

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第5770965号
(P5770965)

(45) 発行日 平成27年8月26日(2015.8.26)

(24) 登録日 平成27年7月3日(2015.7.3)

(51) Int. Cl.	F I		
A 6 1 K 8/64 (2006.01)	A 6 1 K	8/64	Z N A
A 6 1 K 8/365 (2006.01)	A 6 1 K	8/365	
A 6 1 K 8/67 (2006.01)	A 6 1 K	8/67	
A 6 1 Q 17/00 (2006.01)	A 6 1 Q	17/00	
A 6 1 Q 19/00 (2006.01)	A 6 1 Q	19/00	

請求項の数 5 (全 27 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2008-539289 (P2008-539289)	(73) 特許権者	505066718 コグニス・アイピー・マネージメント・ゲ ゼルシャフト・ミット・ベシュレンクテル ・ハフツング Cognis IP Managemen t GmbH ドイツ連邦共和国, 40589デュッセル ドルフ, ヘンケルストラーセ, 67
(86) (22) 出願日	平成18年10月25日(2006.10.25)	(74) 代理人	100081422 弁理士 田中 光雄
(65) 公表番号	特表2009-514906 (P2009-514906A)	(74) 代理人	100101454 弁理士 山田 卓二
(43) 公表日	平成21年4月9日(2009.4.9)	(74) 代理人	100104592 弁理士 森住 憲一
(86) 国際出願番号	PCT/EP2006/010258		
(87) 国際公開番号	W02007/051550		
(87) 国際公開日	平成19年5月10日(2007.5.10)		
審査請求日	平成21年10月23日(2009.10.23)		
審判番号	不服2013-13763 (P2013-13763/J1)		
審判請求日	平成25年7月18日(2013.7.18)		
(31) 優先権主張番号	05023954.0		
(32) 優先日	平成17年11月3日(2005.11.3)		
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		

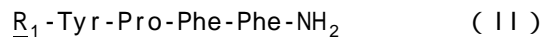
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 オリゴペプチドおよびその使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

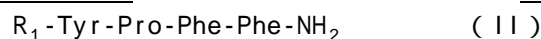
式(II)：

[式中、R₁は、アセチル基である。]

で示されるオリゴペプチドの、 - ヒドロキシ酸、 - ヒドロキシ酸およびレチノイドからなる群から選択される刺激性化粧用剤の肌への適用による敏感肌の痒み、ほてり、刺痛、穿痛またはうずきを減じるための化粧用組成物における使用。

【請求項2】

- ヒドロキシ酸、 - ヒドロキシ酸およびレチノイドからなる群から選択される刺激性化粧用剤を含む化粧用組成物の製造のための、式(II)：

[式中、R₁は、アセチル基である。]

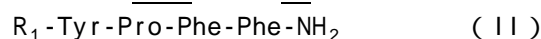
で示されるオリゴペプチドの使用。

【請求項3】

オリゴペプチドを、0.001～1000ppmの濃度で使用することを特徴とする、請求項1または2に記載の使用。

【請求項4】

少なくとも1種の式(II)：



10

20

[式中、 R_1 は、アセチル基である。]

で示されるオリゴペプチド、および

少なくとも1種の、 α -ヒドロキシ酸、 β -ヒドロキシ酸およびレチノイドからなる群から選択される化粧用剤

を含んでなる化粧用組成物。

【請求項5】

オリゴペプチドを、0.001~1000 ppmの濃度で使用することを特徴とする、請求項4に記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

10

【0001】

本発明は、オリゴペプチド、中でもエンドモルフィン-1およびエンドモルフィン-2の化粧的使用、このようなオリゴペプチドを含む化粧品、およびある種のオリゴペプチド誘導体自身に関する。

【背景技術】

【0002】

今日、消費者は化粧品を多数の組合せで利用できる。その際、これらの化粧品が、特定のケア効果を示すか、またはある種の不足を解決することが期待されているだけではなく、多くの特性を同時に有し、従って改善された性能範囲を示す製品に対する常に頻繁な要求が存在する。貯蔵安定性、光安定性および処方される能力のような化粧品の技術的特性に好都合に影響し、同時に、例えば皮膚および/または毛髪にケア特性、炎症抑制特性および/または光保護特性を与える活性成分の構成要素にもなる物質が、特に興味深い。とりわけ、良好な皮膚適合性、および特に敏感肌のヒトに対する良好な皮膚適合性に対する重要性が増している。

20

【0003】

敏感肌は、環境因子または刺激に対して自覚的に皮膚が過敏な状態である。人口の約40%の人達が、自分は敏感肌の特徴を有していると考えている。自分の皮膚を敏感であると感じている消費者は、皮膚が、化粧品、石鹸および日焼け止め剤と接触し、乾燥、低温または風のある気候、太陽光または紫外線、汚染環境、除毛または毛剃りのような物理的処理、またはストレスに暴露された後に悪化すると、過度の反応を報告する。彼らは、痒み、ほてり、刺痛、穿痛またはうずきのような自覚症状を示す。

30

【0004】

敏感肌の機構面は未だに不明であるが、解質層の増加した浸透性および皮膚の神経応答の加速が含まれると考えられる。

【0005】

様々な文献が、敏感肌の化粧法を扱っている。Parfums Cosmetiques Actualites, 2004, 178, 128-169においてC. Chavignylは、皮膚バリアの回復によって、および炎症反応に関与する細胞伝達物質の製造の制限によって、皮膚の耐性閾値を上昇させるための様々な方策および製品を概説している。

【0006】

40

ペプチドエンドモルフィン-1 (H-Tyr-Pro-Trp-Phe-NH₂) およびエンドモルフィン-2 (H-Tyr-Pro-Phe-Phe-NH₂) は、既知の医薬用剤である。

【0007】

WO 98/42732 (EP 0 994 897) は、ペプチドエンドモルフィン-1 (H-Tyr-Pro-Trp-Phe-NH₂) およびエンドモルフィン-2 (H-Tyr-Pro-Phe-Phe-NH₂)、種々の構造変形体、およびそれらの医薬組成物への使用を開示している。化粧的使用は記載されていない。合成変形体(アセチル化型)は開示されていない。

【0008】

WO 03/020304 (EP1427438) は、炎症、および慢性関節リウマチ、全身性紅斑性狼瘡、多発性硬化症、乾癬または喘息のような自己免疫疾患の治療または予防に使用するための

50

、エンドモルフィン含有医薬組成物を記載している。エンドモルフィンは、天然エンドモルフィン、合成エンドモルフィン、エンドモルフィン類似体、エンドモルフィン模倣薬、天然エンドモルフィンの機能性断片、合成エンドモルフィンの機能性断片、およびエンドモルフィン誘導体である。好ましい態様では、エンドモルフィン - 1 またはエンドモルフィン - 2 を使用する。記載されているエンドモルフィン誘導体は、グリコシル化、硫酸化、ヒドロキシル化、または他の既知のペプチド変性法によって得られたものである。それらの化粧的使用は記載されておらず、本発明のペプチド誘導体も記載されていない。

【 0 0 0 9 】

WO 97/07130 (EP 845003 B1) は、テトラペプチド、テトラペプチド誘導体、および痛みを治療するためのそれらの医薬的使用を記載している。テトラペプチドは常に、D - A 1 1 a または D - A r g を含む。WO 95/22557 は、オリゴペプチド、中でもエンドモルフィン - 2、および痛みを治療するためのそれらの医薬的使用を請求している。US 4350627 は、様々なテトラペプチドおよびペンタペプチド、並びにそれらの治療的使用を開示している。

【 発明の開示 】

【 発明が解決しようとする課題 】

【 0 0 1 0 】

本発明の目的は、敏感肌のヒトが使用するのに適した化粧用組成物を提供することであった。本発明の更なる目的では、該化粧用組成物は、痒み、ほてり、刺痛、穿痛またはうずきのような敏感肌の自覚症状を防ぐだけでなく、敏感肌に現れている症状を改善すべきである。本発明の更なる目的は、環境因子または刺激に対する自覚的な皮膚の過敏性を低減し、痒み、ほてり、刺痛、穿痛またはうずきのような対応する皮膚の自覚症状を減じて、敏感肌を救うのに役立つ、化粧用組成物を提供することであった。本発明の更なる目的は、非刺激性の、従って敏感肌のヒトが安全に使用できる化粧用組成物を得る目的を有する化粧品に、例えば - ヒドロキシ酸またはレチノールのような既知の刺激性の剤を配合できる化粧品を提供することであった。

【 0 0 1 1 】

また、本発明の化粧品はもちろん、好ましい無毒性であり、最も一般的な化粧用成分と適合性であるべきである。

【 課題を解決するための手段 】

【 0 0 1 2 】

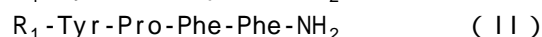
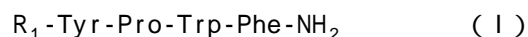
意外にも、本発明のオリゴペプチドがこれらの要求を満たすことが見出された。

【 0 0 1 3 】

いずれの従来技術文献も、本発明のオリゴペプチド、および本発明で特許請求したオリゴペプチドの化粧的使用を記載していない。いずれの文献も、敏感肌に使用され得るオリゴペプチドを記載していない。

【 0 0 1 4 】

本発明の 1 つの態様は、式 (I) および / または式 (II) :



[式中、 R_1 は、Tyr のアミノ末端部の NH_2 基と結合しており、

a) - H、

b) - OH、- SH、- COOH または - CONH₂ 基によって官能化され得る、1 ~ 2 4 個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、

c) 二官能性リンカーを介して [AA] のアミノ末端部と結合する、ステロールまたはスフィンゴ脂質基

からなる群から選択される。]

で示されるオリゴペプチドの化粧品への使用を対象とする。

【 0 0 1 5 】

言い換えると、本発明は、 R_1 - [配列表配列番号 1] および / または R_1 - [配列表

配列番号 2] [式中、 R_1 は上記した意味を有する。] で示されるオリゴペプチドの化粧的使用を対象とする。

【 0 0 1 6 】

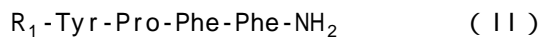
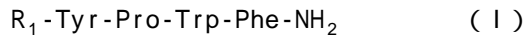
本発明のオリゴペプチドが、その鎮静特性および緩和特性故に、良好な化粧用特性を示すことが見出された。

【 0 0 1 7 】

本発明のオリゴペプチドが敏感肌を処置するための組成物の製造に適していることも見出された。

【 0 0 1 8 】

従って、本発明の 1 つの態様は、敏感肌を処置する組成物の製造のための、式 (I) および / または式 (II) :



