



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2023-0109142
(43) 공개일자 2023년07월19일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
A61K 8/49 (2006.01) A61K 8/27 (2006.01)
A61K 8/29 (2006.01) A61K 8/34 (2006.01)
A61K 8/35 (2006.01) A61K 8/37 (2006.01)
A61K 8/40 (2006.01) A61K 8/55 (2006.01)
A61K 8/67 (2006.01) A61Q 17/04 (2006.01)
(52) CPC특허분류
A61K 8/49 (2013.01)
A61K 8/27 (2013.01)
(21) 출원번호 10-2023-7016427
(22) 출원일자(국제) 2021년10월15일
심사청구일자 없음
(85) 번역문제출일자 2023년05월15일
(86) 국제출원번호 PCT/US2021/055128
(87) 국제공개번호 WO 2022/081942
국제공개일자 2022년04월21일
(30) 우선권주장
63/092,851 2020년10월16일 미국(US)

(71) 출원인
시스파이어, 인크.
미국, 매사추세츠 02139, 캠프리지, 매사추세츠
애비뉴 501
(72) 발명자
데라비, 레일라, 에프.
미국, 매사추세츠 02139, 캠프리지, 매사추세츠
애비뉴 501, 씨/오 시스파이어, 인크.
마틴, 카밀, 에이.
미국, 매사추세츠 02139, 캠프리지, 매사추세츠
애비뉴 501, 씨/오 시스파이어, 인크.
콕스, 나탈리
미국, 매사추세츠 02139, 캠프리지, 매사추세츠
애비뉴 501, 씨/오 시스파이어, 인크.
(74) 대리인
강명구

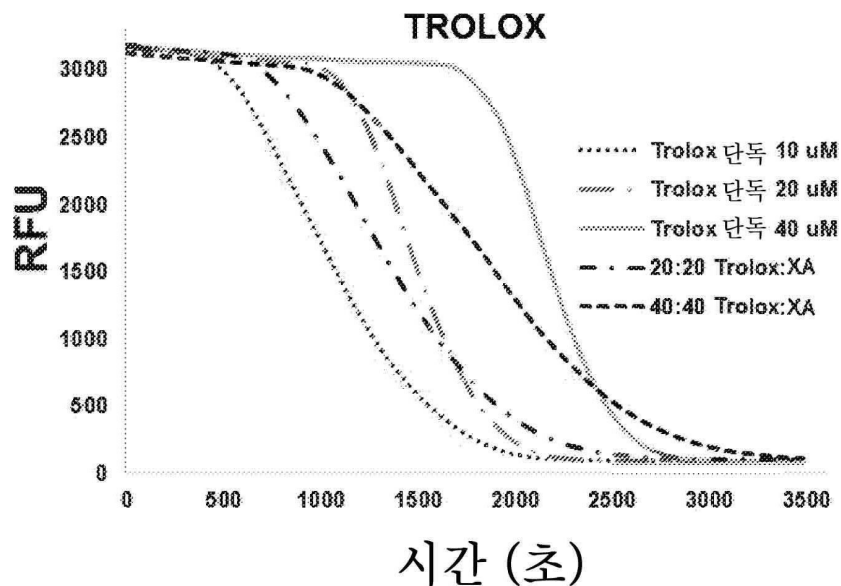
전체 청구항 수 : 총 93 항

(54) 발명의 명칭 산화방지제 및 UV-필터 안정화제로서 잔토마틴을 포함하는 광보호 화장품 조성물

(57) 요약

페녹사존 및/또는 페녹사진 소분자, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 예를 들어 잔토마틴의 불포화 용액은 페녹사존 및/또는 페녹사진을 보호 및 안정성을 향상시키기 위해 피부과 및 피부 관리 제제에서 독립적인 개별 분자로서 사용한다. 응집되지 않은 잔토마틴 분자는 공지된 화학적 UV 필터의 UV-필터링 성능을 증진시키고 광-안정성 (뒷면에 계속)

대표도



및 UV-흡수 특성을 증가시킬 수 있다. 따라서, 불포화 용액 중의 응집되지 않은 잔토마틴은 선케어 제품에서 UV-A 필터 아보벤존의 성능을 대체할 수 있고 시간 경과에 따라 더 큰 성능 안정성을 제공하는 공지된 향산화제의 성능을 대체할 수 있다. 잔토마틴 분자의 불포화 용액을 피부과 제제, 특히 선스크린 및 페이스셜 모이스처라이저와 같은 자외선 차단 제제에 통합함으로써, 전통적인 화학적 및 물리적 UV 필터와 관련된 전신 독성 없이 향상된 보호를 달성할 수 있다. 잔토마틴의 불포화 용액은 선스크린 제제에서 더 안전하고 효과적이며 오래 지속되는 광역 스펙트럼 보호를 제공한다.

(52) CPC특허분류

A61K 8/29 (2013.01)
A61K 8/342 (2013.01)
A61K 8/35 (2013.01)
A61K 8/37 (2013.01)
A61K 8/375 (2013.01)
A61K 8/40 (2013.01)
A61K 8/55 (2013.01)
A61K 8/676 (2013.01)
A61K 8/678 (2013.01)

명세서

청구범위

청구항 1

다음을 포함하는 조성물:

적어도 하나의 UV-필터링 물질; 및

1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 임의의 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액.

청구항 2

제1항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 함께 상승작용을 나타내는 조성물.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물보다 더 큰 조사 전 SPF를 갖는 조성물.

청구항 4

제1항 내지 제3항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물보다 더 큰 조사 후 SPF를 갖는 조성물.

청구항 5

제3항 또는 제4항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물과 비교하여 10% 초과 SPF 증가를 갖는 조성물.

청구항 6

제3항 또는 제4항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물과 비교하여 25% 초과 SPF 증가를 갖는 조성물.

청구항 7

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물의 SPF는 적어도 1 주 동안 유지되는 조성물.

청구항 8

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물의 SPF는 적어도 2 주 동안 유지되는 조성물.

청구항 9

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물의 SPF는 적어도 3 주 동안 유지되는 조성물.

청구항 10

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물

질을 포함하는 조성물보다 더 큰 UV 흡광도를 나타내는 조성물.

청구항 11

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물과 비교하여 100% 초과 UV 흡광도 변화를 나타내는 조성물.

청구항 12

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물과 비교하여 150% 초과 UV 흡광도 변화를 나타내는 조성물.

청구항 13

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물과 비교하여 200% 초과 UV 흡광도 변화를 나타내는 조성물.

청구항 14

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 또는 로도마틴, 이의 유도체 또는 전구체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 15

제14항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 또는 이의 염을 포함하는 조성물.

청구항 16

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 응집되지 않은 분자를 포함하는 조성물.

청구항 17

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 적어도 하나의 UV-흡수 화합물을 포함하는 조성물.

청구항 18

제17항에 있어서, 적어도 하나의 UV-흡수 화합물은 아보벤존, 옥시벤존, 옥시벤존 시녹세이트, 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥티녹세이트, 옥토크릴렌, 및 트롤아민 살리실레이트로부터 선택되는 조성물.

청구항 19

제1항 내지 제16항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 적어도 하나의 UV-산란 입자를 포함하는 조성물.

청구항 20

제19항에 있어서, 적어도 하나의 UV-산란 입자는 이산화티타늄 및 이산화아연으로부터 선택되는 조성물.

청구항 21

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 용액으로서 제제화되는 조성물.

청구항 22

제21항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질 및 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 용액 내에서 균질하게 분포되는 조성물.

청구항 23

제1항 내지 제18항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 에멀전으로서 제제화되는 조성물.

청구항 24

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 포타슘 세틸 포스페이트, PEG-150 디스테아레이트, 세테아릴 알코올, 카프릴릭/카프릭 트리글리세라이드, 및 글리세릴 스테아레이트로부터 선택되는 하나 이상의 비이온성 중합체 유화제를 추가로 포함하는 조성물.

청구항 25

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 화장품 또는 피부과 제제에서 사용하기 위해 크림, 젤, 스프레이 또는 로션으로 제제화되는 조성물.

청구항 26

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 태양 자외선 복사로부터의 보호를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 27

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 적어도 15의 SPF를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 28

제1항 내지 제26항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 적어도 30의 SPF를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 29

제1항 내지 제26항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 15-100의 SPF를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 30

제1항 내지 제26항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 60 이상의 SPF를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 31

제1항 내지 제30항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 적어도 15의 UVA-PF를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 32

제1항 내지 제30항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 적어도 30의 UVA-PF를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 33

제1항 내지 제30항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 15-100의 UVA-PF를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 34

제1항 내지 제30항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 60 이상의 UVA-PF를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 35

제1항 내지 제34항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 광역 스펙트럼 보호를 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 36

제1항 내지 제35항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 적어도 0.7 이상의 UVA I 대 UV B 필터의 비율을 제공하도록 제제화되는 조성물.

청구항 37

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 추가 항산화 화합물을 추가로 포함하는 조성물.

청구항 38

제37항에 있어서, 적어도 하나의 추가 항산화 화합물은 알부틴, BHA, BHT, 코지산, 하이드록시아니솔, 하이드로퀴논, t-부틸 하이드로퀴논, 토코페롤, 노르디하이드로구아아레트산, 로즈마린산, 트롤록스, 구시폴, 플라본, 플라바논, 이소플라본, 플라바놀, 프로토카테추산, 레조르실산, 갈산, 카페산, 페룰산, 클로로겐산, 아스코르브산, 아스코르빌 팔미테이트, 카로티노이드, 시스테인 하이드로클로라이드, 디티오프레이톨, 글루타티온, 티오클리콜산, 티오티프로피온산, 알파-리포산, 및/또는 잔틴 중 하나 이상을 포함하는 조성물.

청구항 39

제37항 또는 제38항에 있어서, 적어도 하나의 추가 항산화 화합물은 0.1-5 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 40

제37항 또는 제38항에 있어서, 적어도 하나의 추가 항산화 화합물은 0.1-1 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 41

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 향라디칼 화합물을 추가로 포함하는 조성물.

청구항 42

제41항에 있어서, 향라디칼 화합물은 0.1-15 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 43

제41항에 있어서, 향라디칼 화합물은 0.1-1 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 44

제41항에 있어서, 향라디칼 화합물은 1-10 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 45

제41항에 있어서, 향라디칼 화합물은 6-8 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 46

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 10-35 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 47

제1항 내지 제45항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 0.1-15 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 48

제1항 내지 제45항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 0.1-5 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 49

제1항 내지 제45항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 0.1-1 wt %로 존재하는 조성물.

청구항 50

전술한 청구항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 0.1-1 wt % 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 51

제1항 내지 제49항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 0.01-0.1 wt % 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 52

제1항 내지 제49항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 0.01-0.05 wt % 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 53

제1항 내지 제49항 중 어느 한 항에 있어서, 조성물은 0.1 wt % 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 54

적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물의 SPF를 유지하는 방법으로서, 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 불포화 용액을 조성물에 첨가하여 최종 화장료 제제를 제공하는 것을 포함하는 방법.

청구항 55

제54항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 또는 로도마틴, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 방법.

청구항 56

제55항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 또는 이의 염을 포함하는 방법.

청구항 57

제54항 내지 제56항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 적어도 하나의 UV-흡수 화합물을 포함하는 방법.

청구항 58

제57항에 있어서, 적어도 하나의 UV-흡수 화합물은 아보벤존, 옥시벤존, 옥시벤존 시녹세이트, 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥티녹세이트, 옥토크릴렌, 및 트몰아민 살리실레이트로부터 선택되는 방법.

청구항 59

제54항 내지 제58항 중 어느 한 항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 최종 화장료 제제에서 0.01-0.1 wt %를 차지하는 방법.

청구항 60

제54항 내지 제58항 중 어느 한 항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 최종 화장료 제제에서 0.01 wt %를 차지하는 방법.

청구항 61

제54항 내지 제60항 중 어느 한 항에 있어서, SPF는 적어도 1 주 동안 유지되는 방법.

청구항 62

제54항 내지 제60항 중 어느 한 항에 있어서, SPF는 적어도 2 주 동안 유지되는 방법.

청구항 63

제54항 내지 제60항 중 어느 한 항에 있어서, SPF는 적어도 3 주 동안 유지되는 방법.

청구항 64

적어도 하나의 UV-필터링 물질을 포함하는 조성물의 SPF를 증가시키는 방법으로서, 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 불포화 용액을 조성물에 첨가하여 최종 화장료 제제를 제공하는 것을 포함하는 방법.

청구항 65

제64항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 함께 상승작용을 나타내는 방법.

청구항 66

제64항 또는 제65항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-여과 물질을 포함하는 조성물과 비교하여 10% 초과 of 조사 전 SPF 증가를 갖는 방법.

청구항 67

제64항 또는 제65항에 있어서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-여과 물질을 포함하는 조성물과 비교하여 10% 초과 of 조사 후 SPF 증가를 갖는 방법.

청구항 68

제64항 내지 제67항 중 어느 한 항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 또는 로도마틴, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 방법.

청구항 69

제68항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 또는 이의 염을 포함하는 방법.

청구항 70

제64항 내지 제69항 중 어느 한 항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 최종 화장료 제제에서 0.03 wt %를 포함하는 방법.

청구항 71

제64항 내지 제70항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 적어도 하나의 UV-흡수 화합물을 포함하는 방법.

청구항 72

제71항에 있어서, UV-흡수 화합물은 아보벤존, 옥시벤존, 옥시벤존 시녹세이트, 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥티녹세이트, 옥토크릴렌, 및/또는 트롤아민 살리실레이트 중 하나를 포함하는 방법.

청구항 73

제64항 내지 제70항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질은 적어도 하나의 UV-산란 입자를 포함하는 방법.

청구항 74

제73항에 있어서, UV-산란 입자는 이산화티타늄 또는 산화아연을 포함하는 방법.

청구항 75

다음을 포함하는 향산화제 조성물:

비타민 E 유사체; 및

하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액.

청구항 76

제75항에 있어서, 조성물은 비타민 E 유사체만을 포함하는 조성물보다 더 오랫동안 산화방지제로서 작용하는 조성물.

청구항 77

제75항 또는 제76항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 로도마틴, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 78

제77항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 또는 이의 염을 포함하는 조성물.

청구항 79

제75항 내지 제78항 중 어느 한 항에 있어서, 비타민 E 유사체 및 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 1:1의 몰비로 존재하는 조성물.

청구항 80

제75항 내지 제79항 중 어느 한 항에 있어서, 비타민 E 유사체는 트롤록스인 조성물.

청구항 81

제75항 내지 제80항 중 어느 한 항에 있어서, 0.01-1 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 82

제75항 내지 제80항 중 어느 한 항에 있어서, 1-5 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 83

제75항 내지 제80항 중 어느 한 항에 있어서, 1-10 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 84

제75항 내지 제80항 중 어느 한 항에 있어서, 50 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 85

다음을 포함하는 향산화제 조성물:

아스코르브산; 및

하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불

포화 용액.

청구항 86

제86항에 있어서, 조성물은 아스코르브산만을 포함하는 조성물보다 더 오랫동안 산화방지제로서 작용하는 조성물.

청구항 87

제85항 또는 제86항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 로도마틴, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 88

제87항에 있어서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 또는 이의 염을 포함하는 조성물.

청구항 89

제85항 내지 제88항 중 어느 한 항에 있어서, 아스코르브산 및 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 최종 제제에서 1:1의 몰비로 존재하는 조성물.

청구항 90

제85항 내지 제89항 중 어느 한 항에 있어서, 0.01-1 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 91

제85항 내지 제89항 중 어느 한 항에 있어서, 1-5 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 92

제85항 내지 제89항 중 어느 한 항에 있어서, 1-10 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

청구항 93

제85항 내지 제89항 중 어느 한 항에 있어서, 50 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 조성물.

발명의 설명

기술 분야

[0001]

관련 출원

[0002]

본 출원은 2020년 10월 16일에 출원된 미국 특허 가출원 번호 63/092,851에 대한 우선권을 주장하며, 이 출원은 그 전체가 본원에 참조로 포함된다.

[0003]

재정 지원

[0004]

본 발명은 미국 국립과학재단에 의해 수여된 승인 NSF SBIR 2050284하에 정부 지원으로 이루어졌다. 정부는 본 발명에 대한 특정 권리를 가진다.

배경 기술

[0005]

배경

[0006]

태양 자외선(UV) 복사에 대한 환경적 노출은 매년 약 350만 건의 피부암 사례에 대한 주요 원인 중 하나이다.

흑색종에 사용할 수 있는 효과적인 치료 옵션이 거의 없으므로, 국소 선스크린의 매일 도포를 통해 예방적 피부 관리에 많은 노력을 했다.

[0007] 그러나, 환경 워킹 그룹(Environmental Working Group, EWG)에 의한 최근의 보고서에 따르면 선스크린 중의 UV 필터의 >70%가 (1) UV-복사로부터 인간 피부를 보호하는 데 효과적이지 않고/않거나 (2) 독성 성분을 포함한다. 동물의 발달 및 생식 독성의 시작을 뒷받침하는 축적된 데이터와 함께, 이러한 데이터는 상업적 선스크린의 만성적 사용이 인간 및 해양 건강 모두에 대한 부상하는 위협임을 나타내며, 미국 식품의약국(FDA)과 함께 현재 처방전 없이 구입할 수 있는(OTC) 선스크린 제품을 재평가하도록 업계를 압박하고 있다.

[0008] 공지된 항산화제(비타민 C 및 E)는 불안정하고 공기 및 햇빛과 쉽게 반응하여 효과가 없는(때로 독성이 있는) 부산물을 형성한다. 페녹사존 및 페녹사진은 태양 보호 제제로 사용될 수 있는 소분자이다. 예를 들어 안정화된 3 차원 형태의 응집된 잔토마틴이 선케어 제제에 혼입되었다. 이러한 제제에서 사용되는 잔토마틴 입자 응집체는 일반적으로 크기가 100 nm 초과이다.

[0009] 현재 사용되는 것을 대체할 더 안전하고 친환경적이며 효과적인 UV-필터에 대한 절실한 필요성이 있다.

[0010] 업계가 지속 불가능하고 때로 독성이 있는 많은 상재를 대체하도록 설계된 천연 및 환경 친화적인 제품 제공을 계속 추진함에 따라, 성장하는 추세는 화장품에서 생물학적으로 파생되거나 생물학적으로 영감을 받은 원료의 적용 및 활용을 지원한다. Bom, S., et al., *A step forward on sustainability in the cosmetics industry: A review*. Journal of Cleaner Production, 2019. 225: p. 270-290. Bom, S., et al., *Replacing Synthetic Ingredients by Sustainable Natural Alternatives: A Case Study Using Topical O/W Emulsions*. Molecules, 2020. 25(21). 영감 또는 원천의 기원에도 불구하고, 이러한 생체 기반 또는 생체 영감 원료는 처방전 없이 구입할 수 있는 제품에 혼입될 수 있기 전에 여전히 엄격한 안전 심사 및 기준을 거쳐야 한다. Bom, 2019. Bom, S., H.M. Ribeiro, and J. Marto, *Sustainability Calculator: A Tool to Assess Sustainability in Cosmetic Products*. Sustainability, 2020. 12(4): p. 1437. 암모늄 잔토마틴(이하 잔토마틴으로 지칭됨)은 절지동물 및 두족류에 존재하는 자연 발생 생물색소이며 이들 중에서 트립토판의 대사 동안 형성된다. Riou, M. and J.P. Christides, Cryptic color change in a crab spider (*Misumena vatia*): identification and quantification of 전구체s and onmochrome pigments by HPLC. J Chem Ecol, 2010. 36(4): p. 412-23. Futahashi, R.a.K., Ryoji and Mano, Hiroaki and Fukatsu, Takema, Redox alters yellow dragonflies into red. PNAS 2012. 109(31): p. 12626-12631. Osani-Futahashi, M., et al., Positional cloning of a Bombyz pink-eyed white egg locus reveals the major role of cardinal in onmochrome synthesis. Heredity, 2016. 116: p. 135-145. Williams, T.L., et al., Dynamic pigmentary and structural coloration within cephalopod chromatophore organs. Nature communications, 2019. 10. Deravi, L.F., et al., The structure-function relationships of a natural nanoscale photonic device in cuttlefish chromatophores. J R Soc Interface, 2014. 11(93): p. 20130942. Williams, T.L., et al., Contributions of phenoxazone-based pigments to the structure and function of nanostructured granules in squid chromatophores. Langmuir, 2016. 32(15): p. 3754-3759. Williams, T.L., et al., Dynamic pigmentary and structural coloration within cephalopod chromatophore organs. Nat Commun, 2019. 10(1): p. 1004.

