

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2009-517478

(P2009-517478A)

(43) 公表日 平成21年4月30日(2009.4.30)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 8/894 (2006.01)	A 6 1 K 8/894	4 C 0 8 3
C 0 8 L 83/04 (2006.01)	C 0 8 L 83/04	4 J 0 0 2
C 0 8 K 3/20 (2006.01)	C 0 8 K 3/20	
A 6 1 K 8/895 (2006.01)	A 6 1 K 8/895	
A 6 1 K 8/06 (2006.01)	A 6 1 K 8/06	

審査請求 有 予備審査請求 未請求 (全 41 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2008-543414 (P2008-543414)	(71) 出願人	590005058
(86) (22) 出願日	平成18年11月30日 (2006.11.30)		ザ プロクター アンド ギャンブル カ ンパニー
(85) 翻訳文提出日	平成20年6月2日 (2008.6.2)		アメリカ合衆国オハイオ州, シンシナティ ー, ワン プロクター アンド ギャンブ ル ブラザ (番地なし)
(86) 国際出願番号	PCT/US2006/045657	(74) 代理人	100077481
(87) 国際公開番号	W02007/064687		弁理士 谷 義一
(87) 国際公開日	平成19年6月7日 (2007.6.7)	(74) 代理人	100088915
(31) 優先権主張番号	60/742, 073		弁理士 阿部 和夫
(32) 優先日	平成17年12月2日 (2005.12.2)	(72) 発明者	吉見 直久
(33) 優先権主張国	米国 (US)		兵庫県西宮市西宮浜4-10-3-110 1
(31) 優先権主張番号	60/800, 554	(72) 発明者	田中 秀和
(32) 優先日	平成18年5月15日 (2006.5.15)		大阪府豊中市上野西2丁目11-71
(33) 優先権主張国	米国 (US)		最終頁に続く
(31) 優先権主張番号	60/812, 791		
(32) 優先日	平成18年6月12日 (2006.6.12)		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

(54) 【発明の名称】 シロキサンエラストマーを含む油中水型エマルション組成物

(57) 【要約】

本発明は、約0.1%~約15%の非乳化性架橋シロキサンエラストマー、約0.1%~約15%の乳化性架橋シロキサンエラストマー、約1%~約40%の前記非乳化および乳化性架橋シロキサンエラストマーの溶媒、任意選択的に0%~約5%の追加の乳化剤、および約50%~約99%の水相を含む油中水型エマルション組成物に関し、前記組成物は皮膚に広げる際に剪断応力が加わるとエマルションから水相が放出される。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

油中水型エマルション組成物であって、

- a) 0.1% ~ 15% の非乳化性架橋シロキサンエラストマー、
- b) 0.1% ~ 15% の乳化性架橋シロキサンエラストマー、
- c) 1% ~ 40% の前記非乳化性および乳化性架橋シロキサンエラストマーの溶媒、
- d) 任意選択的に、0% ~ 5% の追加の乳化剤、
- e) 50% ~ 99% の水相を含み、

皮膚に広げる際に前記組成物に剪断応力が加わると、前記エマルションから水相が放出される組成物。

10

【請求項 2】

ナイアシンアミド、ヘキサミジン化合物、美白剤、ペプチド、糖アミン、およびこれらの混合物から成る群から選択されるスキンケア活性物質をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

スキンコンディショニング剤をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記スキンコンディショニング剤が、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ソルビトール、ヒドロキシプロピルソルビトール、トレハロース、ヘキシレングリコール、1, 3 - ブチレングリコール、1, 2, 6 - ヘキサントリオール、グリセリン、1, 2 - ヘキサンジオール、ペンチレングリコール、エトキシ化グリセリン、プロポキシ化グリセリン、およびこれらの混合物から成る群から選択される請求項 3 に記載の組成物。

20

【請求項 5】

粒子状物質をさらに含む請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記乳化性架橋シロキサンエラストマーがジメチコンコポリオールクロスポリマーおよびジメチコンである請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記非乳化性架橋シロキサンエラストマーが、ジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマー、およびこれらの混合物から成る群から選択される請求項 1 に記載の組成物。

30

【請求項 8】

前記エラストマーの溶媒が、揮発性で非極性の油類、不揮発性で極性の油類、不揮発性で非極性の油類、不揮発性のパラフィン系炭化水素油類、およびこれらの混合物から成る群から選択される請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

0.1% ~ 50% の追加のスキンケア活性物質をさらに含み、前記追加のスキンケア活性物質が、日焼け止め活性物質、油性テルペンアルコール、フィトステロール、油性ビタミン化合物、皮膚軟化剤および閉塞剤、デヒドロ酢酸、ヘキサンジオール、抗ニキビ活性物質、ヒドロキシ酸、キレート化剤、フラボノイド、抗炎症剤、抗セルライト剤、局所麻酔剤、落屑活性物質、酸化防止剤/フリーラジカルスカベンジャー、日焼け剤、皮膚鎮静および回復剤、抗菌活性物質、抗カビ活性物質、およびこれらの混合物から成る群から選択される請求項 1 に記載の組成物。

40

【請求項 10】

皮膚の状態を調節する方法であって、処置の必要なヒトの皮膚に請求項 1 に係る組成物の安全且つ有効な量を適用することを含む方法。

【請求項 11】

油中水型エマルション組成物であって、

- a) 0.1% ~ 15% の非乳化性架橋シロキサンエラストマー、
- b) 0.1% ~ 15% の乳化性架橋シロキサンエラストマー、

50

- c) 1% ~ 40%の前記非乳化性および乳化性架橋シロキサンエラストマーの溶媒、
- d) 任意選択的に、0% ~ 5%の追加の乳化剤、
- e) 50% ~ 99%の水相を含み、

前記組成物が、本明細書に記載の顕微鏡法により剪断の1分以内に少なくとも10 μmの最大直線寸法を有する水相の非晶質部分を放出する組成物。

【請求項12】

油中水型エマルション組成物であって、

- a) 0.1% ~ 15%の非乳化性架橋シロキサンエラストマー、
- b) 0.1% ~ 15%の乳化性架橋シロキサンエラストマー、
- c) 1% ~ 40%の前記非乳化性および乳化性架橋シロキサンエラストマーの溶媒、
- d) 任意選択的に、0% ~ 5%の追加の乳化剤、
- e) 50% ~ 99%の水相を含み、

10

前記組成物が、本明細書に記載の撹拌法により13500rpmの速度でミリングした1分後に少なくとも0.25gの重量の水相の部分を放出する組成物。

【請求項13】

油中水型エマルション組成物であって、

- a) 0.1% ~ 15%の非乳化性架橋シロキサンエラストマー、
- b) 0.1% ~ 15%の乳化性架橋シロキサンエラストマー、
- c) 1% ~ 40%の前記非乳化性および乳化性架橋シロキサンエラストマーの溶媒、
- d) 所望により0% ~ 5%の追加の乳化剤、
- e) 50% ~ 99%の水相を含み、

20

前記組成物が、本明細書に記載のレオロジー法により測定した場合、-5未満の傾きを有する10g剪断応力対10g粘度のプロットを生じる組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、乳化および非乳化シロキサンエラストマーの組み合わせを含む油中水型エマルションタイプのスキンケア組成物に関する。このような組成物は、使用者の許容可能な審美性を備えた製品においてスキンケア活性物質の放出に有用である。とりわけ、皮膚に塗り広げる際に組成物から放出される水相の量および速度により、使用者に許容可能な審美性およびべたつかない肌触りを提供することができる。

30

【背景技術】

【0002】

消費者にとって現在利用可能な多くのパーソナルケア製品は主として、皮膚および/または毛髪健康および/または物理的外観を改善することに向けられている。スキンケア製品の中で、その多くが、水分補給、美白、油分調節、あるいは一般に皮膚の老化やヒトの皮膚に対する環境的ダメージに関連した皮膚のしわやその他の組織構造の変化を遅らせたり、最小限に抑えたり、さらには無くすことを目的としている。数多くの化合物が、当該技術分野において上記のような皮膚状態の調節に有用であると述べられている。

【0003】

40

皮膚は、多数の外因性因子および内因性因子による損傷を受けやすい。外部要因としては、紫外線放射（例えば、日光暴露による）、環境汚染、風、熱、低湿度、強い界面活性剤、研磨剤等が挙げられる。内因性因子としては、経年的老化、および他の皮膚内部からの生化学的变化が挙げられる。皮膚の調節に役立ったり、上記のような損傷により引き起こされるダメージを軽減したり、あるいはその両方が可能な、特定のスキンケア活性物質または化合物を放出することは当然重要であるが、使用者が感覚的且つ審美的観点から特定のスキンケア組成物を受入れることも重要である。例えば、一般的に含有されるグリセリンなどの保湿剤の濃度が増すと、肌のべたつき感も増大する。使用者の多くは、べたつき、脂っぽさ、または粘着感のある組成物を好まず、滑らかに広がり、水のような爽やかな肌触りで、後からすべすべした感触を提供できる組成物を好む。

50

【0004】

先行のシリコンエラストマーを含有するスキンケアおよび化粧品組成物は、例えば、W002/03930号、W002/03950号、W002/03951号、W002/03952号、欧州特許第1,166,746A1号、欧州特許第1,068,851A1号、日本公開第2003-081757号、および日本公開第2003-55141号に記載されている。これらの開示の中で、塗布時に水性成分の爽やかさと「液はね」の印象を与えるとされる組成物が記載されている。しかしながら、このような先行の開示は、シリコン乳化剤のみを含有する組成物、または異なるシリコンエラストマー系を使用した組成物を提示している。同様に、以前に開示された組成物は、本発明の組成物が提供するエマルジョンの水性成分の含有量およびその放出量を提供していないと考えられる。

10

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

以上のことから、特にべたつかない爽やかな感触や水相の放出に関して、スキンケア活性物質の放出が向上し、さらに感覚的且つ審美的効果も提供可能なスキンケア組成物を処方する必要性が依然として存在する。既存の技術分野には、本発明の利点および効果の全てを提供するものはない。

【課題を解決するための手段】

【0006】

本発明は、約0.1%~約15%の非乳化性架橋シロキサンエラストマー、約0.1%~約15%の乳化性架橋シロキサンエラストマー、約1%~約40%の非乳化および乳化性架橋シロキサンエラストマーの溶媒、任意選択的に0%~約5%の追加の乳化剤、約50%~約99%の水相を含む油中水型エマルジョン組成物に関し、この組成物は皮膚に広げる際に剪断応力が加わると前記エマルジョンから水相が放出される。

20

【0007】

本発明はまた、かかる組成物を哺乳類の皮膚の状態を調整するために使用方法に関する。該方法は、一般に、こうした処置を必要とする哺乳類の皮膚に組成物の安全且つ有効な量を局所適用する工程を含む。

【0008】

本開示を読むことで、本発明のこれらおよび他の特徴、態様、および利点が、当業者には明らかになるであろう。

30

【発明を実施するための最良の形態】

【0009】

本明細書は、本発明を具体的に示し且つ明確に主張する特許請求の範囲をもって結論とするが、本発明は以下の説明によってより深く理解されることが考えられる。

別段の指定がない限り、本明細書において使用するすべての百分率および比率は、組成物全体の重量によるものであり、また、すべての測定は25℃でなされたものである。

【0010】

本明細書で使用するとき、「スキンケア製品」は、皮膚を処置若しくは手入れするため、または何らかの形で保湿、改善、若しくは清浄するために使用されるものである。「スキンケア製品」という句によって意図される製品には、保湿剤、パーソナルクレンジング製品、閉塞性薬剤送達貼付剤、マニキュア液、粉末類、拭き取り用品、ヘアコンディショナー、皮膚トリートメントエマルジョン、シェービングクリーム等が挙げられるが、これらに限定されない。

40

【0011】

本明細書で使用される用語「周囲条件」とは、特に指示がない限り、約0.1MPa(1気圧)、約50%の相対湿度および約25℃のもとでの周囲の条件をいう。

【0012】

本発明の組成物は、本発明の成分並びに本明細書に記載されるその他の成分を包含する

50

ことができ、それらから本質的に成ることができ、またはそれらから成ることができる。本明細書で使用する時、「から本質的に成る」とは、組成物または成分が追加成分を包含してよいが、それら追加成分が特許請求される組成物または方法の基本的および新規な特徴を大きく変化させない場合に限ることを意味する。

【0013】

すべての百分率、割合および比率は、特に指定のない限り、本発明のスキンケア組成物の全体の重量に基づく。列挙する成分に関連するこのようなすべての重量は、活性レベルに基づくので、特に指定しない限り、市販の物質に包含される場合があるキャリアや副生成物を包含しない。

【0014】

本明細書で引用するすべての刊行物は、その全体を参考として本明細書に組み込む。

【0015】

本明細書で使用する時、用語「ケラチン組織」とは、哺乳類（例えば、ヒト、イヌ、ネコなど）の最外保護外皮として配置されるケラチン含有層を指し、皮膚、唇、毛髪、足の爪、指の爪、角皮、ひづめなどが挙げられるが、これに限定されるものではない。

【0016】

本明細書で使用する時、用語「皮膚科学的に許容可能な」とは、このように記載されている組成物またはその構成成分が、過度の毒性、不適合性、不安定性、アレルギー反応などを伴うことなく、哺乳類のケラチン組織と接触させて使用するのに適していることを意味する。

【0017】

本明細書で使用する時、用語「安全且つ有効な量」とは、本明細書で開示する個々の利益またはその利益の組み合わせを含む、肯定的利益、好ましくはケラチン組織の外観または感触の肯定的利益、または毛髪の外観または感触の肯定的利益を顕著に生じさせるのに十分であるが、重篤な副作用を十分避けるだけの少ない化合物または組成物の量、即ち、当業者の健全な判断の範囲内での妥当な利益対危険比を提供する量を意味する。

【0018】

本明細書で使用する時、用語「滑らかにする」および「軟らかくする」とは、触知性の感覚の改善のような、ケラチン組織表面の改変を意味する。

【0019】

皮膚の状態を調節するなどのスキンケア効果では、1以上のスキンケア活性物質を高濃度で含有することが望ましい。しかしながら、従来のスキンケア製品で高濃度のスキンケア活性物質を使用した場合、欠点がある。例えば、ナイアシンアミドの「塩析」により生じる残留物は、皮膚に望ましくない白化作用を与える。同様に、高濃度のグリセリンなどのスキンコンディショニング剤は、皮膚に脂っぽくべたついた感じを与える。

【0020】

シリコーンエラストマーは、スキンケア組成物における有用な構成成分として当該技術分野において公知である。このようなシリコーンエラストマーは、グリセリンを含有するスキンコンディショニング剤に付随する粘着性やべたつき感を軽減するために使用されている。例えば、欧州特許第1,068,851A1号に記載されているようなシリコーン乳化剤を使用すると、91%もの水相を含む組成物を提供するとされている。しかしながら、乳化および非乳化シロキサンエラストマーの組み合わせを含む本発明の油中水型エマルジョン組成物は、皮膚に広げて塗布する際にエマルジョンから放出される過程で、これまで可能と考えられていたよりも良好な感覚的効果さえ与える水相を含むスキンケア組成物を提供し得ることが分かっている。さらに、本発明のエマルジョンから水相が放出される速度は、使用者に望ましい審美的且つ感覚的効果を与えるように制御可能である。また、組成物を皮膚に広げる際に脂っぽさやべたつき感を感じさせることなく、本発明の組成物にグリセリンなどのスキンコンディショニング剤の濃度を上げて組み込むことができる。

【0021】

本発明の組成物は、皮膚の状態を調節し、およびとりわけケラチン組織の状態を調節するために有用である。皮膚状態、即ち哺乳類、特にヒトの皮膚状態の調節は、体に対する内因性および/または外因性因子によって誘発または引き起こされ得る状態のために必要とされることが多い。例として、環境的損傷、放射線への暴露（紫外線放射を含めて）、経年的老化、更年期（例えば、閉経後の皮膚の変化）、ストレス、病気などが挙げられる。例えば、「皮膚状態の調整」には、皮膚状態の予防的調整および/または治療的調整が挙げられ、皮膚の萎縮を軽減させるための皮膚の肥厚化（即ち、表皮および/または真皮の構築、および/または皮膚の皮下（例えば、皮下脂肪または筋肉）層、ならびに適用可能であれば爪および毛幹の角質層）、真皮-表皮境界（乳頭間隆起としても知られる）の回旋の増加、弾性線維症やたるみや皮膚の変形からの回復の喪失などの皮膚の弾力性の喪失（皮膚エラスチン機能の喪失、損傷、および/または不活性化）の予防、目の下のくまなどの非メラニン性の皮膚の変色、しみ（例えば、酒さによる不均一な赤味）（以後、「赤斑」と呼ぶ）、血色の悪さ（青白い色）、毛細血管拡張症またはクモ状脈管によって引き起こされる変色の予防、などの1つ以上の利益を包含してもよい。

10

【0022】

本発明の組成物は、安定性、重大な（使用者の許容不可能な）皮膚の炎症がないことおよび良好な審美性を含む、追加の利益を提供する。

【0023】

本発明の組成物は、非乳化性架橋シロキサンエラストマー、乳化性架橋シロキサンエラストマー、非乳化および乳化性架橋シロキサンエラストマーの溶媒、任意選択的に追加の乳化剤、および水相を含む。また、組成物は好ましくは1以上のスキンケア活性物質も含有する。