[式中、 R_1 は、 Tyr のアミノ末端部の NH_2 基と結合しており、

a) - H、

b) - OH、- SH、- COOH または - CONH₂ 基によって官能化され得る、1 ~ 24 個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、または

c) 二官能性リンカーを介して Tyr のアミノ末端部と結合する、ステロールまたはスフィンゴ脂質基

からなる群から選択される。]

で示されるオリゴペプチドの使用を対象とする。

【 0 0 1 9 】

本発明のオリゴペプチドが、既知の刺激性化粧用剤を含有する化粧用組成物に使用され得ることも見出された。意外にも、これらの既知の刺激性化粧用剤の刺激能力が、本発明のオリゴペプチドによって減じられることが見出された。

【 0 0 2 0 】

従って、本発明の更なる態様は、少なくとも 1 種の請求項 1 に記載のオリゴペプチド、および少なくとも 1 種の、 - ヒドロキシ酸、 - ヒドロキシ酸およびレチノイドからなる群から選択される化粧用剤を含んでなる化粧用組成物を対象とする。

【 発明を実施するための最良の形態 】

【 0 0 2 1 】

[化粧用剤]

化粧用剤は - ヒドロキシ酸であり得る。化粧用に許容できる - ヒドロキシ酸、それらの塩およびそれらのエステルの全てが適している。好ましくは - ヒドロキシ酸が選択され、 - ヒドロキシ酸は $C_2 \sim C_{12}$ - ヒドロキシ酸およびそれらの塩、並びに $C_2 \sim C_{24}$ 、好ましくは $C_{14} \sim C_{22}$ アルコールとのそれらのエステルから選択される。

【 0 0 2 2 】

化粧用剤は - ヒドロキシ酸であり得る。化粧用に許容できる - ヒドロキシ酸、それらの塩およびそれらのエステルの全てが適している。好ましくは - ヒドロキシ酸が選択され、 - ヒドロキシ酸は $C_2 \sim C_{12}$ - ヒドロキシ酸およびそれらの塩、並びに $C_2 \sim C_{24}$ 、好ましくは $C_{14} \sim C_{22}$ アルコールとのそれらのエステルから選択される。

【 0 0 2 3 】

本発明の好ましい態様では、 - ヒドロキシ酸または - ヒドロキシ酸或いはそれらの塩またはエステルを使用し、酸は、好ましくは、乳酸、クエン酸、グリコール酸、ゲンチシン酸、サリチル酸、グルコン酸、およびヘプトン酸からなる群から選択される。

【 0 0 2 4 】

化粧用剤はレチノイドであり得る。本発明に従った適当なレチノイドは、レチノール、レチナール、レチノイン酸、酢酸レチニル、パルミチン酸レチニル、およびアスコルビン酸レチニルからなる群から選択され得る。

10

20

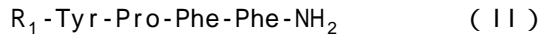
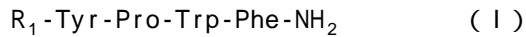
30

40

50

【 0 0 2 5 】

本発明の1つの態様は、式(Ⅰ)および/または式(Ⅱ)：



[式中、 R_1 は、Tyrのアミノ末端部の NH_2 基と結合しており、

b) -OH、-SH、-COOHまたは-CONH₂基によって官能化され得る、1~24個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、または

c) 二官能性リンカーを介して[AA]のアミノ末端部と結合する、ステロールまたはスフィンゴ脂質基

である。]

で示されるオリゴペプチドを対象とする。

【 0 0 2 6 】

言い換えると、本発明は、 R_1 - [配列表配列番号1] および/または R_1 - [配列表配列番号2] [式中、 R_1 は上記した意味を有する。] で示されるオリゴペプチドを対象とする。

【 0 0 2 7 】

本発明のオリゴペプチドが、敏感肌に使用できる化粧用組成物の製造に特に有用であることが見出された。

【 0 0 2 8 】

[R_1 部分]

Tyrのアミノ末端部は R_1 と結合している。 R_1 は、

a) -H、

b) -OH、-SH、-COOHまたは-CONH₂基によって官能化され得る、1~24個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、または

c) 二官能性リンカーを介してTyrのアミノ末端部と結合する、ステロールまたはスフィンゴ脂質基

からなる群から選択される。

【 0 0 2 9 】

態様a)では、アミノ末端は置換されず、アミノ基からなる。本発明の範囲では、 $R_1 = \text{H}$ の場合、本発明のオリゴペプチドはプロトン化され得、例えば、塩化物、臭化物、フッ化物、またはヨウ化物のような塩として存在し得る。

【 0 0 3 0 】

好ましい態様では、本発明のオリゴペプチドは、エンドモルフィン - 1 [Tyr-Pro-Trp-Phe-NH₂] および/またはエンドモルフィン - 2 [Tyr-Pro-Phe-Phe-NH₂] である。

【 0 0 3 1 】

本発明の好ましい態様では、 R_1 は、1~24個の炭素原子、1~4個、好ましくは1~6個、好ましくは1~12個、好ましくは10~20個、より好ましくは12~18個の炭素原子を有する、直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基である。本発明の1つの態様では、アシル基は、12個以下、11個以下、10個以下、9個以下、8個以下、7個以下、6個以下、5個以下、4個以下、3個以下、2個以下の炭素原子を有する。

【 0 0 3 2 】

基 R_1 は、好ましくは、アセチル($\text{CH}_3\text{-CO-}$)、エタノイル($\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CO-}$)、プロピオニル、ブタノイル、(=ブチリル; $\text{CH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-CO-}$)、デカノイル、パルミトイル($\text{CH}_3\text{-(CH}_2)_{14}\text{-CO-}$)、ステアロイル($\text{CH}_3\text{-(CH}_2)_{16}\text{-CO-}$)、オレイル、リポイル、リノレイルまたは共役リノレイルによって形成される群から選択され、基がアセチルであることが特に好ましい。

【 0 0 3 3 】

10

20

30

40

50

従って、本発明の特に好ましい態様では、式(1)で示されるオリゴペプチドは、N - アセチル - Tyr - Pro - Trp - Phe - NH₂ および / または N - アセチル - Tyr - Pro - Phe - Phe - NH₂ である。

【0034】

本発明の1つの態様では、アシル基は、-OH、-SH、-COOH および -CONH₂ からなる群から選択される、1つ以上の官能基によって更に官能化され得る。

【0035】

本発明の1つの態様では、R₁ はステロール基である。ステロール基は、植物ステロールまたは動物起源のステロールから選択され得る。

【0036】

本発明におけるステロールは、C - 3 に1個のヒドロキシル基だけを含んで他の官能基を含まないステロイドである。従って、形式上それらはアルコールであり、これが、この化合物群が時折ステロールとも称される理由である。一般に、ステロールは、約27個～約30個の炭素原子、および5/6位、時には7/8位、8/9位または他の位置に1つの二重結合を有する。本発明の目的に使用され得るステロールは、例えば、大豆油、菜種油、ヒマワリ油、ココナツ油、パーム核油、およびパーム油のような天然物から得られたものである。好ましいステロールは、シグマステロール、カンベステロール、シトステロール、ブラシカステロール、スチグマステロール、D5アベナスステロール、D7アベナスステロール、エルゴステロール、シトロスタジエノール、コレステロール、ラノステロール、スポンゴステロール、フンギステロール、ステラステロール、ジモステロール、およびそれらの混合物であり、特に、エルゴステロール、アベナスステロール(D5およびD7アベナスステロール)、カンベステロール、スチグマステロール、シトステロール、ブラシカステロール、シトロスタジエノール、シグマスタジエノール、およびそれらの混合物に基づいた植物ステロールである。当業者に知られている他の植物ステロールも全て使用できる。

【0037】

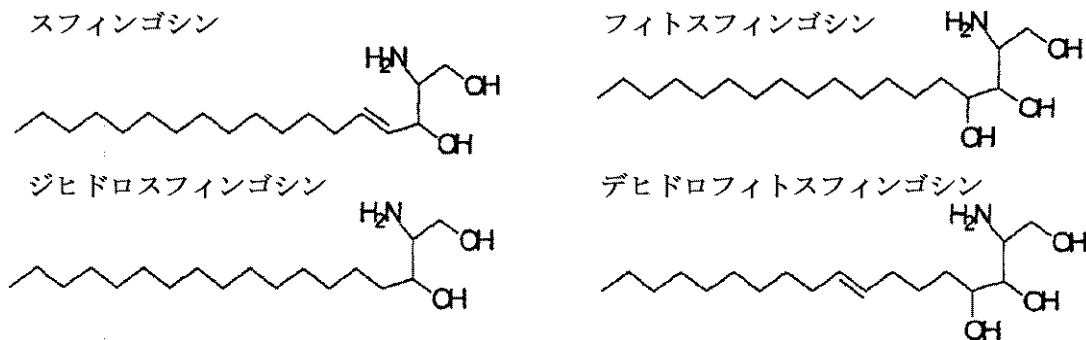
好ましい態様では、ステロール基は、コレステロール、スチグマステロール、シトステロール、またはブラシカステロールからなる群から選択される。

【0038】

1つの態様では、R₁ はスフィンゴ脂質であり、好ましくはスフィンゴ脂質は、スフィンゴシン、フィトスフィンゴシン、ジヒドロスフィンゴシン、またはデヒドロフィトスフィンゴシンからなる群から選択される。

【0039】

【化1】



【0040】

ステロールまたはスフィンゴ脂質は、二酸、例えばコハク酸のような二官能性リンカーを用いてオリゴペプチドと結合している。C - 3のステロールヒドロキシル基は、エステル結合を介して二官能性リンカーに結合され得、二官能性リンカーは、アミド結合を介してTyrのアミノ末端部に結合され得る。C - 1のスフィンゴ脂質アミノ基は、アミド結合を介して二官能性リンカーと結合され得、二官能性リンカーは、アミド結合を介してTyrのアミノ末端部に結合され得る。

10

20

30

40

50

【0041】

用語「オリゴペプチド」は、式(Ⅰ)および/または式(Ⅱ)で示される単一のオリゴペプチド種、式(Ⅰ)および/または式(Ⅱ)で示されるオリゴペプチドの少なくとも2種、少なくとも3種またはそれ以上の混合物、少なくとも1種の式(Ⅰ)で示される単一種と少なくとも1種の式(Ⅱ)で示される単一種との混合物を含んで、同義的に使用される。R₁がHではない場合、用語「オリゴペプチド誘導體」が、より正確な用語になる。この説明に使用したように、用語「オリゴペプチド」は、オリゴペプチド、オリゴペプチド誘導體、オリゴペプチドの塩、およびオリゴペプチド誘導體の塩を包含する。このような可能な塩は、ナトリウム塩またはカリウム塩を含む。

