフェノンを含む局所用組成物に接触させるステップを含む、皮膚及び／又は頭皮を処置する方法にも関する。

20

【0016】

さらなる実施形態では、本発明は、皮膚掻痒感の処置、防止及び／又は予防のための、並びに皮膚の恒常性及び／又は皮膚マイクロバイオームのバランスを維持するための、エリトルロース及びヒドロキシアセトフェノンを含む局所用組成物の使用に関する。

【0017】

本発明による局所用組成物のさらなる適切な使用は、医薬としての適用を包含する。したがって、本発明による局所用組成物は、マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母、特に癬風菌 (*Malassezia furfur*) などを死滅させること、及び／又はその増殖を阻害することが望ましい任意の障害及び疾患の処置、防止及び／又は予防を、それを必要とする患者において行うために、例えば癬風、頭部秕糠疹の形成、脂漏性皮膚炎、アトピー性皮膚炎及び乾癬の処置、防止及び／又は予防のためなどに使用することができる。

30

【0018】

プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*) に対する抗微生物活性があるため、エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せは、皮膚の恒常性を維持し、及び／又は皮膚マイクロバイオームの健康を向上させることによる、そのようなプロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*) の個体数過剰に関連する皮膚の悪状況の処置にさらに適している。

【0019】

本発明による局所用組成物の別の適切な使用は、ざ瘡の処置、防止及び／又は予防である。なぜなら、この組合せはまた、プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*) (P・アクネス (*P. acnes*)) の死滅／その増殖の阻害に極めて有効でもあるためである。

40

【0020】

「エリトルロース」という用語は、D型若しくはL型の、又はラセミ体としてのエリトルロースを指す。好ましくは、L - (+) - エリトルロース [533 - 50 - 6] が使用される。エリトルロースは、例えば、DSM Nutritional Products Ltd, Kaiseraugstにおいて市販されている。

【0021】

50

ヒドロキシアセトフェノンという用語は、o -、m - 又は p - ヒドロキシアセトフェノンを指す。本発明の全ての実施形態において特に好ましいものは、p - ヒドロキシアセトフェノン [C A S 9 9 - 9 3 - 4] であり、これは、1 - (4 - ヒドロキシフェニル) - エタノンとも呼ばれ、例えば、SymriseにおいてSymSave (登録商標) Hとして市販されている。

【 0 0 2 2 】

「抗微生物活性」(又は「抗微生物効果」)という用語は、本明細書で使用する場合、マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母、特に癬風菌 (*Malassezia furfur*) など、プロピオニバクテリウム・アクネス (*Propionibacterium acnes*)、及び/又はカビ、例えばアスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) などを死滅させる、及び/又はそれらの増殖を阻害する能力を意味する。

10

【 0 0 2 3 】

本発明の全ての実施形態において、好ましくは、局所用組成物は、第一級又は第二級芳香族アミン又は窒素を含有する複素環式化合物から選択される第一級又は第二級アミノ基を伴う成分を含有しない(実質的に含まない)。

【 0 0 2 4 】

本発明の全ての実施形態において、局所用組成物は、好ましくは、エリトルロースを、組成物の総重量を基準にして、約 0 . 0 0 5 ~ 5 w t . - % の範囲で、より好ましくは約 0 . 0 1 ~ 3 w t . - % の範囲で、最も好ましくは 0 . 0 2 5 ~ 2 w t . - % の範囲で選択される量で、例えば 0 . 0 4 ~ 1 w t . - % の量で、特に有利なことには 0 . 0 4 ~ 0 . 7 5 w t . - % の量で、例えば 0 . 0 4 ~ 0 . 5 w t . - % の量で含む。さらなる特に適切な範囲としては、特に癬風菌 (*M. furfur*)、P・アクネス (*P. acnes*) 及び/又はA・ブラジリエンシス (*A. brasiliensis*) の選択的処置のために、0 . 0 1 ~ 0 . 2 w t . - % 又は 0 . 0 5 ~ 0 . 2 w t . - % が挙げられる。

20

【 0 0 2 5 】

本発明の全ての実施形態において、局所用組成物は、好ましくは、ヒドロキシアセトフェノンを、組成物の総重量を基準にして、約 0 . 0 1 w t . - % ~ 2 w t . - % の範囲で、好ましくは 0 . 1 w t . - % ~ 1 w t . - % の範囲で、最も好ましくは 0 . 1 w t . - % ~ 0 . 6 w t . - % の範囲で選択される量で含む。

30

【 0 0 2 6 】

好ましくは、本発明の全ての実施形態において、エリトルロース：ヒドロキシアセトフェノンの比 (w / w) は、約 1 0 : 1 ~ 0 . 1 : 1 の範囲で、さらに有利なことには約 5 : 1 ~ 0 . 5 : 1 の範囲で選択される。さらなる特に適切な範囲としては、0 . 0 1 ~ 0 . 2 w t . - % 又は 0 . 0 5 ~ 0 . 2 w t . - % が挙げられる。

【 0 0 2 7 】

マラセチア属 (*Malassezia*) 酵母、P・アクネス (*P. acnes*)、アスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) のそれぞれに対するエリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せの抗微生物活性を利用するために、その組合せは、多数の製剤又は用途、例えば、化粧用組成物若しくは医薬組成物、医薬品又は家庭用品などに使用することができる。

40

【 0 0 2 8 】

特に本発明は、特に化粧用組成物、家庭用品、プラスチック製品、紙及び/又は塗料の群から選択される製品の防腐を、エリトルロースを含有しない製品と比較して向上させるための、且つ任意選択により、好ましくはアスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) に関してその効果を認めるための、エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの混合物の使用に関する。

【 0 0 2 9 】

したがって、別の実施形態では、本発明は、特にカビによって、最も特定するとアスペルギルス・ブラジリエンシス (*Aspergillus brasiliensis*) な

50

によって引き起こされる、化粧用組成物及び／若しくは医薬組成物、家庭用品、プラスチック製品、紙並びに／又は塗料の、微生物腐食及び微生物分解を防止する方法であって、組成物、製品、プラスチック製品、紙及び／又は塗料に、本明細書で与えられる定義及び優先事項の全てを備えるエリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せ（混合物）を加えるステップを含む方法に関する。特定の実施形態では、本方法はまた、その結果を認めるステップも包含する。