20

【0024】

本明細書の組成物はまた、多種多様なその他の成分を含んでもよい。本発明の組成物は以下に詳細に記載される。

【0025】

架橋シロキサンエラストマー

本発明の必須成分は、架橋オルガノポリシロキサンエラストマーである。架橋オルガノポリシロキサンエラストマーの出発材料として作用し得る硬化性オルガノポリシロキサン組成物の種類に関しては、特に制限はない。これに関連する例は、SiH含有ジオルガノポリシロキサンとケイ素結合ビニル基を有するオルガノポリシロキサンとの付加反応により白金金属触媒下で硬化する付加反応硬化オルガノポリシロキサン組成物；ヒドロキシル末端ジオルガノポリシロキサンとSiH含有ジオルガノポリシロキサンとの脱水素反応により有機スズ化合物の存在下で硬化する縮合硬化オルガノポリシロキサン組成物；ヒドロキシル末端ジオルガノポリシロキサンと加水分解性オルガノシラン類の縮合反応（この縮合反応は、脱水、アルコール-遊離、オキシム-遊離、アミン-遊離、アミド-遊離、カルボキシル-遊離、およびケトン-遊離反応によって示される）により有機スズ化合物またはチタン酸エステルの存在下で硬化する縮合硬化オルガノポリシロキサン組成物；オルガノペルオキシド触媒の存在下で熱硬化するペルオキシド硬化オルガノポリシロキサン組成物；およびガンマ線、紫外線、または電子ビームのような高エネルギー放射線により硬化されるオルガノポリシロキサン組成物である。

30

40

【0026】

迅速な硬化速度および優れた硬化均一性から、付加反応硬化型オルガノポリシロキサン組成物が好ましい。特に好ましい付加反応硬化型オルガノポリシロキサン組成物は、

(A) 各分子中に少なくとも2つの低級アルケニル基を有するオルガノポリシロキサン

、

(B) 各分子中に少なくとも2つのケイ素結合した水素原子を有するオルガノポリシロキサン、および

(C) 白金型の触媒から調製される。

【0027】

50

以上に関して、構成成分(A)は、シロキサンエラストマーを生じるオルガノポリシロキサンの基本構成成分であり、構成成分(C)による触媒下でのこの構成成分と構成成分(B)との付加反応によって硬化が進む。この構成成分(A)は、各分子中に少なくとも2つのケイ素結合低級アルケニル基を含まなければならず、低級アルケニル基が2つ未満ではネットワーク構造が形成されないので、十分に硬化した生成物が得られない。前記低級アルケニル基は、ビニル、アリル、およびプロペニルによって例示される。低級アルケニル基は、分子中のどの位置にも存在することができるが、分子末端に存在することが好ましい。この構成成分の分子構造は、直鎖、分岐状直鎖、環状、または網状であってもよいが、直鎖であって、可能性としてやや分岐状のものが好ましい。構成成分の分子量の制限は特にないので、粘度は低い粘度の液体から極めて高い粘度のゴムであってもよい。硬化した生成物をゴム状のエラストマーの形態で得るには、25における粘度が少なくとも $0.0001 \text{ m}^2/\text{s}$ (100センチストークス)であることが好ましい。これらのオルガノポリシロキサンは、メチルビニルシロキサン、メチルビニルシロキサン-ジメチルシロキサンコポリマー、ジメチルビニルシロキシ終端ジメチルポリシロキサン、ジメチルビニルシロキシ終端ジメチルシロキサン-メチルフェニルシロキサンコポリマー、ジメチルビニルシロキシ終端ジメチルシロキサン-ジフェニルシロキサン-メチルビニルシロキサンコポリマー、トリメチルシロキシ終端ジメチルシロキサン-メチルビニルシロキサンコポリマー、トリメチルシロキシ終端ジメチルシロキサン-メチルフェニルシロキサン-メチルビニルシロキサンコポリマー、ジメチルビニルシロキシ終端メチル(3,3,3-トリフルオロプロピル)ポリシロキサン、およびジメチルビニルシロキシ終端ジメチルシロキサン-メチル(3,3,-トリフルオロプロピル)シロキサンコポリマーによって例示される。

10

20

30

40

50

【0028】

構成成分(B)は、各分子中に少なくとも2つのケイ素結合した水素原子を有するオルガノポリシロキサンであり、構成成分(A)の架橋剤である。構成成分(C)による触媒下での、この構成成分中のケイ素結合した水素原子と構成成分(A)中の低級アルケニル基との付加反応によって、硬化が進む。この構成成分(B)は、架橋剤として機能するためには、各分子中に少なくとも2つのケイ素結合した水素原子を含有しなければならない。さらに、構成成分(A)の各分子中のアルケニル基の数と構成成分(B)の各分子中のケイ素結合した水素原子の数との合計が、少なくとも5になるべきである。ネットワーク構造が本質的に形成されないので、5未満にならないようにしなければならない。

【0029】

この構成成分の分子構造については特に制限がなく、直鎖、分岐含有直鎖、環状などのいずれかであってもよい。この構成成分の分子量は特に制限がないが、構成成分(A)との良好な混和性を得るには、25における粘度が $1 \text{ E} - 6 \text{ m}^2/\text{s}$ (1cst) ~ $0.05 \text{ m}^2/\text{s}$ (50,000センチストークス)であることが好ましい。この構成成分は、この構成成分中のケイ素結合した水素原子の総量と構成成分(A)中のすべての低級アルケニル基の総量とのモル比が(1.5:1) ~ (20:1)の範囲に入るような量で添加されることが好ましい。このモル比が0.5:1より低くなると、良好な硬化特性を得るのが困難になる。(20:1)を超えると、硬化生成物が加熱されたときに、硬度が高いレベルに上昇する傾向にある。さらに、多量のアルケニルを含有するオルガノシロキサンが、例えば補強の目的で補助的に添加されるときには、SiHを含有するこの構成成分を、これらのアルケニル基を相殺する量だけ補助的に添加することが好ましい。この構成成分は、具体的には、トリメチルシロキシ終端メチル水素ポリシロキサン、トリメチルシロキシ終端ジメチルシロキサン-メチル水素シロキサンコポリマー、およびジメチルシロキサン-メチル水素-シロキサン環状コポリマーによって例示される。

【0030】

構成成分(C)は、ケイ素結合した水素原子とアルケニル基との付加反応の触媒であり、具体的には、塩化白金酸、場合によってはアルコールまたはケトンに溶解させてその溶液を任意で熟成させた塩化白金酸、塩化白金酸-オレフィン錯体、塩化白金酸-アルケニ

ルシロキサン錯体、塩化白金酸 - ジケトン錯体、白金黒、およびキャリア担持の白金によって例示される。

【0031】

この構成成分は、構成成分(A)と(B)の総量の厳密に1,000,000重量部当たりの重量部が好ましくは0.1~1,000、更に好ましくは1~100である白金型金属として添加する。上記の硬化オルガノポリシロキサン組成物の基礎を形成するオルガノポリシロキサンにおいてケイ素と結合可能なその他の有機基は、例えば、メチル、エチル、プロピル、ブチル、およびオクチルのようなアルキル基、2-フェニルエチル、2-フェニルプロピル、および3,3,3-トリフルオロプロピルのような置換されたアルキル基、フェニル、トリル、およびキシリルのようなアリール基、フェニルエチルのような置換されたアリール基、および例えばエポキシ基、カルボキシレートエステル基、メルカプト基などで置換された一価の炭化水素基である。

10

【0032】

オルガノポリシロキサンエラストマー粉末の生成例は、次の通りである。界面活性剤(非イオン性、アニオン性、カチオン性、若しくは両性)の存在下で、前述のオルガノポリシロキサン組成物(付加硬化型、縮合硬化型、若しくはペルオキシド硬化型)を水と混合し、ホモキサー、コロイドミル、ホモジナイザー、プロペラミキサーなどで均質になるまで混合した後、これを温水(少なくとも温度50)中に放出して硬化させ、次いで乾燥させる、オルガノポリシロキサン組成物(付加硬化型、縮合硬化型、若しくはペルオキシド硬化型)を加熱流中に直接噴霧することによって硬化させる、放射線硬化型オルガノポリシロキサン組成物を高エネルギー放射線下で噴霧して硬化させることによって、粉末を得る、オルガノポリシロキサン組成物(付加硬化型、縮合硬化型、若しくはペルオキシド硬化型)または高エネルギー硬化型オルガノポリシロキサン組成物を硬化させ(この高エネルギー硬化型オルガノポリシロキサン組成物は高エネルギー放射線によって硬化させる)、次いでこの生成物を、例えばボールミル、アトマイザー、混練器、ロールミルなどのような公知の粉碎機を使用して粉碎して、粉末を形成する。好適なオルガノポリシロキサンエラストマー粉末としては、信越化学工業のKSP-100、KSP-101、KSP-102、KSP-103、KSP-104、KSP-105などのビニルジメチコン/メチコンシレスキオキサクロスポリマー、信越化学工業のKSP-200などのフルオロアルキル基を含有するハイブリッドシリコン粉末、信越化学工業のKSP-300やDow CorningのDC9506などのフェニル基含有ハイブリッドシリコン粉末が挙げられる。

20

30

【0033】

好ましいオルガノポリシロキサン組成物は、ジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマーである。そのようなジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマー類は、ダウ・コーニング(Dow Corning)(DC9040およびDC9041)、ゼネラル・エレクトリック(General Electric)(SFE839)、シンエツ(Shin Etsu)(KSG-15、16、18[ジメチコン/フェニルビニルジメチコンクロスポリマー])、およびグラント・インダストリーズ(Grant Industries)(グランシル(Gransil)(商標)ライン材料)を包含する種々の供給元によって供給され、またシンエツ(Shin Etsu)から供給されているラウリルジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマー類(例えば、KSG-21、KSG-210、KSG-310、KSG-320、KSG-41、KSG-42、KSG-43、KSG-44、KSG-710、およびKSG-810)である。本発明に有用な架橋オルガノポリシロキサンエラストマーおよびその製造方法は、米国特許第4,970,252号(サクタ(Sakuta)ら)、米国特許第5,760,116号(キルガー(Kilgour)ら)、米国特許第5,654,362号(シュルツ,Jr.(Schulz, Jr.)ら)、および日本国特許出願第61-18708号(ポーラ化成工業株式会社(Pola Kasei Kogyo KK))にも記載されている。

40

【0034】

本発明の組成物は、乳化および非乳化性架橋オルガノポリシロキサンエラストマーの組

50

み合わせを含む。本明細書で使用するとき、用語「非乳化」は、ポリオキシアルキレン単位またはポリグリセリン単位が存在しない架橋オルガノポリシロキサンエラストマーを定義する。本明細書で使用するとき、「乳化型」という用語は、少なくとも1つのポリオキシアルキレン（例えば、ポリオキシエチレンまたはポリオキシプロピレン）単位またはポリグリセリン単位を有する架橋オルガノポリシロキサンエラストマーを意味する。

【0035】

特に有用な乳化エラストマー類は、ジビニル化合物から、特に少なくとも2個の遊離ビニル基を持つシロキサンポリマー類から、ポリシロキサン骨格上でSi-H結合と反応させて形成された、ポリオキシアルキレン変性エラストマー類である。好ましくは、エラストマーは、分子が球形のMQ樹脂上でSi-H部位によって架橋されるジメチルポリシロキサンである。

10

【0036】

本発明の非乳化性架橋オルガノポリシロキサンエラストマーは、10～60回通過させて再利用をしてもしなくても、SonoLatorを使用して、シロキサンエラストマー用溶媒の存在下で高剪断処理（約34.5MPa（5,000psi））を行うことで、更に処理するのが好ましい。

【0037】

乳化性架橋オルガノポリシロキサンエラストマーは、本発明の組成物中に約0.1重量%～約15重量%、好ましくは約0.2重量%～約5重量%、最も好ましくは約0.2重量%～約2重量%の濃度で存在する。

20

【0038】

非乳化性架橋オルガノポリシロキサンエラストマーは、本発明の組成物中に約0.1重量%～約15重量%、好ましくは約0.1重量%～約5重量%、最も好ましくは約0.1重量%～約2重量%の濃度で存在する。

【0039】

非乳化および乳化性架橋シロキサンエラストマーの溶媒

本発明の組成物には、上記の架橋オルガノポリシロキサンエラストマーの溶媒が含まれている。この溶媒は、本発明の架橋オルガノポリシロキサンエラストマー粒子と組み合わせると、エラストマー粒子を懸濁し、膨潤して、弾性のゲル様網状構造またはマトリックスを提供する働きをする。架橋シロキサンエラストマーの溶媒は周囲条件下では液体であり、好ましくは低い粘度を有して、皮膚に対する拡散力を向上させる。

30

【0040】

本発明の化粧品組成物の溶媒の濃度は、主に用いられる溶媒および架橋シロキサンエラストマーの種類および量によって変化する。溶媒の好ましい濃度は、組成物の約1重量%～約50重量%、好ましくは約4重量%～約50重量%、より好ましくは約5重量%～約40重量%である。

【0041】

架橋シロキサンエラストマーの溶媒には、ヒトの皮膚に局所適用するのに好適な1つ以上の液状キャリアが含まれている。液状キャリアが、約28～約250、好ましくは約28～約100、好ましくは約28～約78の温度における、選択されたシロキサンエラストマーの濃度にて、選択された架橋シロキサンエラストマーとの間で溶液またはその他の均質な液体または液体分散液を形成する場合、液状キャリアは、有機、シリコン含有またはフッ素含有、揮発性または非揮発性、極性または非極性であってもよい。架橋シロキサンエラストマーの溶媒は、好ましくは約3～約13（cal/cm³）^{0.5}、更に好ましくは約5～約11（cal/cm³）^{0.5}、最も好ましくは約5～約9（cal/cm³）^{0.5}の溶解度パラメータを有する。液体キャリアまたはその他の物質の溶解度パラメータ、およびその溶解度パラメータの決定方法は、化学技術分野で周知である。溶解度パラメータおよびそれらを決定するための手段の説明は、C. D. ボーン（C. D. Vaughan）の「製品、包装、浸透、および保存における溶解度の影響（Solubility Effects in Product, Package, Penetration and Preservation）」103、化粧品およびトイレットリー

40

50

(Cosmetics and Toiletries) 47 ~ 69 頁 (1988 年 10 月)、および C. D. ボーン (C. D. Vaughan) の「化粧品処方における溶解度パラメータの使用 (Using Solubility Parameters in Cosmetics Formulation)」36、日本化粧品技術者会誌 (J. Soc. Cosmetic Chemists) 319 ~ 333 頁 (1988 年 9 / 10 月) に記載されており、これらの論文は参考として本明細書に組み込まれている。

【0042】

溶媒には好ましくは揮発性、非極性の油；不揮発性、比較的極性の高い油；不揮発性、非極性の油；および不揮発性のパラフィン系炭化水素の油が挙げられ；それぞれ以下で更に完全に説明する。本明細書で使用する時、用語「不揮発性」は、0.1 MPa (1 気圧)、25 において約 26.7 Pa (0.2 mmHg) 以下の蒸気圧を示す物質、および / または 0.1 MPa (1 気圧) での沸点が少なくとも約 300 の物質を指す。本明細書で使用する場合、「揮発性」という用語は、本明細書において先に定義した「不揮発性」に当てはまらない全ての物質をいう。本明細書で使用する場合、「比較的極性の高い」という用語は、溶解度パラメータの点で極性が別の物質よりも高いことを意味し、つまり、溶解度パラメータが高いほど、液体の極性は高くなる。「非極性」という用語は、通常は、物質の溶解度パラメータが約 $6.5 (cal/cm^3)^{0.5}$ 未満であることを意味する。

10

【0043】

1. 非極性で揮発性の油類

非極性で揮発性の油は、本発明の組成物に極めて望ましい審美的特性を付与する傾向にある。したがって、非極性で揮発性の油は、好ましくはかなり高いレベルで利用される。本発明で特に有用な非極性で揮発性の油は、シリコン油、炭化水素、およびこれらの混合物から成る群より選択される。このような非極性で揮発性の油は、例えば、バルサム (Balsam) およびサガリン (Sagarin) 編「化粧品、科学、および技術 (Cosmetics, Science, and Technology)」、第 1 巻、27 ~ 104 頁 (1972 年) に開示されている。本発明に有用な非極性で揮発性の油類は、飽和若しくは不飽和のいずれであってよく、脂肪族の特徴を有してよく、直鎖若しくは分枝鎖であってよく、または脂環式若しくは芳香族の環を含有してもよい。好ましい非極性で揮発性の炭化水素類の例としては、イソドデカンおよびイソドカン (例えば、プレスパーズ社 (Presperse Inc.) から入手可能なペルメチル (Permethil) - 99A) などのポリドカン類、および C7 ~ C8 から C12 ~ C15 までのイソパラフィン類 (例えば、エクソン・ケミカルズ社 (Exxon Chemicals) から入手可能なアイソパー (Isopar) シリーズ) が挙げられる。非極性で揮発性の液体シリコン油は、米国特許第 4,781,917 号 (1988 年 11 月 1 日に Luebbe らに発行) に開示されている。更に、種々の揮発性シリコン物質の説明は、トッド (Todd) らの「化粧用揮発性シリコン流体 (Volatile Silicone Fluids for Cosmetics)」、化粧品およびトイレタリー (Cosmetics and Toiletries)、91:27 ~ 32 (1976 年) にも記載されている。特に好ましい揮発性シリコン油は、次式に相当する環式揮発性シリコンから成る群より選択される。