발명의 내용

[0011] 요약

[0012] 선케어 및 화장품 응용분야를 위한 개선된 조성물이 본원에 개시된다. 새로운 조성물은 태양광 및 미용 관리를 제공하는 데 더욱 효과적인 사용을 제공하기 위해 생물체에서 영감을 받은 광안정 부류의 페녹사존 및 페녹사진(또는 이의 유도체 또는 전구체)으로부터의 하나 이상의 화합물의 불포화 용액을 포함한다. 본원에서 사용되는 바와 같이, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물의 불포화 용액은 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물이 용액에 완전해 용해된 화학적 용액을 포함한다. 용액 중의 소분자와 다른 용액 성분 사이에 이온 결합, 정전기적 결합, 수소 결합 및 반 데르 발스 결합이 있을 수 있지만, 불포화 용액 중의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물은 공유 결합 또는 기타 결합에 의해 다른 활성 분자 구성요소와 결합하지 않는다. 불포화 용액 중의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물은 또한 피부과 또는 기타 제제에서 향상된 안정화를 위해 비활성 측쇄 및/또는 중합체와 결합될 수 있지만, 동일하거나 상이한 종의 활성 분자와 결합하거나 연계되지 않는다. 불포화 용액 중의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물은 응집되고 용액 또는 더 큰 제제 중의 다른 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물 또는 다른 활성 분자와 3 차원 안정화 구조를 형성하지 않는다. 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물의 불포화 용액은 3-하이드록시키누레닌을 비롯한

페녹사존 및/또는 페녹사진 유도체 또는 전구체의 불포화 용액을 포함할 수 있다. 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물의 불포화 용액은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 또는 로도마틴, 상기 중 임의의 것의 유도체, 상기 중 임의의 것의 전구체, 및 상기 중 임의의 것의 염을 또한 포함할 수 있다. 특정 구체예에서, 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 염은 잔토마틴, 또는 이의 염이다. 그러한 특정 구체예에서, 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 염은 암모늄 잔토마틴이다.

[0013] 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물(예를 들어 잔토마틴, 또는 이의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 결합된 페녹사존 및 페녹사진 화합물에 비해 안정화 및 증진 특성을 갖는 조성물을 제공하는데, 불포화 용액 중의 응집되지 않은 소분자의 분자 및 화학적 특성이 UV 보호 체제에서 이용될 수 있기 때문이다. 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물의 불포화 용액은 체제에 쉽게 혼입되고 응집되지 않은 소분자의 화학이 이용되어 UV-흡수, 증진 및 안정화와 관련하여 놀라운 특성을 제공할 수 있다. 특정 적합화에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물의 불포화 용액은 잔토마틴, 이의 하나 이상의 유도체 또는 전구체, 또는 이의 염을 포함한다. 잔토마틴은 절지동물 및 두족류에 존재하는 생물색소이지만 본원에 개시된 조성물을 위해 합성적으로 형성될 수 있다.

[0014] 본 출원은 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt% 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액을 포함하는 조성물을 제공한다. 그러한 특정 구체예에서, 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 로도마틴, 이의 유도체 또는 전구체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함한다. 특정 구체예에서, 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 3-하이드록시키투렌을 포함한다. 다른 구체예에서, 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 잔토마틴, 이의 하나 이상의 유도체 또는 전구체, 또는 이의 염(예를 들어 암모늄 잔토마틴)을 포함한다. 특정 구체예에서, 1 wt% 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 합성 분자를 포함한다. 특정 구체예에서, 1 wt% 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 응집되지 않은 분자를 포함한다.

[0015] 특정 구체예에서, 본 출원의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체의 불포화 용액은 더 넓은 UV-가시광선 스펙트럼에 걸쳐 종래의 화학 필터보다 최대 3x 더 많이 흡수할 수 있는 UV-필터를 제공한다.

[0016] 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 함께 상승작용을 나타낸다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물보다 더 큰 조사 전 SPF를 갖는다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물보다 더 큰 조사 후 SPF를 갖는다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물과 비교하여 10% 초과 SPF 증가를 갖는다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물과 비교하여 25% 초과 SPF 증가를 갖는다. 상기 중 임의의 것의 특정 구체예에서, 조성물의 SPF는 적어도 1 주 동안 유지된다. 상기 중 임의의 것의 특정 구체예에서, 조성물의 SPF는 적어도 2 주 동안 유지된다. 상기 중 임의의 것의 특정 구체예에서, 조성물의 SPF는 적어도 3 주 동안 유지된다.

[0017] 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-흡수 화합물을

포함하는 조성물보다 더 큰 UV 흡광도를 나타낸다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-흡수 화합물을 포함하는 조성물과 비교하여 100% 초과 UV 흡광도 변화를 나타낸다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-흡수 화합물을 포함하는 조성물과 비교하여 150% 초과 UV 흡광도 변화를 나타낸다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-흡수 화합물을 포함하는 조성물과 비교하여 200% 초과 UV 흡광도 변화를 나타낸다.

[0018] 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt% 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체의 불포화 용액을 포함하는 본 출원의 조성물은 용액으로 제제화될 수 있다. 그러한 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 용액 내에 균질하게 분포된다. 다른 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체의 불포화 용액을 포함하는 본 출원의 조성물은 에멀전으로 제제화될 수 있다. 그러한 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체의 불포화 용액은 에멀전의 용액상의 가용성 부분을 포함한다.

[0019] 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액을 포함하는 본 출원의 조성물은 화장품 또는 피부과 제제에 사용하기 위해 크림, 젤, 스프레이 또는 로션으로 제제화될 수 있다. 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 태양 자외선 복사로부터의 보호를 제공하도록 제제화된다. 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 청색광 및 적외선 영역에 대해 보호하기 위한 광역 스펙트럼 보호를 제공하도록 제제화된다. 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 적어도 0.7 이상의 UVA I 대 UV B 필터의 비율을 제공하도록 제제화된다. 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 또는 이의 전구체 또는 유도체(예를 들어 잔토마틴, 이의 유도체 또는 전구체, 또는 상기 중 임의의 것의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 피부 보호제로서 향상된 활성을 제공하기 위한 넓은 범위의 태양광(UV-근적외선)을 흡수하고 산란시킬 수 있다. 특정 구체예에서, 조성물은 15, 30, 60 또는 100의 자외선 차단 지수("SPF")를 제공하도록 제제화된다. 특정 구체예에서, 조성물은 15-100의 SPF를 제공하도록 제제화된다. 특정 구체예에서, 조성물은 적어도 15, 30, 60, 또는 100의 UVA 차단 지수("UVA-PF")를 제공하도록 제제화된다. 특정 구체예에서, 조성물은 15-100의 UVA-PF를 제공하도록 제제화된다. 특정 구체예에서, 조성물은 적어도 0.7 이상의 UVA I 대 UV 필터의 비율을 제공하도록 제제화된다.

[0020] 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 하나 이상의 비이온성 중합체 유화제를 추가로 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, 하나 이상의 비이온성 중합체 유화제는 포타슘 세틸 포스페이트, PEG-150 디스테아레이트, 세테아릴 알코올, 카프릴릭/카프릭 트리글리세라이드, 및 글리세릴 스테아레이트로부터 선택된다.

[0021] 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 적어도 하나의 추가 항산화 화합물을 추가로 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, 적어도 하나의 추가 항산화 화합물은 알부틴, BHA, BHT, 코지산, 하이드록시아니솔, 하이드로퀴논, t-부틸 하이드로퀴논, 토코페롤, 노르디하이드로구아아아레트산, 로즈마린산, 트롤록스, 구시폴, 플라본, 플라바논, 이소플라본, 플라바놀, 프로토키테추산, 레조르실산, 갈산, 카페산, 페룰산, 클로로겐산, 아스코르브산, 아스코르빌 팔미테이트, 카로티노이드, 시스테인 하이드로클로라이드, 디티오프레이톨, 글루타티온, 티오키리콜산, 티오프로피온산, 알파-리포산, 및/또는 잔틴 중 하나 이상을 포함한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 유도체 또는 전구체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 조성물에서 항산화 화합물 기능을 한다. 특정 구체예에서, 적어도 하나의 추가 항산화 화합물은 0.1-5 wt %로 존재한다. 특정 구체예에서, 적어도 하나의 추가 항산화 화합물은 0.1-1 wt %로 존재한다.

[0022] 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 하나 이상의 향라디칼 화합물을 추가로 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, 향라디칼 화합물은 약 0.1-15 wt%, 0.1-1 wt %, 1-10 wt %, 또는 6-8 wt %의 양으로 최종 제제에 존재한다. 특정 구체예에서, 향라디칼 화합물은 약 0.1 wt %, 0.5 wt %, 1 wt %, 6 wt %, 8 wt %, 10 wt %, 15 wt %의 양, 또는 임의의 다른 적합한 양으로 최종 제제에 존재한다.

- [0023] 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)은 0.1-15 wt%, 0.1-5 wt %, 0.1-1 wt %의 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)은 0.1 wt %, 0.5 wt %, 1 wt %, 6 wt %, 8 wt %, 10 wt %, 15 wt %의 양으로, 또는 임의의 다른 적합한 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)은 FDA 승인된 UV-필터 또는 또 다른 UV-필터링 화합물을 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, UV-흡수 화합물은 아보벤존, 옥시벤존, 옥시벤존 시녹세이트, 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥티녹세이트, 옥토크릴렌, 및/또는 트롤아민 살리실레이트 중 하나 이상을 포함한다. 다른 구체예에서, UV-산란 입자는 이산화티타늄 또는 이산화아연을 포함한다.
- [0024] 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 조성물은 0.1-1 wt % 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)을 포함한다. 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 조성물은 0.01-0.1 wt % 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)을 포함한다. 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 조성물은 0.01-0.05 wt % 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)을 포함한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 최종 제제에 약 0.01 wt %, 0.03 wt %, 0.05 wt %, 0.1 wt %, 0.5 wt %, 또는 1 wt %의 양으로 존재한다.
- [0025] 본 출원은 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물의 SPF를 유지하는 방법으로서, 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 불포화 용액을 조성물에 첨가하여 최종 화장료 제제를 제공하는 것을 포함하는 방법을 제공한다. 특정 구체예에서, SPF는 적어도 1 주, 적어도 2 주, 또는 적어도 3 주 동안 유지된다.
- [0026] 본 출원은 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물의 SPF를 증가시키는 방법으로서, 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함하는 불포화 용액을 조성물에 첨가하여 최종 화장료 제제를 제공하는 것을 포함하는 방법을 추가로 제공한다. 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 함께 상승작용을 나타낸다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물과 비교하여 10% 초과와 조사 전 SPF 증가를 갖는다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물과 비교하여 10% 초과와 조사 후 SPF 증가를 갖는다.
- [0027] 본 출원의 방법의 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 또는 로도마틴, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 또는 이의 염을 포함한다. 본 출원의 방법의 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 최종 화장료 제제에서 0.01-0.1 wt %를 차지한다. 본 출원의 방법의 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 최종 화장료 제제에서 0.01 wt %를 차지한다. 본 출원의 방법의 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 최종 화장료 제제에서 0.03 wt %를 차지한다.
- [0028] 본 출원의 방법의 특정 구체예에서, UV-필터링 물질은 UV-흡수 화합물을 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, UV-흡수 화합물은 아보벤존, 옥시벤존, 옥시벤존 시녹세이트, 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥티녹세이트, 옥토크릴렌, 및/또는 트롤아민 살리실레이트 중 하나이다. 특정 구체예에서, UV-필터링 물질은 UV-산란 입자를 포함

한다. 그러한 특정 구체예에서, UV-산란 입자는 이산화티타늄 또는 산화아연을 포함한다.

[0029] 본 출원은 비타민 E 유사체; 및 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액을 포함하는 항산화제 조성물을 추가로 제공한다. 그러한 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 로도마틴, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염, 예컨대 잔토마틴, 또는 이의 염을 포함한다. 특정 구체예에서, 조성물은 비타민 E 유사체만을 포함하는 조성물보다 더 오랫동안 항산화제로서 작용한다. 특정 구체예에서, 비타민 E 유사체 및 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 조성물에 약 1:1의 몰비로 존재한다. 특정 구체예에서, 불포화 용액의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 약 0.01 내지 10 wt %, 특히 0.01-1 wt %, 1-5 wt %, 1-10 wt %의 양, 또는 임의의 다른 적합한 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, 불포화 용액의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 약 50 wt %의 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, 불포화 용액의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 약 50 wt % 또는 최대 75 wt %의 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, 비타민 E 유사체는 트롤록스이다.

[0030] 본 출원은 아스코르브산 및 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을 포함하는 항산화제 조성물을 제공한다. 특정 구체예에서, 조성물은 아스코르브산만을 포함하는 조성물보다 더 오랫동안 항산화제로서 작용한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 로도마틴, 또는 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염, 예컨대 잔토마틴, 또는 이의 염을 포함한다. 특정 구체예에서, 불포화 용액의 아스코르브산 및 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 약 1:1의 비율로 존재한다. 특정 구체예에서, 불포화 용액의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 최종 제제에 약 0.01 내지 10 wt %, 특히 약 0.01-1 wt %, 약 1-5 wt %, 약 1-10 wt %의 양, 또는 임의의 다른 적합한 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, 불포화 용액의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 약 50 wt %의 양으로 최종 제제에 존재한다.

[0031] 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을, 피부과 제제, 특히 선스크린 및 페이스 모이스처라이저와 같은 자외선 차단 제제에 통합함으로써, 전통적인 화학적 및 물리적 UV 필터와 관련된 전신 독성 없이 향상된 보호를 달성할 수 있다. 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을 포함하는 조성물은 선케어 제품 제제에서 더 안전하고 효과적인 광역 스펙트럼 보호를 제공하고, 제제의 효능을 연장한다.

도면의 간단한 설명

[0032] 도 1은 트롤록스:잔토마틴의 1:1 조합과 비교하여 다양한 농도의 트롤록스의 항산화 특성을 나타낸다.

도 2는 아스코르브산:잔토마틴의 1:1 조합과 비교하여 다양한 농도의 아스코르브산의 항산화 특성을 나타낸다.

도 3은 다양한 농도의 잔토마틴의 항산화 특성을 나타낸다.

도 4A는 1 일차에 옥시벤존 단독과 비교하여 잔토마틴과 옥시벤존의 조합의 UV 흡수를 나타낸다. 도 4B는 16 일

차에 옥시벤존 단독과 비교하여 잔토마틴과 옥시벤존의 조합의 UV 흡수를 나타낸다.

도 5A는 1 일차에 아보벤존 단독과 비교하여 잔토마틴과 아보벤존의 조합의 UV 흡수를 나타낸다. 도 5B는 16 일차에 아보벤존 단독과 비교하여 잔토마틴과 아보벤존의 조합의 UV 흡수를 나타낸다.

도 6A는 1 일차에 옥티살레이트 및 호모살레이트 단독과 비교하여 옥티살레이트 및 호모살레이트와 잔토마틴의 조합(상단 두 라인)의 UV 흡수를 나타낸다. 도 6B는 16 일차에 옥티살레이트 및 호모살레이트 단독과 비교하여 옥티살레이트 및 호모살레이트와 잔토마틴의 조합(상단 두 라인)의 UV 흡수를 나타낸다.

도 7A는 1 일차에 옥티녹세이트 단독과 비교하여 잔토마틴과 옥티녹세이트의 조합의 UV 흡수를 나타낸다. 도 7B는 16 일차에 옥티녹세이트 단독과 비교하여 잔토마틴과 옥티녹세이트의 조합의 UV 흡수를 나타낸다.

도 8A는 1 일차에 옥토크릴렌 단독과 비교하여 잔토마틴과 옥토크릴렌의 조합의 UV 흡수를 나타낸다. 도 8B는 16 일차에 옥토크릴렌 단독과 비교하여 잔토마틴과 옥토크릴렌의 조합의 UV 흡수를 나타낸다.

도 9는 옥티녹세이트 단독 및 아보벤존 또는 잔토마틴과의 조합의 UV 흡수를 나타낸다.

도 10은 아보벤존 단독 및 잔토마틴과의 조합의 UV 흡수를 나타낸다.

도 11는 옥시벤존 단독 및 아보벤존 또는 잔토마틴과의 조합의 UV 흡수를 나타낸다.

도 12는 화학적 선스크린 샘플 조사 전(단색 막대) 및 조사 후(패턴 막대)에 대한 SPF의 측정 결과를 나타낸다.

도 13은 미네랄 선스크린 샘플 조사 전(단색 막대) 및 조사 후(패턴 막대)에 대한 SPF의 측정 결과를 나타낸다.

도 14는 암모늄 잔토마틴의 흡광 능력을 나타낸다.

도 15는 다양한 FDA 승인 유기 UV 필터와 조합된 암모늄 잔토마틴의 흡광 능력을 나타낸다.

도 16은 다양한 FDA 승인 유기 UV 필터와 조합된 암모늄 잔토마틴의 흡광 능력을 나타낸다.

도 17은 UVA 광에 노출된 및 노출되지 않은 잔토마틴의 시험관내 광독성 측정을 나타낸다. 도 17A는 다양한 농도의 잔토마틴에 대한 세포 생존율을 보여준다. 도 17B는 다양한 농도의 양성 대조군인 클로르프로마진에 대한 세포 생존율을 보여준다.

도 18은 비타민 E, 비타민 C 및 암모늄 잔토마틴(Xa)에 대한 최고 농도(40 μ M) 조건에 대한 곡선 아래 면적(AUC) 계산을 나타낸다.

도 19는 동일한 농도에서 분석될 때 용액 중의 비타민 C와 비교하여 용액 중의 암모늄 잔토마틴의 반감기 측정을 나타낸다.

도 20은 단독으로 또는 암모늄 잔토마틴(Xa)과 조합하여 측정된 비타민 C의 활성을 나타낸다.

도 21은 단독으로 또는 암모늄 잔토마틴(Xa)과 조합하여 측정된 비타민 E의 활성을 나타낸다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

상세한 설명

잔토마틴은 절지동물 및 두족류에 존재하는 생물색소이며, 단리 또는 합성되어 화학적 선스크린제의 UV-필터링 성능을 안정시키고 일부 경우에 증진 또는 향상시키는 향산화제로서 제제에서 사용될 수 있다. 생물체에서 영감을 받은 분자는 기존의 UV-필터 및 향산화 화합물을 향상 및 증진하기 위해 또는 기능적 대체 UVA 필터로서 선케어 제품에서 사용되는 전통적인 화학물질에 대한 안전하고 세포 적합성인 대안이다. 본원에 개시된 조성물은 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을 자외선 차단 또는 기타 피부 보호를 위한 피부 보호 조성물에서 활성 성분으로서 사용하고, 유해한 건강 결과를 가질 수 있는 이러한 조성물에서 전통적으로 이용되는 화학물질에 대한 더욱 안전하고 효과적인 대안을 제공한다.

페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 또는 로도마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염)을 불포화 용액 중의 독립적인 응집되지 않은 단위로서 제제화하는 것은 여러 가지 놀라운 이점을 갖는다. 예를 들어, 이는 UV 필터의 성능을 증진시킬 수 있다. 첨부

도면을 참조하여 예시 섹션에 설명된 바와 같이, 예비 데이터는 잔토마틴, 또는 이의 염의 불포화 용액은 광-안정성을 증가시키거나 그렇지 않으면 공지된 화학적 UV-필터의 UV-흡수 특성을 안정화시킬 수 있다는 발견을 뒷받침한다. 잔토마틴, 또는 이의 염의 불포화 용액은 유일하게 알려진 공지된 UV-A 필터인 아보벤존의 성능을 완전히 대체하거나 이와 경쟁할 수 있다. 잔토마틴, 또는 이의 염의 불포화 용액은 시간 경과에 따른 항산화 특성 및 안정성 면에서 공지된 항산화제와 비교하여 개선된 성능을 제공할 수 있다.

[0036] 본원에 개시된 조성물은 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을 에멀전(예컨대 크림)의 가용성 부분 또는 용액 상으로서 또는 현탁액(예컨대 에어로졸 스프레이) 내에 균질하게 분포된 것으로 포함한다.

[0037] 응집되지 않은 비입자 형태의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액의 이러한 기능 각각은 차례로 간략하게 논의된다.