【 0 0 3 0 】

特定の有利な実施形態では、本発明は、（エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せ（混合物）の次に）水、並びに界面活性剤、乳化剤、増粘剤及び油からなる群から選択される少なくとも１種のさらなる作用剤をさらに含む化粧用組成物又は医薬組成物が微生物増殖に特定の感受性があるため、特にカビによって、最も特定するとアスペルギルス・ブラジリエンス（*Aspergillus brasiliensis*）などによって引き起こされる、そのような化粧用組成物又は医薬組成物の微生物腐食及び微生物分解を防止する方法に関する。

10

【 0 0 3 1 】

したがって、別の実施形態では、本発明はまた、水、並びに界面活性剤、乳化剤、増粘剤及び油からなる群から選択される少なくとも１種の作用剤を含む化粧用組成物又は医薬組成物であって、本明細書で与えられる定義及び優先事項の全てを備えるエリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの混合物をさらに含む、化粧用組成物又は医薬組成物も対象とする。

20

【 0 0 3 2 】

エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せの本発明による使用は、美容の意味及び医薬の意味の両方で実現することができる。医薬としての適用は、例えば、抗頭部秕糠疹組成物の場合に想定される。しかしながら、本発明の全ての実施形態において、その使用は、好ましくは、皮膚掻痒感の対処又は皮膚の恒常性の維持などの美容（非治療）のためである。

【 0 0 3 3 】

本発明による局所用組成物は、好ましくは、哺乳動物のケラチンの組織、特にヒトの皮膚又はヒトの頭皮及び毛髪などに局所的に適用される化粧用組成物又は医薬組成物である。

【 0 0 3 4 】

30

「化粧用組成物」という用語は、本願で使用される場合、R o m p p L e x i k o n C h e m i e , 1 0 t h e d i t i o n 1 9 9 7 , G e o r g T h i e m e V e r l a g S t u t t g a r t , N e w Y o r k 中の “ K o s m e t i k a ” の見出しの下に定義されている化粧用組成物、及び A . D o m s c h , “ C o s m e t i c C o m p o s i t i o n s ” , V e r l a g f u r c h e m i s c h e I n d u s t r i e (e d . H . Z i o l k o w s k y) , 4 ^{t h} e d i t i o n , 1 9 9 2 に開示されている化粧用組成物を指す。

【 0 0 3 5 】

本発明による化粧用組成物又は医薬組成物は、好ましくは、生理学的に許容される媒体、即ち、皮膚、粘膜及びケラチン線維などのケラチン物質と適合性のある媒体をさらに含む。好ましくは、生理学的に許容される媒体は、美容的に又は薬学的に許容される担体である。

40

【 0 0 3 6 】

美容的に又は薬学的に許容される担体という用語は、化粧用組成物に従来使用されている全ての担体及び／又は賦形剤及び／又は希釈剤を指す。

【 0 0 3 7 】

本発明による局所用組成物は、一般に、エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとを、本明細書に指定されている量で、適切な担体とともに混合することによって調製される。

【 0 0 3 8 】

50

担体の正確な量は、エリトルロース及びヒドロキシアセトフェノン、並びに当業者であれば担体とは異なると分類する他のいずれかの任意選択の成分（例えば他の活性成分）の実際のレベルに依存することになる。

有利な実施形態では、本発明による化粧用組成物又は医薬組成物は、化粧用組成物の総重量を基準にして、約50%～約99%、好ましくは約60%～約98%、より好ましくは約70%～約98%、例えば特に約80%～約95%の担体を含む。

【0039】

特定の有利な実施形態では、担体は、さらに少なくとも40wt.-%、より好ましくは少なくとも50wt.-%、最も好ましくは少なくとも55wt.-%の水、例えば特に約55～約90wt.-%の水からなる。

【0040】

本発明の組成物（担体を含む）には、従来の補助剤及び添加剤、例えば、防腐剤／抗酸化剤、脂肪性物質／油、有機溶媒、シリコン、増粘剤、軟化剤、乳化剤、消泡剤、香料などの審美的成分、界面活性剤、充填剤、アニオン性、カチオン性、非イオン性若しくは両性のポリマー若しくはこれらの混合物、噴射剤、酸性化剤若しくは塩基性化剤、染料、着色料（coloring）／着色剤（colorant）、研磨剤、吸収剤、キレート剤及び／又は金属イオン封鎖剤、精油、皮膚感知剤（skin sensate）、収斂剤、顔料又は通常そのような組成物に製剤化される任意の他の成分を含めてもよい。

【0041】

本発明によれば、本発明による組成物には、化粧用組成物又は医薬組成物に従来から使用されているさらなる美容的に活性な成分も含めてもよい。代表的な活性成分は、皮膚美白剤、UV遮蔽剤、色素沈着過剰の処置剤、炎症の防止剤又は低減剤、ファーマリング剤、保湿剤、鎮静化剤、及び／又は活力付与剤（energizing agent）並びに弾性及び皮膚バリアを向上させるための作用剤を包含する。

【0042】

本発明の化粧用組成物に使用するのに適切な、化粧品賦形剤、希釈剤、補助剤、添加剤、並びにスキンケア業界で広く使用されている活性成分の例は、例えば、International Cosmetic Ingredient Dictionary & Handbook by Personal Care Product Council（<http://www.personalcarecouncil.org/>）に記載されており、オンラインINFO BASE（<http://online.personalcarecouncil.org/jsp/Home.jsp>）からアクセス可能であるが、それに限定されない。

【0043】

活性成分及び賦形剤、希釈剤、補助剤、添加剤などの必要量は、所望の製品形態及び用途に基づいて、当業者が容易に決定することができる。追加の成分は、適切と判断されれば、油性相に、水性相に、又は別々に添加することができる。

【0044】

本明細書において有用な美容的に活性な成分は、場合により、2つ以上の有益性をもたらすことができ、又は2つ以上の作用機序によって作動することができる。

【0045】

当然ながら、当業者は、上記の任意選択による追加の成分、補助剤、希釈剤及び添加剤並びに／又はそれらの量を、想定される1つ又は複数の添加が本発明による組合せに本来備わっている有利な性質に悪影響を及ぼさないように、又は実質的に悪影響を及ぼさないように、注意深く選択することになる。

【0046】

好ましくは、本発明による化粧用組成物又は医薬組成物は、溶媒中懸濁液若しくは溶媒中分散体、又は脂肪性物質の形態、或いはエマルジョン若しくはマイクロエマルジョン（特にO/W型又はW/O型）、PIT-エマルジョン、ナノエマルジョン、多相エマルジョン（例えばO/W/O型又はW/O/W型）、ピッカリングエマルジョン、ヒドロゲル