【0042】

アミノ酸は、ペプチド断片中でL体、D体、またはDL体のいずれかとして存在し得る。本発明の好ましい態様では、アミノ酸は全てL体として存在する。

【0043】

〔オリゴペプチドの合成〕

本発明のオリゴペプチドは、化学合成または酵素合成によって得ることができる。それらはまた、本発明のオリゴペプチド(例えばエンドモルフィン-1またはエンドモルフィン-2)またはオリゴペプチド前駆体を含有する、微生物、植物または動物の天然蛋白質の制御された加水分解によって得ることもできる。次いで、化学的または酵素的に得たエンドモルフィン-1またはエンドモルフィン-2を、既知の化学的または酵素的方法によって更に誘導體化(例えばアセチル化)して、本発明のオリゴペプチドを得ることができる。

【0044】

オリゴペプチドを微生物によって製造することもできる。該微生物は、オリゴペプチドを自然に形成するか、或いは本発明のオリゴペプチドを形成するように、遺伝学的に変性されているか、または発酵中に発酵条件を通じて幾つかの他の方法で扱われるものである。

【0045】

オリゴペプチド(またはオリゴペプチド前駆体)が蛋白質の加水分化によって得られる場合、このように得られたオリゴペプチドは、粗で使用されるか、または既知の方法(膜濾過、クロマトグラフィー、免疫沈降)によって更に精製して、所望のオリゴペプチドを得ることができる。

【0046】

〔オリゴペプチドを含む化粧用組成物〕

本発明の1つの態様は、少なくとも1種の式(Ⅰ)および/または式(Ⅱ)で示されるオリゴペプチドを含む化粧用組成物を対象とする。

【0047】

オリゴペプチドは、好適には、0.001~1000 ppm、好ましくは0.05~500 ppm、より好ましくは0.5~100 ppmの濃度で使用される。

【0048】

オリゴペプチドは、好適には、化粧品に許容される1種以上の溶媒、例えば、水、グリセロール、プロピレングリコール、ブチレングリコール、ペンチレングリコール、エトキシ化またはプロポキシ化ジグリコール、エタノール、プロパノール、イソプロパノールまたは前記溶媒の混合物に溶解または可溶化される。更に、リボソーム中に溶解されているか、有機ポリマーまたは無機支持体或いは局所適用に許容できる類似物質に吸着されている、オリゴペプチドを使用することもできる。

【0049】

溶媒の他に、更なる助剤および添加剤も、本発明に使用される調製物中に存在し得る。

【0050】

〔化粧用組成物〕

本発明のオリゴペプチドおよびその化粧的使用は、例えば、ヘアシャンプー、ヘアロー

10

20

30

40

50

ション、フォームバス、シャワーバス、クリーム、ジェル、ローション、アルコール性および水性/アルコール性溶液、エマルジョン、ワックス/脂肪塊、スティック製剤、パウダーまたは軟膏のような化粧用組成物の製造に役立つ。これらの組成物は、更なる助剤および添加剤として、穏やかな界面活性剤、油成分、乳化剤、真珠光沢ワックス、コンシステンシー調整剤、増粘剤、過脂肪剤、安定剤、ポリマー、シリコン化合物、脂肪、ワックス、レシチン、リン脂質、UV保護因子、生物起源活性成分、酸化防止剤、消臭剤、制汗剤、フケ防止剤、フィルム形成剤、膨潤剤、防虫剤、日焼け剤、チロシン抑制剤（脱色剤）、ヒドロトロープ、可溶化剤、保存剤、香油、染料なども含む得る。

【0051】

〔界面活性剤〕

存在し得る界面活性物質は、アニオン性、非イオン性、カチオン性および/または両性或いは双性イオン性界面活性剤である。組成物中のこれらの含有量は、通常約1～70重量%、好ましくは5～50重量%、特に10～30重量%である。

【0052】

アニオン性界面活性剤の典型例は、石鹼、アルキルベンゼンスルホネート、アルカンスルホネート、オレフィンスルホネート、アルキルエーテルスルホネート、グリセロールエーテルスルホネート、 α -メチルエステルスルホネート、スルホ脂肪酸、アルキルスルフェート、アルキルエーテルスルフェート、グリセロールエーテルスルフェート、脂肪酸エーテルスルフェート、ヒドロキシ混合エーテルスルフェート、モノグリセリド（エーテル）スルフェート、脂肪酸アミド（エーテル）スルフェート、モノ-およびジ-アルキルスルホスクシネート、モノ-およびジ-アルキルスルホスクシナメート、スルホトリグリセリド、アミド石鹼、エーテルカルボン酸およびその塩、脂肪酸イセチオネート、脂肪酸サルコシネート、脂肪酸タウリド、N-アシルアミノ酸（例えば、アシルラクチレート、アシルタートレート、アシルグルタメートおよびアシルアスパルテート）、アルキルオリゴグルコシドスルフェート、蛋白質脂肪酸縮合物（特に、小麦系植物性の生成物）、並びにアルキル（エーテル）ホスフェートである。アニオン性界面活性剤がポリグリコールエーテル鎖を有する場合、通常と同族体分布を有し得るが、狭い同族体分布を有することが好ましい。

【0053】

非イオン性界面活性剤の典型例は、脂肪アルコールポリグリコールエーテル、アルキルフェノールポリグリコールエーテル、脂肪酸ポリグリコールエステル、脂肪酸アミドポリグリコールエーテル、脂肪アミンポリグリコールエーテル、アルコキシ化トリグリセリド、混合エーテルまたは混合ホルマール、場合により部分的に酸化されたアルキル（アルケニル）オリゴグリコシドまたはグルクロン酸誘導体、脂肪酸-N-アルキルグルカミド、蛋白質加水分解物（特に小麦系植物性の生成物）、ポリオール脂肪酸エステル、糖エステル、ソルピタンエステル、ポリソルベート並びにアミノキシドである。非イオン性界面活性剤がポリグリコールエーテル鎖を有する場合、通常と同族体分布を有し得るが、狭い同族体分布を有することが好ましい。

【0054】

カチオン性界面活性剤の典型例は、第4級アンモニウム化合物、例えばジメチルジステアリルアンモニウムクロリド、およびエステルクォート（esterquat）、とりわけ第4級化脂肪酸トリアルカノールアミンエステル塩である。両性および双性イオン性界面活性剤の典型例は、アルキルベタイン、アルキルアミドベタイン、アミノプロピオネート、アミノグリシネート、イミダゾリニウムベタインおよびスルホベタインである。

【0055】

上記界面活性剤は、いずれも既知の化合物である。特に適当な穏やかな（即ち特に皮膚に適合性の）界面活性剤の典型例は、脂肪アルコールポリグリコールエーテルスルフェート、モノグリセリドスルフェート、モノ-および/またはジ-アルキルスルホスクシネート、脂肪酸イセチオネート、脂肪酸サルコシネート、脂肪酸タウリド、脂肪酸グルタメート、 α -オレフィンスルホネート、エーテルカルボン酸、アルキルオリゴグルコシド、脂

10

20

30

40

50

肪酸グルカミド、アルキルアミドベタイン、両性アセタール、および/または蛋白質脂肪酸縮合物(好ましくは小麦蛋白質由来のもの)である。

【0056】

〔油成分〕

適当な油成分は例えば、6~18個、好ましくは8~10個の炭素原子を有する脂肪アルコールベースのゲルベアルコール、直鎖 C_{6-22} 脂肪酸と直鎖または分枝 C_{6-22} 脂肪アルコールとのエステル、および/または分枝 C_{6-13} カルボン酸と直鎖または分枝 C_{6-22} 脂肪アルコールとのエステル、例えば、ミリスチルミリステート、ミリスチルパルミテート、ミリスチルステアレート、ミリスチルイソステアレート、ミリスチルオレエート、ミリスチルベヘネート、ミリスチルエルケート、セチルミリステート、セチルパルミテート、セチルステアレート、セチルイソステアレート、セチルオレエート、セチルベヘネート、セチルエルケート、ステアリルミリステート、ステアリルパルミテート、ステアリルステアレート、ステアリルイソステアレート、ステアリルオレエート、ステアリルベヘネート、ステアリルエルケート、イソステアリルミリステート、イソステアリルパルミテート、イソステアリルステアレート、イソステアリルイソステアレート、イソステアリルオレエート、イソステアリルベヘネート、イソステアリルオレエート、オレイルミリステート、オレイルパルミテート、オレイルステアレート、オレイルイソステアレート、オレイルオレエート、オレイルベヘネート、オレイルエルケート、ベヘニルミリステート、ベヘニルパルミテート、ベヘニルステアレート、ベヘニルイソステアレート、ベヘニルオレエート、ベヘニルベヘネート、ベヘニルエルケート、エルシルミリステート、エルシルパルミテート、エルシルステアレート、エルシルイソステアレート、エルシルオレエート、エルシルベヘネート、およびエルシルエルケートである。

【0057】

他の適当な油成分の例は、直鎖 C_{6-22} 脂肪酸と分枝アルコール(とりわけ2-エチルヘキサノール)とのエステル、 C_{18-38} アルキルヒドロキシカルボン酸と直鎖または分枝 C_{6-22} 脂肪アルコールとのエステル(DE 19756377 A1参照)、とりわけジオクチルマレート、直鎖および/または分枝脂肪酸と多価アルコール(例えば、プロピレングリコール、二量体ジオールまたは三量体トリオール)および/またはゲルベアルコールとのエステル、 C_{6-10} 脂肪酸ベースのトリグリセリド、 C_{6-18} 脂肪酸ベースの液体モノ-/ジ-/トリ-グリセリド混合物、 C_{6-22} 脂肪アルコールおよび/またはゲルベアルコールと芳香族カルボン酸(とりわけ安息香酸)とのエステル、 C_{2-12} ジカルボン酸と1~22個の炭素原子を有する直鎖または分枝アルコールまたは2~10個の炭素原子および2~6個のヒドロキシル基を有するポリオールとのエステル、植物油、分枝第1級アルコール、置換シクロヘキサン、直鎖および分枝 C_{6-22} 脂肪アルコールカーボネート(例えばジカプリリルカーボネート(Cetiol(登録商標)CC))、 C_{6-18} 好ましくは C_{8-10} 脂肪アルコールベースのゲルベカーボネート、安息香酸と直鎖および/または分枝 C_{6-22} アルコールとのエステル(例えばFinsolv(登録商標)TN)、各アルキル基に6~22個の炭素原子を有する直鎖または分枝の対称または非対称ジアルキルエーテル(例えばジカプリリルエーテル(Cetiol(登録商標)OE))、エポキシ化脂肪酸エステル、ポリオールによる開環生成物、シリコン油(シクロメチコン、とりわけシリコンメチコン型)、および/または脂肪族炭化水素またはナフテン炭化水素、例えば、スクアラン、スクアレンまたはジアルキルシクロヘキサンである。