[0038] 일반적 사용

[0039] 본 출원은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액 및 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물을 제공한다. 특정 구체예에서, 조성물은 광역 스펙트럼 보호를 제공하는 데 사용하기 위한 것이다. 특정 구체예에서, 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물은 예를 들어 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 로도마틴, 이의 유도체 또는 전구체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함한다. 특정 구체예에서, 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 조성물에 약 1.0 wt %, 0.9 wt %, 0.8 wt %, 0.7 wt %, 0.6 wt %, 0.5 wt %, 0.4 wt %, 0.3wt %, 0.1 wt %, 0.05 wt %, 또는 0.01 wt % 미만의 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 조성물에 약 wt % 0.1-1 wt %, 0.01-0.1 wt %, 0.01-0.05 wt % 범위로, 또는 임의의 다른 적합한 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)은 조성물에 약 0.1 wt %, 1 wt %, 5 wt %, 10 wt %, 15 wt %, 20 wt %, 25 wt %, 30 wt %, 35 wt %, 또는 40 wt % 초과와 양 또는 다른 적합한 양으로 존재한다. 일부 구체예에서, UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)은 최종 제제에 약 0.1-40 wt %, 0.1-35 wt %, 0.1-30 wt %, 0.1-25 wt %, 0.1- 20 wt %, 0.1-15 wt %, 0.1-5 wt %, 또는 0.1-1 wt % 범위로 존재한다.

[0040] 본 출원은 0.1-1 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액, 및 0.1-40 wt %의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물을 제공한다. 특정 구체예에서, 조성물은 약 30-100의 SPF 및 약 30-100의 UVA-PF를 갖는다.

[0041] 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 함께 상승작용을 나타낸다. 두 가지 이상의 성분의 혼합물의 효능(예를 들어 SPF 또는 UV 흡수 특성)이 각 성분의 효능을 초과하는 경우, 이는 "상승작용"으로 지칭된다. 특정 구체예에서, 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 및 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액은 함께 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)과 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액을 조합한 것의 예상 효능(예를 들어 SPF 또는 UV-흡수 및/또는 -산란 특성)보다 더 많은 효능을 제공한다. 그러한 특정 구체예에서, 조합은 예상 효능(예를 들어 SPF 또는 UV-흡수 및/또는 -산란 특성)보다 적어도 5%, 10%, 15%, 20%, 25%, 또는 30% 더 많은 효능을 제공한다.

[0042] 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물보다 더 큰 조사 전 SPF를 갖는다. 그러한 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중

임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물과 비교하여 1% 초과, 5% 초과, 10% 초과, 15% 초과, 20% 초과, 25% 초과, 30% 초과, 35% 초과, 40% 초과, 45% 초과, 또는 50% 초과,의 조사 전 SPF 증가를 갖는다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물보다 더 큰 조사 후 SPF를 갖는다. 그러한 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물과 비교하여 1% 초과, 5% 초과, 10% 초과, 15% 초과, 20% 초과, 25% 초과, 30% 초과, 35% 초과, 40% 초과, 45% 초과, 또는 50% 초과,의 조사 후 SPF 증가를 갖는다. 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물보다 더 큰 조사 전 및 후 SPF를 갖는다.

[0043] 특정 구체예에서, 조성물의 SPF는 적어도 1 일, 적어도 2 일, 적어도 3 일, 적어도 4 일, 적어도 5 일, 적어도 6 일, 적어도 1 주, 적어도 2 주, 적어도 3 주, 적어도 4 주, 또는 적어도 5 주 동안 유지된다. 특정 구체예에서, 조성물의 SPF는 적어도 1 주 동안 유지된다. 특정 구체예에서, 조성물의 SPF는 적어도 2 주 동안 유지된다. 특정 구체예에서, 조성물의 SPF는 적어도 3 주 동안 유지된다. 상기 중 임의의 것의 특정 구체예에서, SPF는 조사 전 SPF이다.

[0044] 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물보다 더 큰 UV 흡광도를 나타낸다. 그러한 특정 구체예에서, 조성물은 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액이 없이 적어도 하나의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물과 비교하여 10%, 20%, 30%, 40%, 50%, 60%, 70%, 80%, 90%, 100%, 125%, 150%, 175%, 200%, 225%, 또는 250% UV 흡광도 증가를 나타낸다.

[0045] 특정 구체예에서, 하나 이상의 UV-필터링 물질은 하나 이상의 UV-흡수 화합물, 예컨대 하나 이상의 화학적 선블록을 포함한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 UV-필터링 물질은 하나 이상의 UV-산란 화합물, 예컨대 하나 이상의 물리적 선블록을 포함한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 UV-흡수 화합물은 아보벤존, 옥시벤존, 옥시벤존 시녹세이트, 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥티녹세이트, 옥토크릴렌, 및 트롤아민 살리실레이트, 베모트리 지놀, 및 비스옥트리졸로부터 선택된다. 특정 구체예에서, UV-필터링 물질은 화학적 및 물리적 선블록을 포함한다. 사용될 수 있는 화학적 선블록의 비제한적 예는 베모트리 지놀(Tinosorb S), 비스옥트리졸(Tinosorb M), 파라-아미노벤조산(PABA), PABA 에스테르(글리세릴 PABA, 아밀디메틸 PABA 및 옥틸디메틸 PABA), 부틸 PABA, 에틸 PABA, 에캄술, 에틸 디하이드록시프로필 PABA, 벤조페논(옥시벤존, 설리소벤존, 벤조페논, 및 벤조페논-1 내지 12), 신나메이트(옥틸 메톡시신나메이트, 이소아밀 p-메톡시신나메이트, 옥틸메톡시 신나메이트, 시녹세이트, 디 이소프로필 메틸 신나메이트, DEA-메톡시신나메이트, 에틸 디이소프로필신나메이트, 글리세릴 옥타노에이트 디 메톡시신나메이트 및 에틸 메톡시신나메이트), 신나메이트 에스테르, 살리실레이트(호모메틸 살리실레이트, 벤 질 살리실레이트, 글리콜 살리실레이트, 이소프로필벤질 살리실레이트 등), 안트라닐레이트, 에틸 우로카네이트, 호모살레이트, 옥티살레이트, 디벤조일메탄 유도체(예를 들어 아보벤존), 옥토크릴렌, 옥틸 트리아존, 디갈로이 트리올레이트, 글리세릴 아미노벤조에이트, 디하이드록시아세톤 함유 로손, 에틸헥실 트리아존, 디옥틸 부타미 오 트리아존, 벤질리덴 말로네이트 폴리실록산, 테레프탈릴렌 디카포르 설펜산, 디소듐 페닐 디벤즈이미다졸 테트라설포네이트, 디에틸아미노 하이드록시벤조일 헥실 벤조에이트, 비스 디에틸아미노 하이드록시벤조일 벤조 에이트, 비스 벤즈옥사조일페닐 에틸헥실이미노 트리아진, 드로메트리졸 트리실록산, 메틸렌 비스-벤조트리아졸 릴 테트라메틸부틸페놀, 및 비스-에틸헥실옥시페놀 메톡시페닐트리아진, 4-메틸벤질리덴캄포르, 및 이소펜틸 4- 메톡시신나메이트를 포함한다. 물리적 선블록의 비제한적 예는 카올린, 탈크, 페트콜라툼 및 금속 산화물(예를 들어 이산화티타늄 및 산화아연)을 포함한다. 특정 구체예에서, UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)은 조성물에 1 wt% 초과, 2 wt% 초과, 3 wt% 초과, 4 wt% 초과, 5 wt% 초과, 10 wt% 초과, 15 wt% 초과, 20 wt% 초과, 25 wt% 초과, 30 wt% 초과, 35 wt% 초과, 40 wt% 초과, 45 wt% 초과, 또는 50 wt% 초 과로 존재한다.

[0046] 본 출원의 조성물은 용액, 현탁액 또는 에멀전으로서 제제화될 수 있다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사

존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 용액, 현탁액 또는 에멀전 내에 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)과 함께 분포된다. 그러한 특정 구체예에서, 분포는 균질할 수 있다. 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 크림, 젤, 스프레이 또는 로션으로 제제화된다. 그러한 특정 구체예에서, 조성물은 화장품 또는 피부과 제제에 사용하기 위한 것이다. 본 출원의 조성물은 태양 자외선 복사로부터의 보호를 제공하기 위한 국소 사용에 적합하다.

[0047] 본 출원은 태양 자외선 복사로부터의 보호를 제공하는 방법으로서, 1 wt % 이하의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액, 및 0.1-40 wt %의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 화장품 또는 피부과 제제를 도포하는 것을 포함하는 방법을 제공한다. 특정 구체예에서, 조성물은 0.1-1 wt %의 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을 포함한다. 특정 구체예에서, 조성물은 10-40 wt %의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함한다. 특정 구체예에서, 화장품 또는 피부과 제제는 국소 투여용이다.

[0048] 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 비이온성 중합체 유화제, 예컨대 포타슘 세틸 포스페이트, PEG-150 디스테아레이트, 세테아릴 알코올, 카프릴릭/카프릭 트리글리세라이드, 및 글리세릴 스테아레이트를 추가로 포함한다.

[0049] 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 태양 보호를 제공한다. 특정 구체예에서, 조성물은 적어도 약 15, 30, 60, 100, 또는 다른 적합한 양의 보호의 SPF를 제공한다. 특정 구체예에서, 조성물 중의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 양은 특정 SPF를 제공하기 위해 변경되거나 조정될 수 있다. 특정 구체예에서, 조성물 중의 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)의 양은 특정 SPF를 제공하기 위해 변경되거나 조정될 수 있다. 예를 들어, 잔토마틴은 385 nm의 임계 파장을 갖는 한편, FDA-승인 UV-필터는 적어도 370 nm의 임계 파장을 갖는 경우 "광역-스펙트럼"으로 간주된다. 따라서, 불포화 용액 중의 잔토마틴은 광역 스펙트럼 UV-필터 기능을 할 수 있다. 잔토마틴 제제에 의해 제공되는 SPF는 잔토마틴이 조정 가능한 UV-필터가 되도록 농도에 따라 다르다. 용액 중의 0.03 mM 잔토마틴의 제제는 약 1 SPF를 제공하고, 0.25 mM 농도는 약 5 SPF를 제공하고, 1 mM 농도는 약 20 SPF를 제공하고, 5 mM 농도는 약 100 SPF를 제공할 것으로 예상된다. 특정 구체예에서, 조성물은 적어도 15의 UVA-PF를 제공하도록 제제화된다. 예를 들어, 조성물은 적어도 15, 30, 60, 100, 또는 임의의 다른 적합한 양의 보호의 UVA-PF를 제공하도록 제제화될 수 있다. 조성물 중의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴) 및/또는 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)의 양은 특정 SPF를 제공하기 위해 변경되거나 조정될 수 있다. 특정 구체예에서, 조성물은 광역 스펙트럼 보호를 제공한다. 특정 구체예에서, 조성물은 적어도 0.7 이상의 UVA I 대 UV 필터의 비율을 제공한다.

[0050] 본 출원의 조성물의 특정 구체예에서, 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 이의 항산화 특성에 의존한다. 조성물에 존재하는 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 양은 필요한 항산화 성능을 달성하기 위해 증가되거나 그렇지 않으면 조정될 수 있다. 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 추가의 항산화 화합물을 포함할 수 있다. 그러한 특정 구체예에서, 추가의 항산화 화합물은 알부틴, BHA, BHT, 코지산, 하이드록시아니솔, 하이드로퀴논, t-부틸 하이드로퀴논, 토코페롤, 노르디하이드로구아아아레탄산, 로즈마린산, 트롤록스, 구시폴, 플라본, 플라바논, 이소플라본, 플라바놀, 프로토카테추산, 레조르실산, 갈산, 카페인산, 페룰산, 클로로겐산, 아스코르브산, 아스코르빌 팔미테이트, 카로티노이드, 시스테인 하이드로클로라이드, 디티오프레틸, 글루타티온, 티오킬리콜산, 티오프로피온산, 알파-리포산, 및/또는 잔틴 중 하나 이상을 포함한다. 특정 구체예에서, 추가의 항산화 화합물은 세틸 시스테인, 알파-리포산, 알부틴, 아스코르브산, 아스코르브산 폴리펩티드, 아스코르빌 디팔미테이트, 아스코르빌 메틸실라놀 펩티네이트, 아스코르빌 팔미테이트, 아스코르빌 스테아레이트, BHA, BHT, t-부틸 하이드로퀴논, 카페인산, 카로티노이드, 클로로겐산, 시스테인, 시스테인 HCl, 디아밀하이드로퀴논, 디-t-부

틸하이드로퀴논, 디세틸 티오디프로피오네이트, 디올레일 토크페릴 메틸실라놀, 디소듐 아스코르빌 설페이트, 디스테아릴 티오디프로피오네이트, 디트리데실 티오디프로피오네이트, 도데실 갈레이트, 에리소르브산, 아스코르브산의 에스테르, 에틸 페룰레이트, 페룰산, 플라본, 플라바논, 플라바놀, 갈산 에스테르, 글루타티온, 구시폴, 하이드로퀴논, 하이드록시아니솔, 이소플라본, 이소옥틸 티오글리콜레이트, 디티오프레이톨, 코지산, 마그네슘 아스코르베이트, 마그네슘 아스코르빌 포스페이트, 메틸실라놀 아스코르베이트, 녹차 또는 포도씨 추출물과 같은 천연 식물성 항산화제, 노르디하이드로구아아아레트산, 옥틸 갈레이트, 페닐티오글리콜산, 포타슘 아스코르빌 토크페릴 포스페이트, 포타슘 설페이트, 프로필 갈레이트, 프로토크테추산, 퀴논, 로즈마린산, 소듐 아스코르베이트, 소듐 비셀파이트, 소듐 에리소르베이트, 소듐 메타비셀파이트, 소듐 설페이트, 초과산화물 불균등화효소, 소듐 티오글리콜레이트, 소르비틸 푸르푸랄, 티오디글리콜, 티오디글리콜아미드, 티오디글리콜산, 티오디프로피온산, 티오글리콜산, 티오락트산, 티오살리실산, 토크페레스-5, 토크페레스-10, 토크페레스-12, 토크페레스-18, 토크페레스-50, 토크페롤, 토크페솔란, 토크페릴 아세테이트, 토크페릴 리놀레이트, 토크페릴 니코티네이트, 토크페릴 석시네이트, 트리스(노닐페닐)포스파이트, 트롤록스, 및 잔틴을 포함한다. 특정 구체예에서, 추가의 항산화 화합물은 조성물에 0.1 wt %, 0.5 wt %, 1 wt %, 3 wt %, 5 wt % 초과 양, 또는 임의의 다른 적합한 양으로 존재한다.

[0051] 특정 구체예에서, 본 출원의 조성물은 향라디칼 화합물을 추가로 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, 향라디칼 화합물은 최종 제제에 0.1 wt %, 1 wt %, 5 wt %, 6 wt %, 8 wt %, 10 wt % 초과 양, 또는 임의의 다른 적합한 양으로 존재한다.

[0052] 본 출원은 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액 및 UV-필터링 또는 항산화 성분을 포함하는 조성물을 추가로 제공한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 UV-필터링 또는 항산화 성분의 성능을 향상시킨다. 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을 조성물에 균질하게 분포시킴으로써 활성 UV-필터링 또는 항산화 성분, 불포화 용액은 UV-필터링 또는 항산화 성분의 UV-필터링 또는 항산화 성능을 개선할 수 있다.

[0053] UV-필터 안정화제

[0054] 1 wt % 이하의 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 활성 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)과 함께 조성물에 분포될 때 독립적인 안정화제 작용을 할 수 있다. 따라서, 본 출원은 1 wt % 이하의 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴), 및 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 포함하는 조성물로서, 여기서 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)이 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 안정화하는 조성물을 제공한다. 특정 구체예에서, 초기 UV-흡수 능력의 10%, 20%, 30%, 40%, 50%, 60%, 70%, 80%, 또는 90% 초과가 UV-흡수 화합물에 대해 적어도 1 주, 적어도 2 주, 또는 적어도 3 주 동안 유지된다. 특정 구체예에서, 초기 UV-흡수 능력의 100%가 UV-흡수 화합물에 대해 적어도 1 주, 적어도 2 주, 또는 적어도 3 주 동안 유지된다. 특정 구체예에서, 초기 UV-산란 능력의 10%, 20%, 30%, 40%, 50%, 60%, 70%, 80%, 또는 90% 초과가 UV-산란 입자에 대해 적어도 1 주, 적어도 2 주, 또는 적어도 3 주 동안 유지된다. 특정 구체예에서, 초기 UV-산란 능력의 100%가 UV-산란 입자에 대해 적어도 1 주, 적어도 2 주, 또는 적어도 3 주 동안 유지된다.

[0055] 본 출원은 UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 안정화시키는 방법으로서, UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)을 1 wt % 이하의 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)과 조합하는 것을 포함하는 방법을 추가로 제공한다. 특정 구체예에서, UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자) 안정화는 적어도 1 주, 적어도 2 주, 또는 적어도 3 주 동안 UV-흡수 및/또는 UV-산란 능력의 10%, 20%, 30%, 40%, 50%,

60%, 70%, 80%, 또는 90% 초과를 유지하는 것을 포함한다.

- [0056] 특정 구체예에서, UV-필터링 물질(예를 들어 UV-흡수 화합물 또는 UV-산란 입자)은 광-불안정 화학적 UV-필터, 예를 들어 아보벤존, 옥시벤존, 옥시벤존 시녹세이트, 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥티녹세이트, 옥토크릴렌, 및/또는 트롤아민 살리실레이트를 포함한다. 이러한 UV-광 흡수 화학적 필터는 일반적으로 불안정하며 제제에서 하나 이상의 화합물 또는 물질에 의한 안정화를 필요로 한다.
- [0057] 특정 구체예에서, 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 조성물의 약 0.01-0.05 wt %, 0.1-1 wt %의 양으로 존재한다.
- [0058] 실시예 및 첨부 도면과 관련하여 아래에 설명된 바와 같이, 응집되지 않은 잔토마틴의 존재는 주위 광 및 온도에 노출 시 시판되는 UV-필터의 UVB 및 UVA 안정성 증진에 기여하는 것으로 나타났다. 잔토마틴의 불포화 용액의 존재에서 안정성 증진은 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥토크릴렌, 옥시벤존, 및 옥티녹세이트를 포함하여 테스트된 모든 화학적 필터에서 일관되었다. 10-100% UV 필터링 유지가 몇 주에 걸쳐 관찰되었다. 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을 포함하는 용액은 모사 태양광, 또는 태양광의 존재에서 UV-필터의 안정성을 또한 증진시킬 수 있다.
- [0059] UV-흡광 증진제
- [0060] 1 wt % 이하의 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 공지된 UV-흡수 화합물에 대해 UV-흡광도 증진제로서 사용될 수 있다. 따라서, 본 출원은 1 wt % 이하의 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴), 및 활성 UV-흡수 화합물을 포함하는 조성물로서, 여기서 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)이 UV-흡수 화합물의 UV-흡수 특성을 향상시키는 조성물을 제공한다. 특정 구체예에서, 조성물은 UV-B에서 UV-A 및 UV-B에서 UV-흡수 화합물의 UV-흡수 특성을 향상시킨다. 특정 구체예에서, 조성물은 UV-A에서 UV-A 및 UV-B에서 UV-흡수 화합물의 UV-흡수 특성을 향상시킨다. 특정 구체예에서, 조성물은 UV-A 및 UV-B에서 UV-A 및 UV-B에서 UV-흡수 화합물의 UV-흡수 특성을 향상시킨다.
- [0061] 본 출원은 UV-흡수 화합물의 UV-흡수 특성을 향상시키는 방법으로서, UV-흡수 화합물을 1 wt % 이하의 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염의 불포화 용액(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)과 조합하는 것을 포함하는 방법을 추가로 제공한다.
- [0062] 특정 구체예에서, 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈가르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 로도마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 조성물의 0.01-0.03 wt %, 0.1-1 wt %, 또는 0.1-1 wt %를 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)은 조성물의 0.03 wt %를 포함한다.
- [0063] 특정 구체예에서, UV-흡수 화합물은 아보벤존, 옥시벤존, 호모살레이트, 옥티살레이트, 옥티녹세이트, 옥토크릴렌, 옥시벤존 시녹세이트, 및/또는 트롤아민 살리실레이트를 포함한다. 특정 구체예에서, UV-흡수 화합물은 이산화티타늄 또는 산화아연을 포함한다.
- [0064] 0.01-0.03 wt %, 0.1-1 wt %, 0.1-1 wt %, 또는 1-10 wt % 범위의 농도의 잔토마틴의 불포화 용액의 단순 첨가는 시판되는 화학적 UV-필터의 UV-흡수 특성에서 상당한 스펙트럼 향상을 유도할 수 있다. 일 예에서, 약 0.03 wt % 잔토마틴으로 조성물에 혼입된 잔토마틴의 불포화 용액은 아보벤존의 활성을 UV-B(300 nm)에서 ~250% 및 UV-A(360 nm)에서 약 9% 증진시킬 수 있다. 이는 아보벤존의 UV-B 성능만을 각각 229% 및 393% 증진시키는 옥시벤존이 있는 아보벤존의 활성 또는 옥티녹세이트가 있는 아보벤존의 활성과 상이하다. (실시예 및 첨부 도면 참

조). UV-A 성능을 살펴보면 옥시벤존 및 옥티녹세이트는 아보벤존 성능을 각각 약 46% 및 56% 감소시킨다. 이러한 주요 차이점은 증진제로서의 잔토마틴의 중요한 능력을 강조한다.