10

20

30

40

50

、リポゲル、単相溶液若しくは多相溶液又はベシクル分散体の形態である。

【 0 0 4 7 】

本発明による化粧用組成物又は医薬組成物は、液剤、ローション剤、濃厚ローション剤、ゲル剤、クリーム剤、乳剤、軟膏剤又はペースト剤の形態とすることができる。

【 0 0 4 8 】

本発明による化粧用組成物又は医薬組成物は、pHを、3～10の範囲で、好ましくは3～8のpHの範囲で、最も好ましくはpH3～6.5の範囲で有する。pHは、当業者に公知の方法によって、例えば、グリコール酸、乳酸、リンゴ酸、クエン酸及び酒石酸を含むヒドロキシ酸などの酸、又は例えば水酸化ナトリウム若しくは水酸化カリウム又は水酸化アンモニウムなどの塩基、並びにこれらの混合物を使用することによって調整される。

10

【 0 0 4 9 】

好ましくは、本発明による組成物において、クエン酸が、少なくとも0.0001wt.-%の量で、例えば0.01～1wt.-%の量で、特に0.01～0.5wt.-%の量で、pHの調整のために使用される。

【 0 0 5 0 】

本発明による化粧用組成物は、防腐剤を含むのが有利である。本発明の全ての実施形態において、特定の適切な防腐剤は、フェノキシエタノール及びエチルヘキシルグリセリン並びにこれらの混合物である。防腐剤は、存在する場合、好ましくは、組成物の総重量を基準にして、0.01～2wt.-%の量で、より好ましくは0.05～1.5wt.-%の量で、最も好ましくは0.1～1.0wt.-%の量で使用される。

20

【 0 0 5 1 】

本発明による化粧用組成物は、特に、スキンケア製剤、機能性製剤及び/又はヘアケア製剤であり、最も特定すると、スキンケア製剤又はヘアケア製剤などである。

【 0 0 5 2 】

スキンケア製剤の例としては、特に、光からの保護製剤、抗加齢製剤、光加齢の処置製剤、ボディオイル、ボディローション、ボディゲル、処置クリーム、皮膚保護軟膏剤、保湿ゲル若しくは保湿スプレーなどの保湿製剤、顔の及び/又は身体の保湿剤、並びに美白製剤がある。

【 0 0 5 3 】

機能性製剤の例としては、活性成分を含有する化粧用組成物、例えば、ホルモン製剤、ビタミン製剤、植物抽出物製剤、抗加齢製剤、及び/又は抗微生物（抗菌又は抗真菌）製剤があるが、これらに限定されない。

30

【 0 0 5 4 】

本発明に従って適切であり、挙げることができるヘアケア製剤の例としては、シャンプー、ヘアコンディショナー（ヘアリンスとも呼ばれる）、整髪組成物、ヘアトニック、毛髪再生組成物、ヘアローション、ウォーターウェーブローション、ヘアスプレー、ヘアクリーム、ヘアゲル、ヘアオイル、ヘアボマード又はヘアプリランチンがある。したがって、これらは常に、使用される実際の目的に依存して、毛髪及び頭皮に適用される時間が短くも長くもなる製剤である。

【 0 0 5 5 】

40

本発明によるヘアケア製剤がシャンプーとして供給される場合、これらは、透明な液体、不透明な液体（真珠のような光沢効果のある）、クリーム形態、ゲル様、又は粉末形態、若しくは錠剤形態、及びエアゾールとすることができる。これらのシャンプーの主材料である界面活性剤原料は、性質の点で、アニオン性、カチオン性、非イオン性及び両性とすることができ、これらの物質の組合せでも存在することができる。

【 0 0 5 6 】

本発明によるシャンプー製剤に組み入れるのに適切なアニオン性界面活性剤の例としては、C₁₀～20アルキル-及びアルキレンカルボキシレート、アルキルエーテルカルボキシレート、脂肪アルコールスルフェート、脂肪アルコールエーテルスルフェート、アルキロールアミドスルフェート及びスルホネート、脂肪酸アルキロールアミドポリグリコール

50

エーテルスルフェート、アルカンスルホネート及びヒドロキシアлкアンスルホネート、オレフィンスルホネート、イソチオネートのアクリルエステル、アルファ - スルホ脂肪酸エステル、アルキルベンゼンスルホネート、アルキルフェノールグリコールエーテルスルホネート、スルホスクシネート、スルホコハク酸モノエステル及びジエステル、脂肪アルコールエーテルホスフェート、タンパク質 - 脂肪酸縮合物、アルキルモノグリセリドスルフェート及びスルホネート、アルキルグリセリドエーテルスルホネート、脂肪酸メチルタウリド、脂肪酸サルコシネート、並びにスルホリシノレートがある。これらの化合物及びその混合物は、水に可溶性又は水に分散性のそれらの塩の形態、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、アンモニウム塩、モノ - 、ジ - 及びトリエタノールアンモニウム塩、及び類似のアルキルアヌモニウム (alkyl ammonium) 塩の形態で使用される。

10

【0057】

適切なカチオン性界面活性剤の例としては、第四級アンモニウム塩、例えば、ジ (C₁₀ ~ C₂₄ アルキル) ジメチルアンモニウムクロリド若しくはブロミド、好ましくはジ (C₁₂ ~ C₁₈ アルキル) - ジメチルアンモニウムクロリド若しくはブロミド；C₁₀ ~ C₂₄ - アルキルジメチルエチルアンモニウムクロリド若しくはブロミド；C₁₀ ~ C₂₄ - アルキルトリエチルアンモニウムクロリド若しくはブロミド、好ましくはセチルトリメチルアンモニウムクロリド若しくはブロミド、及びC₂₀ ~ C₂₄ - アルキルトリエチルアンモニウムクロリド若しくはブロミド；C₁₀ ~ C₂₄ - アルキルジメチルベンジルアンモニウムクロリド若しくはブロミド、好ましくはC₁₂ ~ C₁₈ - アルキルジメチルベンジルアンモニウムクロリド (C₁₂ - C₁₈ - alkyl dimethyl benzyl ammonium chloride)；N - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) ピリジニウムクロリド若しくはブロミド、好ましくはN - (C₁₂ ~ C₁₆ - アルキル) ピリジニウムクロリド若しくはブロミド；N - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) イソキノリニウムクロリド、ブロミド若しくはモノアルキルスルフェート；N - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) イソキノリニウムクロリド、ブロミド若しくはモノアルキルスルフェート；N - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) - N - メチルモルホリニウムクロリド、ブロミド若しくはモノアルキルスルフェート；N - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) - N - エチルモルホリニウムクロリド、ブロミド若しくはモノアルキルスルフェート；C₁₆ ~ C₁₈ - アルキルペンタオキセチルアンモニウムクロリド；イソブチルフェノキシエチルジメチル - ベンジルアンモニウムクロリド；N, N - ジエチルアミノエチルステアリルアミド及びオレイルアミドの、塩酸、酢酸、乳酸、クエン酸、リン酸との塩；N - アシルアミドエチル - N, N - ジエチル - N - メチルアンモニウムクロリド、ブロミド若しくはモノアルキルスルフェート、及びN - アシルアミノエチル - N, N - ジエチル - N - ベンジルアンモニウムクロリド、ブロミド若しくはモノアルキルスルフェート (アシルは好ましくはステアリル又はオレイルである) がある。