【0058】

〔乳化剤〕

適当な乳化剤は、例えば、下記群の少なくとも1つから選ばれる非イオン性界面活性剤である。

・直鎖 C_{8-22} 脂肪アルコール、 C_{12-22} 脂肪酸、アルキル基中に8~15個の炭素原子を有するアルキルフェノール、およびアルキル基中に8~22個の炭素原子を有するアルキルアミンの、エチレンオキシド2~30molおよび/またはプロピレンオキシド0~5mol付加生成物；

10

20

30

40

50

- ・アルキル（アルケニル）基に8～22個の炭素原子を有するアルキルおよび／またはアルケニルオリゴグリコシド、並びにそれらのエトキシ化類似体；
- ・ひまし油および／または水素化ひまし油のエチレンオキシド1～15mol付加生成物；
- ・ひまし油および／または水素化ひまし油のエチレンオキシド15～60mol付加生成物；
- ・グリセロールおよび／またはソルビタンと不飽和直鎖または飽和分枝 C_{12-22} 脂肪酸および／または C_{3-18} ヒドロキシカルボン酸との部分エステル、並びにそれらのエチレンオキシド1～30mol付加生成物；

【0059】

- ・ポリグリセロール（平均自己縮合度2～8）、ポリエチレングリコール（分子量400～5000）、トリメチロールプロパン、ペンタエリスリトール、糖アルコール（例えば、ソルビトール）、アルキルグルコシド（例えば、メチルグルコシド、ブチルグルコシド、ラウリルグルコシド）およびポリグルコシド（例えば、セルロース）と飽和および／または不飽和の直鎖または分枝 C_{12-22} 脂肪酸および／または C_{3-18} ヒドロキシカルボン酸との部分エステル、並びにそれらのエチレンオキシド1～30mol付加生成物；
- ・ペンタエリスリトール、脂肪酸、クエン酸および脂肪アルコールの混合エステル、および／または C_{6-22} 脂肪酸、メチルグリコースおよびポリオール、好ましくはグリセロールまたはポリグリセロールの混合エステル；
- ・モノ-、ジ-およびトリアルキルホスフェート、並びにモノ-、ジ-および／またはトリ-PEG-アルキルホスフェート、並びにそれらの塩；
- ・羊毛ワックスアルコール；
- ・ポリシロキサン／ポリアルキル／ポリエーテルコポリマーおよび対応する誘導体；
- ・ブロックコポリマー、例えばポリエチレングリコール-30ジポリヒドロキシステアレート；
- ・ポリマー乳化剤、例えばGoodrichのPemulenタイプ（TR-1、TR-2）；
- ・ポリアルキレングリコール；
- ・グリセロールカーボネート。

【0060】

- ・エチレンオキシド付加生成物
脂肪アルコール、脂肪酸、アルキルフェノール、またはひまし油のエチレンオキシドおよび／またはプロピレンオキシド付加生成物は知られており、市販品である。これらは同族体混合物であり、その平均アルコキシ化度は、エチレンオキシドおよび／またはプロピレンオキシドと付加反応を行う基質との物質量比に対応する。グリセロールのエチレンオキシド付加生成物の $C_{12/18}$ 脂肪酸モノエステルおよびジエステルは、化粧品のための脂肪回復剤として知られている。

【0061】

- ・アルキルおよび／またはアルケニルオリゴグリコシド
アルキルおよび／またはアルケニルオリゴグリコシド、それらの製造方法およびそれらの使用は、従来技術から知られている。これらは特に、グルコースまたはオリゴ糖類と8～18個の炭素原子を有する第1級アルコールとの反応によって製造される。グリコシド基に関しては、環状糖基が脂肪アルコールとグリコシド結合しているモノグリコシドと、好ましくは約8までのオリゴマー化度を有するオリゴグリコシドの両方が適している。ここで、オリゴマー化度は、このような工業用製品に常套の同族体分布に基づく統計的平均値である。

【0062】

- ・部分グリセリド
適当な部分グリセリドの典型例は、ヒドロキシステアリン酸モノグリセリド、ヒドロキシステアリン酸ジグリセリド、イソステアリン酸モノグリセリド、イソステアリン酸ジグ

10

20

30

40

50

リセリド、オレイン酸モノグリセリド、オレイン酸ジグリセリド、リシノール酸モノグリセリド、リシノール酸ジグリセリド、リノール酸モノグリセリド、リノール酸ジグリセリド、リノレン酸モノグリセリド、リノレン酸ジグリセリド、エルカ酸モノグリセリド、エルカ酸ジグリセリド、酒石酸モノグリセリド、酒石酸ジグリセリド、クエン酸モノグリセリド、クエン酸ジグリセリド、リンゴ酸モノグリセリド、リンゴ酸ジグリセリドおよびこれらの工業用混合物であり、製造工程の微量生成物として、トリグリセリドも少量含む。同様に、上記部分グリセリドのエチレンオキシド1～30mol、好ましくは5～10mol付加生成物も適当である。

【0063】

・ソルビタンエステル

適当なソルビタンエステルは、ソルビタンモノイソステアレート、ソルビタンセスキイソステアレート、ソルビタンジイソステアレート、ソルビタントリイソステアレート、ソルビタンモノオレート、ソルビタンセスキオレート、ソルビタンジオレート、ソルビタントリオレート、ソルビタンモノエルケート、ソルビタンセスキエルケート、ソルビタンジエルケート、ソルビタントリエルケート、ソルビタンモノリシノレート、ソルビタンセスキリシノレート、ソルビタンジリシノレート、ソルビタントリリシノレート、ソルビタンモノヒドロキシステアレート、ソルビタンセスキヒドロキシステアレート、ソルビタンジヒドロキシステアレート、ソルビタントリヒドロキシステアレート、ソルビタンモノタートレート、ソルビタンセスキタートレート、ソルビタンジタートレート、ソルビタントリタートレート、ソルビタンモノシトレート、ソルビタンセスキシトレート、ソルビタンジシトレート、ソルビタントリシトレート、ソルビタンモノマレエート、ソルビタンセスキマレエート、ソルビタンジマレエート、ソルビタントリマレエート、およびこれらの工業用混合物である。同様に、上記ソルビタンエステルのエチレンオキシド1～30mol、好ましくは5～10mol付加生成物も適当である。

【0064】

・ポリグリセロールエステル

適当なポリグリセロールエステルの典型例は、ポリグリセリル - 2 ジポリヒドロキシステアレート (Dehymuls (登録商標) PGPH)、ポリグリセリル - 3 ジイソステアレート (Lameform (登録商標) TGI)、ポリグリセリル - 4 イソステアレート (Isolan (登録商標) GI 34)、ポリグリセリル - 3 オレート、ジイソステアロイルポリグリセリル - 3 ジイソステアレート (Isolan (登録商標) PDI)、ポリグリセリル - 3 メチルグルコースジステアレート (Tego Care (登録商標) 450)、ポリグリセリル - 3 蜜ろう (Cera Bellina (登録商標))、ポリグリセリル - 4 カプレート (Polyglycerol Caprate T2010/90)、ポリグリセリル - 3 セチルエーテル (Chimexane (登録商標) NL)、ポリグリセリル - 3 ジステアレート (Cremophor (登録商標) GS 32) およびポリグリセリルポリリシノレート (Admul (登録商標) WOL 1403)、ポリグリセリルダイメレートイソステアレート、並びにこれらの混合物である。他の適当なポリオールエステルの例は、トリメチロールプロパンまたはペンタエリスリトールと、ラウリン酸、ココナツ脂肪酸、獣脂脂肪酸、パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸、ベヘン酸などとのモノ -、ジ - およびトリ - エステルであって、場合によりエチレンオキシド1～30molと反応したものである。

【0065】

・アニオン性乳化剤

典型的なアニオン性乳化剤は、12～22個の炭素原子を有する脂肪族脂肪酸で、例えばパルミチン酸、ステアリン酸、ベヘン酸、および12～22個の炭素原子を有するジカルボン酸、例えばアゼライン酸またはセバシン酸である。

【0066】

・両性およびカチオン性乳化剤

更に、双性イオン性界面活性剤を乳化剤として使用できる。用語「双性イオン性界面活性剤」は、分子中に少なくとも1個の第4級アンモニウム基および少なくとも1個のカルボキシレートおよびスルホネート基を有する界面活性化合物を意味する。特に適当な双性

10

20

30

40

50

イオン性界面活性剤は、いわゆるベタイン、例えば、アルキルまたはアシル基中に 8 ~ 18 個の炭素原子を各々の場合に有する、N - アルキル - N , N - ジメチルアンモニウムグリシネート（例えばココアルキルジメチルアンモニウムグリシネート）、N - アシルアミノプロピル - N , N - ジメチルアンモニウムグリシネート（例えばココアシルアミノプロピルジメチルアンモニウムグリシネート）、および 2 - アルキル - 3 - カルボキシメチル - 3 - ヒドロキシエチルイミダゾリン、並びにココアシルアミノエチルヒドロキシエチルカルボキシメチルグリシネートである。CTFA 名ココミドプロピルベタイン（Cocamidopropyl Betaine）として知られている脂肪酸アミド誘導体が、特に好ましい。

【 0 0 6 7 】

両性界面活性剤も、適当な乳化剤である。用語「両性界面活性剤」は、分子中に、 C_{8-18} アルキルまたはアシル基に加えて、少なくとも 1 個の遊離アミノ基および少なくとも 1 個の - COOH または - SO₃H 基を有する界面活性化合物を意味し、分子内塩を形成し得る。適当な両性界面活性剤の例は、アルキル基中に約 8 ~ 18 個の炭素原子を各々の場合に有する、N - アルキルグリシン、N - アルキルアミノプロピオン酸、N - アルキルアミノ酪酸、N - アルキルイミノジプロピオン酸、N - ヒドロキシエチル - N - アルキルアミドプロピルグリシン、N - アルキルタウリン、N - アルキルサルコシン、2 - アルキルアミノプロピオン酸およびアルキルアミノ酢酸である。特に好ましい両性界面活性剤は、N - ココアルキルアミノプロピオネート、ココアシルアミノエチルアミノプロピオネート、および C_{12-18} アシルサルコシンである。最後に、カチオン性界面活性剤も乳化剤として適しており、エステルクォート（esterquat）タイプのもの（好ましくはメチル第 4 級化ジ脂肪酸トリエタノールアミンエステル塩）が特に好ましい。