[0065] 대안적인 UV-A 필터

[0066] 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 현재 미국에서 유일하게 승인된 화학적 UV-A 필터인 광-불안정 아보벤존에 대한 대체 UV-A 필터로서 작용할 수 있다.

[0067] 실시예 및 첨부 도면과 관련하여 아래에 설명된 바와 같이, 실험에서 옥시벤존과 함께 응집되지 않은 잔토마틴의 사용은 약 1.19의 용액 중 흡수 강도를 가졌다 (360 nm에서 측정된 0.79 강도의 아보벤존 및 옥시벤존과 비교). 이러한 경향은 옥티녹세이트와 함께 응집되지 않은 잔토마틴을 사용하여 유사하게 관찰되었고, 여기서 360 nm에서 약 0.65의 강도를 야기한 옥티녹세이트 및 아보벤존과 비교하여 용액에서 약 1.09의 강도가 달성되었다.

[0068] 항산화 증진제 및 안정화제

[0069] 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 항산화 증진제로서 작용할 수 있다. 따라서, 본 출원은 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액, 및 항산화제를 포함하는 조성물로서, 여기서 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)이 항산화제의 항산화 능력을 향상시키는 조성물을 제공한다. 특정 구체예에서, 항산화제는 비타민 E 유사체 트롤록스 또는 아스코르브산을 포함한다.

[0070] 본 출원은 항산화제의 항산화 능력을 향상시키는 방법으로서, 항산화제를 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액과 조합하는 것을 포함하는 방법을 제공한다.

[0071] 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 화장품 응용분야에서 기존 및 공지된 항산화제에 대한 직접적인 대체로서 작용할 수 있다. 따라서, 본 출원은 화장품 조성물에서 사용하기 위한 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액을 제공하고, 여기서 불포화 용액이 화장품 조성물을 위한 항산화 특성을 제공한다.

[0072] 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액은 동일한 항산화제에 대해 안정화제로서 작용할 수 있다. 따라서, 본 출원은 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴), 및 항산화제를 포함하는 조성물로서, 여기서 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)이 항산화제를 안정화시키는 조성물을 제공한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴) 및 항산화제는 조성물에 0.1:1, 0.2:1, 0.3:1, 0.4:1, 0.5:1, 0.6:1, 0.7:1, 0.8:1, 0.9:1, 또는 1:1 몰비로 존재한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴) 및 항산화제는 조성물에 2:1, 3:1, 4:1, 5:1, 6:1, 7:1, 8:1, 9:1, 또는 10:1 몰비로 존재한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 페녹사존 및/또는 페녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체,

또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴) 및 항산화제는 조성물에 1:1 몰비로 존재한다. 특정 구체예에서, 항산화제는 비타민 E 유사체 트롤록스 또는 아스코르브산을 포함한다. 예를 들어, 트롤록스 및 잔토마틴과 같은 약 1:1 비타민 E 유사체의 조성물은 항산화제 안정성이 높아진 증거를 보여준다. 유사하게, 1:1 아스코르브산 및 잔토마틴의 조성물은 항산화제 안정화를 또한 보여준다.

[0073] 본 출원은 항산화제의 항산화 능력을 유지하는 방법으로서, 항산화제를 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염(예를 들어 잔토마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 어느 하나의 염, 예컨대 암모늄 잔토마틴)의 불포화 용액과 조합하는 것을 포함하는 방법을 제공한다. 특정 구체예에서, 항산화제의 항산화 능력의 100%가 적어도 1 주 동안 유지된다. 특정 구체예에서, 항산화제의 항산화 능력의 적어도 30%, 적어도 40%, 적어도 50%, 적어도 60%, 적어도 70%, 적어도 80%, 또는 적어도 90%가 적어도 1 주 동안 유지된다.

[0074] 상기 방법 및 조성물의 특정 구체예에서, 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 잔토마틴, 탈카르복실화 잔토마틴, 고리화되지 않은 잔토마틴, 오마틴 D, 디하이드록시-잔토마틴, 로도마틴, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염을 포함한다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 폐녹사존 및/또는 폐녹사진 화합물, 이의 전구체 또는 유도체, 또는 상기 중 임의의 것의 염은 조성물의 0.01-1 wt %, 1-5 wt %, 1-10 wt %, 50 wt %, 또는 최대 75%를 포함한다.

[0075] 하기 및 첨부 도면에서 설명된 바와 같이, 표준 산소 라디칼 항산화 능력(ORAC) 분석을 사용하여 37 °C에서 90 분에 걸친, 잔토마틴 단독 및 등몰 아스코르브산(비타민 C) 또는 트롤록스(비타민 E 유사체)와 혼합된 잔토마틴의 불포화 용액의 항산화 능력 및 성능 실험에서 항산화제 안정화/증진 효과가 관찰되었다. ORAC 분석은 퍼옥실 라디칼에 의해 플루오레세인 프로브의 산화를 기반으로 생체분자의 항산화 능력을 측정한다 (항산화 능력이 감소함에 따라 형광이 감소한다). 모든 경우에, 불포화 용액 중의 잔토마틴은 공지된 항산화제 표준(트롤록스 및 비타민 C)에 필적하는 항산화 능력을 제공했다. 이러한 발견은 최고 농도(40 μM) 조건에 대한 비교 가능한 곡선 아래 면적(AUC) 계산에 의해 뒷받침된다.

[0076] 화장료 또는 피부과 제제

[0077] 본 출원은 본원에 개시된 바와 같은 조성물을 포함하는 화장료 또는 피부과 제제를 제공한다.

[0078] 특정 구체예에서, 본원에 개시된 바와 같은 조성물을 포함하는 화장료 또는 피부과 제제는 유변성 조절제를 추가로 포함한다. 특정 구체예에서, 유변성 조절제는 피부에 도포한 후 조성물의 현저한 흘러내림(dripping) 또는 뭉침(pooling)을 방지하는 양으로 존재한다. 특정 구체예에서, 유변성 조절제는 카보머이다. 일부 구체예에서, 유변성 조절제는 스테아르산, 팔미트산, 스테아릴 알코올, 세틸 알코올, 베헤닐 알코올, 스테아르산, 팔미트산, 평균 약 1 내지 약 21 개의 에틸렌 옥사이드 단위체를 갖는 스테아릴 알코올의 폴리에틸렌 글리콜 에테르, 평균 약 1 내지 약 5 개의 에틸렌 옥사이드 단위체를 갖는 세틸 알코올의 폴리에틸렌 글리콜 에테르, 및 이들의 혼합물로부터 선택된다.

[0079] 유변성 조절제의 추가 예는 조성물의 점도를 증가시킬 수 있는 물질을 포함하는 증점제 또는 겔화제를 포함한다. 증점제는 조성물 내의 활성 성분의 효능을 실질적으로 변경하지 않고 조성물의 점도를 증가시킬 수 있는 것을 포함한다. 증점제는 또한 본 출원의 조성물의 안정성을 증가시킬 수 있다. 본 출원의 특정 양태에서, 증점제는 수소화 폴리이소부텐 또는 트리하이드록시 스테아린, 또는 두 가지 모두의 혼합물을 포함한다. 본 출원의 맥락에서 사용될 수 있는 추가 증점제의 추가 비제한적 예는 카르복실산 중합체, 가교된 폴리아크릴레이트 중합체, 폴리아크릴아미드 중합체, 다당류, 및 겔을 포함한다. 카르복실산 중합체의 예는 아크릴산, 치환된 아크릴산, 및 이들 아크릴산 및 치환된 아크릴산의 염 및 에스테르로부터 유도된 하나 이상의 단량체를 포함하는 가교된 화합물을 포함하고, 여기서 가교제는 두 개 이상의 탄소-탄소 이중 결합을 포함하고 다가 알코올로부터 유도된다 (CTFA International Cosmetic Ingredient Dictionary, Fourth Edition, 1991, pp. 12 및 80 참조). 시판되는 카르복실산 중합체의 예는 수크로스 또는 펜타에리트리톨의 알릴 에테르와 가교된 아크릴산의 동중중합체인 카보머를 포함한다 (예를 들어 B. F. Goodrich의 Carbopol™ 900 시리즈). 가교된 폴리아크릴레이트 중합체의 비제한적 예는 양이온성 및 비이온성 중합체를 포함한다.

[0080] 폴리아크릴아미드 중합체(치환된 분지형 또는 비분지형 중합체를 포함하는 비이온성 폴리아크릴아미드 중합체 포함)의 비제한적 예는 폴리아크릴아미드, 이소과라핀 및 라우레스-7, 아크릴아미드 및 치환된 아크릴아미드와 아크릴산 및 치환된 아크릴산의 다중 블록 공중합체를 포함한다.

[0081] 다당류의 비제한적 예는 셀룰로스, 카르복시메틸 하이드록시에틸셀룰로스, 셀룰로스 아세테이트 프로피오네이트

카르복실레이트, 하이드록시에틸셀룰로스, 하이드록시에틸 에틸셀룰로스, 하이드록시프로필 셀룰로스, 하이드록시프로필 메틸셀룰로스, 메틸 하이드록시에틸셀룰로스, 미정질 셀룰로스, 소듐 셀룰로스 설페이트, 및 이들의 혼합물을 포함한다. 또 다른 예는 알킬 치환된 셀룰로스이고 여기서 셀룰로스 중합체의 하이드록시기가 하이드록시알킬화(바람직하게는 하이드록시 에틸화 또는 하이드록시프로필화)되어 하이드록시알킬화 셀룰로스를 형성하고 이는 이후 에테르 결합을 통해 C10-C30 직쇄 또는 분지쇄 알킬기로 추가로 변형된다. 전형적으로 이들 중합체는 C10-C30 직쇄 또는 분지쇄 알코올과 하이드록시알킬셀룰로스의 에테르이다. 다른 유용한 다당류는 세 개의 단위체마다 (1-3) 연결된 글루코스 단위체와 (1-6) 연결된 글루코스의 선형 사슬을 포함하는 스큐레로글루칸을 포함한다.

[0082]

본 발명의 조성물과 함께 사용될 수 있는 검의 비제한적 예는 아카시아, 한천, 알긴, 알긴산, 암모늄 알지네이트, 아밀로펙틴, 칼슘 알지네이트, 칼슘 카라기난, 카르니틴, 카라기난, 텍스트린, 젤라틴, 젤란 검, 구아 검, 구아 하이드록시프로필트리모늄 클로라이드, 헥토라이트, 하이알루론산, 수화 실리카, 하이드록시프로필키토산, 하이드록시프로필 구아, 카라야 검, 다시마, 로커스트 콩 검, 나토 검, 포타슘 알지네이트, 포타슘 카라기난, 프로필렌 글리콜 알지네이트, 스큐레로티움 검, 소듐 카르복시메틸 텍스트란, 소듐 카라기난, 트라가칸트 검, 잔탄 검, 및 이들의 혼합물을 포함한다. 일 구체예에서, 증점제는 콘드루스 크리스푸스(카라기난) 추출물이다.

[0083]

특정 구체예에서, 본원에 개시된 바와 같은 조성물을 포함하는 화장품 또는 피부과 제제는 보습제(예를 들어 습윤제)를 추가로 포함한다. 본 출원의 화장품 또는 피부과 제제에서 사용될 수 있는 보습제의 예는 아미노산, 콘드로이틴 설페이트, 디글리세린, 에리트리톨, 프럭토스, 글루코스, 글리세린, 글리세롤 중합체, 글리콜, 1,2,6-헥산트리올, 꿀, 하이알루론산, 수소화 꿀, 수소화 전분 가수분해물, 이노시톨, 락티톨, 말티톨, 말토스, 만니톨, 천연 보습 인자, PEG-15 부탄디올, 폴리글리세릴 소르비톨, 피폴리돈 카르복실산의 염, 포타슘 PCA, 프로필렌 글리콜, 소듐 글루쿠로네이트, 소듐 PCA, 소르비톨, 수크로스, 트레할로스, 우레아, 및 자일리톨을 포함한다. 일 구체예에서, 보습제는 글리세린이다. 다른 예는 아세틸화 라놀린, 아세틸화 라놀린 알코올, 알라닌, 조류 추출물, 알로에 바르바덴시스, 알로에-바르바덴시스 추출물, 알로에 바르바덴시스 겔, 알테아 오피시날리스 추출물, 살구(프루누스 아르메니아카) 씨 오일, 아르기닌, 아르기닌 아스파테이트, 아르니카 몬타나 추출물, 아스파르트산, 아보카도(페르세아 그라티시마) 오일, 장벽 스펅고지질, 부틸 알코올, 밀랍, 베헤닐 알코올, 베타-시토스테롤, 자작나무(베틀라 알바) 껍질 추출물, 보리지(보리지 오피시날리스) 추출물, 부차브롬(루스쿠스 아쿨레아투스) 추출물, 부틸렌 글리콜, 카렌둘라 오피시날리스 추출물, 카렌둘라 오피시날리스 오일, 칸데틸라(유포르비아 세리페라) 왁스, 카놀라 오일, 카프릴릭/카프릭 트리글리세라이드, 카다몬(엘레타리아 카다모姆) 오일, 카나우바(코페르니시아 세리페라) 왁스, 당근(다우쿠스 카로타 사티바) 오일, 피마자(리시누스 코뮤니스) 오일, 세라마이드, 세레신, 세테아레스-5, 세테아레스-12, 세테아레스-20, 세테아릴 옥타노에이트, 세테스-20, 세테스-24, 세틸 아세테이트, 세틸 옥타노에이트, 세틸 팔미테이트, 카모마일(안테미스 노빌리스) 오일, 콜레스테롤, 콜레스테롤 에스테르, 콜레스테릴 하이드록시스테아레이트, 시트르산, 클라리(살비아 스클라레아) 오일, 코코아(테오브로마 카카오) 버터, 코코-카프릴레이트/카프레이트, 코코넛(코코스 누시페라) 오일, 콜라겐, 콜라겐 아미노산, 옥수수(제아 메이스) 오일, 지방산, 데실 올레이트, 디메티콘 코폴리올, 디메티코놀, 디옥틸 아디페이트, 디옥틸 석시네이트, 디펜타에리트리톨 헥사카프릴레이트/헥사카프레이트, DNA, 에리트리톨, 에톡시디글리콜, 에틸 리놀레이트, 유칼립투스 글루볼루스 오일, 달맞이꽃(오에노테라 비엔니스) 오일, 지방산, 제라늄 마쿨라툼 오일, 글루코사민, 글루코스 글루타메이트, 글루탐산, 글리세레스-26, 글리세린, 글리세롤, 글리세릴 디스테아레이트, 글리세릴 하이드록시스테아레이트, 글리세릴 라우레이트, 글리세릴 리놀레이트, 글리세릴 미리스테이트, 글리세릴 올레이트, 글리세릴 스테아레이트, 글리세릴 스테아레이트 SE, 글리신, 글리콜 스테아레이트, 글리콜 스테아레이트 SE, 글리코사미노글리칸, 포도(비티스 비니페라) 씨 오일, 헤이즐(코릴루스 아메리카나) 넛 오일, 헤이즐(코릴루스 아벨라나) 넛 오일, 헥실렌 글리콜, 하이알루론산, 혼성 홍화(카르타무스 틱토토리우스) 오일, 수소화 피마자유, 수소화 코코-글리세라이드, 수소화 코코넛 오일, 수소화 라놀린, 수소화 레시틴, 수소화 팜 글리세라이드, 수소화 팜 커널 오일, 수소화 대두유, 수소화 우지 글리세라이드, 수소화 식물성 오일, 가수분해 콜라겐, 가수분해 엘라스틴, 가수분해 글리코사미노글리칸, 가수분해 케라틴, 가수분해 대두 단백질, 하이드록실화 라놀린, 하이드록시프로판, 이소세틸 스테아레이트, 이소세틸 스테아로일 스테아레이트, 이소데실 올레이트, 이소프로필이소스테아레이트, 이소프로필 라놀레이트, 이소프로필 미리스테이트, 이소프로필 팔미테이트, 이소프로필 스테아레이트, 이소스테아르아미드 DEA, 이소스테아르산, 이소스테아릴 락테이트, 이소스테아릴 네오펜타노에이트, 자스민(자스미눔 오피시날레) 오일, 호호바(북수스 치넨시스) 오일, 다시마, 쿠쿠이(알레우리테스 몰루카나) 넛 오일, 락타미드 MEA, 라네스-16, 라네스-10 아세테이트, 라놀린, 라놀린산, 라놀린 알코올, 라놀린 오일, 라놀린 왁스, 라벤더(라반둘라 안구스티폴리아) 오일, 레시틴, 레몬(시트루스 메디카 리모눔) 오

일, 리놀레산, 리놀렌산, 마카다미아 테르니폴리아 넷 오일, 말티톨, 마트리카리아(카모밀라 레쿠티타) 오일, 메틸 글루코스 세스퀴스테아레이트, 메틸실라놀 PCA, 미네랄 오일, 밍크 오일, 모르티에렐라 오일, 미리스틸 락테이트, 미리스틸 미리스테이트, 미리스틸 프로피오네이트, 네오펜틸 글리콜 디카프릴레이트/디카프레이트, 옥틸도데카놀, 옥틸도데실 미리스테이트, 옥틸도데실 스테아로일 스테아레이트, 옥틸 하이드록시스테아레이트, 옥틸 팔미테이트, 옥틸 살리실레이트, 옥틸 스테아레이트, 올레산, 올리브(올레아 유로파에) 오일, 오렌지(시트루스 아우란티움 두르투스) 오일, 팜(엘라에이스 기넨시스) 오일, 팔미트산, 판테틴, 판테놀, 판테닐 에틸 에테르, 파라핀, PCA, 복숭아(프루누스 페르시카) 씨 오일, 땅콩(아라키스 히포가에아) 오일을 포함한다. 보습제의 추가 비제한적 예는 PEG-8 C12-18 에스테르, PEG-15 코카민, PEG-150 디스테아레이트, PEG-60 글리세릴이소스테아레이트, PEG-5 글리세릴 스테아레이트, PEG-30 글리세릴 스테아레이트, PEG-7 수소화 피마자유, PEG-40 수소화 피마자유, PEG-60 수소화 피마자유, PEG-20 메틸 글루코스 세스퀴스테아레이트, PEG40 소르비탄 퍼올레이트, PEG-5 대두 스테롤, PEG-10 대두 스테롤, PEG-2 스테아레이트, PEG-8 스테아레이트, PEG-20 스테아레이트, PEG-32 스테아레이트, PEG40 스테아레이트, PEG-50 스테아레이트, PEG-100 스테아레이트, PEG-150 스테아레이트, 펜타데칼락톤, 페퍼민트(멘타 피페리타) 오일, 페트콜라툼, 인지질, 폴리아미노 당 추출물, 폴리글리세릴-3 디이소스테아레이트, 폴리쿼터늄-24, 폴리소르베이트 20, 폴리소르베이트 40, 폴리소르베이트 60, 폴리소르베이트 80, 폴리소르베이트 85, 포타슘 미리스테이트, 포타슘 팔미테이트, 프로필렌 글리콜, 프로필렌 글리콜 디카프릴레이트/디카프레이트, 프로필렌 글리콜 디옥타노에이트, 프로필렌 글리콜 디셀라고네이트, 프로필렌 글리콜 라우레이트, 프로필렌 글리콜 스테아레이트, 프로필렌 글리콜 스테아레이트 SE, PVP, 피리독신 디팔미테이트, 레티놀, 레티놀 팔미테이트, 쌀(오리자 사티바)겨 오일, RNA, 로즈마리(로즈마리누스 오피시날리스) 오일, 장미 오일, 홍화(카르타무스 틱토리우스) 오일, 세이지(살리바 오피시날리스) 오일, 백단향(산탈룸 알BUM) 오일, 세린, 혈청 단백질, 참깨(세사뭉 인디쿰) 오일, 시어 버터(부티로스페르뭉 파르키), 실크 분말, 소듐 콘드로이틴 설페이트, 소듐 하이알루로네이트, 소듐 락테이트, 소듐 팔미테이트, 소듐 PCA, 소듐 폴리글루타메이트, 가용성 콜라겐, 소르비탄 라우레이트, 소르비탄 올레이트, 소르비탄 팔미테이트, 소르비탄 세스퀴올레이트, 소르비탄 스테아레이트, 소르비톨, 대두(글리신 소자) 오일, 스펅고지질, 스쿠알렌, 스쿠알렌, 스테아르아미드 MEA-스테아레이트, 스테아르산, 스테아록시 디메티콘, 스테아록시트리메틸실란, 스테아릴 알코올, 스테아릴 글리시레티네이트, 스테아릴 헵타노에이트, 스테아릴 스테아레이트, 해바라기(헬리안투스 아누스) 씨 오일, 스위트 아몬드(프루누스 아미그달루스 둘시스) 오일, 합성 밀랍, 토코페롤, 토코페릴 아세테이트, 토코페릴 리놀레이트, 트리베헨인, 트리데실 네오펜타노에이트, 트리데실 스테아레이트, 트리에타놀아민, 트리스테아린, 우레아, 식물성 오일, 물, 왁스, 밀(트리피쿰 불가레) 배아 오일, 및 일랑(카낭가 오도라타) 오일을 포함할 수 있다. 일 구체예에서, 보습제는 알란토인일 수 있다.