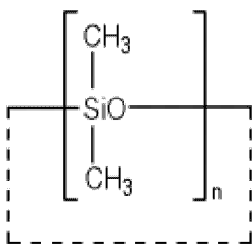
20

30

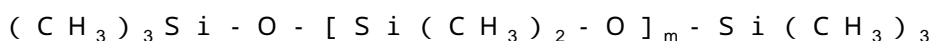
【0044】

【化 1】

40



式中、n は約 3 ~ 約 7 である。直鎖状揮発性シリコンは次式に相当する：



式中、m は約 1 ~ 約 7 である。線状揮発性シリコン類は、一般に、25 度で約 5 E -

50

6 m²/s (5 センチストークス) 未満の粘度を有するが、環状シリコン類は 25 で約 1 E - 5 m²/s (10 センチストークス) 未満の粘度を有する。揮発性シリコン油の非常に好ましい例としては、様々な粘度のシクロメチコン類、例えば、ダウ・コーニング (Dow Corning) 200、ダウ・コーニング 244、ダウ・コーニング (Dow Corning) 245、ダウ・コーニング (Dow Corning) 344、およびダウ・コーニング (Dow Corning) 345 (ダウ・コーニング社 (Dow Corning Corp.) から市販) ; SF - 1204 および SF - 1202 シリコン流体 (G. E. シリコンズ社 (G. E. Silicones) から市販)、GE7207 および 7158 (ゼネラル・エレクトリック社 (General Electric Co.) から市販) ; ならびに SWS - 03314 (SWS シリコンズ社 (SWS Silicones Corp.) から市販) が挙げられる。

10

【0045】

2. 比較的極性の高い不揮発性の油類

不揮発性の油は、上述した非極性で揮発性の油に比べて「比較的極性が高い」。従って、不揮発性共溶媒は、非極性で揮発性の油の少なくとも 1 つよりも極性が高い (すなわち、より高い溶解度パラメータを有する)。本発明で潜在的に有用性のある比較的極性の高い不揮発性油は、例えば、パルサム (Balsam) およびサガリン (Sagarin) 編「コスメティック・サイエンス・アンド・テクノロジー (Cosmetics, Science, and Technology)」(1972 年) 第 1 巻、27 ~ 104 頁; 米国特許第 4, 202, 879 号 (シェルトン (Shelton)、1980 年 5 月 13 日); 米国特許第 4, 816, 261 号 (ルビー (Luebbe) ら、1989 年 3 月 28 日) に開示されている。本発明で有用な比較的極性の高い不揮発性の油類は好ましくは、シリコン油類; 炭化水素油類; 脂肪族アルコール; 脂肪酸類; 一および二塩基カルボン酸とモノおよび多価アルコールとのエステル類; ポリオキシエチレン類、ポリオキシプロピレン類、脂肪族アルコール類のポリオキシエチレンエーテルとポリオキシプロピレンエーテルとの混合物; ならびにこれらの混合物から成る群より選択される。本発明で有用な比較的極性の高い不揮発性共溶媒は、飽和または不飽和のいずれでもよく、脂肪族の特徴を有してもよく、直鎖または分枝鎖でもよく、あるいは脂環式の環または芳香環を含有してもよい。更に好ましくは、比較的極性の高い不揮発性の液状共溶媒は、約 12 ~ 26 個の炭素原子を有する脂肪族アルコール; 約 12 ~ 26 個の炭素原子を有する脂肪酸; 一塩基カルボン酸と約 14 ~ 30 個の炭素原子を有するアルコールとのエステル; 二塩基カルボン酸と約 10 ~ 30 個の炭素原子を有するアルコールとのエステル; 多価アルコールと約 5 ~ 26 個の炭素原子を有するカルボン酸とのエステル; 約 12 ~ 26 個の炭素原子を有し、約 50 を下回るエトキシ化およびプロポキシ化の程度をもつ脂肪族アルコールのエトキシ化、プロポキシ化、エトキシ化とプロポキシ化の混合のエーテル; 並びにこれらの混合物から成る群から選択される。より好ましいのは、プロポキシ化度が約 50 未満の C14 ~ C18 の脂肪族アルコールのプロポキシ化エーテル類、C2 ~ C8 のアルコールと C12 ~ C26 のカルボン酸とのエステル類 (例えば、ミリスチン酸エチル、パルミチン酸イソプロピル)、C12 ~ C26 のアルコールと安息香酸とのエステル類 (例えば、ファインテックス社 (Finetex) から供給されるフィンソルブ (Finsolv) TN)、C2 ~ C8 のアルコールとアジピン酸、セバシン酸、およびフタル酸とのジエステル類 (例えば、セバシン酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソプロピル、フタル酸ジ-n-ブチル)、C6 ~ C26 のカルボン酸の多価アルコールエステル類 (例えば、ジカプリン酸/ジカプリル酸プロピレングリコール、イソステアリン酸プロピレングリコール); ならびにこれらの混合物である。さらに好ましいのは、約 12 ~ 26 個の炭素原子を有する分岐鎖脂肪族系の脂肪族 (aliphatic fatty) アルコール類である。

20

30

40

【0046】

3. 非極性で不揮発性の油類

架橋シロキサンエラストマーの溶媒には、上記の液体に加え、任意選択的に非揮発性で非極性の油が含まれてもよい。典型的な不揮発性で非極性の皮膚軟化剤は、例えば、パルサム (Balsam) およびサガリン (Sagarin) 編「化粧品、科学と技術 (Cosmetics, Scienc

50

e, and Technology)」(1972年)第1巻、27～104頁、米国特許第4,202,879号(シェルトン(Shelton)、1980年5月13日発行)、米国特許第4,816,261号(ルーベ(Luebbe)ら、1989年3月28日発行)に開示されている。本発明で有用な不揮発性の油類は、本質的に不揮発性のポリシロキサン類、パラフィン系炭化水素油類、およびこれらの混合物である。本発明で有用なポリシロキサン類は、ポリアルキルシロキサン類、ポリアリールシロキサン類、ポリアルキルアリールシロキサン類、ポリエーテルシロキサンコポリマー類、およびこれらの混合物から成る群より選択される(selected)。これらの例としては、25 で約 $1 \text{ E} - 6 \text{ m}^2 / \text{s}$ (1 c s t) ~ 約 $0.1 \text{ m}^2 / \text{s}$ (100,000 センチストーク)の粘度を有するポリジメチルシロキサン類が挙げられる。好ましい不揮発性シリコーン皮膚軟化剤のうち、本組成物に有用なのは、25 で約 $2 \text{ E} - 6 \text{ m}^2 / \text{s}$ (2 c s t) ~ 約 $0.0004 \text{ m}^2 / \text{s}$ (400 センチストーク)の粘度を有するポリジメチルシロキサン類である。このようなポリアルキルシロキサン類としては、ビスカシル(Viscasil)シリーズ(ゼネラル・エレクトリック社(General Electric Company)より販売)およびダウ・コーニング(Dow Corning)200シリーズ(ダウ・コーニング社(Dow Corning Corp.)より販売)が挙げられる。ポリアルキルアリールシロキサンは、25 での粘度が約 $1.5 \text{ E} - 5 \text{ m}^2 / \text{s}$ (15 c s t) ~ 約 $6.5 \text{ E} - 5 \text{ m}^2 / \text{s}$ (65 センチストークス)であるポリメチルフェニルシロキサンを含む。これらは、例えば、SF1075メチルフェニル流体(ゼネラル・エレクトリック社(General Electric Company)より販売)および556化粧品級の流体(ダウ・コーニング社(Dow Corning Corp.)より販売)として市販されている。

【0047】

本発明で有用な不揮発性のパラフィン系炭化水素油類には、鉱油類および特定の分岐鎖炭化水素類が包含される。これらの流体の例は、米国特許第5,019,375号(1991年3月28日タナー(Tanner)らに発行)に開示されている。好ましい鉱油類は、次の特性を有する：

- (1) 40 における粘度が約 $5 \text{ E} - 6 \text{ m}^2 / \text{s}$ (5 センチストークス) ~ 約 $7 \text{ E} - 5 \text{ m}^2 / \text{s}$ (70 センチストークス)、
- (2) 25 における密度が約 $0.82 \sim 0.89 \text{ g} / \text{cm}^3$ 、
- (3) 引火点が約 138 ~ 約 216 、および
- (4) 炭素鎖長が炭素原子約 14 ~ 約 40 個。

【0048】

好ましい分岐鎖炭化水素油類は、次の特性を有する：

- (1) 20 における密度が約 $0.79 \sim 0.89 \text{ g} / \text{cm}^3$ 、
- (2) 沸点が約 250 超、および
- (3) 引火点が約 110 ~ 約 200 という特性を有している。

【0049】

好適な分岐鎖炭化水素類としては、平均約 24 個の炭素原子を含有するパーメチル(Permethy)103A；平均約 68 個の炭素原子を含有するパーメチル(Permethy)104A；平均約 20 個の炭素原子を含有するパーメチル(Permethy)102A；これらはすべてパーメチル社(Permethy Corporation)から購入されてよい；ならびに30個の炭素原子と40個の炭素原子の混合物を含有するエチルフロー(Ethylflo)364(エチル社(Ethyl Corp.)から購入されてよい)が挙げられる。

【0050】

本発明で有用な追加の溶媒は、米国特許第5,750,096号(1998年5月12日Gerald J. Guskeyらに発行)に記載されている。

【0051】

水相

本発明の化粧品組成物は、組成物の約 50 重量% ~ 約 99 重量%、好ましくは約 50 重量% ~ 約 95 重量%、より好ましくは約 65 重量% ~ 約 90 重量%の水相を含む。

【0052】

10

20

30

40

50

本発明の組成物は油中水型エマルションである。このような組成物では、一般に油相に対する水相の弱い結合が存在する。これにより、例えば皮膚に塗り広げる際に水滴が飛び散る感覚を与えるなどの、適用時に組成物の変化が可能になる。例えば、皮膚に塗り広げる前の皮膚に最初に適用する時点では、組成物はゲルまたはクリーム形態である。塗り広げる際に指の剪断応力によってエマルションが破断され、それによってエマルションから水相が放出されると考えられる。これにより、上記のように放出された水相は触覚に加えて視覚的にも認識可能であるため、使用者に良好な感覚的效果を提供する。

【0053】

ある実施形態では、視覚的に認識可能な水相の放出は、試験方法に記載する顕微鏡法によって特徴付けられる。顕微鏡法は、油相中に乳化された水性領域の存在およびサイズを顕微鏡を使用して視覚的に分析する方法である。エマルションに剪断力を一定時間単位で増加させて与えた後、エマルションの顕微鏡写真を撮影する。剪断の約1分以内に500倍の倍率で少なくとも約10 μ mの最大直線寸法を有する非晶質の水性領域が見えるようになった場合、水相の放出を視覚的に認識できる。別の実施形態では、剪断の約1分以内に500倍の倍率で少なくとも約25、50、または75 μ mの寸法を有する非晶質の水性領域が見えるようになった場合、水相の放出を視覚的に認識できる。別の好適な実施形態では、剪断の約45秒、30秒、または15秒以内に500倍の倍率で少なくとも約10 μ mの寸法を有する非晶質の水性領域が見えるようになった場合、水相の放出を視覚的に認識できる。

10

【0054】

ある実施形態では、視覚的に認識可能な水相の放出は、試験方法に記載するミリング法に従ってミリングした後の相分離によって特徴付けられる。ミリング法は、エマルションのサンプル30gをバルクミリングする。ある実施形態では、24000rpmの速度でミリングした1分後に少なくとも約0.5gの水相が分離した場合、水相の部分の放出を視覚的に認識できる。別の実施形態では、24000rpmの速度でミリングした1分後に少なくとも約1.0g、2.5g、または5.0gの水相が分離する。さらに別の実施形態では、13500rpmの速度でミリングした1分後に少なくとも約0.25gの水相が分離した場合、水相の部分の放出を視覚的に認識できる。また別の実施形態では、組成物は24000rpmの速度でミリングした1分後に少なくとも約0.5gの水相を分離し得るが、8000rpmの速度でミリングした1分後には視覚的に認識可能な水相の放出を生じない(すなわち水相は0.1g未満)。このような実施形態は、皮膚に局所適用されると依然として水相の放出を認識でき、同時に好適な保存および加工安定性も有すると考えられる。

20

30

【0055】

ある実施形態では、触覚的に認識可能な水相の放出は、試験方法に記載するレオロジー法で測定した場合の粘度の低下によって特徴付けられる。レオロジー法は、エマルションのサンプルに制御した応力を加えて、剪断応力の対数(x軸)対粘度の対数(y軸)によるレオロジー特性を示す。剪断力を加えると水相を放出するエマルションの場合、剪断力対粘度のプロットは、限界の剪断応力で粘度が低下する形状を示す。プロットの急激な低下を示す部分の傾きは約-5より小さい。別の実施形態では、プロットの急激な低下を示す部分の傾きは約-10、-25、-50、-75、または-100より小さい。

40

【0056】

理論に束縛されるものではないが、エマルションから放出される水相の量およびその速度は、エマルション内で油相が水相と結合している方法に応じて制御可能である。さらに、エマルションから放出される水相の量およびその速度は、例えば、以下に記載するように水相を分散させるために追加の乳化剤を加えたり、乳化性架橋シロキサンエラストマーの濃度を請求項の範囲内で変更したり、水相/油相の比率を変えたりすることによっても制御可能であると考えられる。

【0057】

水相を分散させるための追加の乳化剤

50

本発明の油中水型エマルションは、任意選択的に乳化エラストマーに加えて乳化剤を含むことができる。ある実施形態では、組成物は追加の乳化剤を組成物の約0重量%～約5重量%、好ましくは約0.01重量%～約5重量%、より好ましくは約0.1重量%～約3重量%、さらに好ましくは約0.1重量%～約2重量%含んでいてもよい。追加の乳化剤が存在する場合、乳化剤は連続するシリコン相内で水相の分散および懸濁を補助する。

【0058】

本明細書では、好ましいシリコン中水型エマルションを形成するために、多種多様な乳化剤を使用することができる。選択された乳化剤が、本発明の組成物の構成成分と化学的且つ物理的に適合性があり、所望の分散特性を提供することを条件に、既知のまたは従来の乳化剤を組成物で使用することができる。好適な乳化剤としては、局所適用パーソナルケア製品で使用されることで当業者に既知の、シリコン乳化剤、非シリコン含有乳化剤、およびそれらの混合物が挙げられる。好ましくはこれらの乳化剤は、HLB値が約1.4以下、更に好ましくは約2～約1.4、および更に一層好ましくは約4～約1.0である。これらの範囲外のHLB値を有する乳化剤は、これらの範囲内に収まる有効な重量平均HLBが得られるように、他の乳化剤と組み合わせて使用することができる。

10

【0059】

シリコン乳化剤が好ましい。多種多様なシリコン乳化剤が本明細書で有用である。これらのシリコン乳化剤は典型的には、当業者にはシリコン界面活性剤としても既知の、有機的に修飾させたオルガノポリシロキサンである。有用なシリコン乳化剤には、ジメチコンコポリオール類が含まれる。これらの物質は、ポリエチレンオキシド鎖、ポリプロピレンオキシド鎖、これらの鎖の混合物などのポリエーテル側鎖、およびエチレンオキシドおよびプロピレンオキシドの両方に由来する部分を含有するポリエーテル鎖を包含するように変性されたポリジメチルシロキサン類である。他の例には、アルキル変性ジメチコンコポリオール類、即ち、C2～C30のペンダント側鎖を含有する化合物が挙げられる。更に他の有用なジメチコンコポリオール類としては、様々な陽イオン性、陰イオン性、両性、および双性イオン性のペンダント部分を有する物質が挙げられる。

20

【0060】

本明細書で乳化剤として有用なジメチコンコポリオール類および他のシリコン界面活性剤類の非限定的な例には、ペンダントのポリエチレンオキシド側鎖を有するポリジメチルシロキサンポリエーテルコポリマー、ペンダントのポリプロピレンオキシド側鎖を有するポリジメチルシロキサンポリエーテルコポリマー、ポリエチレンオキシド側鎖とポリプロピレンオキシド側鎖の混合したペンダントを有するポリジメチルシロキサンポリエーテルコポリマー、ペンダントの混合ポリ(エチレン)(プロピレン)オキシド側鎖を有するポリジメチルシロキサンポリエーテルコポリマー、ペンダントのオルガノベタイン側鎖を有するポリジメチルシロキサンポリエーテルコポリマー、ペンダントのカルボキシレート側鎖を有するポリジメチルシロキサンポリエーテルコポリマー、ペンダントの四級アンモニウム側鎖を有するポリジメチルシロキサンポリエーテルコポリマー；およびペンダントのC2～C30の直鎖、分岐鎖、または環状のアルキル部分を含有する前記コポリマーの更なる変性体がある。ダウ・コーニング社(Dow Corning Corporation)によって販売される本明細書において有用な市販のジメチコンコポリオール類の例は、ダウ・コーニング(Dow Corning)(登録商標)190、193、Q2-5220、2501ワックス、2-5324流体、および3225C(この後者の物質はシクロメチコンとの混合物として販売されている)である。セチルジメチコンコポリオールは、エイビル(ABIL)(登録商標)EM-90の商品名で市販されており、またポリグリセリル-4イソステアレート(および)ヘキシルラウレートとの混合物としても入手可能で、エイビル(ABIL)(登録商標)WE-09の商品名で販売されている(ゴールドシュミット(Goldschmidt)から入手可能)。セチルジメチコンコポリオールは、ヘキシルラウレート(および)ポリグリセリル-3オレエート(および)セチルジメチコンの混合物としても市販されており、商標名ABIL(登録商標)WS-08(同じくゴールドシュミット(Goldschmidt)から市