20

30

【0058】

界面活性物質として使用することができる適切な非イオン性界面活性剤の例としては、脂肪アルコールエトキシレート (アルキルポリエチレングリコール)、アルキルフェノールポリエチレングリコール、アルキルメルカプタンポリエチレングリコール、脂肪アミンエトキシレート (アルキルアミノポリエチレングリコール)、脂肪酸エトキシレート (アシルポリエチレングリコール)、ポリプロピレングリコールエトキシレート (Pluronic)、脂肪酸アルキロールアミド (脂肪酸アミドポリエチレングリコール)、スクロースエステル、ソルビトールエステル及びポリグリコールエーテルがある。

40

【0059】

シャンプーに添加することができる両性界面活性剤の例としては、N - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) - . . . - アミノプロピオン酸塩及びN - (C₁₂ ~ C₁₈ - アルキル) - . . . - イミノジプロピオン酸塩 (アルカリ金属とモノ - 、ジ - 及びトリアルキルアンモニウムとの塩として)；N - アシルアミドアルキル - N, N - ジメチルアセトベタイン、好ましくはN - (C₈ ~ C₁₈ - アシル) アミドプロピル - N, N - ジメチルアセトベタイン；C₁₂ ~ C₁₈ - アルキルジメチルスルホプロピルベタイン；イミダゾリン系の両性界面

50

活性剤（商品名：Miranol（登録商標）、Steinapon（登録商標））、好ましくは1-（-カルボキシメチルオキシエチル）-1-（カルボキシメチル）-2-ラウリルイミダゾリニウムのナトリウム塩；アミノオキシド、例えばC₁₂~C₁₈-アルキルジメチルアミノオキシド、脂肪酸アミドアルキルジメチルアミノオキシドがある。

【0060】

本発明によるヘアケア製剤は、ヘアケアに慣例のさらなる添加剤、例えば、香料、着色剤（同時に毛髪を染色又は着色するものも）、溶媒、乳白剤及び真珠光沢剤、例えば、脂肪酸のポリオールとのエステル、脂肪酸のマグネシウム塩及び亜鉛塩、コポリマー系分散体、増粘剤、例えば、塩化ナトリウム、塩化カリウム及び塩化アンモニウム、硫酸ナトリウム、脂肪酸アルキロールアミド、セルロース誘導体、天然ゴム、さらに植物抽出物、タンパク質誘導体、例えば、ゼラチン、コラーゲン加水分解物、天然系又は合成系のポリペプチド、卵黄、レシチン、ラノリン及びラノリン誘導体、脂肪、油、脂肪アルコール、シリコーン、脱臭剤、抗微生物活性のある物質、抗脂漏活性のある物質、角質溶解及び角質形成効果のある物質、例えば、硫黄、サリチル酸及び酵素、並びにさらなる抗頭部乾癬疹剤、例えば、オールアミン、クリンバゾール、ジンクピリチオン、ケトコナゾール、サリチル酸、硫黄、タール製剤、ウンデセン酸の誘導体、ネットел（nettel）、ローズマリー、コットンウッド、カバノキ、クルミ、ヤナギの樹皮及び/又はアルニカの抽出物を追加として含有することができる。

10

【0061】

本発明による組成物は頭部乾癬疹を処置するのに特に適しているため、本発明はまた、頭皮を、エリトルロス及びヒドロキシアセトフェノンを含むヘアケア製剤に接触させるステップを含む、頭皮を処置する方法にも関する。好ましい実施形態では、本方法は、頭部乾癬疹の処置を対象とする。別の好ましい実施形態では、ヘアケア製剤は、シャンプー又はコンディショナーの形態の洗い流す組成物である。さらなる好ましい実施形態では、本方法は、毛髪を水ですすぐステップをさらに含む。

20

【0062】

シャンプーは、それ自体が既知の方法で、個々の成分を混合することによって、及び必要な場合は、特定の種類の製剤に適切なさらなる加工によって、製造される。

【0063】

本発明に従ってエリトルロスとヒドロキシアセトフェノン（hydroxacetophenone）との組合せを使用することができ、挙げることができるヘアケア製剤の例は、一定の時間の後に毛髪から洗い流す、又は製剤によっては毛髪に残すこともできる、ヘアコンディショナー、ヘアトニック及び毛髪再生組成物である。

30

これらの製剤も全て、シャンプーについて既に述べたように、それ自体が既知の方法で、エリトルロスとヒドロキシアセトフェノン（hydroxacetophenone）との組合せを添加して、製造される。

【0064】

本発明による特定の適切なヘアケア製剤は、（i）エリトルロスを、組成物の総重量を基準にして、0.005~1.0wt.-%の範囲で、好ましくは0.01~0.8wt.-%の範囲で、最も好ましくは0.04~0.75wt.-%の範囲で選択される量で、（ii）p-ヒドロキシアセトフェノン（p-hydroxacetophenone）を、組成物の総重量を基準にして、約0.01wt.-%~2wt.-%の範囲で、好ましくは0.1wt.-%~1wt.-%の範囲で、最も好ましくは0.1wt.-%~0.6wt.-%の範囲で選択される量で、（iii）水、及び（vi）少なくとも1種のアニオン性界面活性剤を含むシャンプー製剤である。好ましくは、アニオン性界面活性剤は、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸アンモニウム、ラウリルエーテル硫酸ナトリウム、ラウリルエーテル硫酸アンモニウム、ナトリウムラウロイルサルコニート（sodium lauroyl sarcosinate）、オレイルコハク酸ナトリウム、ラウリルスルホコハク酸アンモニウム、ドデシルベンゾールスルホン酸ナトリウム及び/若しくはドデシルベンゾールスルホン酸トリエタノールアミン又はそれらの混合物、例

40

50

えば、特にラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸アンモニウム、ラウリルエーテル硫酸ナトリウム及び／又はラウリルエーテル硫酸アンモニウムからなる群から選択される。本発明による組成物中のアニオン性界面活性剤の総量は、組成物の総重量を基準にして、0.5～45wt.-%、好ましくは1.5～35wt.-%、より好ましくは7～25wt.-%、特に7～15wt.-%の範囲である。