[0084] 특정 구체예에서, 본원에 개시된 바와 같은 조성물을 포함하는 화장료 또는 피부과 제제는 보존제를 추가로 포함한다. 특정 구체예에서, 보존제는 4차 암모늄 보존제, 예컨대 폴리쿼터늄-1 및 벤잘코늄 할라이드(예를 들어 벤잘코늄 클로라이드("BAC") 및 벤잘코늄 브로마이드), 파라벤(예를 들어 메틸파라벤 및 프로필파라벤), 페녹시에탄올, 에틸헥실글리세린, 에틸헥실글리세린벤질 알코올, 클로로부탄올, 페놀, 소르브산, 티메로살 및 이들의 조합 중 하나 이상으로부터 선택된다.

[0085] 특정 구체예에서, 본원에 개시된 바와 같은 조성물을 포함하는 화장료 또는 피부과 제제는 국소 사용을 위한 화장료 제제 또는 약제 제조에서 일반적으로 사용되는 부형제, 예컨대 살균제, 안정화제, 유화제, 완충제, 습윤제, 착색제, 및 화장료/약제 제조 기술에서 일반적으로 사용되는 기타 부형제를 추가로 포함할 수 있다.

[0086] 특정 구체예에서, 본원에 개시된 바와 같은 조성물을 포함하는 화장료 또는 피부과 제제는 하나 이상의 유화제를 추가로 포함한다. 그러한 특정 구체예에서, 유화제는 상 사이의 계면 장력을 감소시키고 제제화 및 에멀전의 안정성을 개선한다. 유화제는 비이온성 유화제, 음이온성 유화제, 양이온성 유화제, 쯔비터이온성 유화제 또는 이들의 조합을 포함할 수 있다. 유화제의 비제한적 예는 글리세린의 에스테르, 프로필렌 글리콜의 에스테르, 폴리에틸렌 글리콜의 지방산 에스테르, 폴리프로필렌 글리콜의 지방산 에스테르, 소르비톨의 에스테르, 소르비탄 무수물의 에스테르, 카르복실산 공중합체, 글루코스의 에스테르 및 에테르, 에톡시화 에테르, 에톡시화 알코올, 알킬 포스페이트, 폴리옥시에틸렌 지방 에테르 포스페이트, 지방산 아마이드, 아실 락틸레이트, 비누, TEA 스테아레이트, DEA 올레스-3 포스페이트, 폴리에틸렌 글리콜 20 소르비탄 모노라우레이트(폴리소르베이트 20), 폴리에틸렌 글리콜 5 대두 스테롤, 스테아레스-2, 스테아레스-20, 스테아레스-21, 세테아레스-20, PPG-2 메틸글루코스 에테르 디스테아레이트, 세테스 10, 폴리소르베이트 80, 세틸 포스페이트, 포타슘 세틸 포스페이트, 디에탄올아민 세틸 포스페이트, 폴리소르베이트 60, 글리세릴 스테아레이트, PEG-100 스테아레이트, 및 이들의 혼합물을 포함한다. 일 구체예에서, 비이온성 유화제는 세테아릴 올리베이트 또는 소르비탄 올리베이트이다.

- [0087] 특정 구체예에서, 본원에 개시된 바와 같은 조성물은 사용 전에 하나 이상의 추가 화장료 조성물과 조합된다. 특정 구체예에서, 하나 이상의 추가 화장료 조성물은 알파 및 베타 하이드록시산, 아미노산, 펩티드, 매트릭스 단백질, 성장 인자, 줄기 세포 활성화제, 에스트로겐, 항안드로겐, 및 피부 미백제로부터 선택된 하나 이상의 제제를 포함한다. 본원에 개시된 바와 같은 조성물이 사용 전에 하나 이상의 추가 화장료 조성물과 조합되는 본 출원의 특정 구체예에서, 하나 이상의 추가 화장료 조성물은 하나 이상의 화장료 성분을 포함한다. CTFA International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook (2004 및 2008)에 설명된 다양한 비제한적 화장료 성분이 사용될 수 있다. 화장료 성분의 비제한적 예는 향료(인공 및 천연), 염료 및 색소 성분(예를 들어 Blue 1, Blue 1 Lake, Red 40, 이산화티타늄, D&C blue no. 4, D&C green no. 5, D&C orange no. 4, D&C red no. 17, D&C red no. 33, D&C violet no. 2, D&C yellow no. 10, 및 D&C yellow no. 11), 흡착제, 윤활제, 용매, 보습제(예를 들어 연화제, 습윤제, 필름 형성제, 밀폐제, 및 피부의 자연 보습 메커니즘에 영향을 미치는 제제 포함), 발수제, UV 흡수제(물리적 및 화학적 흡수제, 예컨대 파라미노벤조산("PABA") 및 상응하는 PABA 유도체, 이산화티타늄, 산화아연 등), 에센셜 오일, 비타민(예를 들어 A, B, C, D, E, 및 K), 미량 금속(예를 들어 아연, 칼슘 및 셀레늄), 항자극제(예를 들어 스테로이드 및 비스테로이드성 항염증제), 식물 추출물(예를 들어 알로에 베라, 카모마일, 오이 추출물, 은행잎, 인삼, 및 로즈마리), 항균제, 항산화제(예를 들어 BHT 및 토코페롤), 킬레이트제(예를 들어 디소듐 EDTA 및 테트라소듐 EDTA), 보존제(예를 들어 메틸파라벤 및 프로필파라벤), pH 조정제(예를 들어 소듐 하이드록사이드 및 시트르산), 흡수제(예를 들어 알루미늄 전분 옥테닐석시네이트, 카오린, 옥수수 전분, 귀리 전분, 시클로덱스트린, 탈크 및 제올라이트), 피부 표백제 및 미백제(예를 들어 하이드로퀴논 및 니아신아미드 락테이트), 습윤제(예를 들어 소르비톨, 우레아 및 만니톨), 각질제거제, 방수제(예를 들어 마그네슘/알루미늄 하이드록사이드 스테아레이트), 피부 컨디셔닝제(예를 들어 알로에 추출물, 알란토인, 비사보롤, 세라마이드, 디메티콘, 하이알루론산, 및 디포타슘 글리시리제이트)를 포함한다.
- [0088] 본 출원의 특정 구체예에서, 본원에 개시된 바와 같은 조성물은 사용 전에 하나 이상의 국소 피부과 약물 조성물과 조합된다. 그러한 특정 구체예에서, 약학적 활성제는 항여드름제, 장미증 치료에 사용되는 제제, 진통제, 마취제, 항문직장제, 항히스타민제, 비스테로이드성 항염증제 약물을 포함하는 항염증제, 항생제, 항진균제, 항바이러스제, 항미생물제, 항암 활성제, 움약, 살충제, 항신생물제, 발한억제제, 항소양제, 항건선제, 항지루제, 생물학적 활성 단백질 및 펩티드, 화상 치료제, 소작제, 탈색제, 제모제, 기저귀 발진 치료제, 효소, 모발 성장 자극제, 에플로르니틴 및 이의 염 및 유사제를 포함하는 모발 성장 지연제, 지혈제, 각질용해제, 구내염 치료제, 입술 발진 치료제, 치아 및 치주 치료제, 감광성 활성제, 피부 보호제/장벽제, 호르몬 및 코르티코스테로이드를 포함하는 스테로이드, 일광 화상 치료제, 선스크린, 경피 활성제, 비강 활성제, 질 활성제, 사마귀 치료제, 상처 치료제, 상처 치유제 등으로부터 선택된다.
- [0089] 전술한 내용은 단지 본 발명의 원리를 예시한 것일 뿐이며, 장치는 제한이 아니라 설명의 목적으로 제시된 설명된 구현 이외의 다른 구현에 의해 실행될 수 있다. 본 개시내용을 검토한 후 당업자는 변형 및 수정을 할 것이다. 개시된 특징은 본 명세서에 기술된 하나 이상의 다른 특징과 임의의 조합 및 하위 조합(여러 종속 조합 및 하위 조합 포함)으로 구현될 수 있다. 임의의 구성요소를 포함하여 상기 설명되거나 예시된 다양한 특징은 다른 시스템, 조성물 및 제제에 결합되거나 통합될 수 있다. 또한 특정 특징이 생략되거나 구현되지 않을 수 있다.
- [0090] 변화, 치환 및 변경의 예는 당업자에 의해 확인될 수 있고 본원에 개시된 정보의 범위를 벗어나지 않고 이루어질 수 있다. 여기에 인용된 모든 참조문헌은 그 전체가 참고문헌으로 포함되며 본 출원의 일부가 된다.
- [0091] 예시
- [0092] 이제 일반적으로 설명되는 본 발명은 첨부 도면에 기록된 결과를 참조하여 다음 실시예를 참조함으로써 더 쉽게 이해될 것이며, 이는 본 발명의 특정 양태 및 구체예의 설명의 목적으로만 포함되며 본 발명을 제한하려는 것이 아니다.
- [0093] 실시예 1: 잔토마틴의 항산화 특성
- [0094] 불포화 용액 중의 암모늄 잔토마틴(본원에서 "잔토마틴"으로 지칭됨)의 항산화 특성을 공지된 표준 항산화제와 비교했다. 실험 결과는 잔토마틴과 비교하여 공지된 항산화제인 트롤록스(비타민 E 유사체) 및 아스코르브산에 대해 시간(초 단위) 경과에 따른 상대 형광 값(RFU)을 도시하는 도 1-3에 제공된다. 10, 20, 및 40 μM 트롤록스, 아스코르브산, 및 암모늄 잔토마틴("Xa")을 사용하여 실험을 수행하고 1:1 트롤록스: Xa(20 μM : 20 μM 및 40 μM : 40 μM) 및 1:1 아스코르브산: Xa(20 μM : 20 μM 및 40 μM : 40 μM)의 성능과 비교했다.
- [0095] 도 1은 트롤록스 및 1:1 트롤록스: 잔토마틴의 성능을 도시한다. 도 2는 아스코르브산 및 1:1 아스코르브산: 잔

토마틴의 성능을 도시한다. 도 3은 잔토마틴 단독을 도시한다. 모든 경우에, 잔토마틴은 불포화 용액 중의 응집되지 않은 잔토마틴 분자 형태였다. 도 1은 1:1 비율의 대 잔토마틴이 20 μM 이상의 농도로 트롤록스만을 함유하는 조성물과 비교하여 시간 경과에 따라 더 느린 RFU 감소를 가짐을 보여준다. 조성물 중 잔토마틴의 존재는 트롤록스의 분해를 지연시킨다. 유사하게, 도 2에 도시된 바와 같이, 도 3에서 아스코르브산 대 잔토마틴의 1:1 비율은 더 긴 시간 동안 더 높은 RFU 값을 유지하여, 비슷한 농도에서 아스코르브산 단독에 비해 더 느린 RFU 값 감소 및 지연된 분해를 야기했다. 도 3은 10, 20 및 40 μM 의 농도의 잔토마틴이 도 1 및 2의 조성물에 비해 더 긴 시간 동안 높은 RFU 값을 유지함을 보여준다. 항산화제 단독을 포함하는 조성물과 유사한 활성 수준이 잔토마틴을 포함하는 조성물에서 발견되었다. 또한, 잔토마틴은 공지된 표준 항산화제 단독의 조성물과 비교할 때 더 긴 수명을 제공하는, 시간 경과에 따른 항산화제 분해 지연 능력을 입증했다.

표 1은 도 1-3에 제시된 데이터에 대한 곡선 아래 면적(AUC)의 계산 결과를 보여준다.

표 1: AUC의 비교

표 1

	AUC
트롤록스 단독, 40 μM	55
AA 단독, 40 μM	55
XA 단독, 40 μM	56
트롤록스:XA 40:40	55
트롤록스:XA 20:20	50
아스코르브산:XA 40:40	54
아스코르브산:XA 20:20	55
블랭크	11

결과는 잔토마틴이 비타민 c 및 비타민 e와 비슷한 활성을 가짐을 보여준다.

실시예 2: 잔토마틴의 UV-필터 안정화 특성

잔토마틴의 불포화 용액의 UV-필터 안정화 특성을 시간 경과에 따른 UV-필터 안정화제의 거동을 잔토마틴과 조합된 UV-필터 안정화제와 비교하여 조사했다. 도 4-8에 나타난 바와 같이, 옥시벤존(도 4A 및 4B), 아보벤존(도 5A 및 5B), 옥티살레이트 및 호모살레이트(도 6A 및 6B), 옥티녹세이트(도 7A 및 7B) 및 옥토크릴렌(도 8A 및 8B)을 포함하는 용액에 잔토마틴의 불포화 용액을 첨가하는 것은 화학적 UV 필터 단독에 비해 1 일차에 UV 흡수를 약 240 내지 약 310 nm 증가시켰다. 16 일차에, 화학적 UV 필터와 함께 잔토마틴을 포함하는 제제의 UV 흡수 프로파일은 1 일차 UV 흡수 프로파일과 더욱 유사하며 화학적 UV 필터 단독보다 UV 스펙트럼 전체에서 더 높은 UV 흡수를 나타낸다. 따라서, 화학적 UV 필터 옥시벤존, 아보벤존, 옥티살레이트 및 호모살레이트, 옥티녹세이트, 및 옥토크릴렌과 함께 제제에서 약 0.01 wt %의 잔토마틴의 존재는 화학적 UV 필터의 UV 흡수 특성을 향상시키고 시간이 지남에 따라 화학적 UV 필터를 안정화시킨다.

실시예 3: 잔토마틴의 UV-증진 특성

도 9-11은 화학적 UV 필터 옥티녹세이트, 아보벤존, 및 옥시벤존, 단독, 아보벤존과의 조합, 및 불포화 용액 중의 잔토마틴 소분자(0.03 wt %)와의 조합의 UV 흡수 거동을 보여준다. 표 2-4는 다양한 조합의 성능 변화를 보여준다.

표 2: 옥티녹세이트와 잔토마틴의 UV 흡수 거동 변화

표 2

	310 nm	성능 변화 (%)	360 nm	성능 변화 (%)
옥시녹스대조군	2.53		0	
옥시녹스 + Xa	1.94	-23	1.09	109%

표 3: 다양한 조합에서 아보벤존 UV 흡수 거동 변화

표 3

	300 nm	성능 변화 (%)	360 nm	성능 변화 (%)
아보 대조군	0.31		1.49	
아보+ Xa	1.13	264	1.63	9
아보+ 옥시	1.02	229	0.79	-46
아보+ 옥티녹스	1.53	393	0.65	-56

표 4: 옥시벤존과 잔토마틴의 UV 흡수 거동 변화

표 4

	290 nm	성능 변화 (%)	360 nm	성능 변화 (%)
옥시 대조군	2		0.31	
옥시 + Xa	1.78	-11	1.19	283

옥티녹세이트, 아보벤존, 및 옥시벤존을 포함하는 조성물에 잔토마틴을 첨가하는 것은 조성물의 UV 흡수 프로파일을 변경하고 UV 스펙트럼에 걸쳐 제제의 UV 흡수를 증가시킨다. 옥티녹세이트 또는 옥시벤존과 잔토마틴 분자의 조합은 아보벤존이 있는 동일한 UV 필터보다 더 큰 UV 흡수를 나타낸다. 0.03 wt %의 잔토마틴의 존재는 일부 경우에 옥티녹세이트 및 옥시벤존의 UVB 흡수력을 250% 초과까지 향상시키는 것으로 나타났다. 동일한 양의 잔토마틴의 존재는 아보벤존의 성능을 최대 109%까지 증진시켰다. 따라서, 잔토마틴의 불포화 용액은 아보벤존에 대한 대체제로서 기능을 할 수 있고 다른 필터의 UVB 흡수력을 향상시킬 수도 있다.

실시예 4: 화학적 선스크린 및 미네랄 선스크린

화학적 선스크린을 표 5에 요약된 성분으로 제조했다.

표 5: 화학적 선스크린

표 5

활성 성분	대조군	잔토마틴 샘플
에틸헥실 메톡시신나메이트 (옥티녹세이트)	7.0%	7.0%
옥토크릴렌	10%	10%
호모살레이트	15%	15%
아보벤존	3.0%	3.0%
암모늄 잔토마틴	0%	0.1%

구체적으로, 위에 나타난 대조군 화학적 선스크린을 아래 표 6에 제공된 전체 성분 목록으로 제조했다. 메인 비커에서 디소듐 EDTA를 물에 가용화하여 상 A를 제조했다. 비커를 75 °C로 가열했다. 용액을 교반하고 C10-C30 알킬 아크릴레이트 교차중합체를 천천히 첨가하고 대부분의 물질이 용액에 분산될 때까지 혼합한다. C10-C30 알킬 아크릴레이트 교차중합체가 통합된 후, 모든 교차중합체가 혼합물 전체에 고르게 분산될 때까지 용액을 혼합했다. 별도의 비커에 상 B 성분 4-9을 측정하여 넣고 60 °C로 가열하여 상 B를 제조했다. 모든 성분 및 왁스가 녹고 혼합되도록 혼합물을 교반했다. 상 B 성분 10-12를 개별 용기에 첨가하고 상 B 비커에 개별적으로 천천히 첨가하여, 각 성분이 고르게 분산되도록 했다. 모두 혼입될 때, 상 B를 상 A에 첨가하고 잘 혼합했다. 교반을 증가시켜 배치를 완전히 유화시켰다. 이후 혼합을 계속하며 배치를 냉각했다. 상 C를 배치에 첨가하고 통합을 보장하도록 잘 혼합했다. 50 °C에서 소듐 하이드록사이드를 배치에 첨가했다. 이후 배치를 혼합물에서 제거하고 4 분 동안 균질화했다. 이후 배치가 실온에 도달할 때까지 혼합을 계속했다.