30

40

50

販)で販売されている。ポリジメチルシロキシエチルジメチコンコポリオールは、KF-6028、KF-6104、KF-6105、およびKF-6106の商標名で(シンエツ(Shin-Etsu)から)市販されている。また、ジメチコンコポリオール類の他の非限定的な例としては、ラウリルジメチコンコポリオール、ラウリルポリジメチルシロキシエチルジメチコンコポリオール、ジメチコンコポリオールアセテート、ジメチコンコポリオールアジパート、ジメチコンコポリオールアミン、ジメチコンコポリオールベヘネート、ジメチコンコポリオールブチルエーテル、ジメチコンコポリオールヒドロキシステアレート、ジメチコンコポリオールイソステアレート、ジメチコンコポリオールラウレート、ジメチコンコポリオールメチルエーテル、ジメチコンコポリオールホスフェート、およびジメチコンコポリオールステアレートも挙げられる。

10

【0061】

本明細書で有用なジメチコンコポリオール乳化剤は、例えば、米国特許第4,960,764号(フィゲロア, Jr. (Figueroa, Jr.)ら); 欧州特許第330,369号(サノゲイラ (SaNogueira)); G. H. ダームス (Dahms)らの「シリコンコポリオールにより提案される新処方の可能性 (New Formulation Possibilities Offered by Silicone Copolyols)」(化粧品およびトイレタリー (Cosmetics & Toiletries)、第110巻、91~100頁、1995年3月); M. E. カルロッチ (Carlotti)らの「W/O-Sエマルションの最適化およびエステル構造とエマルション特性との定量的な関係の研究 (Optimization of W/O-S Emulsions And Study Of The Quantitative Relationships Between Ester Structure And Emulsion Properties)」(分散科学およびテクノロジー誌 (J. Dispersion Science And Technology)、13(3)、315~336、1992年); P. ハーマイヤー (Hameyer)の「化粧品用油中水型エマルションの調製における有機およびオルガノシリコン乳化剤の比較技術調査 (Comparative Technological Investigations of Organic and Organosilicone Emulsifiers in Cosmetic Water-in-Oil Emulsion Preparations)」(H A P P I 28(4)、88~128頁、1991年); J. スミッド-コルバー (Smid-Korbar)らの「エマルションにおけるシリコン界面活性剤の有効性および有用性 (Efficiency and usability of silicone surfactants in emulsions)」(臨時通達 (Provisional Communication)、化粧品科学の国際誌 (International Journal of Cosmetic Science)、12、135~139、1990年); および D. G. クルジシク (Krzysik)らの「油中水型システム用の新規シリコン乳化剤 (A New Silicone Emulsifier For Water-in-Oil Systems)」(医薬品および化粧品産業 (Drug and Cosmetic Industry)、第146(4)巻、28~81頁、1990年4月)に記載されている。

20

30

【0062】

本明細書で有用な非シリコン含有乳化剤には、糖エステル類およびポリエステル類、アルコキシル化糖エステル類およびポリエステル類、C1~C30脂肪族アルコール類のC1~C30脂肪酸エステル類、C1~C30脂肪族アルコール類のC1~C30脂肪酸エステル類のアルコキシル化誘導体、C1~C30脂肪族アルコール類のアルコキシル化エーテル類、C1~C30脂肪酸類のポリグリセリルエステル類、ポリオール類のC1~C30エステル類、ポリオール類のC1~C30エーテル類、アルキルホスフェート類、ポリオキシアルキレン脂肪族エーテルホスフェート類、脂肪酸アミド類、アシルラクチレート類、石鹸類、およびそれらの混合物のような、様々な非イオン性並びにアニオン性乳化剤がある。

40

【0063】

スキンケア活性物質

本発明の局所適用組成物は、さらに少なくとも1つのスキンケア活性物質を含むことが好ましい。本明細書の処方には、一般に「水溶性」として特徴付けられる活性物質に加えて一般に「油溶性」として特徴付けられる活性物質が好適である。理論に束縛されるものではないが、本発明の組成物は種々の活性物質を配合することで汎用性を与えると考えられる。

50

【0064】

しかしながら、本発明のいかなる実施形態においても、本明細書で有用な活性物質類は、それらが提供する効果または前提とされるそれらの作用機序によって分類することができる。ただし、本明細書で有用な活性物質類は、場合によっては、2つ以上の効果をもたらすことができるか、または2つ以上の作用機序を介して機能できると解されるべきである。従って、本明細書の分類は便宜上実施されるものであって、活性物質を、列挙した特定の用途または用途類に制限しようとするものではない。

【0065】

本明細書に好適なスキンケア活性物質の非限定的な例には、ナイアシンアミド、ヘキサミジン化合物、美白活性物質、ペプチド、糖アミン、およびこれらの混合物が挙げられる。

10

【0066】

ナイアシンアミド

ナイアシンアミド（または溶媒に可溶性で室温で固体の別のビタミンB₃化合物）は、本明細書に用いるのに好ましいスキンケア活性物質である。本発明は、好ましくは約2%～約30%、より好ましくは約2%～約20%、さらに好ましくは約2%～約10%のビタミンB₃化合物を含む。

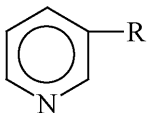
【0067】

本明細書で使用するとき、「ナイアシンアミド」は次式を有する化合物を意味する。

【0068】

【化2】

20



式中、Rは -CONH₂である。

【0069】

ナイアシンアミドは、実質的に純粋な物質として、あるいは好適な物理的および/または化学的単離によって天然（例えば、植物）資源から得られた抽出物として包含されてもよい。ビタミンB₃化合物は、好ましくは実質的に純粋であり、より好ましくは本質的に純粋である。

30

【0070】

ヘキサミジン化合物

本発明の局所的に適用する組成物はまた、安全且つ有効な量の1つ以上のヘキサミジンおよびその塩を含む。より好ましくは、ヘキサミジンはヘキサミジンジイセチオネートである。

【0071】

本明細書で使用するとき、「ヘキサミジン」は、そのいかなる異性体および互変異性体も含み、エレストブ（Elestab）（登録商標）HP100の商品名のヘキサミジンジイセチオネートとしてラボラトリーズ・セロバイオロジクス（Laboratoires Serobiologiques）（フランス、プルノイ（Pulnoy））より市販されている。

40

【0072】

本発明の組成物において、ヘキサミジンは、好ましくは組成物の約0.0001重量%～25重量%、より好ましくは約0.001重量%～約10重量%、より好ましくは約0.01重量%～約5重量%、最も好ましくは約0.02重量%～約2.5重量%含まれる。

【0073】

美白剤

本組成物は美白剤を含有してもよい。本明細書において有用な美白剤とは、皮膚の外観を改変するだけでなく、処置前と比較して、異常な色素沈着を更に改善する活性成分をい

50

う。本明細書で有用な美白剤としては、アスコルビン酸化合物、ビタミンB₃化合物、アゼライン酸、ブチルヒドロキシアニソール、没食子酸とその誘導体、ヒドロキノイン (hydroquinone)、コウジ酸、アルブチン、クワ抽出物、ウンデシレノイルフェニルアラニン、およびこれらの混合物が挙げられる。美白剤の組み合わせの使用は、それらが異なる機構により美白の効果をもたらす可能性があるという点で、有利であるとも考えられている。

【0074】

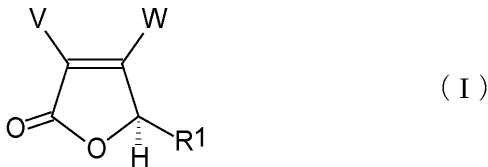
使用する場合、組成物は好ましくは、組成物の約0.1重量%～約10重量%、より好ましくは約0.2重量%～約5重量%の美白剤を含有する。

【0075】

アスコルビン酸化合物は美白剤に有用であり、次式(I)を有する。

【0076】

【化3】



式中、VおよびWは独立して-OHであり、R¹は-CH(OH)-CH₂OHおよびこれらの塩である。

【0077】

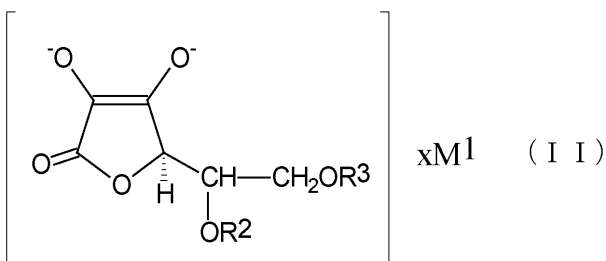
好ましくは、本明細書で有用なアスコルビン酸化合物は、アスコルビン酸塩またはこれらの誘導体であり、これには例えば、当該技術分野において周知の方法で調整したナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウム、バリウム、アンモニウム、およびプロタミン塩などの、当業者に公知の無毒性アルカリ金属、アルカリ土類金属、およびアンモニウム塩が挙げられるが、これらに限定されない。

【0078】

より好ましくは、本明細書で有用なアスコルビン酸塩は、次式(II)を有する金属アスコルビン酸である。

【0079】

【化4】



式中、R²およびR³は独立して水素および炭素数が1～約8個の直鎖または分枝鎖アルキルから選択され、M¹は金属であり、xは1～約3の整数である。より好ましくは、R²およびR³は独立して水素および炭素数が1～約3個の直鎖または分枝鎖アルキルから選択され、M¹はナトリウム、カリウム、マグネシウム、またはカルシウムである。

【0080】

その他の式(II)を有する好ましいアスコルビン酸塩の例には、アスコルビン酸の一価の金属塩(例えば、アスコルビン酸ナトリウム、アスコルビン酸カリウム)、二価の金属塩(例えば、アスコルビン酸マグネシウム、アスコルビン酸カルシウム)、および三価の金属塩(例えば、アスコルビン酸アルミニウム)が挙げられる。

【0081】

好ましくは、本明細書で有用なアスコルビン酸塩は、次式(III)を有する水溶性アスコルビルエステルである。

10

20

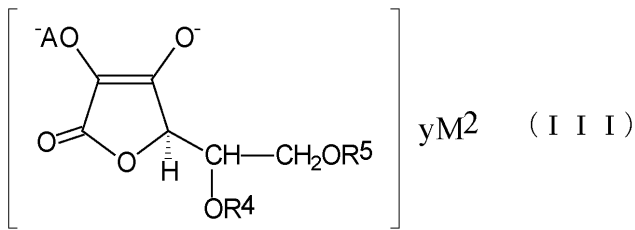
30

40

50

【 0 0 8 2 】

【 化 5 】



式中、Aは硫酸またはリン酸であり、 R^4 および R^5 は独立して水素および炭素数が1～約8個の直鎖または分枝鎖アルキルから選択され、 M^2 は金属であり、 y は1～約3の整数である。より好ましくは、 R^4 および R^5 は独立して水素および炭素数が1～約3個の直鎖または分枝鎖アルキルから選択され、 M^2 はナトリウム、カリウム、マグネシウム、またはカルシウムである。

10

【 0 0 8 3 】

別の特に好ましいアスコルビン酸化合物は、一般にL-アスコルビン酸2-グルコシドまたはアスコルビルグルコシドと呼ばれる2-o-D-グルコピラノシル-L-アスコルビン酸、並びにその金属塩である。このような化合物は林原(Hayashibara)から入手可能である。

【 0 0 8 4 】

アスコルビン酸リン酸マグネシウムはビタミンCの安定形である。この化合物は生体内でビタミンCに変換される。また、水、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、マルチール、およびグリセリンなどの種々の溶媒に可溶性で、これらの溶媒中で安定である。ビタミンCとは異なり、アスコルビン酸リン酸マグネシウムは皮膚に経皮吸収される。アスコルビン酸リン酸マグネシウムは、ニッコール(NIKKOL)VC-PMGとしてパーネット・プロダクツ社(Barnet Products Corp.)から市販されている。

20

【 0 0 8 5 】

代表的な水溶性塩誘導体としては、L-アスコルビン酸2-グルコシドや、リン酸L-アスコルビルナトリウム、リン酸L-アスコルビルカリウム、リン酸L-アスコルビルマグネシウム、リン酸L-アスコルビルカルシウム、リン酸L-アスコルビルアルミニウムのようなリン酸L-アスコルビルエステル塩が挙げられるが、これらに限定されない。硫酸L-アスコルビルエステル塩も用いることができる。例としては、硫酸L-アスコルビルナトリウム、硫酸L-アスコルビルカリウム、硫酸L-アスコルビルマグネシウム、硫酸L-アスコルビルカルシウム、および硫酸L-アスコルビルアルミニウムがある。

30

【 0 0 8 6 】

また、ウンデシレノイルフェニルアラニンも美白剤として本明細書に用いるのに好適な置換アミノ酸である。この化合物はセピホワイトMsh(Sepiwhite Msh)の商標名でセピック(Seppic)から入手可能である。塩化セチルピリジニウムおよびテトラヒドロルクミンも美白剤として本明細書に用いるのに好適である。

【 0 0 8 7 】

カンゾウ由来の天然物質であるグリシルリジン酸、およびその誘導体のグリチルレチン酸なども、本明細書に用いるのに好適である。このような物質はモールゼン(Maurzen)またはイチマル・ファークス(Ichimaru Pharcos)から入手可能である。

40

【 0 0 8 8 】

ペプチド

ジ-、トリ-、テトラ-、ペントペプチド、並びにそれらの誘導体を含むペプチドは、これらに限定されるものではないが、安全且つ有効な量で本発明の組成物に含めることも可能である。本明細書で使用するとき、「ペプチド」という用語は、天然由来のペプチドおよび合成ペプチドの両方を意味する。また、本明細書で有用なのは、ペプチドが含まれている天然由来の組成物および市販されている組成物である。

50

【0089】

本明細書に用いるのに好適なジペプチドとしては、カルノシン (Carnosine) (- A l a - H i s) が挙げられる。本明細書に用いるのに好適なトリペプチドとしては、G l y - H i s - L y s、A r g - L y s - A r g、H i s - G l y - G l y が挙げられる。好ましいトリペプチドおよびその誘導体としては、バイオペプチド (Biopeptide) C L (登録商標) として購入可能なパルミトイル - G l y - H i s - L y s (フランス、セダーマ (Sederma) から入手可能な 1 0 0 p p m のパルミトイル - G l y - H i s - L y s) ; ペプチド C K (A r g - L y s - A r g) ; ペプチド C K + (A c - A r g - L y s - A r g - N H ₂) ; およびイアミン (Iamin) としてシグマ (ミズーリ州セントルイス) から購入可能な H i s - G l y - G l y の銅誘導体が挙げられる。テトラペプチドおよびペンタペプチドも本明細書に用いるのに好適である。

10

【0090】

好ましい市販のペンタペプチド誘導体含有組成物は、マトリキシル (Matrixyl) (登録商標) であり、これは、パルミトイル - l y s - t h r - t h r - l y s - s e r を 1 0 0 p p m 含有する (p a l - K T T K S、フランスのセダーマ (Sederma) から入手可能)。別の好ましいペプチドには、パルミトイル - リジン - トレオニン (p a l - K T) およびパルミトイル - グリシン - グルタミン - プロリン - アルギニン (p a l - G Q P R、リジン (RIGIN) (登録商標) の名で知られる組成物として入手可能) が挙げられ、同様にフランスのセダーマ (Sederma) から市販されている。

20

【0091】

ペプチドは、本組成物に含まれる場合、好ましくは組成物の約 0 . 0 0 0 0 0 1 重量% ~ 約 1 0 重量%、より好ましくは約 0 . 0 0 0 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 1 重量%、更に好ましくは約 0 . 0 0 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 0 1 重量% の濃度で含まれる。ペプチドとしてカルノシン (Carnosine) (登録商標) が含まれているある組成物では、組成物には好ましくは前記ペプチドが組成物の約 0 . 1 重量% ~ 約 5 重量% の濃度で含まれている。ペプチドまたはペプチド含有組成物としてパルミトイル - L y s - T h r - T h r - L y s - S e r および / またはバイオペプチド C L (登録商標) が含まれている別の実施形態では、組成物には好ましくは約 0 . 0 0 0 1 % ~ 約 1 0 % のパルミトイル - L y s - T h r - T h r - L y s - S e r および / またはバイオペプチド C L (登録商標) ペプチド含有組成物が含まれている。

30

【0092】

糖アミン

本発明の組成物は、安全且つ有効な量の、アミノ糖としても知られる糖アミンを包含してもよい。本明細書で使用する時、「糖アミン」とは、6 炭素の糖のアミン誘導体のことをいう。好ましくは、当該組成物は、組成物の約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 2 0 重量%、より好ましくは約 1 重量% ~ 約 1 0 重量%、更により好ましくは約 2 重量% ~ 約 5 重量% の糖アミンを含有する。

【0093】

本明細書において有用な糖アミン類の例としてはグルコサミン、N - アセチルグルコサミン、マンノサミン、N - アセチルマンノサミン、ガラクトサミン、N - アセチルガラクトサミンが挙げられる。本明細書の使用に好ましいのはグルコサミンである。加えて、2 つ以上の糖アミンの組み合わせを使用してもよい。