【0065】

本発明による特定の適切なヘアコンディショナーは、洗い流すコンディショナーでも洗い流さないコンディショナーでもよいが、好ましくは洗い流すコンディショナーである。本発明による特定の有利なヘアコンディショナーは、(i)エリトルロースを、組成物の総重量を基準にして、0.005～1.0wt.-%の範囲で、好ましくは0.01～0.8wt.-%の範囲で、最も好ましくは0.04～0.75wt.-%の範囲で選択される量で、(ii)p-ヒドロキシアセトフェノン(p-hydroxyacetophenone)を、組成物の総重量を基準にして、約0.01wt.-%～2wt.-%の範囲で、好ましくは0.1wt.-%～1wt.-%の範囲で、最も好ましくは0.1wt.-%～0.6wt.-%の範囲で選択される量で、(iii)水、及び(iv)少なくとも1種のコンディショニング剤、例えば、シリコーン油、第四級ポリマー、天然由来のコンディショニング剤などを含むが、これらに限定されない。

【0066】

第四級ポリマーは、好ましくは、例えば、ポリクオタニウム-6(例えば、TILAMAR(登録商標)Quat 640又は641の商品名で商品化されている)、ポリクオタニウム-22(例えば、TILAMAR(登録商標)Quat 2240又は2241の商品名で商品化されている)、ポリクオタニウム-7(例えば、TILAMAR(登録商標)Quat 710、711又は712の商品名で商品化されている)などから選択される。天然由来のコンディショニング剤は、好ましくは、例えば、グアーヒドロキシプロピルトリモニウムクロリドなどの糖系のポリマー(例えば、Jaguar C-17、Jaguar C-1000、Jaguar C-13Sの商品名で商品化されている))から選択されるが、これに限定されない。原則として、いずれのシリコーン油も、ヘアコンディショナーに使用するのに適切である。しかしながら、シリコーン油は、好ましくは、ジメチコン、ジメチコノール、ポリジメチルシロキサン、アリアル化シリコーン、環式シリコーン、シリコーン界面活性剤及びアミノ化シリコーンから選択され、揮発性でも非揮発性でもよい。特定の適切なシリコーン油は、Dow Corningなどの種々の供給元から入手可能なジメチコン、ジメチコノール、ポリジメチルシロキサンである。ヘアコンディショナー中の少なくとも1種のシリコーン油の総量は、好ましくは、組成物の総重量を基準にして、0.01～10wt.-%、好ましくは0.02～7.5wt.-%、より好ましくは0.05～5wt.-%、最も好ましくは0.1～3wt.-%の範囲で選択される。

【0067】

別の好ましい実施形態では、本発明による化粧用組成物は、O/Wエマルジョン、W/Oエマルジョン、及び／又はシャワーゲル若しくはヘアゲルなどのゲルである。

【0068】

本発明によるO/Wエマルジョンは、(i)エリトルロースを、組成物の総重量を基準にして、0.005～1.0wt.-%の範囲で、好ましくは0.01～0.8wt.-%の範囲で、最も好ましくは0.04～0.75wt.-%の範囲で選択される量で、(ii)p-ヒドロキシアセトフェノン(p-hydroxyacetophenone)を、組成物の総重量を基準にして、約0.01wt.-%～2wt.-%の範囲で、好ましくは0.1wt.-%～1wt.-%の範囲で、最も好ましくは0.1wt.-%～0.6wt.-%の範囲で選択される量で、(iii)水、及び(iv)グリセリルステアレート(glyceryl stearate)、グリセリルステアレート(自己乳化型)、ステアリン酸、ステアリン酸の塩、ポリグリセリル-3-メチルグリコースジステアレート、セテアレス-20、ステアレス-2、ステアレス-12、ステア

10

20

30

40

50

リン酸 P E G - 40、リン酸エステル及びその塩、例えば、リン酸セチル (Amphisol (登録商標) A)、セチルリン酸ジエタノールアミン (Amphisol (登録商標) DEA)、セチルリン酸カリウム (Amphisol (登録商標) K)、ナトリウムセテアリールスルファト (sodium cetearyl sulfate)、ナトリウムグリセリルオレートホスフェート、水素添加植物グリセリドホスフェート、オレイン酸ソルピタン、セスキオレイン酸ソルピタン、イソステアリン酸ソルピタン、トリオレイン酸ソルピタン、ラウリルグルコシド、デシルグルコシド、ステアロイルグルタミン酸ナトリウム、ポリステアリン酸スクロース及び水化ポリイソブテンのリスト、並びにそれらの混合物から選択される少なくとも1種のO/W-又はSi/W-乳化剤を含むのが有利である。また、1種又は複数種の合成ポリマー、例えば、PVPエイコセンコポリマー、(アクリレーツ/アクリル酸アルキル(C10~30))クロスポリマー、(アクリレーツ/メタクリル酸ステアレス-20)コポリマー、(PEG-22/ドデシルグリコール)コポリマー、(PEG-45/ドデシルグリコール)コポリマー、及びこれらの混合物が、乳化剤として使用されてもよい。特定の好ましい実施形態では、O/W-乳化剤は、リン酸セチル、例えば特にセチルリン酸カリウム (Amphisol (登録商標) Kとして市販されている)、ステアリン酸グリセリル(及び)ステアリン酸PEG100 (Arlacel (登録商標) 165として市販されている)及び/又はポリアルキレングリコールエーテル、例えば特にラウレス-35 (35EO単位のラウリルアルコール、Brij (登録商標) 35として市販されている)などの群から選択される。少なくとも1種のO/W乳化剤は、好ましくは、組成物の総重量に対して、約0.001~10wt.-%の量で、より好ましくは0.1~7wt.-%の量で使用される。さらに、O/Wエマルションの形態の化粧用組成物は、アルキルアルコール、例えば、セチルアルコール (Lorol C16、Lanette 16)セテアリルアルコール (Lanette (登録商標) O)、ステアリルアルコール (Lanette (登録商標) 18)、ベヘニルアルコール (Lanette (登録商標) 22)、モノステアリン酸グリセリル、ミリスチン酸グリセリル (Estol (登録商標) 3650)、水素添加コグリセリド (Lipocire Na10)のリスト(これに限定されない)及びそれらの混合物から選択される少なくとも1種の共乳化剤を含有するのが有利である。