표 6: 대조군 화학적 선스크린

표 6

	상	성분명	기능	중량 %
1	A	탈이온수		42.980
2	A	디소듐 EDTA	킬레이트제	0.020
3	A	아크릴레이트/C10-30 알킬 아크릴레이트 교차중합체	질감 향상제	0.300
4	B	세테아릴 알코올	유화제	5.000
5	B	C12-15 알킬 벤조에이트	연화제	8.000
6	B	이소프로필 미리스테이트	연화제	5.000
7	B	에틸헥실 메톡시신나메이트 (옥티녹세이트)	UV 필터	7.000
8	B	옥토크릴렌	UV 필터	10.000
9	B	호모살레이트	UV 필터	15.000
10	B	아보벤존	UV 필터	3.000
11	B	포타슘 세틸 포스페이트 (Amphisol K)	유화제	1.200
12	B	글리세릴 스테아레이트	유화제/증점제	1.000
13	C	페녹시에탄올	보존제	1.000
14	D	소듐 하이드록사이드 30% 용액	pH 조정제	0.500
		총계		100.000

[0117]

위에 나타난 암모늄 잔토마틴을 함유하는 화학적 선스크린을 아래 표 7에 제공된 전체 성분 목록으로 제조했다. 구체적으로, 메인 비커에서 디소듐 EDTA를 물에 가용화하고 75 °C로 가열하여 상 A를 제조했다. 용액을 교반하고 C10-C30 알킬 아크릴레이트 교차중합체를 천천히 첨가하고 대부분의 물질이 용액에 분산될 때까지 혼합한다. C10-C30 알킬 아크릴레이트 교차중합체가 통합된 후, 암모늄 잔토마틴을 첨가하고 분산될 때까지 혼합했고 교차중합체는 혼합물 전체에 고르게 분산되었다. 상 B 성분 5-10을 별도의 비커에 첨가하고, 60 °C로 가열하고, 모든 성분 및 왁스가 녹고 혼합되도록 교반했다. 혼합물을 계속 교반했다. 상 B 성분 11-13을 상 B 비커에 개별적으로 천천히 첨가하여, 각 성분이 고르게 분산되도록 했다. 모두 혼입될 때, 상 B를 상 A에 첨가하고 잘 혼합했다. 교반을 증가시켜 배치를 완전히 유화시킨 후 교반을 계속하면서 배치를 냉각했다. 이후 상 C를 배치에 첨가하고 통합을 보장하도록 잘 혼합했다. 이후 소듐 하이드록사이드를 50 °C에서 첨가한 다음 배치를 혼합기로부터 제거하고 4 분 동안 균질화한 후 배치가 실온에 도달할 때까지 혼합을 계속했다.

[0119]

표 7: 암모늄 잔토마틴을 함유하는 화학적 선스크린

표 7

	상	성분명	기능	중량 %
1	A	탈이온수		42.880
2	A	디소듐 EDTA	킬레이트제	0.020
3	A	아크릴레이트/C10-30 알킬 아크릴레이트 교차중합체	질감 향상제	0.300
4	A	잔토마틴	UV 증진제	0.100
5	B	세테아릴 알코올	유화제	5.000
6	B	C12-15 알킬 벤조에이트	연화제	8.000
7	B	이소프로필 미리스테이트	연화제	5.000
8	B	에틸헥실 메톡시신나메이트 (옥티녹세이트)	UV 필터	7.000
9	B	옥토크릴렌	UV 필터	10.000
10	B	호모살레이트	UV 필터	15.000
11	B	아보벤존	UV 필터	3.000
12	B	포타슘 세틸 포스페이트 (Amphisol K)	유화제	1.200
13	B	글리세릴 스테아레이트	유화제/증점제	1.000
14	C	페녹시에탄올	보존제	1.000

[0120]

15	D	소듐 하이드록사이드 30% 용액	pH 조정제	0.500
		총계		100.000

[0121] _미네랄 선스크린을 표 8에 약술된 성분으로 제조했다.

[0122] 표 8: 미네랄 선스크린

표 8

활성 성분	대조군	잔토마틴 샘플
이산화티타늄	7.0%	8.0%
산화아연	10%	10%
잔토마틴	0%	0.1%

[0124] 구체적으로, 위에 나타난 대조군 미네랄 선스크린을 아래 표 9에 제공된 전체 성분 목록으로 제조했다. 메인 비커에서 디소듐 EDTA를 물에 가용화하고 적당하게 혼합하며 비커를 75 °C로 가열하여 상 A를 제조했다. 별도의 비커에서, 글리세린, 잔탄 검 및 하이드록시에틸셀룰로스를 조합하고 잘 혼합한 후 메인 비커에 첨가했다. 배치는 약 ~5 분 동안 교반되었다. 상 B 성분 6-11을 별도의 비커에 첨가하고, 75 °C로 가열하고, 모든 성분 및 왁스가 녹고 혼합되도록 교반했다. 이 비커를 적당한 혼합과 함께 교반한 후 상 B 성분 14를 첨가했다. 이후 상 B 성분 12를 배치에 일부분씩 첨가하여, 물질이 유상에 분산되도록 한 후 다음 부분을 첨가했다. 성분 12를 모두 첨가했을 때, 성분 13으로 동일한 과정을 반복했다. 두 성분이 상 B에 혼입되고 혼합되면, 상 B를 상 A에 첨가하고 잘 혼합한 후 교반을 증가시켜 배치를 완전히 유화시켰다. 배치가 가열하여 유화되면, 비커를 핫플레이트로부터 제거하고 5 분 동안 가열하여 지속적으로 완전히 균질화했다. 이후 생성된 혼합물이 실온으로 냉각되며 계속 교반되었다.

[0125] 표 9: 대조군 미네랄 선스크린

표 9

	상	성분명	기능	중량 %
1	A	탈이온수		50.370
2	A	디소듐 EDTA	킬레이트제	0.030
3	A	글리세린	습윤제	3.000
4	A	하이드록시에틸셀룰로스	증점제	0.000
5	A	잔탄 검	증점제	0.500
6	B	세테아릴 알코올	유화제	3.000
7	B	C12-15 알킬 벤조에이트	연화제	10.000
8	B	이소도데칸	연화제	5.000
9	B	이소프로필 미리스테이트	연화제	5.000
10	B	크림 메이커 유체	유화제/증점제	4.000
11	B	글리세릴 스테아레이트 시트레이트	유화제/증점제	0.100
12	B	이산화티타늄	UV 필터	8.000
13	B	산화아연	UV 필터	10.000
14	B	페녹시에탄올 및 헥실글리세린 (EUXYL 9010)	보존제	1.000
		총계		100.000

[0127] 위에 나타난 암모늄 잔토마틴을 함유하는 미네랄 선스크린을 아래 표 10에 제공된 전체 성분 목록으로 제조했다. 메인 비커에서 디소듐 EDTA를 물에 가용화하고 적당하게 혼합하며 비커를 75 °C로 가열하여 상 A를 제조했다. 이후 암모늄 잔토마틴을 배치에 첨가하고, 각 첨가 사이에 혼합하여 암모늄 잔토마틴이 혼합물에 용해되도록 했다. 완료되면, 혼합물을 40 °C로 냉각하고 필요에 따라 NaOH를 첨가하여 5.0 내지 5.5의 pH에 도달했다. 이후 혼합물을 적당하게 혼합하며 75 °C로 가열했다. 별도의 비커에서, 글리세린 및 잔탄 검을 조합하고 잘 혼합한 후 메인 비커에 첨가했다. 배치는 약 ~10 분 동안 교반되었다. 상 B 성분 7-12를 별도의 비커에 첨가하고, 75 °C로 가열하고, 모든 성분 및 왁스가 녹고 혼합되도록 교반했다. 이 비커를 적당하게 혼합하며 교반한

후 상 B 성분 13을 배치에 일부분씩 첨가하여, 물질이 오일 상에 분산되도록 한 후 다음 부분을 첨가했다. 성분 13을 모두 첨가했을 때, 성분 14로 동일한 과정을 반복했다. 두 성분이 상 B에 혼입되고 혼합되면, 성분 15를 상 B에 첨가한 다음, 상 B를 상 A에 첨가하고 잘 혼합한 후 교반을 증가시켜 배치를 완전히 유화시켰다. 배치가 가열하에 유화되면, 비커를 핫플레이트로부터 제거하고 5 분 동안 가열하에 지속적으로 완전히 균질화했다. 이후 생성된 혼합물이 실온으로 냉각되며 계속 교반되었다. 물로 QS.

표 10: 암모늄 잔토마틴을 함유하는 미네랄 선스크린

표 10

	상	성분명	기능	중량 %
1	A	탈이온수		49.142
2	A	디소듐 EDTA	킬레이트제	0.030
3	A	잔토마틴	UV 필터/증진제	0.100
4	A	30% NaOH 용액	pH 조정제	0.888
5	A	글리세린	습윤제	3.000
6	A	잔탄 겔	증점제	0.500
7	B	세테아릴 알코올	유화제	3.000
8	B	C12-15 알킬 벤조에이트	연화제	10.000
9	B	이소도데칸	연화제	5.000
10	B	이소프로필 미리스테이트	연화제	5.000
11	B	크림 메이커 유체	유화제/증점제	4.000
12	B	글리세릴 스테아레이트 시트레이트	유화제/증점제	0.100
13	B	이산화티타늄	UV 필터	8.000
14	B	산화아연	UV 필터	10.000
15	B	Euxyl PE 9010	보존제	1.000
16	C	50% 시트르산 용액	pH 조정제	0.240
		총계		100.000

Labsphere UV 2000S Ultraviolet Transmittance Analyzer 또는 Solar Light Company, Inc. SPF290-AS를 사용하여 전체 UV 스펙트럼(290 내지 400 나노미터)에 걸쳐 각 파장에 대한 스펙트럼 투과율을 결정했다. 투과율 값은 1 나노미터 간격으로 측정되었다. UV 조사에 Solar Light Model LS1000-4S-009를 사용했다. 시뮬레이터에는 UV 2색성 거울, WG320 필터, 열 필터, 및 UG5 필터가 장착되어 250 내지 400 nm의 모든 파장에 대한 전체 태양 시뮬레이터 조도에서 1,500 Watts/m²의 제한으로 290-400 nm의 연속 방출 스펙트럼을 제공한다. 각 특정 파장에서 홍반 효과성 복사의 백분율은 표 11에 나타난다.

표 11: 다양한 파장의 홍반 효과성 복사의 백분율

표 11

파장 범위 (nm)	홍반 기여도 (%)
<290	<0.1
290 - 300	1.0 - 8.0
290 - 310	49.0 - 65.0
290 - 320	85.0 - 90.0
290 - 330	91.5 - 95.5
290 - 340	94.0 - 97.0
290 - 400	99.9 - 100.0

선스크린을 1.3mg/cm²의 도포율로 네 개의 새로운 미처리 조면화 PMMA 플레이트(조면화 면이 맨 위에 있음)에 도포했다. 선스크린을 플레이트의 전체 표면에 걸쳐 균일하게 분포된 부피가 거의 동일한 많은 수의 작은 액적으로 도포했다. 핑거콧을 사용하여 제품을 약 30 초 동안 매우 가볍게 펴 바르고 약 30 초 동안 더 강하게 펴서 도포했다. 샘플을 제어된 온도(25-35 °C)에서 빛으로부터 보호하며 30 분 동안 건조되도록 했다. 2. PMMA 플레이트의 서로 다른 지점에서, 290-400nm 범위에서 1nm 간격으로 취한, 제품의 다섯 가지 스펙트럼을 얻었다. 네 시간의 태양(UV) 노출을 시뮬레이션하기 위해 샘플을 포함하는 PMMA 플레이트를 제어된 선량의 UV 복사에 노출

시켰다. 조사 후, PMMA 플레이트의 서로 다른 지점에서, 290-400nm 범위에서 1nm 간격으로 취한, 제품의 다섯 가지 스펙트럼을 얻었다. 글리세린으로 처리한 PMMA의 참조(블랭크) 측정을 수행했다. 전체 UV(290-400nm), UVB(290-320nm), 및 UVA(320-400nm) 범위에서의 초기 및 최종 흡광도가 계산되었다. 안정성의 백분율은 최종 값(조사 후)과 초기 값(조사 전) 사이의 비율에 의해 계산되었다.

[0134] 유도된 Mansur 방정식(Sayre, R.M., et al., A comparison of in vivo and in vitro testing of sunscreens formulas. Photochemistry and Photobiology, 1979. 29(3): p. 559-566)을 사용하여 식 1,

$$SPF = CF \sum_{290}^{400} EE(\lambda) I(\lambda) Abs(\lambda)$$

에 따라 SPF를 계산했고, 여기서 $EE(\lambda)$ 는 흥반 효과 스펙트럼을 나타내고; $I(\lambda)$ 은 태양 강도 스펙트럼이고; $Abs(\lambda)$ 는 UV-필터의 흡광도이고; CF는 보정 계수(=10)이다. SPF의 계산에서 사용되는 정규화된 곱하기 함수 [$EE(\lambda) \times I(\lambda)$]에 대한 값은 표 12에서 찾을 수 있다. 계산된 SPF 값은 가장 가까운 정수로 반올림되었다. 임계 파장은 이 데이터를 식 2에 적용하여 결정되었고,

$$\int_{290}^{\lambda_c} A(\lambda) d\lambda = 0.9 \int_{290}^{400} A(\lambda) d\lambda$$

, 여기서 $A(\lambda)$ 는 UV-흡수 화합물의 흡광도를 나타내고 λ_c 는 임계 파장이다. (Administration, U.S.F.D., Code of Federal Regulations Title 21: Sunscreen drug products for over-the-counter human use U.S.D.o.H.H. Services, Editor. 2018.)

[0135] 표 12: SPF의 계산에서 사용된 정규화된 곱하기 함수

표 12

파장 (nm)	EE x I (정규화됨)
290	0.0150
295	0.0817
300	0.2874
305	0.3278
310	0.1864
315	0.0839
320	0.0180
총계	1

$$AUC = \int_{290}^{400} A(\lambda) d\lambda$$

$$AUC \text{ Index (AUCI)} = \frac{AUC_t}{AUC_{t=0}}$$

[0137] 광안정성은 상기 데이터를 식 3, , 및 4, 에 적용하여 결정되었고, 여기서 AUC는 식 3을 사용하여 계산된 290 - 400 nm의 UV-흡광도 스펙트럼으로부터 파생된 곡선 아래 면적이고; $AUC_{t=0}$ 은 조사 전에 결정된 곡선 아래 면적이고; AUC_t 은 특정 시점(예를 들어 30, 60, 및 90 분)의 곡선 아래 면적이고; AUC 지수(AUCI)는 식 4로부터 계산된 조사 후 AUC 및 조사 전 AUC의 몫이다. 화합물 또는 물질은 $AUCI > 0.8$ 인 경우 광-안정성인 것으로 간주된다. (Hojerova, J., Medovcikova, A. and M. Mikula, Photoprotective efficacy and photostability of fifteen sunscreen products having the same label SPF subjected to natural sunlight. International Journal of Pharmaceutics, 2011. 408: p. 27-38.)

[0138] 화학적 선스크린 샘플의 조사 전 및 조사 후 SPF 측정 결과는 도 12에 제공된다. 이 도면에서, 단색 막대는 조사 전 측정치이고, 패턴 막대는 조사 후 측정치이다. 나타난 바와 같이, 0.1% 암모늄 잔토마틴을 함유한 화학적 선스크린은 SPF를 조사 전 45% 및 조사 후 38% 증진을 제공했다.

[0139] 미네랄 선스크린 샘플의 조사 전 및 조사 후 SPF 측정 결과는 도 13에 제공된다. 이 도면에서, 단색 막대는 조사 전 측정치이고, 패턴 막대는 조사 후 측정치이다. 나타난 바와 같이, 0.1% 암모늄 잔토마틴을 함유한 미네랄 선스크린은 SPF를 조사 전 21% 및 조사 후 3% 증진을 제공했다.

[0140] 암모늄 잔토마틴을 포함하는 화학적 선스크린 및 미네랄 선스크린 모두의 성능은 아래 표 11에 제공된 데이터에서도 알 수 있다. 구체적으로, 표 13에서 알 수 있는 바와 같이, 미네랄 선스크린 및 화학적 선스크린 모두에 대한 0.1% 암모늄 잔토마틴의 첨가는 제제의 SPF 및 UVA PF를 증진시켰다.

[0141] 표 13: 화학적 선스크린 및 미네랄 선스크린에서 암모늄 잔토마틴의 성능

표 13

제제	평균 SPF ₀	평균 SPF _{irr}	임계 λ ₀ (nm)	임계 λ _{irr} (nm)	UVA PF ₀	UVA PF _{irr}
화학적 대조군	12.91	11.10	377.18	371.09	6.77	4.93
화학적 + Xa	18.80	15.33	379.39	374.30	17.44	13.76
미네랄 대조군	23.24	21.92	378.64	378.56	10.78	10.33
미네랄 +Xa	28.18	22.50	379.06	379.11	13.48	11.59

암모늄 잔토마틴을 포함하는 화학적 선스크린 및 미네랄 선스크린 모두의 조사 후 대 조사 전 안정성은 아래 표 14에 제공된 데이터에서 알 수 있다. 구체적으로, 대조군 화학적 선스크린 제제의 SPF 안정성이 0.1% 암모늄 잔토마틴으로 개선되었다.

표 14: 암모늄 잔토마틴 화학적 선스크린 및 미네랄 선스크린의 안정성

표 14

제제	UVA 흡광 안정성 (%)	UVB 흡광 안정성 (%)	총 UV 안정성 (%)
화학적 대조군	77.65	97.86	84.90
화학적 + Xa	80.90	95.07%	85.59
미네랄 대조군	98.32	98.04	98.21
미네랄 +Xa	94.66	92.59	93.92

실시예 5: 흡광 및 세포독성 연구

잔토마틴의 자연적 광학적 특징이 낮은(< 0.2 mM) 농도의 유기 UV 필터의 UV 성능을 증진시키기 위해 사용될 수 있는지 여부를 평가하기 위해 암모늄 잔토마틴의 성능을 광역-스펙트럼 흡수제로서 테스트했다. 잔토마틴의 흡광 능력을 280-500 nm의 스펙트럼 범위에 걸쳐 용액에서 단독으로(도 14) 및 FDA 승인 유기 UV 필터와 조합으로(도 15 및 16) 테스트했다. 잔토마틴의 농도 증가와 가시광선을 통한 UV 흡수 간의 명확한 관계를 관찰했다(도 14). 구체적으로, 순수한 유기 UV 필터(DMSO 중 0.1-0.2 mM)의 흡수 거동과 비교할 때, 잔토마틴(DMSO 중 0.6 mM)은 가시광선 영역을 통해 UVB에 걸쳐 더 넓은 프로파일을 나타냈다. 잔토마틴이 화학적 UV 필터와 조합될 때, 테스트된 모든 필터에 걸쳐 UVB(300nm) 및 UVA(360nm) 범위 모두에서 상당한 증가가 달성되었으며, 여기서 잔토마틴 첨가 시 UVA 및 B 성능의 적어도 50% 증가를 관찰했다(도 16). 이러한 결과는 잔토마틴이 용액 중 이러한 분자의 흡수 프로파일을 증진시킴을 효과적으로 입증한다.

잔토마틴의 UV 필터-증진 특징을 고려하여, 다음으로 비세포독성 용량의 UVA 광(315 내지 400 nm 및 0 - 199.9 mW/cm²의 측정 범위)에 노출 및 비노출 시 세포독성을 테스트했다. 이들 실험에서, 세포독성은 UVA 노출과 함께 및 노출 없이 처리 후 BALB/c 3T3 마우스 섬유모세포 세포주 내에서 중성 적색 염료 흡수의 농도 의존성 감소로 표현되었다. (Borenfreund, E. and J.A. Puerner, Toxicity determined in vitro by morphological alterations and neutral red absorption. Toxicol Lett, 1985. 24(2-3): p. 119-24.) UVA의 존재에서, 잔토마틴으로 처리된 세포는 명확한 세포독성 효과를 나타냈으며, 여기서 셋의 독립적인 +UVA 실험에 걸쳐 가장 높은 테스트 항목 농도에서의 상대 세포 생존율은 -UVA 대조군과 비교하여 18.1 %, 29.7%, 및 62.3%였다(3 실험에 대해 88.5 %, 99.3 %, 및 100.6 %, 도 17A). -UVA 실험에 대해 EC50-값을 계산할 수 없었기 때문에, 광자극인자(PIF = EC50 (-UVA)/EC50(+UVA))를 계산할 수 없었다. 대신, 평균 광 효과가 식 5,

$$(MPE = \frac{\sum_{i=1}^n w_i PE_{Ci}}{\sum_{i=1}^n w_i})$$
를 사용하여 계산되었고; 여기서, 임의의 농도(C)에서의 광 효과(PE)는 응답 효과(REC)와 선량 효과(DEC) 농도의 곱으로 정의된다. 잔토마틴을 사용한 세 가지 독립적 실험에 대해 0.019, 0.199 및 0.042의 MPE 값을 측정했다. MPE > 0.15는 광독성을 나타낸다; 따라서 잔토마틴은 데이터셋 셋 중 둘이 임계값 미만이므로 광독성이 아닌 것으로 분류되었다. 이 도면에서, 회색 선은 UVA의 부재(-UVA)에서 수집된 데이터를 나타내고, 검은색 선은 UVA에 대한 노출(+UVA)과 함께 수집된 데이터를 나타낸다. 세 가지 독립적인 실험에 대해 데이터를 수집했다.