【 0 0 6 8 】

〔 脂肪およびワックス 〕

脂肪の典型例は、グリセリド、即ち、高級脂肪酸の混合グリセロールエステルから実質的になる、固体または液体の植物性または動物性生成物である。適当なワックスはとりわけ、天然ワックス、例えばカンデリラろう、カルナウバろう、木ろう、アフリカハネガヤろう、コルクろう、グアルマろう、ライスオイルろう、サトウキビろう、オウリカリろう、モンタンろう、蜜ろう、セラックろう、鯨ろう、ラノリン（羊毛ろう）、尾羽脂、セレシン、オゾケライト（地ろう）、ペトロラタム、パラフィンワックス、微晶質ワックス；化学修飾ワックス（硬ろう）、例えばモンタンエステルろう、サソールろう、水素化ホバろう、並びに合成ワックス、例えばポリアルキレンワックスおよびポリエチレングリコールワックスである。脂肪以外に適当な他の添加剤は、脂肪様物質、例えばレシチンおよびリン脂質である。用語「レシチン」は、脂肪酸、グリセロール、リン酸およびコリンからエステル化によって生成するグリセロリン脂質を意味するものとして当業者に理解されている。即ち、レシチンはしばしば当業者にホスファチジルコリン（PC）とも称される。記載できる天然レシチンの例はケファリンで、これはホスファチジン酸としても知られ、1, 2 - ジアシル - sn - グリセロール - 3 - リン酸の誘導体である。一方、リン脂質は一般的に、リン酸とグリセロールのモノエステルおよび好ましくはジエステルであると理解され（グリセロールホスフェート）、通常脂肪として分類される。また、スフィンゴシンおよびスフィンゴ脂質も適当である。

【 0 0 6 9 】

〔 真珠光沢ワックス 〕

適当な真珠光沢ワックスの例は、アルキレングリコールエステル、とりわけエチレングリコールジステアレート；脂肪酸アルカノールアミド、とりわけココナツ脂肪酸ジエタノールアミド；部分グリセリド、とりわけステアリン酸モノグリセリド；多塩基性の（場合によりヒドロキシ置換した）カルボン酸と、6 ~ 22 個の炭素原子を有する脂肪アルコールとのエステル、とりわけ酒石酸の長鎖エステル；脂肪化合物、例えば脂肪アルコール、脂肪ケトン、脂肪アルデヒド、脂肪エーテルおよび脂肪カーボネート（少なくとも全部で 24 個の炭素原子数を有するもの）、とりわけラウロンおよびジステアリルエーテル；脂肪酸、例えばステアリン酸、ヒドロキシステアリン酸またはベヘン酸；12 ~ 22 個の炭

10

20

30

40

50

素原子を有するオレフィンエポキシドの12～22個の炭素原子を有する脂肪アルコールおよび/または2～15個の炭素原子および2～10個のヒドロキシル基を有するポリオールによる開環生成物；並びにそれらの混合物である。

【0070】

〔コンシステンシー調整剤および増粘剤〕

適当なコンシステンシー調整剤は主として、12～22個（好ましくは16～18個）の炭素原子を有する脂肪アルコールまたはヒドロキシ脂肪アルコール、および部分グリセリド、脂肪酸またはヒドロキシ脂肪酸である。これらの物質を、同鎖長のアルキルオリゴグルコシドおよび/または脂肪酸 N-メチルグルカミド、および/またはポリグリセロールポリ-12-ヒドロキシステアレートと組み合わせて使用することが好ましい。

10

【0071】

適当な増粘剤の例は、Aerosilタイプ（親水性シリカ）、多糖、とりわけキサントガム、グアー、寒天、アルギネート、チロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、比較的高分子量の脂肪酸ポリエチレングリコールモノエステルおよびジエステル、ポリアクリレート（例えばCarbopols（登録商標）およびPemulenタイプ [Goodrich]；Synthalens（登録商標） [Sigma]；Keltrolタイプ [Kelco]；Sepigelタイプ [Seppic]；Salcareタイプ [Allied Colloids]）、ポリアクリルアミド、ポリマー、ポリビニルアルコールおよびポリビニルピロリドンである。ベントナイト、例えば、シクロペンタシロキサン、ジステアジモニウムヘクトリートおよびプロピレンカーボネートの混合物である、Bentone（登録商標）Gel VS-5PC（Rheox）は特に効果を与える。界面活性剤、例えばエトキシ化脂肪酸グリセリド、脂肪酸とポリオール（例えばペンタエリスリトールまたはトリメチロールプロパン）とのエステル、狭い同族体分布を有する脂肪アルコールエトキシレート、またはアルキルオリゴグルコシド、並びに電解質（例えば塩化ナトリウムおよび塩化アンモニウム）である。

20

【0072】

〔過脂肪剤〕

使用できる過脂肪剤は、例えば、ラノリン、レシチン、ポリエトキシ化もしくはアシル化ラノリンおよびレシチン誘導体、ポリオール脂肪酸エステル、モノグリセリド、および脂肪酸アルカノールアミドのような物質である。脂肪酸アルカノールアミドは、フォーム安定剤としても機能する。

30

【0073】

〔安定剤〕

使用できる安定剤は、脂肪酸の金属塩、例えばステアリン酸またはリシノール酸のマグネシウム塩、アルミニウム塩および/または垂鉛塩である。

【0074】

〔ポリマー〕

適当なカチオン性ポリマーは例えば、カチオン性セルロース誘導体、例えば第4級化ヒドロキシエチルセルロース（Polymer JR 400（登録商標） [Amerchol]）、カチオン性デンプン、ジアルルアンモニウム塩およびアクリルアミドのコポリマー、第4級化ビニルピロリドン/ビニルイミダゾールポリマー、例えばLuviquat（登録商標）（BASF）、ポリグリコールおよびアミンの縮合生成物、第4級化コラーゲンポリペプチド、例えばラウリルジモニウムヒドロキシプロピル加水分解コラーゲン（Lamequat（登録商標）L [Gruenau]）、第4級化小麦ポリペプチド、ポリエチレンイミン、カチオン性シリコーンポリマー、例えばアモジメチコン、アジピン酸およびジメチルアミノヒドロキシプロピルジエチレントリアミンのコポリマー（Cartaretines（登録商標） [Sandoz]）、アクリル酸およびジメチルジアルルアンモニウムクロリドのコポリマー（Merquat（登録商標）550 [Chemviro n]）、ポリアミノポリアミド、例えばFR 2252840 Aに記載のもの、およびその架橋水溶性ポリマー、カチオン性キチン誘導体、例えば第4級化キトサン（場合により、微結晶分布したもの）、ジハロアルキル（例えばジプロモブタン）とビス-ジアルキルアミン（例えばビス-ジメチルアミノ-1,3-プロパン）との縮合生成物、カチオン性グアーガム

40

50

、例えばJaguar（登録商標）CBS、Jaguar（登録商標）C-17、Jaguar（登録商標）C-16 [Celanese]、第4級化アンモニウム塩ポリマー、例えばMirapol（登録商標）A-15、Mirapol（登録商標）AD-1、Mirapol（登録商標）AZ-1 [Miranol]である。

【0075】

適当なアニオン性、双性イオン性、両性および非イオン性ポリマーは、例えば酢酸ビニル/クロトン酸コポリマー、ビニルピロリドン/アクリル酸ビニルコポリマー、酢酸ビニル/マレイン酸ブチル/アクリル酸イソボルニルコポリマー、メチルビニルエーテル/無水マレイン酸コポリマーおよびそのエステル、未架橋ポリアクリル酸およびポリオール架橋ポリアクリル酸、アクリルアミドプロピルトリメチルアンモニウムクロリド/アクリレートコポリマー、オクチルアクリルアミド/メタクリル酸メチル/メタクリル酸 t-ブチルアミノエチル/メタクリル酸 2-ヒドロキシプロピルコポリマー、ポリビニルピロリドン、ビニルピロリドン/酢酸ビニルコポリマー、ビニルピロリドン/メタクリル酸ジメチルアミノエチル/ビニルカプロラクタムターポリマー、並びに場合により誘導体化したセルロースエーテル、およびシリコンである。

10

【0076】

〔シリコン化合物〕

適当なシリコン化合物は、例えば、ジメチルポリシロキサン、メチルフェニルポリシロキサン、環状シリコン、並びにアミノ変性、脂肪酸変性、アルコール変性、ポリエーテル変性、エポキシ変性、フッ素変性、グリコシド変性および/またはアルキル変性シリコン化合物（室温で液状および樹脂様であり得るもの）である。他の適当なシリコン化合物は、ジメチルシロキサン単位数200～300の平均鎖長を有するジメチコンおよび水素化シリケートの混合物であるシメチコンである。

20

【0077】

〔UV光保護フィルター〕

UV光保護因子は、例えば、室温で液状または結晶であり、紫外線を吸収して、その吸収したエネルギーをより長波長の放射線（例えば熱）として放出することのできる有機物質（光保護フィルター）である。UV-Bフィルターは、油性または水溶性であり得る。油性物質を以下例示する：

【0078】

- ・ 3-ベンジリデンカンファーまたは3-ベンジリデンノルカンファーおよびそれらの誘導体、例えば3-(4-メチルベンジリデン)-カンファー；
- ・ 4-アミノ安息香酸誘導体、好ましくは4-(ジメチルアミノ)-安息香酸-2-エチルヘキシルエステル、4-(ジメチルアミノ)-安息香酸-2-オクチルエステル、および4-(ジメチルアミノ)-安息香酸アミルエステル；
- ・ 桂皮酸エステル、好ましくは4-メトキシ桂皮酸-2-エチルヘキシルエステル、4-メトキシ桂皮酸プロピルエステル、4-メトキシ桂皮酸イソアミルエステル、2-シアノ-3,3-フェニル桂皮酸-2-エチルヘキシルエステル（オクトクリレン）；
- ・ サリチル酸エステル、好ましくはサリチル酸-2-エチルヘキシルエステル、サリチル酸-4-イソプロピルベンジルエステル、サリチル酸ホモメンチルエステル；

30

【0079】

- ・ ベンゾフェノン誘導体、好ましくは2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、2-ヒドロキシ-4-メトキシ-4'-メチルベンゾフェノン、2,2'-ジヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン；
- ・ ベンザルマロン酸エステル、好ましくは4-メトキシベンザルマロン酸ジ-2-エチルヘキシルエステル；
- ・ トリアジン誘導体、例えば2,4,6-トリアニリノ-(p-カルボ-2'-エチル-1'-ヘキシルオキシ)-1,3,5-トリアジン、およびオクチルトリアゾン、またはジオクチルブタミドトリアゾン (Uvasorb (登録商標) HEB)；
- ・ プロパン-1,3-ジオン、例えば1-(4-t-ブチルフェニル)-3-(4'-メトキシフェニル)-プロパン-1,3-ジオン；