【0069】

本発明によるW/Oエマルションは、(i)エリトルロースを、組成物の総重量を基準にして、0.005~1.0wt.-%の範囲で、好ましくは0.01~0.8wt.-%の範囲で、最も好ましくは0.04~0.75wt.-%の範囲で選択される量で、(ii)p-ヒドロキシアセトフェノン (p-hydroxacetophenone)を、組成物の総重量を基準にして、約0.01wt.-%~2wt.-%の範囲で、好ましくは0.1wt.-%~1wt.-%の範囲で、最も好ましくは0.1wt.-%~0.6wt.-%の範囲で選択される量で、(iii)水、及び(iv)ポリグリセリル-2-ジポリヒドロキステアレート (polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearate)、PEG-30ジポリヒドロキステアレート (PEG-30dipolyhydroxystearate)、セチルジメチコンコポリオール、ジイソステアリン酸ポリグリセリル-3、オレイン酸/イソステアリン酸のポリグリセロールエステル、ポリグリセリル-6ヘキサリシノレート、オレイン酸ポリグリセリル-4、オレイン酸ポリグリセリル-4/ヤシ油脂肪酸PEG-8プロピレングリコール、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸ナトリウム、ラウリン酸カリウム、リシノール酸カリウム、ヤシ脂肪酸ナトリウム、牛脂脂肪酸ナトリウム、ヒマシ脂肪酸カリウム、オレイン酸ナトリウムのリスト、及びこれらの混合物から選択される少なくとも1種のW/O-又はW/Si-乳化剤を含むのが有利である。さらなる適切なW/Si-乳化剤としては、ラウリルポリグリセリル-3ポリジメチルシロキシエチルジメチコン及び/又はPEG-9ポリジメチルシロキシエチルジメチコン及び/又はセチルPEG/PPG-10/1ジメチコン及び/又はPEG-12ジメチコンクロスポリマー及び/又はPEG/PPG-18/18ジメチコンがある。少なくとも1種のW/O乳化剤は、好ましくは、組成物の総重量に

10

20

30

40

50

対して、約 0.001 ~ 10 wt. - % の量で、より好ましくは 0.2 ~ 7 wt. - % の量で使用される。

【0070】

本発明によるゲル製剤は、(i) エリトルロースを、組成物の総重量を基準にして、0.005 ~ 1.0 wt. - % の範囲で、好ましくは 0.01 ~ 0.8 wt. - % の範囲で、最も好ましくは 0.04 ~ 0.75 wt. - % の範囲で選択される量で、(ii) p - ヒドロキシアセトフェノン (p - hydroxyacetophenone) を、組成物の総重量を基準にして、約 0.01 wt. - % ~ 2 wt. - % の範囲で、好ましくは 0.1 wt. - % ~ 1 wt. - % の範囲で、最も好ましくは 0.1 wt. - % ~ 0.6 wt. - % の範囲で選択される量で、(iii) 水、及び (iv) 少なくとも 1 種の水溶性増粘剤を含むのが有利である。そのような水溶性増粘剤は当業者に周知であり、例えば、“Handbook of Water soluble gums and resins”, Robert L. Davidson (Mc Graw Hill Book Company (1980)) に列挙されている。特に適切な水溶性増粘剤は、ポリアクリル酸 (例えば、Carbomer 又は Carbopol (登録商標) の商品名で市販されている)、2 - アクリルアミド - 2 - メチルプロパンスルホン酸のホモポリマー (例えば、Rheothik (登録商標) 11 - 80 として市販されている)、アクリレートコポリマー (例えば、Pemulen (登録商標) 又は Aculyn (登録商標) 33 の商品名で市販されている)、分岐ポリ (メタクリロイルオキシエチルトリメチルアンモニウムクロリド) (INCI 名ポリクオタニウム - 37)、非修飾グアーガム (例えば、Jaguar の商品名で市販されている)、デンプン若しくはその誘導体、及び / 又はヒドロキシアルキルセルローセン (hydroxyalkylcellulosen) からなる群から選択される。好ましくは、水溶性増粘剤は、組成物の総重量を基準にして、約 0.001 ~ 10 wt. - % の量で、より好ましくは 0.2 ~ 7 wt. - % の量で使用される。

【0071】

以下の実施例は、本発明の組成物及び効果をさらに説明するために収載される。これらの実施例は、説明に役立つに過ぎず、決して本発明の範囲を限定するものではない。

【0072】

[実施例]

[実施例 1 : 抗微生物効果]

活性物質 : DSM Nutritional products 製エリトルロース

Symrise 製 SymSave (登録商標) H (p - ヒドロキシアセトフェノン)

抗微生物効果を、制御負荷試験法 (NF EN ISO 11930) と同様にして評価する。したがって、0.85 wt. - % NaCl の生理的血清中のそれぞれの活性物質の溶液を、下の表に記載した濃度で、滅菌条件下で調製した。次いで、活性物質の溶液を 96 - ディープウェルプレート (1.6 ml / ウェル) に入れた。ウェルを、癩菌 (Malassezia furfur)、プロピオニバクテリウム・アクネス (Propionibacterium acnes)、アスペルギルス・ブラジリエンシス (Aspergillus brasiliensis) でそれぞれ汚染し、表 1、2 及び 3 に記載しているように初期汚染を得た。汚染した後、各ウェルを入念に混合して、微生物を確実に均質に分布させた。次いで、各プレートを 22 ° で 24 時間インキュベートした。(残存している) 個体数の計数を汚染から 24 時間後に行った。結果を下の表にまとめている。

【0073】

10

20

30

40

【表 1】

表1: 癬風菌(*Malassezia furfur*)について得られた結果

#	試験溶液	時間 [h]	癬風菌(<i>Malassezia furfur</i>) コロニー数[cfu/ml]	Δ*
1a	0.5 wt.-% エリトルロース°	0	3300	
1b		24	3300	±0%
2a	0.5 wt.-% p-ヒドロキシアセトフェノン	0	3300	
2b		24	550	-83%
3a	0.5 wt.-% エリトルロース°	0	3300	
3b	0.5 wt.-% p-ヒドロキシアセトフェノン ⁺	24	0	-100%

*Δ = ({微生物数 t = 0時間} - {微生物数 t=24}) / {微生物数 t=0} * 100

°0.4 wt.-%の活性物質に相当

【0074】

上の表に見ることができるように、濃度 0.5 % のエリトルロースは、マラサチア・フルフル (*Malassazia furfur*) に対して、その減少をもたらすであろう抗真菌効果を何ら発揮しない。しかしながら、エリトルロースは、p - ヒドロキシアセトフェノンと組み合わせると、癬風菌 (*Malassezia furfur*) に対する p - ヒドロキシアセトフェノンの効果を増強することができる。