대조군은 연구의 타당성을 확인했고, 여기서 +UVA 실험의 음성 대조군이 미처리 -UVA 대조군에 대해 86.80%(실

험 1), 92.03%(실험 2) 및 102.39%(실험 3)의 세포 생존율을 나타냈다. 한편, -UVA(8.327 $\mu\text{g/mL}$ 실험 1, 15.530 $\mu\text{g/mL}$ 실험 2, 및 18.809 $\mu\text{g/mL}$ 실험 3) 및 + UVA 실험(0.221 $\mu\text{g/mL}$ 실험 1, 0.413 $\mu\text{g/mL}$ 실험 2, 및 0.469 $\mu\text{g/mL}$ 실험 3)에 대한 클로르프로마진 함유 양성 대조군의 계산된 EC50 값이 타당성 범위 내에 있었다. 양성 대조군에 대한 PIF 값은 실험 1에서 37.81, 실험 2에서 37.74 및 실험 3에서 40.33이었다 (도 17B).

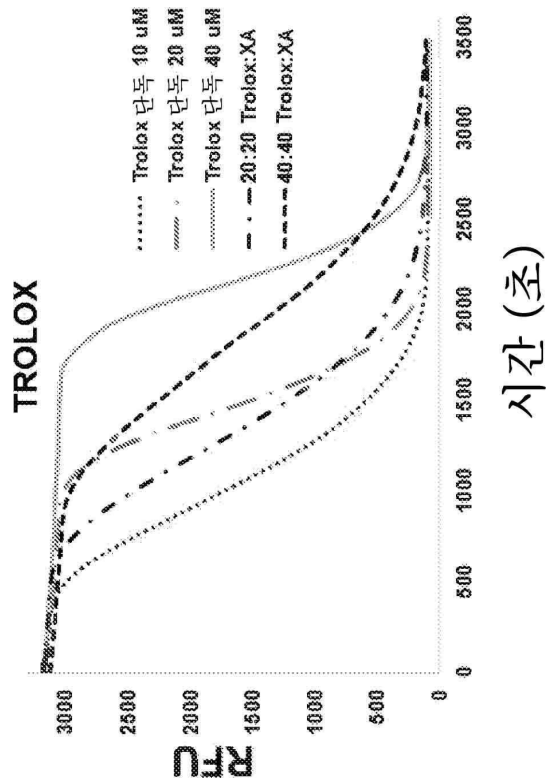
[0150] 이 시험관내 3T3 NRU 광독성 분석의의 독성학적 종말점이 공동 EU/COLIPA 프로젝트에서 개발되고 검증되었기 때문에, 이 분석은 사용 중인 다양한 생체내 테스트에 대한 잘 인식된 시험관내 대안이다. (Spielmann, H., et al., EEC/COLIPA project on in vitro phototoxicity testing: First results obtained with a Balb/c 3T3 cell phototoxicity assay. *Toxicol In Vitro*, 1994. 8(4): p. 793-6; Balls, M. Statement on the scientific validity of the 3T3 NRU PT test (an in vitro test for phototoxic potential). 1998; Spielmann, H., et al., The International EU/COLIPA In Vitro Phototoxicity Validation Study: Results of Phase II (Blind Trial). Part 1: The 3T3 NRU Phototoxicity Test. *Toxicol In Vitro*, 1998. 12(3): p. 305-27.) 이 지침에 따르면, 우리의 데이터는 잔토마틴이 광독성도 아니고 광자극성도 아님을 뜻하며, 여기서 광독성은 테스트 화학물질에 처음 노출된 후 빛에 후속 노출된 후 발생하거나 조사 후 화학물질의 전신 투여 후에 유발되는 독성 반응으로 정의된다.

[0151] 실시예 6: 항산화제 안정화/증진

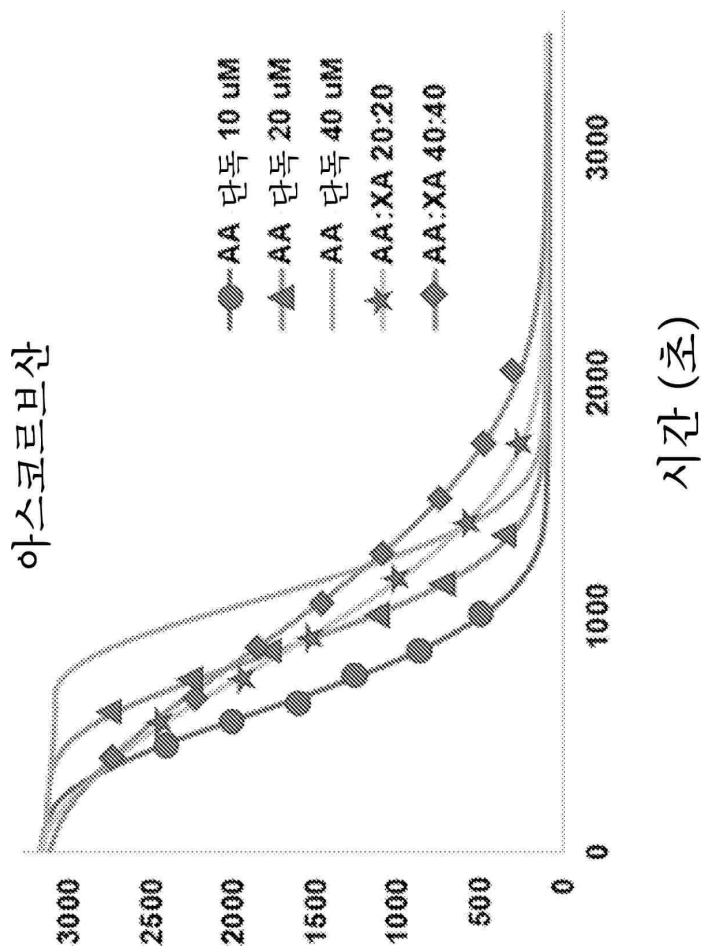
[0152] 항산화제 안정화/증진 실험을 위해, 표준 산소 라디칼 항산화 능력(ORAC) 분석을 사용하여 37 °C에서 90 분에 걸쳐, 암모늄 잔토마틴 단독 및 등몰 아스코르브산(비타민 C) 또는 트롤록스(비타민 E 유사체)와 혼합된 암모늄 잔토마틴의 항산화 능력 및 성능을 테스트했다. ORAC 분석은 퍼옥실 라디칼에 의해 플루오레세인 프로브의 산화를 기반으로 생체분자의 항산화 능력을 측정했다 (항산화 능력이 감소함에 따라 형광이 감소한다). ORAC 분석은 <https://www.cellbiolabs.com/sites/default/files/STA-345-orac-assay-kit.pdf>에 상세히 설명되며, 이의 내용은 본원에 참조로 포함된다. 모든 경우에, 암모늄 잔토마틴은 공지된 항산화 표준(트롤록스 및 비타민 C)에 필적하는 항산화 능력을 제공했다. 이러한 발견은 최고 농도(40 μM) 조건에 대한 비교 가능한 곡선 아래 면적(AUC) 계산에 의해 뒷받침되었다 (도 18). 도 19는 동일한 농도에서 분석될 때 용액 중의 비타민 C와 비교하여 용액 중의 암모늄 잔토마틴의 반감기 측정을 제공한다. 용액 중의 암모늄 잔토마틴은 동일한 농도에서 분석될 때 비타민 C보다 두 배 더 길었다. 도 20 및 21은 각각 비타민 C 및 비타민 E의 성능이 암모늄 잔토마틴과 조합될 때 확장됨을 보여준다. 구체적으로, 도 20은 비타민 C의 성능이 암모늄 잔토마틴과 조합될 때 23% 확장됨을 보여준다. 도 21은 비타민 E의 성능이 암모늄 잔토마틴과 조합될 때 9% 확장됨을 보여준다.