40

50

・ケトトリシクロ(5.2.1.0)デカン誘導体。

【0080】

適当な水溶性物質は、次のような物質である：

・2-フェニルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸並びにそのアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、アンモニウム塩、アルキルアンモニウム塩、アルカノールアンモニウム塩およびグルカンモニウム塩；

・ベンゾフェノンのスルホン酸誘導体、好ましくは2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン-5-スルホン酸およびその塩；

・3-ベンジリデンカンファールのスルホン酸誘導体、例えば4-(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル)-ベンゼンスルホン酸および2-メチル-5-(2-オキソ-3-ボルニリデン)-スルホン酸並びにそれらの塩。

10

【0081】

適当な典型的なUV-Aフィルターはとりわけ、ベンゾイルメタン誘導体、例えば1-(4'-t-ブチルフェニル)-3-(4'-メトキシフェニル)-プロパン-1,3-ジオン、4-t-ブチル-4'-メトキシジベンゾイルメタン(Parsol(登録商標)1789)または1-フェニル-3-(4'-イソプロピルフェニル)-プロパン-1,3-ジオン、およびエンアミン化合物である。

【0082】

UV-AフィルターおよびUV-Bフィルターを混合物として使用しても当然よい。特に好ましい組み合わせは、ベンゾイルメタン誘導体、例えば4-t-ブチル-4'-メトキシジベンゾイルメタン(Parsol(登録商標)1789)および2-シアノ-3,3-フェニル桂皮酸-2-エチルヘキシルエステル(オクトクリレン)と、桂皮酸エステル、好ましくは4-メトキシ桂皮酸-2-エチルヘキシルエステルおよび/または4-メトキシ桂皮酸プロピルエステルおよび/または4-メトキシ桂皮酸イソアミルエステルとの組み合わせからなる。好ましくは、そのような組み合わせは、水溶性フィルター、例えば2-フェニルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸並びにそのアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、アンモニウム塩、アルキルアンモニウム塩、アルカノールアンモニウム塩およびグルカンモニウム塩と組み合わせる。

20

【0083】

上記可溶性物質の他に、不溶性遮光顔料、即ち、微分散金属酸化物または塩を、この目的のために使用してもよい。適当な金属酸化物の例は、とりわけ、酸化亜鉛、二酸化チタン、および鉄、ジルコニウム、ケイ素、マンガン、アルミニウムおよびセリウムの酸化物、並びにそれらの混合物である。使用できる塩は、ケイ酸塩(タルク)、硫酸バリウムおよびステアリン酸亜鉛である。このような酸化物および塩は、皮膚の手入れおよび保護用エマルジョン並びに装飾的化粧品中に、顔料として使用される。

30

【0084】

このような粒子は、100nm未満、好ましくは5~50nm、更に好ましくは15~30nmの平均直径を有するべきである。粒子は球形であり得るが、楕円形粒子または他の非球形粒子を使用してもよい。顔料は、表面処理(即ち、親水化または疎水化)してもよい。その典型例は、コーティングした二酸化チタン、例えばTitan dioxid T 805(Degussa)またはEusolex(登録商標)T2000(Merck)である。適当な疎水性コーティング材料はとりわけ、シリコンおよびこの場合特にトリアルコキシオクチルシランまたはシメチコンである。日焼け止め剤中には、いわゆるマイクロピグメントまたはナノピグメントを使用することが好ましい。微粉化した酸化亜鉛を使用することが好ましい

40

【0085】

〔生物起源活性成分および酸化防止剤〕

生物起源活性剤として、例えば、トコフェロール、酢酸トコフェロール、トコフェロールパルミテート、アスコルビン酸、(デオキシ)リボ核酸およびその分裂生成物、-グルカン、レチノール、ピサボロール、アラントイン、フィタントリオール、パンテノール、AHA酸、アミノ酸、セラミド、疑似セラミド、精油、植物抽出物、例えばスモモ抽出

50

物、バンバラナッツ抽出物、およびビタミン複合体である。

【0086】

酸化防止剤は、UV線が皮膚に侵入すると開始される光化学反応鎖を断つ。その典型例を次に挙げる。アミノ酸（例えばグリシン、ヒスチジン、チロシン、トリプトファン）およびその誘導体、イミダゾール（例えばウロカニン酸）およびその誘導体、ペプチド、例えばD、L-カルノシン、D-カルノシン、L-カルノシンおよびこれらの誘導体（例えばアンセリン）、カロチノイド、カロテン（例えばβ-カロテン、α-カロテン、リコペン）およびその誘導体、クロロゲン酸およびその誘導体、リボン酸およびその誘導体（例えばジヒドロリボン酸）、アウロチオグルコース、プロピルチオウラシルおよび他のチオール（例えばチオレドキシン、グルタチオン、システイン、シスチン、シスタミン、およびそのグリコシル-、N-アセチル-、メチル-、エチル-、プロピル-、アミル-、ブチル-、ラウリル-、パルミトイル-、オレイル-、リノレイル-、コレステリル-およびグリセリル-エステル）およびこれらの塩、ジラウリルチオジプロピオネート、ジステアリルチオジプロピオネート、チオジプロピオン酸およびその誘導体（エステル、エーテル、ペプチド、脂質、ヌクレオチド、ヌクレオシドおよび塩）、スルホキシミン化合物（例えばブチオニンスルホキシミン、ホモシステインスルホキシミン、ブチオニンスルホン、ペンタ-、ヘキサ-およびヘプタ-チオニンスルホキシミン）（例えば $pmol \sim \mu mol / kg$ 程度の極く少ない適含量で）、

10

【0087】

（金属）キレート剤（例えばβ-ヒドロキシ脂肪酸、パルミチン酸、フィチン酸、ラクトフェリン）、α-ヒドロキシ酸（例えばクエン酸、乳酸、リンゴ酸）、フミン酸、胆汁酸、胆汁抽出物、ビリルビン、ビリベルジン、EDTA、EGTAおよびそれらの誘導体、不飽和脂肪酸およびその誘導体（例えばα-リノレン酸、リノール酸、オレイン酸）、葉酸およびその誘導体、ユビキノン、ユビキノールおよびこれらの誘導体、ビタミンCおよびその誘導体（例えばアスコルビルパルミテート、Mgアスコルビルホスフェート、アスコルビルアセテート）、トコフェロールおよび誘導体（例えばビタミンEアセテート）、ビタミンAおよび誘導体（ビタミンAパルミテート）、ベンゾイン樹脂のコニフェリルベンゾエート、ルチン酸およびその誘導体、β-グリコシルルチン、フェルラ酸、フルフリリデングルシトール、カルノシン、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、ノルジヒドログアヤク酸、ノルジヒドログアイアレチン酸、トリヒドロキシブチロフェノン、尿酸およびその誘導体、マンノースおよびその誘導体、スーパーオキシド-ジスムターゼ、亜鉛およびその誘導体（例えばZnO、ZnSO₄）、セレンおよびその誘導体（例えばメチオニンセレン）、スチルベンおよびその誘導体（例えば酸化スチルベン、酸化トランススチルベン）、並びに本発明の目的に適当な上記活性物質の誘導体（塩、エステル、エーテル、糖、ヌクレオチド、ヌクレオシド、ペプチドおよび脂質）。

20

30

【0088】

〔消臭剤および抗菌剤〕

化粧用消臭剤は、体臭に対して作用するか、マスクするか、または除去する。体臭は、アポクリン汗に皮膚細菌が作用して不快臭のある分解産物を形成することによって生じる。従って、消臭剤は、抗菌剤、酵素阻害剤、臭気吸収剤または臭気マスクング剤として作用する活性成分を含有する。

40

【0089】

・抗菌剤

基本的に、適当な抗菌剤は、グラム陽性菌に対して作用する全ての物質、例えば4-ヒドロキシ安息香酸並びにその塩およびエステル、N-(4-クロロフェニル)-N'-(3,4-ジクロロフェニル)-尿素、2,4,4'-トリクロロ-2'-ヒドロキシジフェニルエーテル（トリクロサン）、4-クロロ-3,5-ジメチルフェノール、2,2'-メチレン-ビス-(6-プロモ-4-クロロフェノール)、3-メチル-4-(1-メチルエチル)-フェノール、2-ベンジル-4-クロロフェノール、3-(4-クロロフェノキシ)-1,2-プロパンジオール、3-ヨード-2-プロピニルブチルカルバメー

50

ト、クロロヘキシジン、3,4,4'-トリクロロカルバニリド(TTC)、抗菌性香料、チモール、タイム油、オイゲノール、丁子油、メントール、ミント油、ファルネソール、フェノキシエタノール、グリセロールモノカプレート、グリセロールモノカプリレート、グリセロールモノラウレート(GML)、ジグリセロールモノカプレート(DMC)、サリチル酸-N-アルキルアミド、例えばN-オクチルサリチルアミドまたはN-デシルサリチルアミドである。

【0090】

・酵素阻害剤

適当な酵素阻害剤は、例えばエステラーゼ阻害剤である。これらは、好ましくは、クエン酸トリアルキル、例えばクエン酸トリメチル、クエン酸トリプロピル、クエン酸トリイソプロピル、クエン酸トリブチル、およびとりわけクエン酸トリエチル(Hydagen(登録商標)CAT)である。エステラーゼ阻害剤は、酵素活性を阻害することにより、臭気の生成を抑制する。適当なエステラーゼ阻害剤である他の物質は、ステロールスルフェートまたはホスフェート、例えばラノステロール-、コレステロール-、カンペステロール-、スチグマステロール-およびシトステロール-スルフェートまたはホスフェート、ジカルボン酸およびそのエステル、例えばグルタル酸、グルタル酸モノエチルエステル、グルタル酸ジエチルエステル、アジピン酸、アジピン酸モノエチルエステル、アジピン酸ジエチルエステル、マロン酸およびマロン酸ジエチルエステル、ヒドロキシカルボン酸およびそのエステル、例えばクエン酸、リンゴ酸、酒石酸または酒石酸ジエチルエステル、およびグリシン酸亜鉛である。

【0091】

・臭気吸収剤

適当な臭気吸収剤は、臭気生成化合物を吸収し、概ね保持することのできる物質である。このような臭気吸収剤は、各成分の分圧を低下し、それにより各成分の拡散率も低下する。この過程で、香料が損なわれず維持されることが重要である。臭気吸収剤は細菌に対して有効ではない。臭気吸収剤は例えば、リシノール酸の錯亜鉛塩、または当業者に「fixatives」として知られる、特殊な、主として臭気中和香料、例えばラブダナムまたはエゴノキの抽出物、またはある種のアピエチン酸誘導体を、主成分として含有する。