【0075】

【表 2】

表2: プロピオニバクテリウム・アクネス(*Propionibacterium acnes*)について得られた結果

試験溶液	時間 [h]	P・アクネス(P.acnes) コロニー数[cfu/ml]	Δ* [%]
0.5 wt.-% エリトルロース°	0	500000	
0.5 wt.-% p-ヒドロキシアセトフェノン ⁺	24	3	-100%

°0.4 wt.-%の活性物質に相当。

*Δ = ({微生物数 t = 0時間} - {微生物数 t=24}) / {微生物数 t=0} * 100

【0076】

表 2 から読み出すことができるように、エリトルロースと p - ヒドロキシアセトフェノンとの組合せは、P・アクネス (*P. acnes*) に対して活性が高い。

【0077】

10

20

30

40

50

【表 3】

表2: アスペルギルス・ブラジリエンシス(*Aspergillus brasiliensis*)について得られた結果

試験溶液	時間 [h]	アスペルギルス・ブラジリエンシス (<i>Aspergillus brasiliensis</i>) コロニー数[cfu/ml]	対数ステップ 減少
0.5 wt.-% エリトルロース [°]	0	10000	
	24	100	2
0.4 wt.-% p-ヒドロキシアセトフェノン	0	10000	
	24	100	2
0.25 wt.-% エリトルロース* 0.2 wt.-% p-ヒドロキシアセトフェノン	0	10000	
	24	0	4

[°]0.4 wt.-%の活性物質に相当

* 0.2 wt.-%の活性物質に相当

【0078】

(「対数減少」という用語は、何かの中又は上で減少した細胞、細菌、微生物などの相対数を示すために使用される、よく知られている数学用語であり、例えば2対数減少は、微生物の数が100倍小さいことを意味し、3対数減少は、微生物の数が1000倍小さいことを意味する)。

【0079】

表3に見ることができるように、エリトルロースとヒドロキシアセトフェノンとの組合せは、アスペルギルス・ブラジリエンシス(*Aspergillus brasiliensis*)に対して相乗効果を示す。

【0080】

10

20

30

40

50

【表 4】

実施例2:O/Wファンデーション

成分	INCI	wt. %
脱イオン水	水	100まで添加
グリセリン	グリセリン	2.00
トリエタノールアミン	トリエタノールアミン	0.80
Paratexin	メチルパラベン EP	0.20
Keltrol	キサンタンガム	0.30
エリトルコース	エリスルコース	0.5
二酸化チタン	C.I. 77891	4.57
SunCROMA 黄色酸化鉄	C.I. 77492	0.30
SunCROMA 赤色酸化鉄	C.I. 77491	0.13
SunCROMA 黒色酸化鉄	C.I. 77499	0.20
DC 556	フェニルトリメチコン	3.60
ステアリン酸	ステアリン酸	1.4
セチルアルコール	セチルアルコール	3.0
Paratexin P	プロピルパラベン EP	0.1
p-ヒドロキシアセトフェノン	ヒドロキシアセトフェノン	0.5

10

20

【 0 0 8 1 】

【表 5】

実施例3:アルコールを含まない顔用トニック

成分	INCI	wt. %
ポリソルベート20	ポリソルベート20	2.00
Alpaflor Calendula AO	トウキンセンカ(Calendula Officinalis)エキス、グリセリン、水	0.80
Alpaflor Buddleja AO	フサフジウツギ(Buddleja Davidii)エキス、グリセリン、水	0.80
Arlasilk Phospholipd CDM	ヤシ油PGジモニウムクロリドリン酸ナトリウム	0.50
香料	パルファム	0.10
脱イオン水	水	100まで添加
クエン酸	クエン酸	0.01
エリトルコース	エリスルコース	0.75
Paratexin FRP	エチルパラベン、ブチルパラベン、プロピルパラベン、 イソブチルパラベン	0.10
p-ヒドロキシアセトフェノン	ヒドロキシアセトフェノン	0.7

30

40

【 0 0 8 2 】

50

【表 6】

実施例4:W/Oクリーム

成分	INCI	wt. %
Cremophor WO-7	PEG-7水添ヒマシ油	2.50
Elfacos ST-9	(PEG-45/ドデシルグリコール)コポリマー	2.00
Cirebelle 303	合成ワックス	5.00
Cirebelle 109L	合成ワックス	7.20
Miglyol 818	トリ(カプリル酸/カプリン酸/リノール酸)グリセリド	5.00
Eutanol G	オクチルドデカノール	7.50
Cetiol OE	ジカプリリルエーテル	9.20
脱イオン水	水	100まで添加
グリセリン	グリセリン	5.00
プロピレングリコール	プロピレングリコール	2.00
Euxyl PE 9010	フェノキシエタノール及びエチルヘキシグリセリン	0.80
エリトルローズ	エリスルローズ	0.3
p-ヒドロキシアセトフェノン	ヒドロキシアセトフェノン	0.1

10

20

【 0 0 8 3 】

【表 7】

実施例5:鎮静化ゲル

成分	INCI	wt. %
脱イオン水	水	100まで添加
Keltrol CG RD	キサントガム	0.50
安息香酸ナトリウム	安息香酸ナトリウム	0.20
ソルビン酸カリウム	ソルビン酸カリウム	0.25
Alpaflor Marrabium AO	グリセリン、水、ニガハツカ(Marrabium Vulgare)、 安息香酸ナトリウム、ソルビン酸カリウム	3.00
エリトルローズ	エリスルローズ	0.45
p-ヒドロキシアセトフェノン	ヒドロキシアセトフェノン	0.65

30

【 0 0 8 4 】

40

50

【表 8】

実施例6:O/Wローション

成分	INCI	wt. %
脱イオン水	水	100まで添加
メントール	メントール	0.10
Keltrol CG SFT	キサンタンガム	1.25
Ceralution ES	セテアレス-25、エチレンジコカミドPEG-15 二硫酸二ナトリウム	2.00
Isofol 20	オクチルドデカノール	5.00
Paratexin EC5	安息香酸ベンジルアルコール、デヒドロ酢酸、 ソルビン酸	1.00
エリトルコース	エリスルコース	0.4
p-ヒドロキシアセトフェノン	ヒドロキシアセトフェノン	0.3