40

【0094】

スキンコンディショニング剤

本発明の局所適用組成物は、組成物の約 1 重量% ~ 約 6 0 重量% のスキンコンディショニング剤を含有する。好ましくは、組成物は、組成物の約 2 重量% ~ 約 5 0 重量%、より好ましくは約 5 重量% ~ 約 4 0 重量% のスキンコンディショニング剤を含有する。一般に、スキンコンディショニング剤を高い割合で含有する組成物は、ユーザーに脂っぽいまたはべたつくという認識されることがある。本発明の組成物は、驚くべきことに、脂っぽいまたはべたつくという認識をそれ程高めることなく、比較的高い割合 (例えば、組成物の 2 5

50

重量%を越す割合)でスキンコンディショニング剤を含有できることが分かっている。

【0095】

本明細書に用いるのに好適なスキンコンディショニング剤には、ポリアルキレングリコールなどの多価アルコールが挙げられる。本明細書に用いるのに好ましいのは、アルキレンポリオールおよびそれらの誘導体である。本明細書で有用な多価アルコールの例には、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ソルビトール、トレハロース、ヒドロキシプロピルソルビトール、ヘキシレングリコール、1,3-ブチレングリコール、1,2,6-ヘキセントリオール、グリセリン、1,2-ヘキサジオール、ペンチレングリコール、エトキシ化グリセリン、プロポキシ化グリセリン、ブタントリオール、およびこれらの混合物が挙げられる。本明細書に用いるのに好ましい多価アルコールはグリセリンである。

10

【0096】

本明細書に用いるスキンコンディショニング剤は、従来の製造手段および精製方法から得ることができる。

【0097】

増粘剤

本発明の組成物は、実施形態によっては更に1つ以上の増粘剤を含んでもよい。存在する場合、組成物は好ましくは、組成物の約0.1重量%~約5重量%、更に好ましくは約0.1重量%~約4重量%、更により好ましくは約0.25重量%~約3重量%の増粘剤を含む。

20

【0098】

増粘剤の非限定的な部類としては、以下から選択されるものが挙げられる。

a) カルボン酸ポリマー類

これらのポリマー類は、アクリル酸、置換アクリル酸、並びにこれらのアクリル酸および置換アクリル酸の塩およびエステルから誘導される1つ以上のモノマーを含有する架橋した化合物であり、架橋剤は2つ以上の炭素-炭素二重結合を含有し、多価アルコールから誘導される。

【0099】

本明細書で有用な市販のカルボン酸ポリマー類の例としてはカルボマー類が挙げられ、これらは、スクロースまたはペンタエリスリトール(pentaerytritol)のアリルエーテル類で架橋されたアクリル酸のホモポリマー類が挙げられる。カルボマーは、B.F.グッドリッチ(B.F. Goodrich)からカーボポール(Carbopol)(登録商標)900シリーズ(例えば、カーボポール(Carbopol)(登録商標)954)として入手可能である。更に、他の好適なカルボン酸ポリマー剤としては、 C_{10-30} アルキルアクリレートと、1つ以上のアクリル酸モノマー、メタクリル酸モノマー、またはこれらの短鎖の1つ(即ち、 C_{1-4} アルコール)のエステルとのコポリマーが挙げられ、ここでその架橋剤は、スクロースまたはペンタエリスリトールのアリルエーテルである。これらのコポリマーは、アクリレート/ C_{10-30} アルキルアクリレートクロスポリマーとして知られ、カーボポール(Carbopol)(登録商標)1342、カーボポール(登録商標)1382、ペムレン(Pemulen)TR-1、およびペムレンTR-2としてB.F.グッドリッチ(B.F. Goodrich)より市販されている。換言すれば、本明細書で有用なカルボン酸ポリマー増粘剤の例は、カルボマー類、アクリレート類/ C_{10-30} アルキルアクリレートクロスポリマー類、およびこれらの混合物から選択されるものである。

30

40

【0100】

b) 架橋ポリアクリレートポリマー類

本発明の組成物は、カチオン性および非イオン性ポリマーの両方を含む増粘剤またはゲル化剤として有用な、架橋ポリアクリレートポリマーを任意に含むことができるが、カチオン性ポリマーが一般に好ましい。

【0101】

c) ポリアクリルアミドポリマー類

50

本発明の組成物は、ポリアクリルアミドポリマー、特に置換分枝状または非分枝状ポリマーを含む非イオン性ポリアクリルアミドポリマーを任意に含むことができる。これらのポリアクリルアミドポリマー類の中でも、CTFA表記ポリアクリルアミドおよびイソパラフィンおよびラウレス-7の非イオン性ポリマーがより好ましく、商標名セピゲル (Sepegel) 305としてセピック・コーポレーション (Seppic Corporation) (米国ニュージャージー州フェアフィールド) より市販されている。

【0102】

本明細書で有用な他のポリアクリルアミドポリマー類としては、アクリルアミド類および置換アクリルアミド類と、アクリル酸類および置換アクリル酸類との多元ブロックコポリマー類が挙げられる。前記多元ブロックコポリマー類の市販例としては、リポ・ケミカルズ社 (Lipo Chemicals, Inc.) (ニュージャージー州パターソン (Patterson)) からのハイパン (Hypan) SR150H、SS500V、SS500W、SSSA100Hが挙げられる。

10

【0103】

d) 多糖類

多種多様な多糖類が本明細書において有用である。「多糖類」とは、繰り返す糖 (すなわち、炭水化物) 単位の主鎖を含有するゲル化剤を意味する。多糖類ゲル化剤類の非限定的な例としては、セルロース、カルボキシメチルヒドロキシエチルセルロース、セルロースアセテートプロピオネートカルボキシレート、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシエチルエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルヒドロキシエチルセルロース、微結晶セルロース、セルロース硫酸ナトリウム、およびこれらの混合物から選択されるものが挙げられる。また本明細書で有用なものは、アルキル置換セルロース類である。これらのポリマー類では、セルロースポリマーのヒドロキシ基は、ヒドロキシアルキル化 (好ましくは、ヒドロキシエチル化またはヒドロキシプロピル化) されて、ヒドロキシアルキル化セルロースを形成し、次いでこれは $C_{10} \sim C_{30}$ 直鎖または分枝鎖アルキル基によって、エーテル結合を通じて更に変性される。典型的には、これらのポリマー類は、 $C_{10} \sim C_{30}$ 直鎖または分枝鎖アルコール類とヒドロキシアルキルセルロース類とのエーテル類である。本明細書で有用なアルキル基の例としては、ステアリル、イソステアリル、ラウリル、ミリスチル、セチル、イソセチル、ココイル (すなわち、ココヤシ油のアルコール類から誘導されるアルキル基)、パルミチル、オレイル、リノレイル、リノレニル、リシノレイル、ベヘニル、およびこれらの混合物から選択されるものが挙げられる。アルキルヒドロキシアルキルセルロースエーテル類の中で好ましいのは、CTFA表記セチルヒドロキシエチルセルロースの物質であり、これはセチルアルコールとヒドロキシエチルセルロースとのエーテルである。この物質は、アクアロン社 (Aqualon Corporation) (デラウェア州ウィルミントン) から、商品名ナトロゾル (Natrosol) (登録商標) CSプラス (Plus) として販売されている。

20

30

【0104】

その他の有用な多糖類には、3単位毎に(1~6)結合グルコースを有する直鎖の(1~3)結合グルコース単位であるスクレログルカン類が挙げられるが、その市販の例は、マイケル・メルシエ・プロダクツ社 (Michel Mercier Products Inc.) (ニュージャージー州マウンテンサイド) 製のクリアロゲル (Clearogel) (登録商標) CS11である。

40

【0105】

e) ゴム類

本明細書で有用な他の増粘剤類およびゲル化剤類には、主に自然源より誘導される物質が包含される。これらのゲル化剤ガム類の非限定的な例としては、アカシア、寒天、アルギン、アルギン酸、アルギン酸アンモニウム、アミロペクチン、アルギン酸カルシウム、カラギーナンカルシウム、カルニチン、カラギーナン、デキストリン、ゼラチン、ジェランガム、グアーガム、グアーヒドロキシプロピルトリモニウムクロリド、ヘクトライト、ヒアルロン酸、水酸化ケイ素、ヒドロキシプロピルキトサン、ヒドロキシプロピルグアー、カラヤゴム、ケルブ、イナゴマメゴム、納豆ゴム、アルギン酸カリウム、カラギーナン

50

カリウム、プロピレングリコールアルギネート、スクレロチウムガム、カルボキシメチルデキストランナトリウム、カラギーナンナトリウム、トラガカントガム、キサンタンガム、およびこれらの混合物が挙げられる。

【0106】

粒子状物質

本発明の組成物は、特定の実施形態において、肌触りや外観を変えるために粒子状物質を含有してもよい。好適な粒子状物質の例は、米国特許第5,997,887号(ハ(Ha)ら)に開示されている。例えばTiO₂、ZnO、またはZrO₂などの無機粒子状物質は、複数の供給元から市販されている。好適な粒子状物質の一例には、U.S.コスメティクス(U.S. Cosmetics)から入手可能な物質(トロノックス(TRONOX)TiO₂シリーズ、SAT-T CR837、ルチルTiO₂)が挙げられる。無機化学物質との組み合わせを有する粒子状物質の例は、触媒化成工業株式会社(Catalysts and Chemicals Ind. Co. Ltd.)から入手可能な、層状の無機化学物質を含むカバーリーフ(COVERLEAF)AR-80、およびスズキ・ユシ社(Suzuki Yushi Ind.Co.Ltd)から入手可能な、1以上の無機化学物質を封入したシリカ粉末のゴッドバル(Goddbal)が挙げられる。好ましくは、粒子状物質は、組成物中に、組成物の約0.01重量%~約20重量%、より好ましくは約0.05重量%~約15重量%、更に好ましくは約0.1重量%~約12重量%の濃度で存在する。

10

【0107】

好適な有機粉末/充填剤としては、メチルシルセスキオキサン樹脂微小球から選択されるポリマー粒子(Tospearl 145Aという名称で東芝シリコンから販売されているものなど);ポリメチルメタクリレート微小球(Micropearl M100という名称でSeppicから販売されているもの);架橋ポリジメチルシロキサンの球状粒子(特に、Trefil E506CまたはTrefil E505Cという名称でDow Corning Toray Siliconから販売されているものなど)、ポリアミド球状粒子、更に具体的にはナイロン12(特に、Orgasol 2002D NatC05という名称でAtocchemから販売されているものなど)、ポリスチレン微小球(Dynospheresという名称でDyno Particlesから販売されているものなど)、エチレンアクリレートコポリマー(FloBead EA209という名称でKoboから販売されている)およびこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。

20

30

【0108】

粒子は、より容易に送達溶媒中に分散するように、疎水処理を行ってもよい。また、シリコン相と適合性のある物質で顔料を処理すると有用な場合もある。シリコン中水型エマルジョンに使用するのに特に有用な疎水性顔料の処理には、米国特許第5,143,722号に開示されているようなポリシロキサン処理が挙げられる。この文献はその全体が参考として本明細書に組み込まれている。一次平均粒径が約10~約100,000nm、更に好ましくは約50~約5,000nm、最も好ましくは約100~約1000nmの粒子も好ましい。また、粒径の異なる同一または異なった粒子の混合物も、本明細書で有用である(例えば、約100nm~約400nmの一次粒径を有するTiO₂と約10nm~約50nmの一次粒径を有するTiO₂とを混合する)。

40

【0109】

任意成分

本発明の組成物類は、1以上の追加のスキンケア活性物質を含有してもよい。組成物がヒトのケラチン組織と接触される好ましい実施形態では、前記追加構成成分はケラチン組織への適用に好適であるべきであり、即ち、組成物中に組み込まれたときに、それらは、正しい医学的判断の範囲内で、過度の毒性、不適合性、不安定性、アレルギー反応などを伴うことなくヒトのケラチン組織に接触させて用いるのに好適である。

【0110】

本発明に使用可能な追加のスキンケア活性成分の非限定的な例には、日焼け止め活性物

50

質、油溶性テルペンアルコール、フィトステロール、油溶性ビタミン化合物、追加のビタミンB₃化合物、油溶性ビタミン化合物、皮膚軟化剤および閉塞剤、デヒドロ酢酸、抗ニキビ活性物質、 α -ヒドロキシ酸、キレート化剤、フラボノイド、抗炎症剤、抗セルライト剤、局所麻酔剤、落屑活性物質、酸化防止剤/ラジカルスカベンジャー、局所麻酔剤、日焼け剤、皮膚鎮静および回復剤、抗菌および抗真菌剤、およびこれらの混合物が挙げられる。

【0111】

CTFA化粧品成分ハンドブック(CTFA Cosmetic Ingredient Handbook)、第11版(2004年)には、スキンケア業界で通常使用される多種多様な非限定的な化粧品および医薬品の成分が記載されており、それらは本発明の組成物に用いるのに好適である。これらの構成成分の部類の例としては、研磨材、吸収剤、美容成分、例えば、芳香剤、顔料、染色/着色剤、精油、皮膚感覚剤、収れん剤など(例えば、丁子油、メントール、カンファー、ユーカリ油、オイゲノール、メンチルラクテート、ウィッチヘーゼル留出物)、抗ニキビ剤、固化防止剤、消泡剤、酸化防止剤、結合剤、生物学的添加物、緩衝剤、充填剤、キレート化剤、化学添加物、化粧品用収れん剤、化粧品用殺生物剤、変性剤、薬物収れん剤、外用鎮痛剤、被膜形成体または物質、例えば、組成物の被膜形成特性および実質性を補助するポリマー(例えば、エイコセンおよびビニルピロリドンのコポリマー)、不透明化剤、pH調整剤、保存剤、噴射剤、還元剤、金属イオン封鎖剤、皮膚脱色および美白剤(例えば、ヒドロキノン、コウジ酸、アスコルビン酸、アスコルビルグルコサミン)、スキンコンディショニング剤(例えば、その他の湿潤剤および閉塞性湿潤剤)、皮膚鎮静剤および/または回復剤(例えば、パンテノールおよび誘導體(例えば、エチルパンテノール)、アロエベラ、パントテン酸およびその誘導體、アラントイン、ピサボロール、およびグリチルリチン酸二カリウム)、皮膚処理剤、濃厚剤、ビタミンおよびそれらの誘導體が挙げられる。

10

20

【0112】

しかしながら、本発明のいかなる実施形態においても、本明細書で有用な活性物質類は、それらが提供する効果または前提とされるそれらの作用機序によって分類することができる。ただし、本明細書で有用な活性物質類は、場合によっては、2つ以上の効果をもたらすことができるか、または2つ以上の作用機序を介して機能できると解されるべきである。従って、本明細書の分類は便宜上実施されるものであって、活性物質を、列挙した特定の用途または用途類に制限しようとするものではない。

30

【0113】

日焼け止め活性物質

紫外線に曝されることによって、角質層の過度の鱗屑およびきめの変化を招く可能性がある。したがって、本発明の組成物は、任意選択的に日焼け止め活性物質を含有してもよい。本明細書で使用する時、「日焼け止め活性物質」とは、日焼け止め剤および物理的日焼け防止剤の両方を包含する。好適な日焼け止め活性物質は、有機または無機であってよい。

【0114】

本明細書で有用な無機日焼け止め剤としては、次の金属酸化物;約15nm~100nmの平均一次粒径を有する二酸化チタン、約15nm~150nmの平均一次粒径を有する酸化亜鉛、約15nm~150nmの平均一次粒径を有する酸化ジルコン、約15nm~500nmの平均一次粒径を有する酸化鉄、およびこれらの混合物が挙げられる。本明細書で使用する時、無機日焼け止め剤は、組成物の約0.1重量%~約20重量%、好ましくは約0.5重量%~約10重量%、より好ましくは約1重量%~約5重量%の量で存在する。

40

【0115】

多種多様な、従来有機日焼け止め活性物質が、本明細書での使用に好適である。サガリン(Sagarin)らの化粧品の科学と技術(Cosmetics Science and Technology)(1972年)、第VII章、189頁以下は、多数の適した活性物質を開示している。本発

50

明の組成物に有用な特に好ましい有機日焼け止め活性物質は、ホモサラート、オクトクリレン、2-エチルヘキシル-p-メトキシケイ皮酸塩（パーソル（PARSOL）MCXとして市販されている）、フェニルベンゾイミダゾールスルホン酸、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン（ベンゾフェノン-3）、サリチル酸2-エチルヘキシル、およびこれらの混合物が挙げられる。

【0116】

本発明に有用な組成物において有用な更に好ましい有機日焼け止め活性物質は、2-エチルヘキシル-p-メトキシケイ皮酸塩、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、2-フェニルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸、オクチルジメチル-p-アミノ安息香酸、オクトクリレン、酸化亜鉛、二酸化チタン、およびこれらの混合物である。

10

【0117】

通常は、組成物の約1重量%～約20重量%、より典型的には約2重量%～約10重量%の、安全且つ有効な量の有機日焼け止め活性物質が使用される。正確な量は、選択される1種または複数種の日焼け止め剤、並びに所望の太陽光線保護指数（SPF）によって異なる。

【0118】

油溶性テルペンアルコール

本明細書で使用する時、「テルペンアルコール」は、末端ヒドロキシル基を有する2つまたはそれ以上の5-炭素イソプレン単位 $[CH_2 = C(CH_3) - CH = CH_2]$ を指す。