【0092】

臭気マスキング剤は、臭気マスキング剤としての機能に加えて、防臭剤に香気を付与する、香料または香油である。例えば天然および合成香料の混合物が、香油として記載され得る。天然香料は、花、茎および葉、果実、果皮、根、木、草、針葉および枝、樹脂およびバルサム抽出物を包含する。動物性原料、例えばシベットおよびカストリウムを使用してもよい。典型的な合成香料化合物は、エステル、エーテル、アルデヒド、ケトン、アルコールおよび炭化水素型の生成物である。エステル型香料化合物の例は、ベンジルアセテート、p-t-ブチルシクロヘキシルアセテート、リナリルアセテート、フェニルエチルアセテート、リナリルベンゾエート、ベンジルホルメート、アリルシクロヘキシルプロピオネート、スチラリルプロピオネート、およびベンジルサリチレートである。エーテルは例えば、ベンジルエチルエーテルを包含し、アルデヒドは例えば、8~18個の炭素原子を有する直鎖アルカナル、シトラール、シトロネラル、シトロネリルオキシアセトアルデヒド、シクラメンアルデヒド、ヒドロキシシトロネラル、リリアールおよびブルゲオナルを包含する。適当なケトンには例えば、イオンン類、およびメチルセドリルケトンである。適当なアルコールは、アネトール、シトロネロール、オイゲノール、イソオルゲノール、ゲラニオール、リナロール、フェニルエチルアルコールおよびテルピネオールである。炭化水素は主として、テルペン類およびバルサム類を包含する。しかしながら、共同で快い香を発する種々の香料化合物の混合物を使用することが好ましい。

【0093】

芳香成分として用いられることの多い比較的低揮発性の精油もまた、香油として適している。その例は、セージ油、カモミール油、丁子油、メリッサ油、ミント油、シナモン葉油、リンデン花油、ジュニパーベリー油、ベチベル油、乳香油、ガルバナム油、ラブダナ

10

20

30

40

50

ム油およびラバンジン油である。下記のを単独で、または混合物として使用することが好ましい：ベルガモット油、ジヒドロミルセノール、リリアール、リラルール、シトロネロール、フェニルエチルアルコール、 α -ヘキシルシンナムアルデヒド、ゲラニオール、ベンジルアセトン、シクラメンアルデヒド、リナロール、ボイスアムブレネフォルテ (Bois ambrene Forte)、アンブロキシサン (Ambroxan)、インドール、ヘジオン (hedione)、サンデルイス (sandelice)、レモン油、マンダリン油、オレンジ油、アリルアミルグリコレート、シクロベルタル (cyclovertal)、ラバンジン油、クラリーセージ油、 α -ダマスコン、ゼラニウム油パーボン、シクロヘキシルサリチレート、パートフィックスクール (Vertofix Coeur)、イソ-イー-スーパー (Iso-E-Super)、フィクソリド NP (Fixolid e NP)、エベルニル、イラルデイン (iraldein) ガンマ、フェニル酢酸、ゲラニルアセテート、ベンジルアセテート、ローズオキシド、ロミレート (romilat)、イロチル (irotyl) およびフロラメート (floramat)。

10

【0094】

・制汗剤

制汗剤はエクリン汗腺の働きに作用することによって、発汗を抑制して、脇下の湿りおよび体臭を消す。水性または水不含有の制汗製剤は通例、下記成分を含有する：

- ・活性収斂剤、
- ・油成分、
- ・非イオン性乳化剤、
- ・共乳化剤、
- ・コンシステンシー調整剤、
- ・添加剤、例えば増粘剤または錯化剤、および/または
- ・非水性溶媒、例えばエタノール、プロピレングリコールおよび/またはグリセロール。

20

【0095】

適当なアストリンゼン制汗活性成分は、主として、アルミニウム、ジルコニウムまたは亜鉛の塩である。このような適当な制汗活性成分は、例えば、塩化アルミニウム、アルミニウムクロロヒドレート、アルミニウムジクロロヒドレート、アルミニウムセスキクロロヒドレート、およびこれらと例えば 1, 2 - プロピレングリコールとの錯化合物、アルミニウムヒドロキシアラントイネート、アルミニウムクロリドタートレート、アルミニウムジルコニウムトリクロロヒドレート、アルミニウムジルコニウムテトラクロロヒドレート、アルミニウムジルコニウムペンタクロロヒドレート、およびこれらと例えばアミノ酸 (例えばグリシン) との錯化合物である。これらに加えて、一般に、油溶性および水溶性の添加剤も、制汗剤中に比較的少量存在し得る。そのような油溶性添加剤は、例えば、

30

- ・炎症抑制性、皮膚保護性、または快い香気を有する精油、
- ・合成皮膚保護活性成分、および/または
- ・油溶性香油

である。

【0096】

典型的な水溶性添加剤の例は、保存剤、水溶性芳香物質、pH調節剤、例えば緩衝剤混合物、水溶性増粘剤、例えば水溶性の天然または合成ポリマー (例えばキサンタンガム、ヒドロキシエチルセルロース、ポリビニルピロリドンまたは高分子量ポリエチレンオキシド) である。

40

【0097】

〔フィルム形成剤〕

一般的なフィルム形成剤は、例えばキトサン、微結晶キトサン、第4級化キトサン、ポリビニルピロリドン、ビニルピロリドン/酢酸ビニルコポリマー、アクリル酸系ポリマー、第4級セルロース誘導体、コラーゲン、ヒアルロン酸またはその塩、並びに同様の化合物である。

【0098】

〔フケ防止活性成分〕

50

適当なフケ防止活性成分は、Pirocton Olamin (1 - ヒドロキシ - 4 - メチル - 6 - (2 , 4 , 4 - トリメチルペンチル) - 2 - (1 H) - ピリジノンモノエタノールアミン塩)、Baypival (登録商標) (Climbazole)、Ketoconazol (登録商標) (4 - アセチル - 1 - { 4 - [2 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) r - 2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 , 3 - ジオキシラン - c - 4 - イルメトキシフェニル } - ピペラジン、ケトコナゾール、エルピオール、二硫化セレン、コロイドイオウ、イオウポリエチレングリコールソルビタンモノオレエート、イオウリシノールポリエトキシレート、イオウタール蒸留物、サリチル酸 (またはヘキサクロロフェンとの組み合わせ)、ウンデシレン酸、モノエタノールアミドスルホスクシネート Na 塩、Lamepon (登録商標) UD (蛋白質 / ウンデシレン酸縮合物)、ジンクピリチオン、アルミニウムピリチオン、およびマグネシウムピリチオン / ジピリチオンマグネシウムスルフェートである。

10

【 0 0 9 9 】

〔 膨潤剤 〕

水相用の膨潤剤は、モンモリロナイト、粘土鉱物、Pemulen、およびアルキル修飾Carbopolタイプ (Goodrich) であり得る。他の適当なポリマーおよび膨潤剤は、R. LochheadによるCosm. Toil. 108, 95 (1993)のレビューに記載されている。

【 0 1 0 0 】

〔 防虫剤 〕

適当な防虫剤は、N , N - ジエチル - m - トルアミド、1 , 2 - ペンタンジオールまたはエチルブチルアセチルアミノプロピオネートである。

20

【 0 1 0 1 】

〔 日焼け剤および脱色剤 〕

ジヒドロキシアセトンが日焼け剤として適当である。メラニンの生成を抑制し、脱色剤として使用される、適当なチロシン抑制剤は、アルブチン、フェルラ酸、コウジ酸、クマリン酸およびアスコルビン酸 (ビタミンC) である。

【 0 1 0 2 】

〔 ヒドロトロープ 〕

流動性を改善するために、更にヒドロトロープ、例えばエタノール、イソプロピルアルコール、またはポリオールを使用し得る。本発明で適当なポリオールは、好ましくは2 ~ 15個の炭素原子および少なくとも2個のヒドロキシル基を有する。ポリオールは、他の官能基 (とりわけアミノ基) を有し得るか、または窒素で修飾されていてもよい。ポリオールの典型例は、

30

- ・グリセロール ;
 - ・アルキレングリコール、例えばエチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ブチレングリコール、ヘキシレングリコール、および平均分子量100 ~ 1000ダルトンのポリエチレングリコール ;
 - ・自己縮合度1.5 ~ 10の工業用オリゴグリセロール混合物、例えばジグリセロール含有量40 ~ 50重量%の工業用ジグリセロール混合物 ;
 - ・メチロール化合物、例えばとりわけ、トリメチロールエタン、トリメチロールプロパン、トリメチロールブタン、ペンタエリスリトールおよびジペンタエリスリトール ;
 - ・低級アルキルグルコシド (特に、アルキル基中に1 ~ 8個の炭素原子を有するもの)、例えばメチルおよびブチルグルコシド ;
 - ・5 ~ 12個の炭素原子を有する糖アルコール、例えばソルビトールまたはマンニトール ;
 - ・5 ~ 12個の炭素原子を有する糖、例えばグルコースまたはスクロース ;
 - ・アミノ糖、例えばグルカミン ;
 - ・ジアルコールアミン、例えばジエタノールアミンまたは2 - アミノ - 1 , 3 - プロパンジオール
- である。

40

【 0 1 0 3 】

50

〔保存剤〕

適当な保存剤は、例えば、フェノキシエタノール、ホルムアルデヒド溶液、パラベン、ペンタンジオールまたはソルビン酸、Surfacine（登録商標）の名称で知られている銀複合物、並びにCosmetics Directiveの付録6、パートAおよびBに挙げられた種類の化合物である。

【0104】

〔香油および香料〕

記載し得る香油は、天然および合成香料の混合物である。天然香料は、下記植物の抽出物を包含する：花（ユリ、ラベンダー、バラ、ジャスミン、ネロリ、イラン - イラン）、茎および葉（ゼラニウム、パチョリ、プチグレン）、果実（アニス、コリアンダー、クミン、ピャクシン）、果皮（ベルガモット、レモン、オレンジ）、根（ナツメグ、アンゼリカ、セロリ、カルダモン、コスタス、アヤメ、ショウブ）、木（マツ、ピャクダン、グアヤックウッド、シーダー、シタン）、草（タラゴン、レモングラス、セージ、タイム）、針葉および枝（トウヒ、モミ、マツ、低木マツ）、樹脂およびバルサム（ガルバナム、エレミ、ベンゾイン、ミルラ、乳香、オポパナクス）。動物性原料、例えばシベットおよびカストリウムを使用してもよい。