10

【 0 0 8 5 】

【表 9】

実施例7:顔用クレンジングゲル

成分	INCI	wt. %
脱イオン水	水	100まで添加
Carbopol AQUA SF-1 ポリマー	アクリレーツコポリマー	7.50
Texapon NSO-BZ	ラウレス硫酸ナトリウム	41.00
Miranol Ultra C 32	ココアンホ酢酸ナトリウム	5.00
Hostapon CLG	ラウロイルグルタミン酸ナトリウム	4.50
Jaguar C 162	ヒドロキシプロピルグアーヒドロキシプロピルトリモニウム クロリド	1.00
エリトルコース	エリスルコース	0.3
Euxyl K 300	フェノキシエタノール及びメチルパラベン 及びプロピルパラベン及びエチルパラベン 及びブチルパラベン及びイソブチルパラベン	0.80
Alpaflor Malvia AO	グリセリン、水、ウスベニアオイ(Malva Sylvestris)(ゼニアオイ) 花エキス、ソルビン酸カリウム、安息香酸ナトリウム	2.00
ライムのパルファム	香料	適量
FD&C 黄色5号	CI 19140	0.50
Frescolat Plus	乳酸メンチル、メントール	0.20
Dehyton AB-30	ココベタイン	2.00
Rewoderm LI S 80	水添パーム油脂肪酸PEG-200グリセリル及び ヤシ油脂肪酸PEG-7グリセリル	1.00
クエン酸	クエン酸	適量
p-ヒドロキシアセトフェノン	ヒドロキシアセトフェノン	0.5

20

30

40

50

【 0 0 8 6 】

【 表 1 0 】

実施例8:洗い流さない毛髪及び頭皮のコンディショナー

成分	INCI	wt. %
脱イオン水	水	100まで添加
エタノールDEB 96	変性アルコール	30.00
PVP/VAコポリマー	PVP/VAコポリマー	2.50
Euxyl K-300	フェノキシエタノール、メチルパラベン、ブチルパラベン、 エチルパラベン、プロピルパラベン、イソブチルパラベン	0.80
Protachem HCO-40	PEG-40水添ヒマシ油	0.50
香料ADAM	パルファム	0.10
トリエタノールアミン99%	トリエタノールアミン	0.01
FD & C 黄色5号(0.5%溶液)	CI 19140、水	0.10
FD & C 青色1号(0.5%溶液)	CI 42090、水	0.10
エリトルロース	エリスルロース	0.1
p-ヒドロキシアセトフェノン	ヒドロキシアセトフェノン	0.3

10

20

【 0 0 8 7 】

【 表 1 1 】

実施例9:シャンプー

INCI名	wt. %
アクア(水)	100まで添加
ラウレス硫酸アンモニウム	10.00
ラウリル硫酸アンモニウム	5.00
ジステアリン酸グリコール	1.00
ジメチコン	1.00
セチルアルコール	0.50
コカミドMEA	3.00
エリスルロース	0.8
ZPT	0.50
グアーヒドロキシプロピルトリモニウムクロリド	0.20
水添ポリデセン	1.00
ポリクオタニウム10	0.30
PEG 7m	0.50
トリ(カプリル/カプリン酸)トリメチルプロパン	1.00
防腐剤	適量
香料	0.30
E 104, E 110, E 132	0.02
p-ヒドロキシアセトフェノン	0.7

30

40

50

【 0 0 8 8 】

【 表 1 2 】

実施例10:植物抽出物を含む透明なシャンプー

INCI名	wt. %
アクア(水)	100まで添加
ラウレス硫酸ナトリウム	10.00
ラウリルグルコシド	6.00
コカミドプロピルベタイン,	2.00
プロピレングリコール	2.00
香油	1.25
クエン酸ナトリウム	0.25
安息香酸ナトリウム	0.20
パンテノール	1.00
ギ酸ナトリウム	0.20
ポリクオタニウム-10	0.20
ヒドロキシプロピルグアーヒドロキシプロピルトリモニウムクロリド	0.05
エリスルロース	0.2
PEG-35ヒマシ油	1.00
海塩(Maris sal)	1.25
ポリソルベート20	1.00
酢酸トコフェリル	0.20
アンズ(Prunus armeniaca)	0.20
ムラサキバレンギク(Echinacea purpurea)	0.05
トコフェロール	0.05
リノール酸	0.20
防腐剤	1.00
CI77891	0.02
p-ヒドロキシアセトフェノン	0.6

10

20

30

【 0 0 8 9 】

40

50

【表 1 3】

実施例11:洗い流す毛髪及び頭皮のコンディショナー

INCI名	wt. %
アクア(水)	100まで添加
ステアリルアルコール	2.50
セチルアルコール	2.50
ベヘントリモニウムクロリド	1.30
ジメチコン	2.00
エリスルローズ	0.3
香料	0.50
ブチレングリコール	2.00
メチルパラベン	0.30
p-ヒドロキシアセトフェノン	0.3

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

A 6 1 Q	19/00 (2006.01)	A 6 1 Q	19/00
A 6 1 K	31/7004(2006.01)	A 6 1 K	31/7004
A 6 1 K	31/192 (2006.01)	A 6 1 K	31/192
A 6 1 P	17/00 (2006.01)	A 6 1 P	17/00
A 6 1 P	31/04 (2006.01)	A 6 1 P	31/04
A 6 1 P	31/10 (2006.01)	A 6 1 P	31/10
A 6 1 P	17/10 (2006.01)	A 6 1 P	17/10
A 6 1 P	17/06 (2006.01)	A 6 1 P	17/06

(72)発明者 メンドロク - エディンガー , クリスティーン
 スイス , 4 3 0 3 カイザーアウークシュト , ヴルミスヴェク 5 7 6 , ケアオブ ディーエス
 エム ニュートリショナル プロダクツ リミテッド , パテント デパートメント

(72)発明者 モンギアット , セバスチャン
 スイス , 4 3 0 3 カイザーアウークシュト , ヴルミスヴェク 5 7 6 , ケアオブ ディーエス
 エム ニュートリショナル プロダクツ リミテッド , パテント デパートメント

(72)発明者 ルドルフ , トーマス
 スイス , 4 3 0 3 カイザーアウークシュト , ヴルミスヴェク 5 7 6 , ケアオブ ディーエス
 エム ニュートリショナル プロダクツ リミテッド , パテント デパートメント

審査官 田中 雅之

(58)調査した分野 (Int.Cl. , D B 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
 A 6 1 K 3 1 / 3 3 - 3 3 / 4 4
 A 6 1 K 3 1 / 0 0 - 3 1 / 3 2 7
 A 6 1 P 1 / 0 0 - 4 3 / 0 0
 A 0 1 N 1 / 0 0 - 6 5 / 4 8
 A 0 1 P 1 / 0 0 - 2 3 / 0 0
 C A p l u s / R E G I S T R Y / M E D L I N E / E M B A S E / B I O S I S / K O
 S M E T (S T N)
 M i n t e l G N P D