20

【0119】

本明細書で有用な油溶性テルペンアルコールの例としては、ファルネソール、ファルネソールの誘導体、ファルネソールの異性体、ゲラニオール、ゲラニオールの誘導体、ゲラニオールの異性体、フィタントリオール、フィタントリオールの誘導体、フィタントリオールの異性体、およびこれらの混合物が挙げられる。本明細書に用いるのに好ましいのは、ファルネソールである。

【0120】

ファルネソールは、スクアレンおよびステロール、特にコレステロールの生合成で前駆体および/または中間体として作用すると考えられている天然物質である。ファルネソールは、タンパク質の修飾および調節（例えば、タンパク質のファルネシル化）にも関与し、ファルネソールに反応する細胞核受容体が存在する。

30

【0121】

化学的には、ファルネソールは $[2E, 6E] - 3, 7, 11 - \text{トリメチル} - 2, 6, 10 - \text{ドデカトリエン} - 1 - \text{オール}$ であり、本明細書で使用する時「ファルネソール」はそのような異性体および互変異性体を含む。ファルネソールは、例えばファルネソールの製品名で（ドラゴコ（Dragoco）、米国ニュージャージー州、トトワ、ゴールデンドライブ10から異性体の混合物）およびトランス-トランス-ファルネソールの製品名で（シグマ・ケミカル社（Sigma Chemical Company、米国ミズーリ州、セントルイス、私書箱14508）から市販されている。ファルネソールの好適な誘導体は、アルドリッチ・ケミカル社（Aldrich Chemical Company）（ウィスコンシン州、ミルウォーキー、私書箱2060）から市販されているファルネシルアセテートである。

40

【0122】

ゲラニオールは、3, 7-ジメチル-2, 6-オクタジエン-1-オールとして知られる化学物質の一般名である。本明細書で使用する時、「ゲラニオール」はそのような異性体および互変異性体を含む。ゲラニオールは、アルドリッチ・ケミカル社（Aldrich Chemical Company）（ウィスコンシン州、ミルウォーキー、私書箱2060）から市販されている。好適なゲラニオールの誘導体としては、ゲラニルアセテート、ゲラニルゲラニオール、ゲラニルピロホスフェート、およびゲラニルゲラニルピロホスフェートが挙げられ、これらすべてがシグマ・ケミカル社（Sigma Chemical Company）（ミズーリ州、セント

50

ルイス、私書箱 14508) より市販されている。例えば、ゲラニオールは、クモ状脈管 / 赤斑治療剤、目の周りのくま / 腫れた目の治療剤、血色の悪さの治療剤、たるみ治療剤、かゆみ止め剤、皮膚濃厚剤、毛穴低減剤、油分 / 光沢低減剤、炎症後色素沈着治療剤、創傷処置剤、抗セルライト剤として、ならびに、皺および小皺を含めた皮膚の肌目の調整に有用である。

【0123】

フィタントリオールは、3, 7, 11, 15, テトラメチルヘキサデカン - 1, 2, 3, - トリオールとして知られる化学物質の一般名である。フィタントリオールは B A S F (米国ミシガン州、ワイアンドット、ピドルアベニュー 1609) から市販されている。例えば、フィタントリオールはクモ状脈管 / 赤斑の治療剤、目のくま / 脹れの治療剤、青白さの治療剤、たるみ治療剤、抗かゆみ剤、皮膚濃厚剤、毛穴減少剤、油分 / 光沢減少剤、炎症後の色素沈着の治療剤、傷治療剤、抗セルライト剤として、並びに皺および小皺を含めた皮膚の肌目の調整に有用である。

10

【0124】

フィトステロール

フィトステロールおよびそれらの誘導体は、美白効果を提供することで知られている。油溶性フィトステロール誘導体の非限定例としては、 β -シトステロール、カンペステロール、ブラジカステロール、ルペノール、 β -スピナステロール、スチグマステロール、これらの誘導体、およびこれらの組み合わせが挙げられる。より好ましくは、フィトステロール誘導体は、 β -シトステロール、カンペステロール、ブラジカステロール、スチグマステロール、これらの誘導体、およびこれらの組み合わせから成る群から選択される。

20

【0125】

油溶性ビタミン化合物

種々の皮膚効果を提供することが当該技術分野において既知の多数のビタミン類は、油溶性であり、それらの誘導体の一部またはすべてが油溶性である。そのようなものとして、油溶性ビタミン化合物は、本明細書で油溶性スキンケア活性物質として有用である。このような油溶性ビタミン化合物の非限定的な例としては、レチノイド、追加のビタミン B₃ 化合物、ビタミン C (例えばパルミチン酸アスコルビル)、ビタミン D、ビタミン K、ビタミン E、およびこれらの混合物が挙げられる。本明細書に用いるのに好ましいのは、レチノイド、追加のビタミン B₃ 化合物、ビタミン E、およびこれらの混合物であり、これらはそれぞれ以下に説明する。

30

【0126】

本発明で使用する時、「レチノイド」は、皮膚内でビタミン A の生物学的活性を有するビタミン A またはレチノール様化合物のすべての天然および / または合成類縁体、並びにこれらの化合物の幾何異性体および立体異性体を含む。好ましいレチノイドは、レチノール、レチニルパルミテート、レチニルアセテート、レチニルプロピオネート、レチナールおよびこれらの組み合わせであるが、いかなる油溶性レチノイドも本明細書に使用してよい。

【0127】

本発明の組成物は、特定の実施形態において、追加のビタミン B₃ 化合物 (ナイアシンアミド以外) を含有してもよい。存在する場合、組成物は、ビタミン B₃ 化合物を好ましくは組成物の約 0.01 重量% ~ 約 50 重量%、より好ましくは約 0.1 重量% ~ 約 10 重量%、更に好ましくは約 0.5 重量% ~ 約 10 重量%、更に好ましくは約 1 重量% ~ 約 5 重量% 含有する。

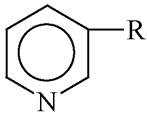
40

【0128】

本明細書で使用する時、「追加のビタミン B₃ 化合物」は、次式を有する化合物を意味する。

【0129】

【化 6】



式中、Rは、 $-COOH$ （すなわち、ニコチン酸）または $-CH_2OH$ （すなわち、ニコチルアルコール）、これらの誘導体、および上記いずれかの塩である。前述のビタミン B_3 化合物の代表的な誘導体には、非血管拡張性のニコチン酸のエステル（例えば、トコフェリルニコチネート）、ニコチルアミノ酸、カルボン酸のニコチルアルコールエステル、ニコチン酸-N-オキシド、およびナイアシンアミド-N-オキシドを包含するニコチン酸エステルが挙げられる。

10

【0130】

ビタミンEおよびそれらの数種の誘導体は、酸化防止剤/ラジカルスカベンジャーとして特に有用であることが知られている。このような酸化防止剤/ラジカルスカベンジャーは、角質層の鱗屑状の剥がれの増加または質感の変化を引き起こし得る紫外線放射、および皮膚の損傷を引き起こし得るその他の環境要因に対する保護をもたらすのに特に有用である。

【0131】

油性ビタミンE化合物の非限定例としては、トコフェロール（ビタミンE）、ソルビン酸トコフェロール、酢酸トコフェロール、およびその他のトコフェロールのエステルが挙げられる。好ましい酸化防止剤/ラジカルスカベンジャーは、ソルビン酸トコフェロール、酢酸トコフェロール、およびこれらの混合物から選択される。物質の一部類、トコトリエノールも本明細書で有用であり、これはビタミンEに関連する。

20

【0132】

皮膚軟化剤および閉塞剤

皮膚軟化剤は、柔らかく滑らかで柔軟な皮膚の外観維持に役立つ化粧品成分である。皮膚軟化剤は、皮膚表面上または角質層内にとどまる能力によって、潤滑剤として作用し、剥離を減らし、皮膚の外観を改善する機能を有する。閉塞剤は、皮膚表面からの水分蒸発を抑制する化粧品成分である。蒸発による水分の損失を防ぐことによって、閉塞剤物質は皮膚の水分含有量を増加させる。閉塞剤は、一般に皮膚表面上にとどまる傾向がある脂質である。皮膚軟化剤も皮膚適用時に閉塞性を示すことがあり、逆もまた同様である。好適な皮膚軟化剤および閉塞剤の例には、カプリル酸/カプリン酸グリセリド、イソプロピルイソステアレート、鉱油、セチルリシノレート、およびワセリンが挙げられる。

30

【0133】

デヒドロ酢酸

デヒドロ酢酸は、米国特許第6,150,403号に開示されているように、油っぽいおよび/またはてかてかした皮膚の外観を調節するのに有用な化合物である。デヒドロ酢酸の化学名は3-アセチル-6-メチル-2H-ピラン-2,4(3H)-ジオンであり、ユニセプト(Unisept) DHA（登録商標）の商標名でユニバーサル・プリザーブ-A-ケム(Universal Preserv-A-Chem)（ニューヨーク州ブルックリン）から、またトリ-K・インダストリーズ(Tri-K Industries)（ニュージャージー州ノースベール）から、あるいはゲオガード(GEOGARD)（登録商標）221またはゲオガード(GEOGARD)（登録商標）361の商標名でロンザ(Lonza)（ニュージャージー州アナンデール）から市販されている。

40

【0134】

本発明の組成物は、約0.1%~約10%、より好ましくは約0.5%~約5%、さらに好ましくは約1%~約5%のデヒドロ酢酸またはそれらの皮膚科学的に許容可能な塩、誘導体、または互変異性体を含むてもよい。

【0135】

ヘキサンジオール

50

本発明の組成物は、有効量のヘキサンジオール、その異性体類、互変異性体類、塩類および誘導体類を含んでよい。本明細書に用いるのに好適なヘキサンジオールのいくつかの学名としては、1,6-ジヒドロキシヘキサン、1,6-ヘキサンジオール、ヘキサメチレンジオール、ヘキサメチレングリコール、および1,2-ヘキサンジオールが挙げられる。

【0136】

本発明の組成物は、約0.0001%~約50%、あるいは約0.001%~約10%、あるいは約0.01%~約5%、あるいは約0.1%~約2%のヘキサンジオールを含んでもよい。

【0137】

抗ニキビ活性物質

本発明の組成物は1つ以上の抗ニキビ活性物質を安全且つ有効な量で含有してもよい。有用な抗ニキビ活性物質の例としては、レゾルシノール、イオウ、サリチル酸、過酸化ベンゾイル、エリスロマイシン、亜鉛などが挙げられる。

【0138】

- ヒドロキシ酸

油溶性 - ヒドロキシ酸の非限定例としては、サリチル酸およびその誘導体、例えばオクタノイル誘導体が挙げられる。 - ヒドロキシ酸は、抗ニキビおよび老化防止効果を提供することが知られている。

【0139】

キレート化剤

本明細書で使用する時、「キレート剤」または「キレート化剤」とは、金属イオンが容易に化学反応に加わったり、化学反応を触媒したりしないように、錯体を形成することによって系から金属イオンを除くことができる活性物質を意味する。キレート化剤を含むことは、過剰な鱗屑または皮膚組織変化の一因となるような紫外線照射から、また皮膚の損傷を起し得るようなその他の環境化学物質から、保護するためにとりわけ有用である。主題発明の組成物に有用な好ましい油溶性キレート剤は、フリルジオキシム、フリルモノオキシム、およびこれらの誘導体である。

【0140】

フラボノイド

フラボノイド化合物は、米国特許第5,686,082号および第5,686,367号に広く開示されている。本明細書で有用なフラボノイドの非限定的な例は、イソフラボン；非置換フラバノン、モノ-置換フラバノン、およびこれらの混合物から成る群から選択されるフラバノン；非置換カルコン、モノ-置換カルコン、ジ-置換カルコン、トリ-置換カルコン、およびこれらの混合物から成る群から選択されるカルコン；非置換フラボン、モノ-置換フラボン、ジ-置換フラボン、およびこれらの混合物から成る群から選択されるフラボン；1つ以上のイソフラボン；非置換クマリン、モノ-置換クマリン、ジ-置換クマリン、およびこれらの混合物から成る群から選択されるクマリン；非置換クロモン、モノ-置換クロモン、ジ-置換クロモン、およびこれらの混合物から成る群から選択されるクロモン；1つ以上のジクマロール；1つ以上のクロマノン；1つ以上のクロマノール；これらの異性体（例えば、シス/トランス異性体）；並びにこれらの混合物が挙げられる。本明細書で使用する時、用語「置換」フラボノイド類とは、フラボノイドの1つ以上の水素原子が、独立して、ヒドロキシル、C1~C8アルキル、またはC1~C4アルコキシルで置き換えられたものを意味する。また、上記フラボノイド化合物の混合物も使用してよい。

【0141】

大豆イソフラボンなどの植物由来のイソフラボンは、本明細書で特に有用である。本明細書で特に有用な種類のフラボノイドは、好ましくはグルコシルヘスペリジン、グルコシルルチン、グルコシルミリシトリン、グルコシルイソケルシトリン、グルコシルクエルシトリン、メチルヘスペリジン、およびこれらの混合物から成る群から選択されるグリコシ

10

20

30

40

50

ドフラボノイドである。市販のグリコシドフラボノイドとしては、アルプス薬品工業 (Alps Pharmaceutical Industry Co. Ltd.) (日本) から入手可能なヘスペリジン、メチルヘスペリジン、およびルチン、および林原生物化学研究所 (Hayashibara Biochemical Laboratories, Inc.) (日本) から入手可能なグルコシルヘスペリジンおよびグリコシルルチンが挙げられる。

【0142】

抗炎症剤

抗炎症剤を安全且つ有効な量で本発明の組成物に添加してもよく、好ましくは組成物の約0.1%~約10%、より好ましくは約0.5%~約5%である。抗炎症剤は、本発明の皮膚の外観に関する効果を向上させ、例えば、かかる剤は、より均一に且つより満足のいく皮膚の色合いまたは色に寄与する。組成物中で使用されるべき抗炎症剤の的確な量は、かかる剤の効力が広範にわたるので、利用される特定の抗炎症剤に左右される。

10

【0143】

ステロイド性抗炎症剤は本明細書に用いるのに好適であり、非限定的な例としてヒドロコルチゾンが挙げられる。非ステロイド性抗炎症剤も本明細書に用いるのに好適であり、非限定的な例としてイブプロフェン、ナプロキセン、フルフェナム酸、エトフェナマート (etofenamate)、アスピリン、メフェナム酸、メクロフェナム酸、ピロキシカム、およびフェルピナクが挙げられる。これらの群に含まれる様々な化合物が当業者に周知である。非ステロイド性抗炎症剤の混合物と同様に、これらの薬剤の皮膚科学的に許容可能な塩およびエステルもまた使用してよい。

20

【0144】

「天然」の抗炎症剤も本発明で有用である。このような抗炎症剤は、天然原料 (例えば、植物、真菌、微生物の副生成物) から適した物理的および/または化学的単離による抽出物として好適に得ることができ、あるいは合成して調製することができる。例えば、キャンデリラワックス、ピサボロール (例えば、 β -ピサボロール)、アロエベラ、植物ステロール (例えば、フィトステロール)、マンジスタ (Manjistha) (アカネ科アカネ属 (Rubia) の植物、特にルピア・コルディフォリア (Rubia Cordifolia) から抽出)、およびググル (Guggal) (コミフォラ (Commiphora) 属の植物、特にコミフォラ・ムクル (Commiphora Mukul) から抽出)、コラ抽出物、カモミール、ムラサキツメクサ抽出物、およびムチサンゴ抽出物を使用してもよい。

30

【0145】

抗セルライト剤

本発明の組成物は抗セルライト剤を安全且つ有効な量で含有してもよい。好適な剤としては、キサンチン化合物 (例えば、カフェイン、テオフィリン、テオプロミン、およびアミノフィリン) を挙げることができるが、それらに限定されない。

【0146】

局所麻酔剤

本発明の組成物は局所麻酔剤を安全且つ有効な量で含有してもよい。局所麻酔剤の例としては、ベンゾカイン、リドカイン、プピバカイン、クロルプロカイン、ジブカイン、エチドカイン、メピバカイン、テトラカイン、ジクロニン、ヘキシルカイン、プロカイン、コカイン、ケタミン、プラモキシシ、フェノール、および製薬上許容できるこれらの塩が挙げられる。

40

【0147】

落屑活性物質

本発明の組成物には、安全且つ有効量の、好ましくは当該組成物の約0.1重量%~約10重量%、より好ましくは約0.2重量%~約5重量%、さらに好ましくは約0.5重量%~約4重量%の落屑活性物質を添加してよい。落屑活性物質類は、本発明の皮膚の外見に関する効果を増強する。例えば、落屑活性物質類は、皮膚のきめ (例えば、滑らかさ) を改善する傾向がある。本明細書で使用するのに適した落屑システムの1つは、スルフヒドリル化合物および双極性界面活性剤を含有し、米国特許第5,681,852号 (ピ

50

セット (Bissett)) に記載されており、その特許を本明細書に参考として組み込む。本明細書で使用するのに適した他の落屑システムは、サリチル酸および双イオン性界面活性剤を含有し、米国特許第 5,652,228 号 (ビセット (Bissett)) に記載されており、その特許を本明細書に参考として組み込む。これらの特許出願に記載されているような双極性界面活性剤類もまた、本明細書において落屑剤類として有用であり、セチルベタインが特に好ましい。

【 0 1 4 8 】

酸化防止剤 / ラジカルスカベンジャー

本発明の組成物は、安全且つ有効な量の酸化防止剤 / ラジカルスカベンジャーを含んでもよい。酸化防止剤 / ラジカルスカベンジャーは、角質層における鱗屑またはきめの増加の増加を引き起こし得る紫外線からの保護、および皮膚の損傷を起こし得るその他の環境化学物質からの保護に特に有用である。