도면

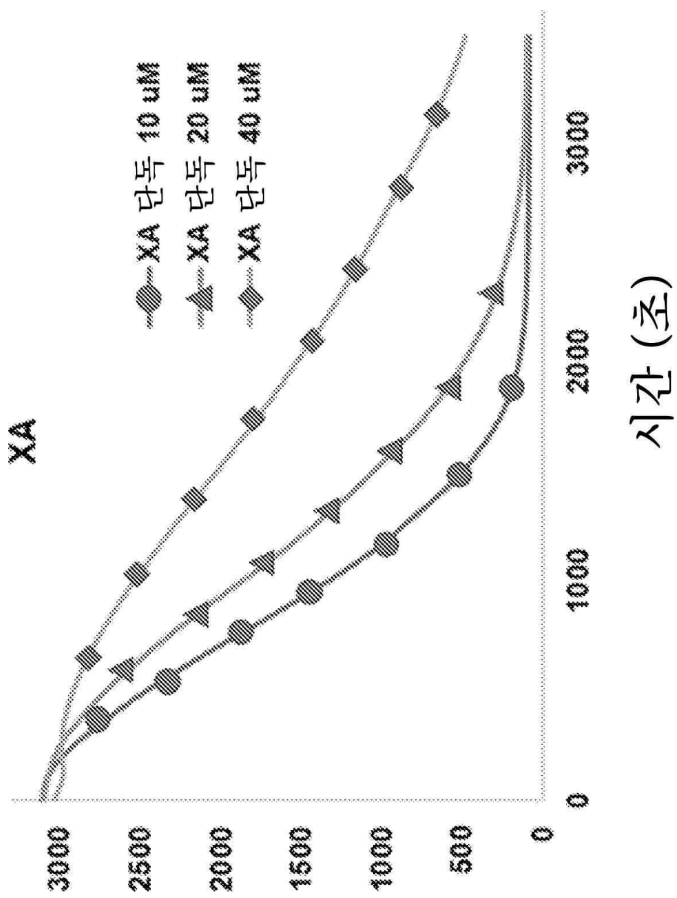
도면1



도면2



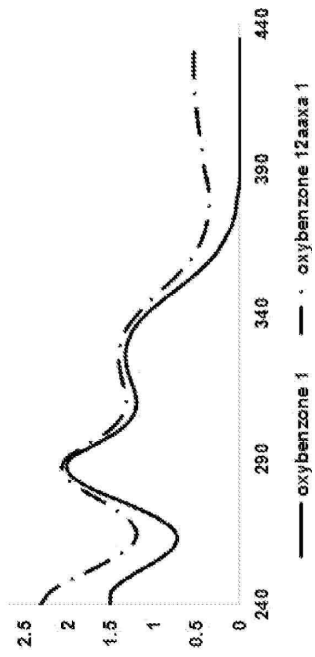
도면3



도면4

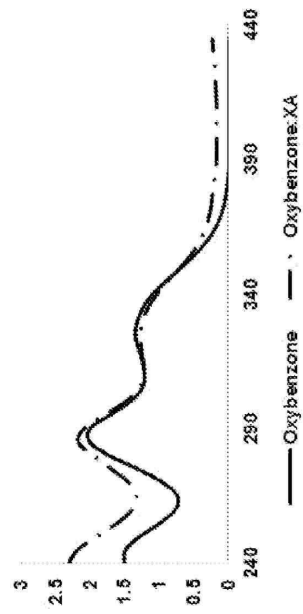
도 4B

16 일차 옥시벤존



도 4A

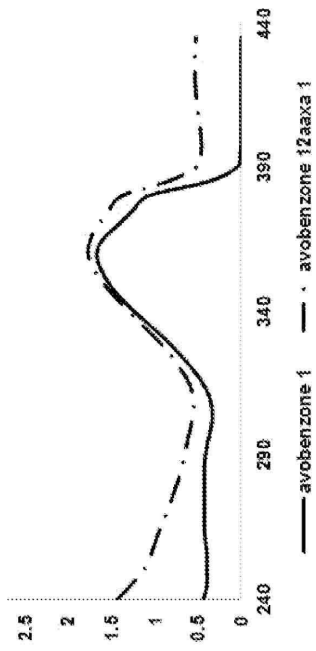
1 일차 옥시벤존



도면5

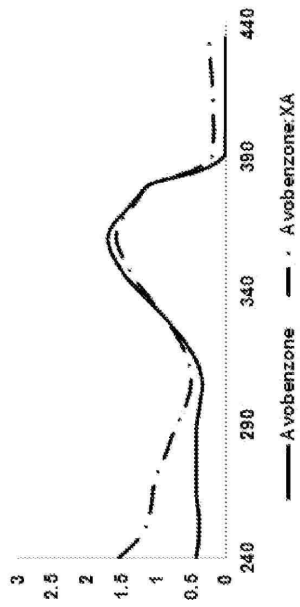
도 5B

16 일차 아보벤존



도 5A

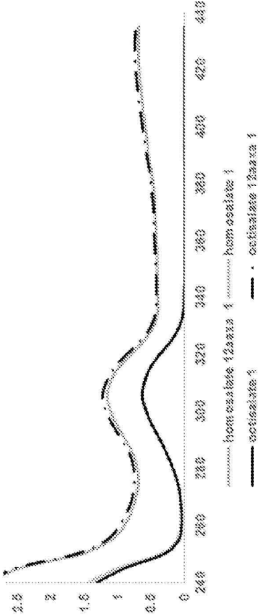
1 일차 아보벤존



도면6

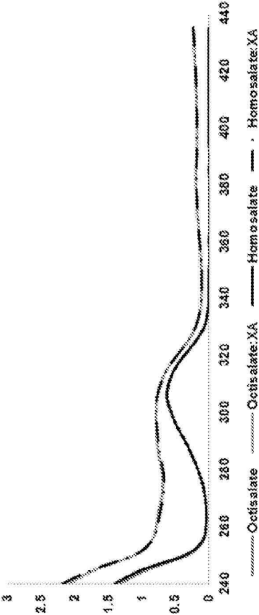
도 6B

16 일차 살레이트



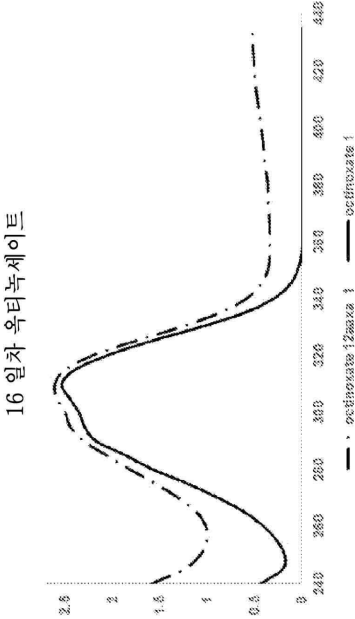
도 6A

1 일차 옥티살레이트 및 호모살레이트

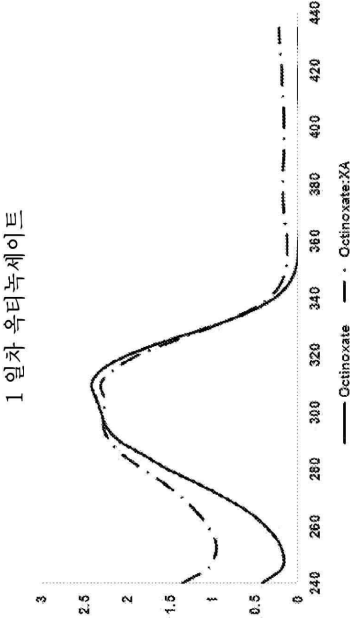


도면7

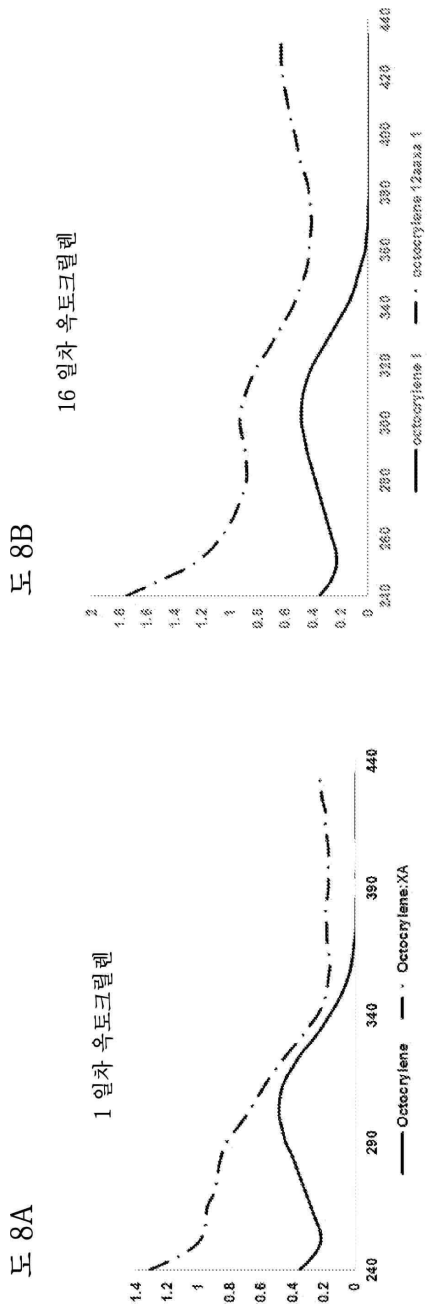
도 7B



도 7A

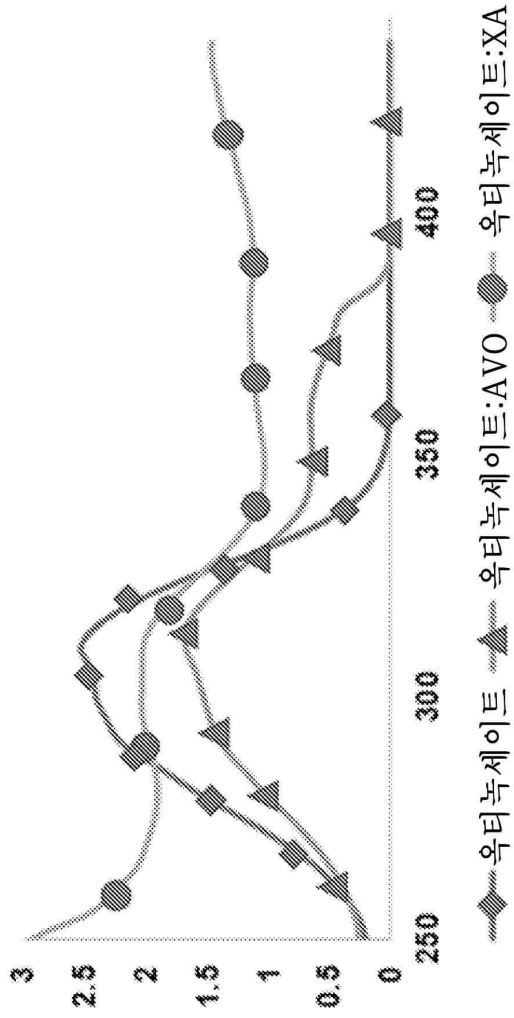


도면8



도면9

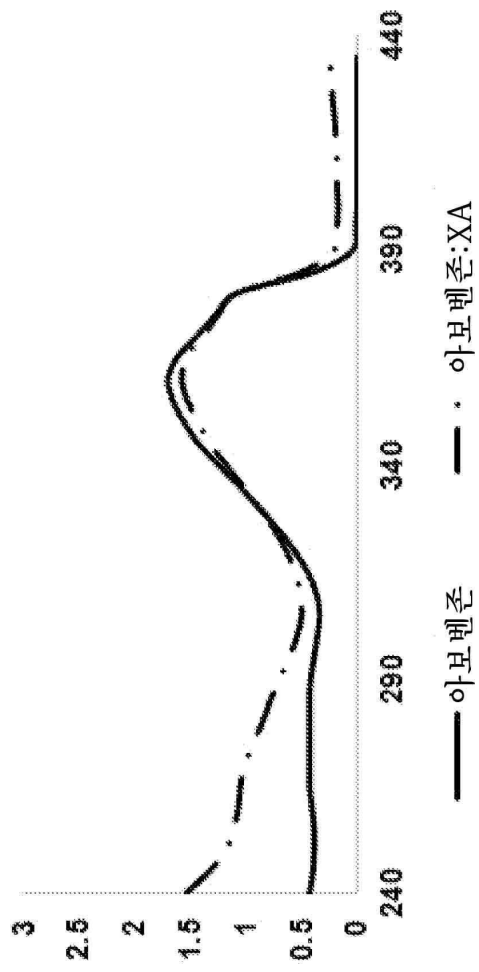
옥티녹세이트, 1 일차



아보벤존, 1 일차

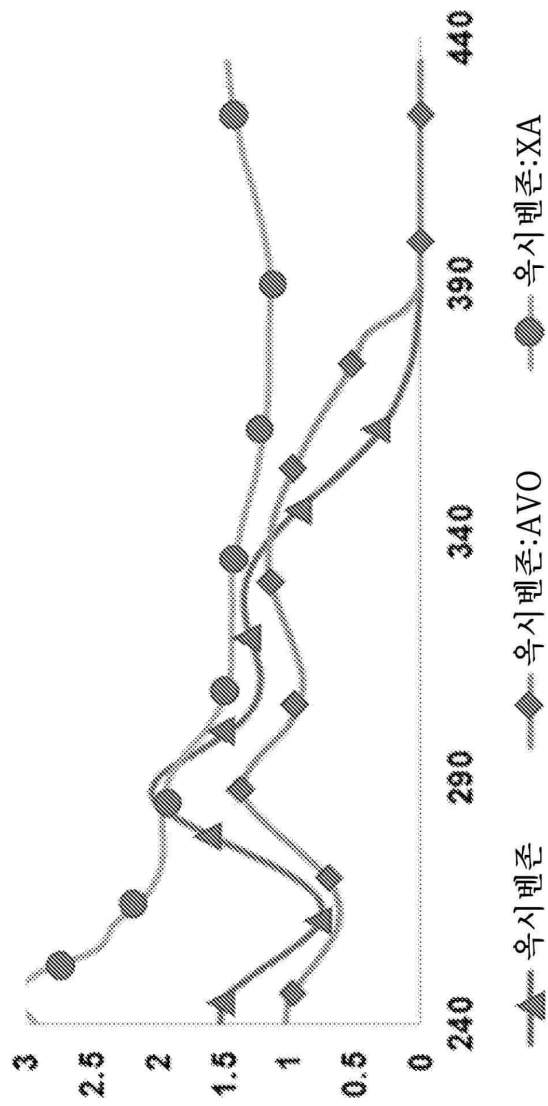
도면10

1 일차 아보벤존

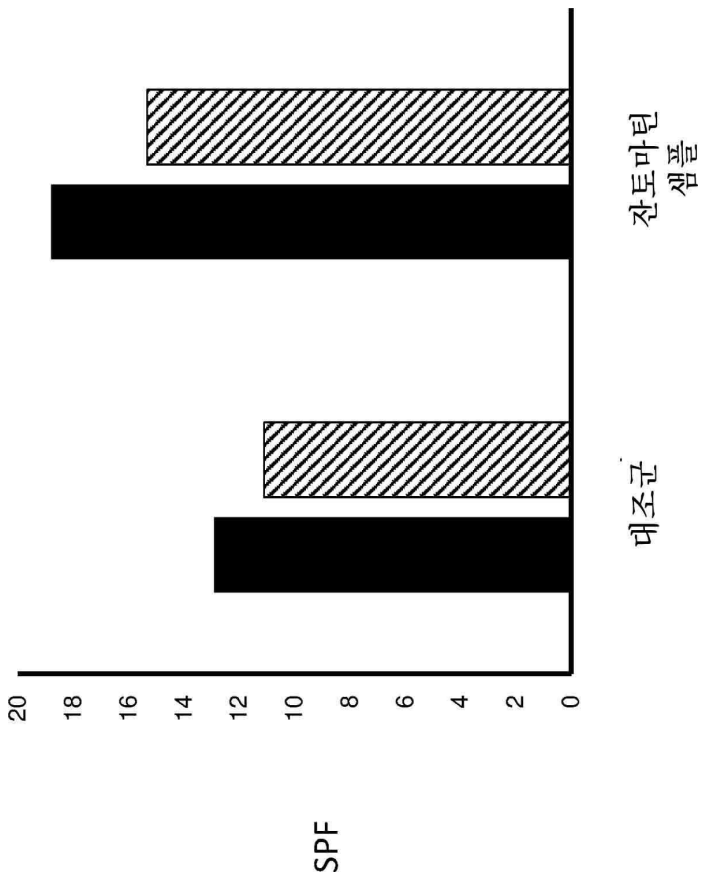


도면11

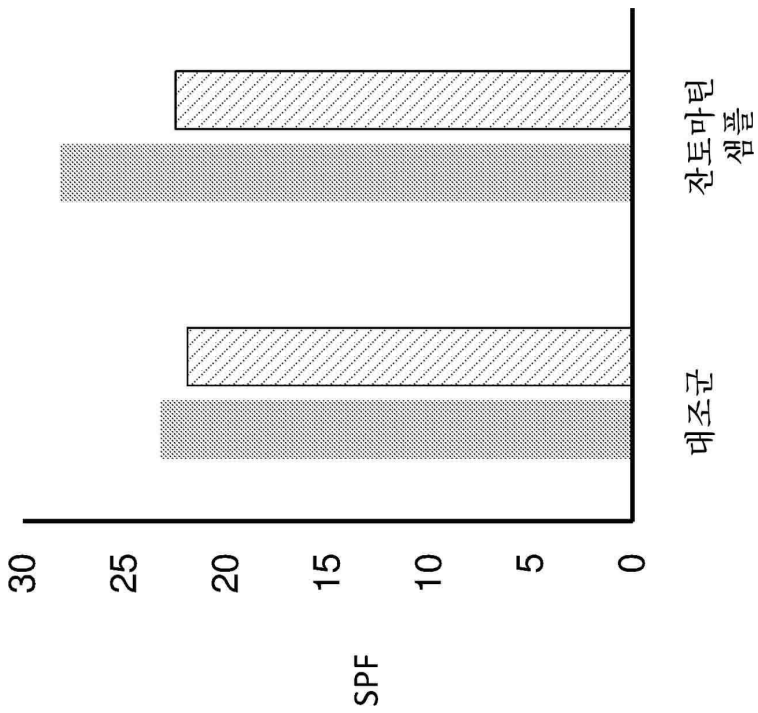
옥시벤존, 1 일차



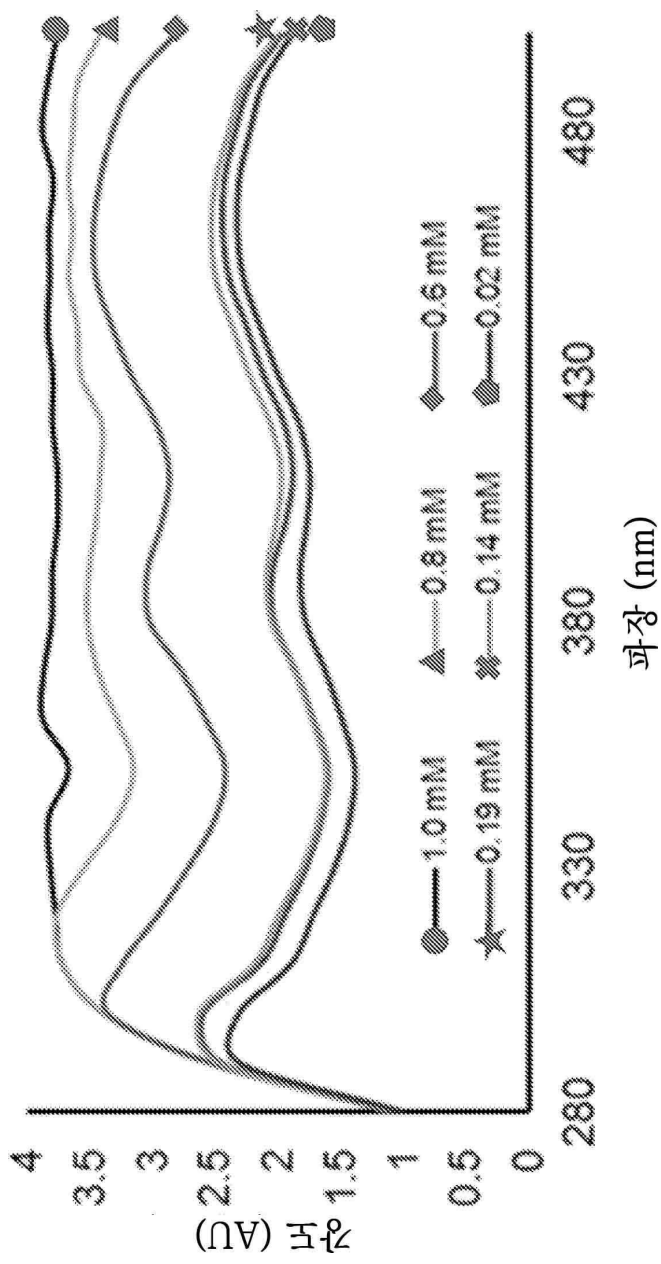
도면12



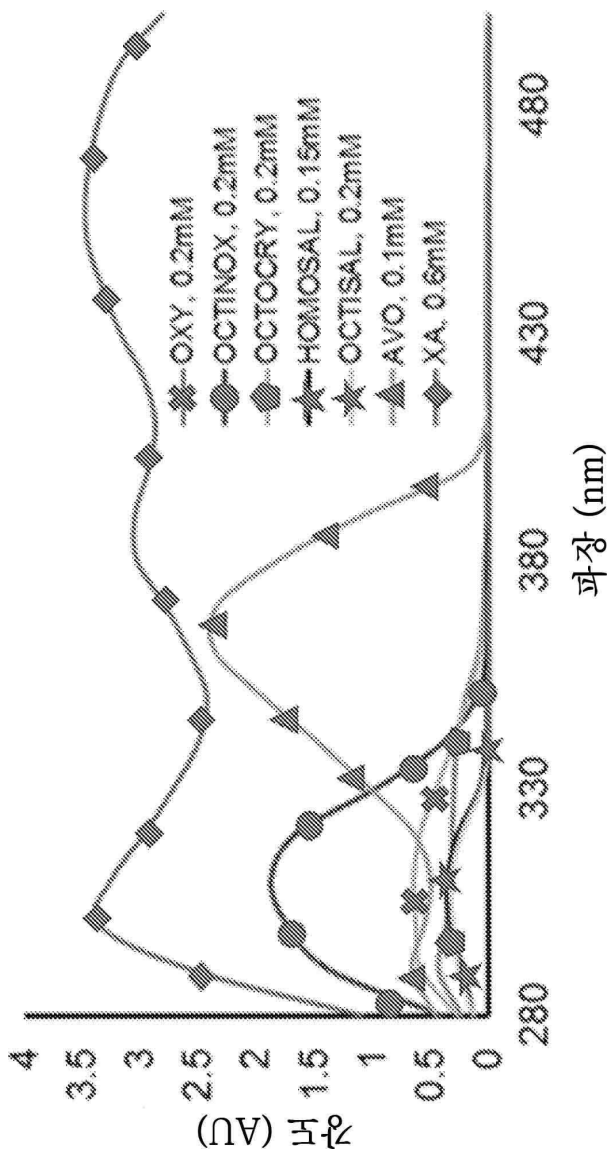
도면13



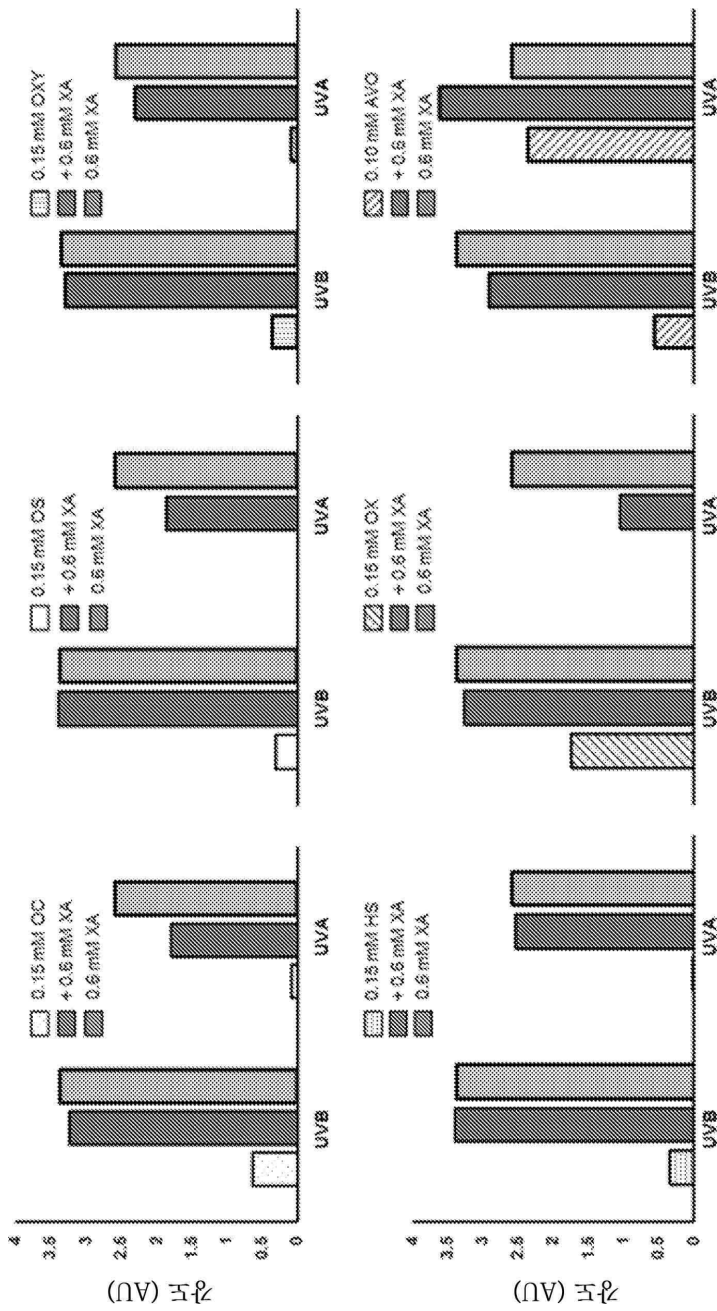
도면14



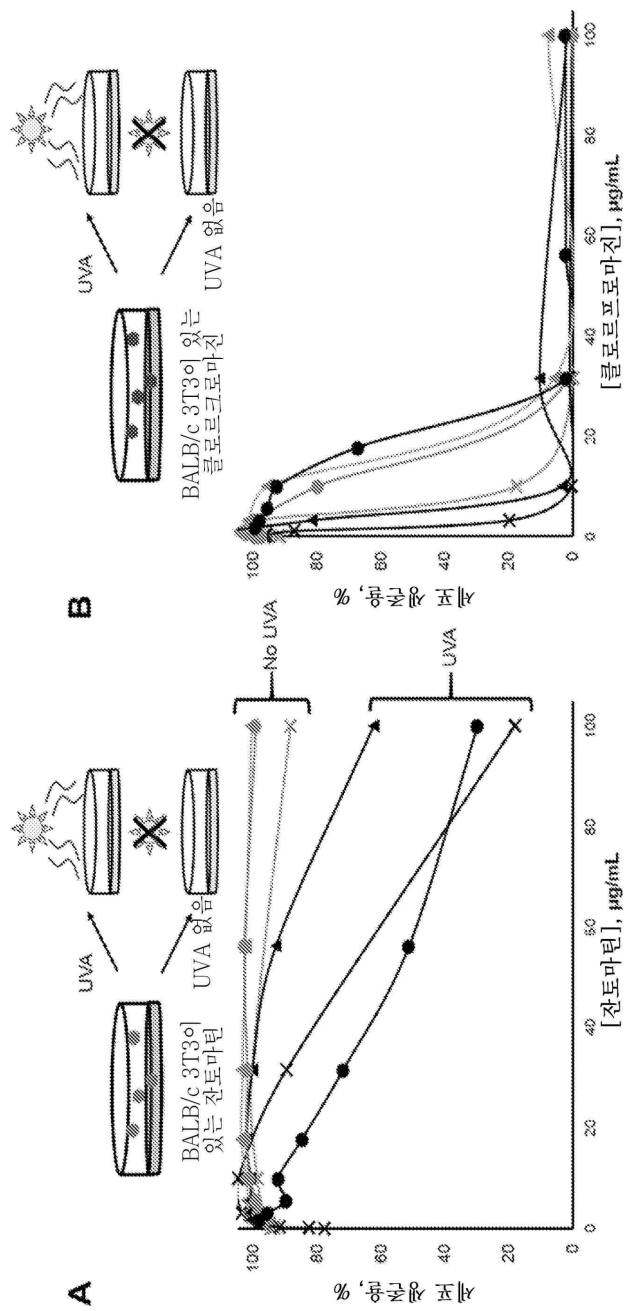
도면15



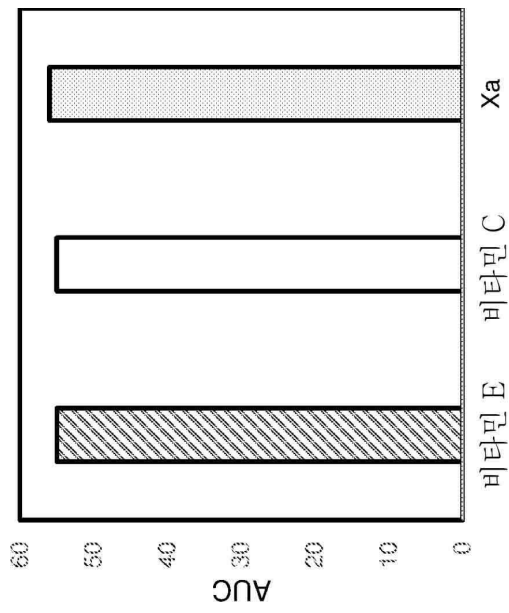
도면16



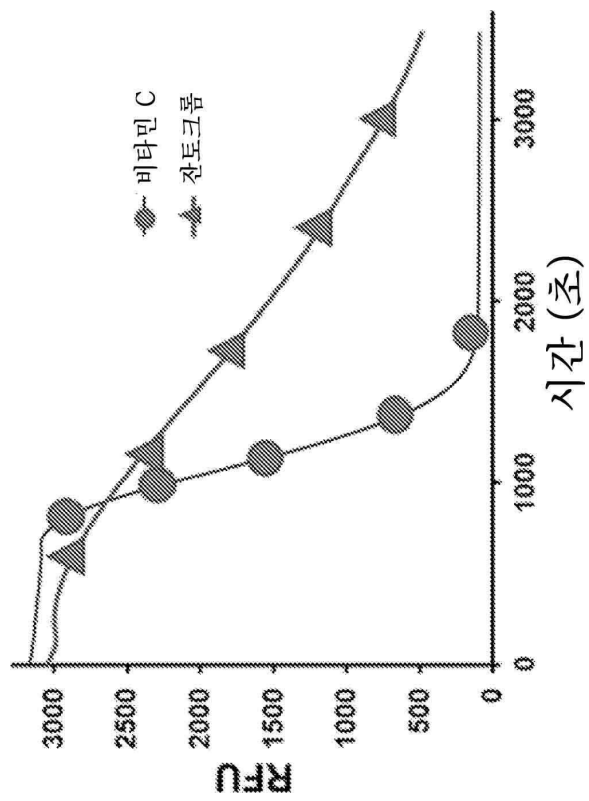
도면17



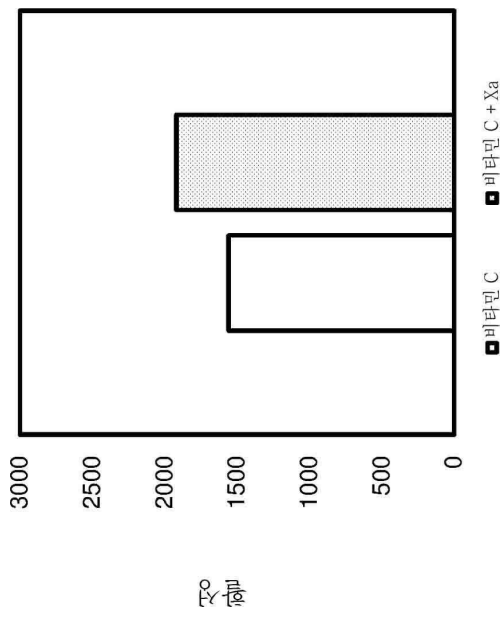
도면18



도면19



도면20



도면21