10

【 0 1 4 9 】

安全且つ有効な量の酸化防止剤 / ラジカルスカベンジャーは、本発明の組成物に、好ましくは組成物の約 0.1 重量% ~ 約 10 重量%、より好ましくは約 0.1 重量% ~ 約 5 重量% で添加してもよい。

【 0 1 5 0 】

酸化防止剤 / ラジカルスカベンジャーとしては、アスコルビン酸 (ビタミン C) およびその塩、脂肪酸のアスコルビルエステル、アスコルビン酸誘導体 (例えば、アスコルビルリン酸マグネシウム、アスコルビルリン酸ナトリウム、ソルビン酸アスコルビル)、トコフェロール (ビタミン E)、ソルビン酸トコフェロール、酢酸トコフェロール、その他のトコフェロールエステル、ブチル化ヒドロキシ安息香酸およびその塩、BHT、6-ヒドロキシ-2,5,7,8-テトラメチルクロマン-2-カルボン酸 (商品名トロロックス (Trolox) (商標登録) で市販されている)、没食子酸およびそのアルキルエステル、とりわけ没食子酸プロピル、尿酸およびその塩およびアルキルエステル、ソルビン酸およびその塩、リポ酸、アミン (例えば、N,N-ジエチルヒドロキシルアミン、アミノ-グアニジン)、スルフヒドリル化合物 (例えば、グルタチオン)、ジヒドロキシフマル酸およびその塩、リシンピドレート、アルギニンピドレート、ノルジヒドログアヤレット酸、バイオフラボノイド、クルクミン、リジン、メチオニン、プロリン、スーパーオキシドジスムターゼ、シリマリン、茶抽出物、ブドウの皮 / 種の抽出物、メラニン、およびローズマリー抽出物などを用いてもよい。好ましい酸化防止剤 / ラジカルスカベンジャーは、酢酸トコフェロールおよびトコフェロールのその他のエステルから選択され、より好ましくは酢酸トコフェロールである。局所適用組成物および本発明に適用できるものにおけるソルビン酸トコフェロールの使用については、ドナルド・L・ビセット (Donald L. Bissett)、ロドニー・D・ブッシュ (Rodney D. Bush) およびランジット・シャテジー (Ranjit Chatterjee) に 1989 年 7 月 11 日に発行された米国特許第 4,847,071 号に記載されている。

20

30

【 0 1 5 1 】

日焼け剤

本発明の組成物は日焼け活性物質を含有してもよい。存在する場合、組成物は、組成物の約 0.1 重量% ~ 約 20 重量%、より好ましくは約 2 重量% ~ 約 7 重量%、さらに好ましくは約 3 重量% ~ 約 6 重量% のジヒドロキシアセトン的人工の日焼け活性物質として含むのが好ましい。

40

【 0 1 5 2 】

ジヒドロキシアセトンは、DHA または 1,3-ジヒドロキシ-2-プロパノンとしても知られ、白色から灰白色の結晶性粉末である。この物質は $C_3H_6O_3$ の化学式で表すことができる。

【 0 1 5 3 】

皮膚鎮静および皮膚回復活性物質

本発明の組成物は皮膚鎮静または皮膚回復活性物質を含んでもよい。本明細書の使用に

50

適した皮膚鎮静または皮膚回復活性物質としては、パンテノール酸誘導体（パンテノール、デクスパンテノール、エチルパンテノールを含む）、アロエベラ、アラントイン、ピサボロール、およびグリチルリチン酸二カリウムが挙げられる。本組成物に、安全且つ有効な量の皮膚鎮静剤および皮膚回復剤を、生成する組成物の好ましくは約0.001重量%～約30重量%、より好ましくは約0.01重量%～約20重量%、さらに好ましくは約0.01重量%～約10重量%加えることができる。

【0154】

抗菌活性物質および抗カビ活性物質

本発明の組成物は、抗菌または抗カビ活性物質を含有してもよい。このような活性物質は、微生物を破壊することができ、微生物の発達を阻止することができ、または微生物の病原作用を予防することができ、当業者に公知である。安全且つ有効な量の抗菌または抗カビ活性物質を、本発明の組成物に、好ましくは約0.001%～約10%、より好ましくは約0.01%～約5%、さらにより好ましくは約0.05%～約2%加えてもよい。

10

【0155】

油溶性活性物質の溶媒

日焼け止め、美白、酸化防止などの目的で油溶性活性物質を使用する場合、油溶性活性物質の効果を保証するため、溶媒としてエステルを使用してもよい。種々の好適なエステル化合物が公知であり、本明細書で使用可能である。多数の例が「国際化粧品成分辞典およびハンドブック（International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook）、第11版、2004年」に記載されている。好適なエステルの例には、イソプロピルラウロイルサルコシネート（味の素（Ajinomoto）から入手可能なエルデュー（Eldew）SL205）などのアミノ酸およびC2～C8アルコールのエステル、並びにフェネチルベンゾエート（インターナショナル・スペシャルティ・プロダクツ（International Specialty Products）から入手可能なエクステンド（X-tend）226）などの安息香酸およびC2～C8アルコールのエステルが挙げられる。使用する溶媒の濃度は含有する油溶性活性物質の種類と量によって異なるが、当業者には容易に判断できるであろう。

20

【0156】

その他の任意成分

種々の追加成分を本発明の組成物に組み入れることができる。これら追加成分の非限定的な例には、着色剤、染料、顔料；精油、芳香剤、皮膚感覚剤、乳白剤、芳香族化合物（例えば、丁子油、メントール、カンファー、ユーカリ油、およびオイゲノール）などの美容目的に好適な成分；防腐剤（例えば、パラヒドロキシ安息香酸のアルキルエステル、ヒダントイン誘導体（1,3-ビス（ヒドロキシメチル）-5,5-ジメチルヒダントインなど）、プロピオン酸塩、および種々の第四級アンモニウム化合物（塩化ベンザルコニウム、クオタニウム15 [ダウシル200]、塩化ベンゼトニウム、および塩化メチルベンゼトニウムなど））が挙げられる。特に好ましい防腐剤は、EDTA二ナトリウム、フェノキシエタノール、エチルパラベン、メチルパラベン、プロピルパラベン、イミダゾリジニル尿素（Germa11 1175として市販されているもの）、デヒドロ酢酸ナトリウム、ベンジルアルコール、および安息香酸ナトリウムである。

30

【0157】

組成物の調製

本発明の方法に有用な組成物は一般に、局所用組成物を調製する場合に当業界において既知であるような従来の方法によって調製する。このような方法は、通常、加熱、冷却、真空の適用などを用いてまたは用いずに、成分を1つ以上の工程で混合して比較的均一な状態にするものである。

40

【0158】

本発明の局所適用組成物は、顔用スキン化粧品、眼用化粧品、口唇用化粧品、頭毛スタイリング補助剤、顔毛スタイリング補助剤、保湿剤、しわ緩和美容液、ローション、マスク、顔用スキンマスク、スキンローション、スキンクリーム、スキングェル、眼用ジェル、眼用クリーム、口唇用ジェル、口唇用クリーム、化粧用ファンデーション、またはそ

50

の他いずれかの周知の皮膚用製品または処理剤に処方されてもよい。

【 0 1 5 9 】

使用方法

本出願人らは、本発明の組成物が、哺乳類の皮膚の機能強化を指向する種々の適用に有用であることを見出した。本明細書で開示され、特許請求の範囲に記載される組成物の使用方法には、1)皮膚に対する化粧品の持続性を高める方法、2)皮膚を加湿する方法、3)皮膚の自然な外観を改善する方法、4)皮膚に有色化粧品を適用する方法、5)皺を防ぎ、その発生を遅らせ、および/またはそれを処置する方法、6)皮膚にUV防護を提供する方法、7)油っぽい外観を防ぎ、その発生を遅らせ、および/またはそれを制御する方法、8)皮膚の感触およびキメを修正する方法、9)均一な皮膚の色調を提供する方法、10)クモ状血管および拡張蛇行静脈の出現を防ぎ、遅らせ、および/または処置する方法、11)皮膚上のうぶ毛の外観を覆い隠す方法、12)ざ瘡、加齢斑、ソバカス、黒子、癬痕、目の下のくま、母斑、炎症後の色素沈着過度などを含めたヒトの皮膚における欠点および/または不完全さを隠す方法などが挙げられるが、これらに限定されない。本明細書で取り上げた各方法には、請求された組成物を皮膚に局所的に適用することが含まれている。

10

【実施例】

【 0 1 6 0 】

以下の実施例は、本発明の範囲内にある実施形態を更に説明および実証する。これら実施例は、説明の目的のためのみに提示するものであって、本発明の精神および範囲から逸脱することなく、多くの変更が可能であるので、本発明を限定するものと解釈すべきではない。

20

【 0 1 6 1 】

油中水型エマルジョンのスキンケア製品は、以下の構成成分から従来の方法により調製される。

【 0 1 6 2 】

【表 1 - 1】

(表 1)

実施例 (質量%に おける値)	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13
A相													
ジメチコン *1	4.0	4.0	6.0	3.0	4.0	4.0	5.0	7.5	4.0	4.09	4.0	4.0	4.0
ポリメチル シルセスキオキサン *2	4.0	4.0	6.0	-	4.0	4.0	-	-	-	4.09	4.0	4.0	4.0
DC9040 *3	3.0	3.0	4.5	-	-	3.0	-	-	-	8.6	3.0	15.0	3.0
DC9045 *4	-	-	-	-	3.0	-	-	-	-	-	-	-	-
KSG-15 *5	-	-	-	2.5	-	-	2.7	2.7	2.7	-	-	-	-
シクロペンタ シロキサン *6	3.0	3.0	6.0	-	3.0	3.0	5.0	7.5	4.0	11.43	7.0	6.0	3.0
KSG-210 *7	2.5	5.0	4.0	5.0	2.75	2.75	2.3	2.3	2.3	5.37	2.75	2.75	2.75
KF-6028 *8	-	-	0.15	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
KF-6017 *9	-	-	-	0.3	-	-	-	-	-	-	-	-	-
KF-6104 *10	-	-	-	-	-	-	-	-	0.5	-	-	-	-
カバーリーフ (Cover Leaf) AR-80 5% KF-9901 *11	-	-	5.0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
KSG-18 *12	-	-	-	1.5	-	-	-	-	-	-	-	-	-
DC-2503 *13	-	-	-	-	-	-	-	-	-	7.08	-	1.5	-
イソステアリン酸 イソプロピル	-	-	-	2.2	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ジーネット (Jeenate) 3H *14	-	-	-	-	-	-	-	-	-	3.54	-	-	-
TiO ₂ 分散液 *15	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0.7	-	-	-
ペトラタム	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0.5	-
セチル リシノレエート	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0.5	-
SEFAコットネット (Cottonate) *16	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0.5	-
芳香剤	0.1	0.1	0.1	-	-	-	-	-	-	0.1	-	0.2	0.1

30

40

【 0 1 6 3 】

【表 1 - 2】

(表 1 の続き)

実施例 (質量%に おける値)	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13
B相													
グリセリン、USP	10.0	10.0	30.0	5.0	7.0	10.0	—	—	—	10.0	10.0	10.0	10.0
ナイアシンアミド	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	4.0	4.0	4.0	5.0	5.0	5.0	5.0
エラストブ (Elastab) HP100 * 17	—	—	—	—	0.1	0.1	—	—	—	—	—	—	—
ベンチレン グリコール	2.0	2.0	2.0	3.0	—	3.0	2.0	2.0	2.0	3.0	—	3.0	3.0
1,2-ヘキササン ジオール	—	—	—	—	3.0	—	—	—	—	—	3.0	—	—
塩化ナトリウム	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
バンテノール	0.5	0.5	0.5	—	1.0	1.0	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
N-アセチル グルコサミン	—	2.0	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
プロマトリキシル (Promatrixyl) (登録商標) * 18	—	—	0.353	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
メチルパラベン	0.2	0.2	0.2	0.2	—	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
クエン酸ナトリウム	0.2	0.2	0.2	0.2	—	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
クエン酸	0.03	0.03	0.03	—	—	0.03	0.015	0.015	0.015	0.03	0.03	0.03	0.03
安息香酸ナトリウム	0.07	0.07	0.07	0.07	—	0.07	0.07	0.07	0.07	0.07	0.05	0.05	0.07
エチルパラベン	0.05	0.05	0.05	0.05	—	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05
ベンジルアルコール	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—	—
グリダントプラス (Glydant Plus) * 19	—	—	—	—	0.3	—	—	—	—	—	—	—	—
EDTA二ナトリウム	—	—	—	0.1	—	0.1	0.1	0.1	0.1	—	—	—	—
アスコルビル グルコシド	—	—	—	2.0	—	—	—	—	—	—	—	—	—
L-アルギニン	—	—	—	1.02	—	—	—	—	—	—	—	—	—
ヘキサミン ジセチレート (Hexamine Diisethanoate)	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.1	0.1	0.1	0.1
水	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量	100までの 適量

10

20

30

40

50

1. 例えば、KF96A(6cs)。シンエツ(Shin-Etsu)(日本、東京)から入手可能。

2. 例えば、トスパール(Tospearl)145A、CF600、または2000。GEアドバンスド・マテリアルズ(GE Advanced Materials)(コネティカット州ウィルトン)から入手可能。

3. 12.5%ジメチコンクロスポリマーのシクロペンタシロキサン溶液。ダウ・コーニング(Dow Corning)(ミシガン州ミッドランド)から入手可能。

4. 12.5%ジメチコンのシクロペンタシロキサン溶液。ダウ・コーニング(Dow Corning)(ミシガン州ミッドランド)から入手可能。

5. 5%ジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマーのジメチコン溶液。シンエツ(Shin-Etsu)(日本、東京)から入手可能。

6. 例えば、GEアドバンスドマテリアルズ(GE Advanced Materials)(コネティカット州ウィルトン)から入手可能なSF-1202、ダウ・コーニング(Dow Corning)(ミシガン州ミッドランド)から入手可能なSH245。

7. 25%ジメチコンPEG-10/15クロスポリマーのジメチコン溶液。シンエツ(Shin-Etsu)(日本、東京)から入手可能。

8. PEG-9ポリジメチルシロキシエチルジメチコン。シンエツ(Shin-Etsu)(日本、東京)から入手可能。

9. PEG-10ジメチコン。シンエツ(Shin-Etsu)(日本、東京)から入手可能。

10. 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。シンエツ(Shin-Etsu)(日本、東京)から入手可能。

11. ジメチコン/メチコンコポリマーの表面コーティングを有するシリカ、アルミナ、二酸化チタン、タルク。触媒化成工業株式会社(Catalysts & Chemicals Ind. Co. Ltd.)(日本、川崎)から入手可能。

12. 25%ジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマーのジメチコン溶液。シンエツ(Shin-Etsu)(日本、東京)から入手可能。

13. ステアリルジメチコンワックス。ダウ・コーニング (Dow Corning) (ミシガン州ミッドランド) から入手可能。

14. ポリエチレン。ジーン・インターナショナル社 (Jeen Int'l Corp.) (ニュージャージー州フェアフィールド) から入手可能。

15. 疎水変性 TiO₂ 分散液。コボ・プロダクツ社 (Kobo Products, Inc.) (ニュージャージー州サウスプレーンフィールド) から入手可能。

16. プロクター & ギャンブル・ケミカルズ (Procter & Gamble Chemicals) (オハイオ州シンシナティ) から入手可能。

17. ヘキサミジンジイセチオネート。ラボラトリーズ・セロバイオロジクス (Laboratoires Serobiologiques) (フランス、パリ) から入手可能。

18. 0.085% パルミトイルペンタペプチド - 3 の水溶液。セダーマ (Sederma) (ニュージャージー州エジソン) から入手可能。

19. DMDMヒダントイン、ヨードプロピニルブチルカルバメート、1,3-ブチレングリコールの水溶液。ロンザ社 (Lonza Inc.) (スイス、バーゼル) から入手可能。

【0164】

別個の好適な容器に A 相および B 相の成分を加え、好適なミキサー (例えば、アンカーブレード、プロペラブレード、I K A T 2 5) を使用して各相を混合する。各相が均一になったら、A 相を好適なミキサー (例えば、アンカーブレード、プロペラブレード、I K A T 2 5) でミリングしながら、B 相をゆっくり A 相に加える。バッチが均一になるまでミリングを続ける。生成物を好適な容器に移す。

【0165】

試験方法

顕微鏡法 - サンプル組成物中の水性領域の存在および大きさを、顕微鏡を使用して視覚的に分析する方法である。この方法では、微分干渉コントラスト機能および交差偏光機能を有し、光学剪断ステージを備えた、標準的な光学顕微鏡を使用する。任意選択的に、低投光性のサンプル組成物に、あるいは水性領域の特徴を調べるために、交差偏光を使用してもよい。交差偏光技術を使用した場合、得られた画像で水性領域は暗く見えるであろう。好適な構成には、MTI 3 CCD カメラ (D A G E - M T I (インディアナ州ミシガンシティー) から入手可能) を備えたツァイス・アキシオプラン (Zeiss Axioplan) 2 顕微鏡 (カール・ツァイス社 (Carl Zeiss, Inc) (ニューヨーク州ソーンウッド) から入手可能) が挙げられる。画像はメタモルフ (Metamorph) ソフトウェア 6.1 バージョン (モレキュラー・デバイス社 (Molecular Devices Corporation) (カリフォルニア州サンニール) から入手可能) を使用して取得し、液滴直径を測定して、得られた画像を保存する。顕微鏡は C S S 4 5 0 光学剪断ステージ (リンクカム・サイエンティフィック・インストルメンツ (Linkam Scientific Instruments) (英国、サリー) から入手可能) を備える。顕微鏡は 500 倍の倍率を与えるように構成する。エマルション (「サンプル」) 約 1.5 g を、剪断を最小限に抑えるように、慎重に剪断ステージに乗せる。剪断システムは、ギャップ幅が 1 mm、一定剪断速度が 16 s⁻¹ の固定モードに設定する。温度は約 25 の一定温度に維持する。最初に剪断ステージで剪断を開始する前にサンプルの顕微鏡写真を取得する。サンプルの平均水性液滴直径は約 3 μm 以下である必要がある。サンプルの平均水性液滴直径が 3 μm より大きい場合、顕微鏡では適切にサンプルの特徴を調べられない場合があるが、ミリング法またはレオロジー法ではサンプルの特徴を調べることができる。サンプルを 15 秒間剪断し、剪断を中断して、顕微鏡写真を取得する。これを 3 回繰り返し (例えば、サンプルを累積で 60 秒間剪断し)、5 枚の顕微鏡写真を得る (例えば、0、15、30、45、および 60 秒の時点で写真を得る)。サンプルの可視の水性領域を分析し、それぞれの可視水性領域の最大直線寸法を調べる。皮膚適用時に放出のない組成物では、このような条件にさらされても水性液滴直径に顕著な変化を示さない。各エマルションにつき 3 つのサンプルを試験する。

【0166】

顕微鏡法に従って試験した選択例の顕微鏡写真を図 1 A ~ B、図 2 A ~ C、図 3 A ~ C

10

20

30

40

50

に示す。顕微鏡写真に示す値は、水性領域のおよその最大寸法 (μm 単位) である。図 1 A ~ B は、それぞれ 0 秒および 15 秒に撮影した実施例 13 の顕微鏡写真である。図 1 B は、切断 15 秒後の水性領域約 $74.05 \mu\text{m}$ を示す。図 2 A ~ C は、それぞれ 0 秒、15 秒、および 60 秒に撮影した実施例 12 の顕微鏡写真である。図 2 C は、切断 60 秒後の水性領域約 $56.04 \mu\text{m}$ を示す。図 3 A ~ C は、それぞれ 0 秒、15 秒、および 60 秒に撮影した比較例 (プロクター & ギャンブル社 (Procter & Gamble Company) から市販されているリジェネリスト・デイリー・リジェネレイティング・セラム (Regenerist Daily Regenerating Serum)) の顕微鏡写真である。図 3 C は、顕微鏡の熟練使用者には容易に判断されるシリコンエラストマー領域を示すが、 $10 \mu\text{m}$ より大きな水性領域は存在しない。

10

【0167】

ミリング法 - (裸眼で) 可視の相分離を生じるように、サンプルエマルジョン (「サンプル」) をバルクミリングする。ミリング法は、IKA ワークス (IKA Works) (ノースカロライナ州ウィルミントン) から入手可能な S25KR-18G 分散体を備えたウルトラ・タラックス (Ultra Turrax) T25 ミキサーを使用し、50 mL ビーカー内でサンプル 30 g をバルクミリングする。本法は約 25°C の温度で実施する。サンプルを約 13500 rpm (約 30000 s^{-1} の切断速度に相当) または約 24000 rpm (約 53000 s^{-1} の切断速度に相当) のいずれかの速度で約 1 分間ミリングする。1 分間のミリング中、ビーカーを手でミキサーの回転軸に平行にゆっくり動かしてもよい (すなわち約 1 Hz 未満の往復運動)。任意選択的に、サンプルを 8000 rpm (約 18000 s^{-1} の切断速度に相当) の速度でミリングしてもよい。ミリング終了後、5 分以内に相分離を目視で観察する。標準的な分離技術を用いて水相をビーカーから取り出す。分離した水相の重量を測定する。本法をさらに 2 つのサンプルで繰り返し、重量の平均値を得る。

20

【0168】

ミリング法に従って試験した選択例では、次の水分放出を示した。

【0169】

【表 2】

	比較例 *	実施例7	実施例8	実施例9
8000rpm	0.0g	2.35g	0.0g	0.0g
13500rpm	0.0g	13.68g	5.22g	0.43g
24000rpm	0.0g	18.39g	15.05g	5.68g

30

* 比較例はプロクター & ギャンブル社 (Procter & Gamble Company) から入手可能な市販のリジェネリスト・デイリー・リジェネレイティング・セラム (Regenerist Daily Regenerating Serum) である。

【0170】

レオロジー法 - エマルジョン (「サンプル」) のレオロジー特性を提供する。サンプルの評価には、データ記録および分析を提供するソフトウェアを有するコンピュータを接続した、TA インストルメンツ (TA Instruments) (デラウェア州ニューカッスル) から入手可能な AR2000 レオメーターを使用する。レオメーターは、ギャップ設定が $1000 \mu\text{m}$ 、温度が 25°C 、制御応力モードで 4 cm の平面プレートを使用するよう構成する。また、レオメーターは、3 分間の持続時間で応力を $1 \text{ Pa} \sim 1000 \text{ Pa}$ まで増加し、十進毎に 10 ポイントの割合でサンプリングするよう構成する。レオロジー特性は、 x 軸に \log_{10} の切断応力 (Pa)、 y 軸に \log_{10} の粘度 ($\text{Pa} \cdot \text{s}$) を使用してプロットする。水分放出性のサンプルは、臨界の切断応力で急激な粘度の低下を示す。この粘度の低下は、ほぼ一定の高い粘度を有する領域とほぼ一定の低い粘度を有する領域との間でプロットの傾きとして測定することができる。傾きは、 $[(\log \text{粘度}(t_2)) - \log \text{粘度}(t_1)] / [(\log \text{切断応力}(t_2)) - \log \text{切断応力}(t_1)]$ の式に従って計算される。式中、粘度 (t_1) および粘度 (t_2) は、2 つの領域間で粘度値が 10 倍 (対数目盛りでは 1.0 の変化) 低下する前後の粘度の読み取り値であり、切断応力 (t_1

40

50

）および剪断応力（ t_2 ）は、対応する剪断応力の読み取り値である。粘度が緩やかに低下し、2つの読み取り値間で10倍を越す粘度の急激な低下が生じない場合、傾きの計算にプロット上の任意の代表的な読み取り値を使用してもよい。粘度の急激な低下は、サンプルからの水分の放出を示すと考えられる。

【0171】

レオロジー法に従って試験した選択例のデータから得られたグラフを図4～7に示す。図4は、実施例12から得られたグラフである。図4は、剪断応力約1.8（log）のデータポイント間で急激な粘度の低下（例えば、傾きが約-106）を示す。図5は、実施例11から得られたグラフである。図5は、剪断応力約0.8（log）のデータポイント間で粘度の低下（例えば、傾きが約-14.7）を示す。図6は、実施例10から得られたグラフである。図6は、剪断応力約1.7（log）のデータポイント間で粘度の低下（例えば、傾きが約-12）を示す。図7は、比較例（プロクター&ギャンブル社（Procter & Gamble Company）から入手可能な市販のリジェネリスト・デイリー・リジェネレイティング・セラム（Regenerist Daily Regenerating Serum））の試験から得られたグラフである。比較例の粘度のポイント間の最大落差は約-3.4である。

10

【0172】

前述した本発明の実施例および実施形態の詳細な記述は、単に説明のために与えるものにすぎず、本発明の精神および範囲から逸脱することなく多数の修正および変更が当業者には明らかになることが理解される；そのような明らかな修正および変更は、添付の特許請求の範囲に含まれるものとする。

20

【0173】

本明細書に開示した寸法および値は、列挙した正確な数値に厳しく制限されるものとして理解すべきではない。それよりむしろ、特に指定されない限り、各こうした寸法は、列挙された値とその値周辺の機能的に同等の範囲の両方を意味することを意図する。例えば、「40mm」として開示された寸法は、「約40mm」を意味することを意図する。

【0174】

「発明を実施するための最良の形態」で引用したすべての文献は、関連部分において本明細書に参考として組み込まれるが、いずれの文献の引用も、それが本発明に対する先行技術であることを容認するものと解釈されるべきではない。この文書における用語のいずれかの意味または定義が、参考として組み込まれる文献における用語のいずれかの意味または定義と対立する範囲については、本文書におけるその用語に与えられた意味または定義を適用するものとする。

30

【0175】

本発明の特定の実施形態を説明記述してきたが、本発明の精神範囲から逸脱することなく他の様々な変更修正を行えることが当業者には明白であろう。したがって、本発明の範囲内にあるそのような全ての変更修正を、添付の特許請求の範囲で扱うものとする。

【図面の簡単な説明】

【0176】

【図1A】本発明の好適な実施形態の顕微鏡写真。

【図1B】本発明の好適な実施形態の顕微鏡写真。

40

【図2A】本発明の好適な実施形態の顕微鏡写真。

【図2B】本発明の好適な実施形態の顕微鏡写真。

【図2C】本発明の好適な実施形態の顕微鏡写真。

【図3A】比較例の顕微鏡写真。

【図3B】比較例の顕微鏡写真。

【図3C】比較例の顕微鏡写真。

【図4】本発明の3つの好適な実施形態のlog剪断応力（x軸）対log粘度（y軸）のプロット。

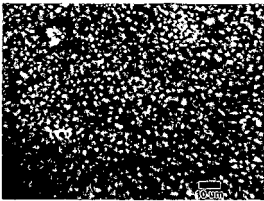
【図5】本発明の3つの好適な実施形態のlog剪断応力（x軸）対log粘度（y軸）のプロット。

50

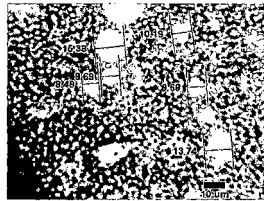
【図6】本発明の3つの好適な実施形態のlog 剪断応力 (x軸) 対 log 粘度 (y軸) のプロット。

【図7】比較例のlog 剪断応力 (x軸) 対 log 粘度 (y軸) のプロット。

【図1A】



【図2B】



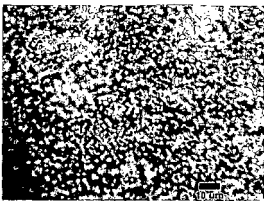
【図1B】



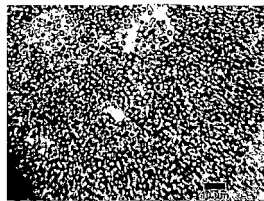
【図2C】



【図2A】



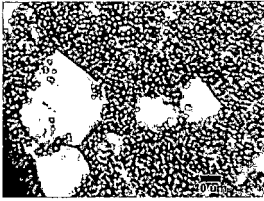
【図3A】



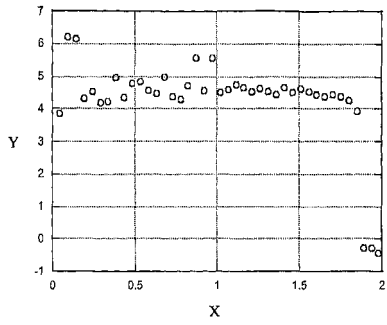
【 図 3 B 】



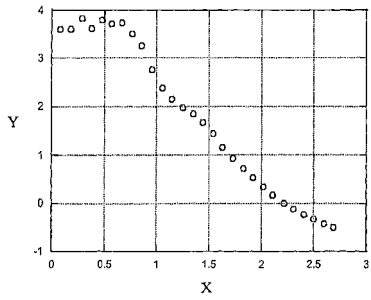
【 図 3 C 】



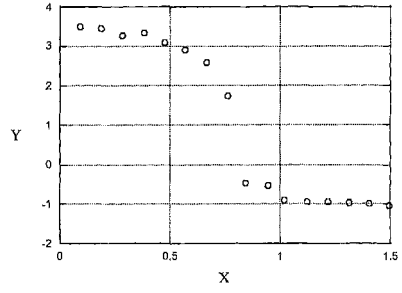
【 図 4 】



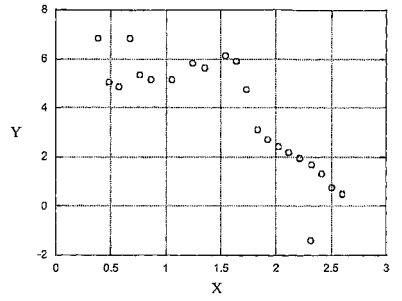
【 図 7 】



【 図 5 】



【 図 6 】



【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No PCT/US2006/045657
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. A61Q19/00 A61K8/06 A61K8/91		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A61K A61Q		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, BIOSIS, EMBASE		
G. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 2004/091440 A1 (KAMEI MASANAO [JP] ET AL) 13 May 2004 (2004-05-13) example 36	1-13
X	EP 1 426 027 A1 (SHINETSU CHEMICAL CO [JP]; SAKUTA KOJI [JP]) 9 June 2004 (2004-06-09) paragraphs [0001], [0006], [0007]; examples 11,13,14,18	1-13
X	EP 1 481 660 A (SHINETSU CHEMICAL CO [JP]) 1 December 2004 (2004-12-01) example 39	1-13
X	EP 1 496 080 A (SHINETSU CHEMICAL CO [JP]) 12 January 2005 (2005-01-12) examples 42,45,48,63	1-13
	-/--	
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box G.		<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
* Special categories of cited documents : *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. *Z* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 15 March 2007		Date of mailing of the international search report 16/04/2007
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 époni, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer KRATTINGER, B

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2006/045657

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 1 550 687 A1 (SHINETSU CHEMICAL CO [JP]) 6 July 2005 (2005-07-06) paragraph [0013]; examples 8,10,14,17,23,28,35	1-3
X	WO 2004/110393 A (SHINETSU CHEMICAL CO [JP]; ICHINOHE SHOJI [JP]) 23 December 2004 (2004-12-23) examples 4,9 & EP 1 632 213 A (SHINETSU CHEMICAL CO. [JP]) 8 March 2006 (2006-03-08)	1-13
X	"Product Brochure KSG Series" 2004, SHIN ETSU, XP002424955 page 1 - page 3 page 7 page 10	1-13
X	"Product Brochure KSP series" 2004, SHIN ETSU, XP002424956 page 1	1-13
X	DATABASE WPI Week 200520 Derwent Publications Ltd., London, GB; AN 2005-186487 XP002425006 & JP 2005 041809 A (NONOGAWA SHOJI KK) 17 February 2005 (2005-02-17) paragraph 20 abstract	1-13
X	DATABASE WPI Week 200503 Derwent Publications Ltd., London, GB; AN 2005-023270 XP002425007 & JP 2004 339106 A (FUKAZAWA T) 2 December 2004 (2004-12-02) paragraphs 70-71; 76-81 abstract	1-13
X	DATABASE WPI Week 200281 Derwent Publications Ltd., London, GB; AN 2002-743923 XP002425018 & JP 2002 193754 A (KOSE KK) 10 July 2002 (2002-07-10) paragraphs 27-28 / ex. 1-4, 7-10; abstract	1-13

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2006/045657

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date	
US 2004091440	A1	13-05-2004	EP 1424373 A2 JP 2004155978 A	02-06-2004 03-06-2004
EP 1426027	A1	09-06-2004	WO 03024413 A1 US 2004234477 A1	27-03-2003 25-11-2004
EP 1481660	A	01-12-2004	JP 2004346046 A US 2004241126 A1	09-12-2004 02-12-2004
EP 1496080	A	12-01-2005	JP 2005042097 A US 2005008600 A1	17-02-2005 13-01-2005
EP 1550687	A1	06-07-2005	WO 2004024798 A1 KR 20050042199 A US 2006034875 A1	25-03-2004 04-05-2005 16-02-2006
WO 2004110393	A	23-12-2004	AU 2003242239 A1 EP 1632213 A1	04-01-2005 08-03-2006
EP 1632213	A	08-03-2006	AU 2003242239 A1 WO 2004110393 A1	04-01-2005 23-12-2004
JP 2005041809	A	17-02-2005	NONE	
JP 2004339106	A	02-12-2004	NONE	
JP 2002193754	A	10-07-2002	NONE	

フロントページの続き

(51) Int. Cl. F I テーマコード (参考)
A 6 1 Q 19/00 (2006.01) A 6 1 Q 19/00

(81) 指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

(72) 発明者 上田 哲弘
 兵庫県神戸市東灘区向洋町中 1 - 2 - 1 8

(72) 発明者 山田 耕作
 兵庫県神戸市北区筑紫が丘 2 - 2 2 - 5

(72) 発明者 カーラ ジョアン スタンプ
 アメリカ合衆国 2 6 3 0 1 ウェストバージニア州 ストーンウッド コスト アベニュー 1
 5 5 0 ユニット 2 6

(72) 発明者 チュ チュー
 アメリカ合衆国 4 5 2 4 2 オハイオ州 シンシナティ ケンウッド ロード 8 6 7 0

F ターム(参考) 4C083 AA162 AB242 AC012 AC111 AC121 AC122 AC131 AC352 AC421 AC762
 AC851 AC852 AD041 AD152 AD161 AD162 AD172 AD211 AD412 BB21
 CC02 CC05 DD32 EE06 EE07
 4J002 CP04W CP14W CP18X CP18Y DE027 EA016 FD31Y GB00 HA07