【0105】

典型的な合成香料化合物は、エステル、エーテル、アルデヒド、ケトン、アルコールおよび炭化水素型の生成物である。エステル型香料化合物の例は、ベンジルアセテート、フェノキシエチルイソブチレート、p - t - ブチルシクロヘキシルアセテート、リナリルアセテート、ジメチルベンジルカルビニルアセテート、フェニルエチルアセテート、リナリルベンゾエート、ベンジルホルメート、エチルメチルフェニルグリシネート、アリルシクロヘキシルプロピオネート、スチラリルプロピオネート、およびベンジルサリチレートである。エーテルは例えば、ベンジルエチルエーテルを包含し、アルデヒドは例えば、8 - 18個の炭素原子を有する直鎖アルカナル、シトラール、シトロネラル、シトロネリルオキシアセトアルデヒド、シクラメンアルデヒド、ヒドロキシシトロネラル、リリアールおよびブルゲオナルを包含する。適当なケトンは例えば、イオノン類、 - イソメチルイオノンおよびメチルセドリルケトンを含む。適当なアルコールは、アネトール、シトロネロール、オイゲノール、イソオルゲノール、ゲラニオール、リナロール、フェニルエチルアルコールおよびテルピネオールを含む。炭化水素は主として、テルペン類、バルサム類を包含する。しかしながら、共同で快い香を発する種々の香料化合物の混合物を使用することが好ましい。

【0106】

他の適当な香油は、芳香成分として用いられることの多い比較的低揮発性の精油である。その例は、セージ油、カモミール油、丁子油、メリッサ油、ミント油、シナモン葉油、リンデン花油、ジュニパーベリー油、ベチベル油、乳香油、ガルバナム油、ラブダナム油およびラバンジン油である。下記のを単独で、または混合物として使用することが好ましい：ベルガモット油、ジヒドロミルセノール、リリアール、リラル、シトロネロール、フェニルエチルアルコール、 - ヘキシルシナナムアルデヒド、ゲラニオール、ベンジルアセトン、シクラメンアルデヒド、リナロール、ボイスサムブレンフォルテ（Boisambrene Forte）、アンブロキサ（Ambroxan）、インドール、ヘジオン（hedione）、サンデルリス（sandelice）、レモン油、マンダリン油、オレンジ油、アリルアミルグリコレート、シクロベルタル（cyclovertal）、ラバンジン油、クラリーセージ油、 - ダマスコン、ゼラニウム油バーボン、シクロヘキシルサリチレート、パートフィックスクール（Vertofix Coeur）、イソ - イー - スーパー（Iso-E-Super）、フィクソリドNP（Fixolide NP）、エベルニル、イラルデイン（iraldein）ガンマ、フェニル酢酸、ゲラニルアセテート、ベンジルアセテート、ローズオキシド、ロミレート（romillat）、イロチル（irotyl）およびフロラメート（floramat）。

【0107】

適当な香料は、例えば、ペパーミント油、スペアミント油、アニス油、スターアニス油

10

20

30

40

50

、クミン油、ユーカリ油、ウイキョウ油、レモン油、ウインターグリーン油、丁子油、メントールなどである。

【 0 1 0 8 】

〔染料〕

適当な染料は、例えば“ Kosmetische Faerbemittel ”, Farbstoffkommission der Deutschen Forschungsgemeinschaft, Verlag Chemie, Weinheim, 1984, 第 8 1 ~ 1 0 6 頁に挙げられているような、化粧用に適当で承認された物質である。その例は、コチニールレッド A (C.I. 16255)、パテントブルー V (C.I. 42051)、インジゴチン (C.I. 73015)、クロロフィリン (C.I. 75810)、キノリンイエロー (C.I. 47005)、二酸化チタン (C.I. 77891)、インダントレンブルー R S (C.I. 69800)、およびマダーレーキ (C.I. 58000) を包含する。蛍光染料としてルミノールも使用し得る。これらの染料は通常、混合物全体に基づいて 0 . 0 0 1 ~ 0 . 1 重量% の濃度で使用される。

10

【 0 1 0 9 】

助剤および添加剤の総含有率は、組成物に基づいて、1 ~ 5 0 重量%、好ましくは 5 ~ 4 0 重量% であり得る。組成物は標準の冷または温工程によって製造され、好ましくは転相温度法により製造される。

【実施例】

【 0 1 1 0 】

【表 1】

実施例 1: 化粧用エマルション

20

商品名	INCI	重量%
Emul gade (登録商標) SE-PF ⁽²⁾	グリセリルステアレート (および) セアレス-20 (および) セアレス-12 (および) セアリアルアルコール (および) セルパルミテート	6. 00
Lanette (登録商標) O ⁽²⁾	セアリアルアルコール	2. 50
Cegesoft (登録商標) C24 ⁽²⁾	ethylhexylpalmitate	6. 00
Cetiol (登録商標) PGL ⁽²⁾	hexyldecyl carnitine (および) hexyldecyl stearate	5. 00
Myritol (登録商標) 312 ⁽²⁾	caprylic acid/caprinic acid triglyceride	3. 00
DC 200-50cts ⁽³⁾	ジメチコン	1. 00
脱イオン水		100まで
Keltrol T ⁽⁴⁾	キサンタンガム	0. 20
Elestab 50J ⁽¹⁾	colophony (および) methylparaben	0. 40
グリセリン		4. 00
Carbopol 980 ⁽⁵⁾ 2%	カルボマー	15. 00
NaOH 10%		0. 60
Perfume ChampalineG10415611 ⁽⁶⁾		0. 10
オリゴペプチド	N-acetyl-Tyr-Pro-Trp-Phe-NH ₂	0. 0003

30

供給者: (1) Laboratoires Serobiologiques; (2) Cognis; (3) Dow Corning; (4) Kelco; (5) Noveon; (6) Rober tet

40

【 0 1 1 1 】

【表 2】

実施例 2：化粧品用液体美容液

商品名	INCI	重量%
Elestab 50J ⁽¹⁾	ケルフェニン（および）メチルパラベン	0.35
オリゴペプチド	H-Tyr-Pro-Phe-Phe-NH ₂	0.001
Keltrol CGT ⁽⁴⁾	キサンタンガム	0.10
Cosmedia SP ⁽²⁾	ホリアクリル酸ナトリウム	0.25
脱イオン水		100まで

供給者：(1)Laboratoires Serobiologiques；(2)Cognis；(4)Kelco

【 0 1 1 2 】

【表 3】

実施例 3 : AHA含有化粧用エマルジョン

商品名	INCI	重量%	
I	グリセリン	2	
	ブチングリコール	1	
	Veegum Ultra ⁽¹⁾	マグネシウムアルミニウムシリケート	0.5
	Rhodicare XC ⁽²⁾	キサンタンガム	0.5
	Elestab CPN ⁽³⁾	クロルフェニン	0.25
	Versene粉 ⁽⁴⁾	テトラナトリウム EDTA	0.1
	脱イオン水		100まで
II	Eumulgin S2	ステアレス-2	2
	Eumulgin S21	ステアレス-21	2
	Lanette 18	ステアリアルアルコール	1.5
	Cutina MD	グリセリルステアレート	3
	Eusolex 2292 ⁽⁵⁾	エチルヘキシルメトキシシナメート	6
	Eusolex 9020 ⁽⁵⁾	ブチルメチルベンゾイルメタン	2
	Cetiol S	ジエチルヘキシルシクロヘキサン	5
	Eutanol G16	ヘキシルデカノール	3
	Eutanol G 3	オクチルデカノール	
	Creasil IH CG ⁽⁶⁾	イソヘキサデカン	2
	DC 200, 100 cs ⁽⁷⁾	ジメチコン	0.75
	Generol R ⁽³⁾	アラナ (菜種) ステロール	0.5
III	脱イオン水		15
	Photonyl LS ⁽³⁾	アルギニン (および) アセチルトリリン酸二ナトリウム (および) マンニトール (および) ヒドロキシ HCl RNA (および) ヒスチジン HCl (および) フェニルアラニン (および) チロシン	1.5
IV	Dry Flo Plus ⁽⁸⁾	オクテニルコハク酸デンプンアルミニウム	3
V	AHCare G60 ⁽³⁾	グリコール酸 (および) 水 (および) アルギニン	10
	アンモニア水 (20.5%溶液)		十分量 (pH3.5)
VI	Dermosaccharides HC ⁽³⁾	グリセリン (および) 水 (および) グリコサミン/グリカン (および) グリコゲン	2
	Powdy Dream 50-3770 ⁽⁹⁾		0.15
VII	オロパチド	N-アセチル-Tyr-Pro-Phe-Phe-NH ₂	0.001

供給者: (1) Vanderbilt; (2) Rhodia; (3) Laboratoires Serobiologiques;
 (4) Brenntag; (5) Merck; (6) Cosmo Chem; (7) Dow Corning; (8) National Starch;
 (9) Cognis Fragrances

【 0 1 1 3 】

実施例 4

活性成分の製剤組成物: Ac-YPPF-NH₂ (アセチル-Tyr-Pro-Phe-Phe-NH₂): 50 / 50
 (w/w) の水/グリセロール溶液中 400 ppm

【 0 1 1 4 】

実施例 5

〔手順〕

プラセボエマルジョンに対する実施例 4 の活性成分を 2% 含むエマルジョンの鎮静効果

10

20

30

40

50

について、16人の有志によるインピボでの官能試験を行った。有志は、熱に対する皮膚感覚のレベルを感知する訓練をした。この訓練中、皮膚の熱感度を「熱知覚分析装置(TSA)」を用いた方法によって評価した。訓練終了時、肩の後ろに2つのゾーンの範囲を設定した：一方はプラセボエマルジョンで処理し、もう一方は2%活性成分含有エマルジョンで処理した(2 μ l/cm²の標準化した塗布)。生成物を塗布してから120分後、有志は熱の知覚を2段階(「感覚的に不快」および「痛い」)で評価した。その結果は、処理されたゾーンおよびプラセボゾーンにおける各々のレベルの感度で観察された温度変化のまとめである。

【0115】

試験した生成物の組成：

【表4】

2%活性成分含有エマルジョン

相A	
水	100.00まで
プロピレングリコール(および)フェノキシエタノール(および)クロルフェニソル(および)メチルパラベン	2.50
セテarylイソナエート(および)セテアレス-20(および)セテarylアルコール(および)グリセリルステアレート(および)グリセリン(および)セテアレス-12(および)セチルパルミテート	10.00
キサンタンガム	0.20
ホリアクリル酸ナトリウム(および)水素化ホリテセン(および)PPG-5 ラウレス-5	1.20
雲母(および)二酸化チタン	1.00
相B	
ジカプリルカーボネート	3.00
相C	
活性成分	2.00

【0116】

【表5】

活性成分不含有エマルジョン(プラセボ)

相A	
水	100.00まで
プロピレングリコール(および)フェノキシエタノール(および)クロルフェニソル(および)メチルパラベン	2.50
セテarylイソナエート(および)セテアレス-20(および)セテarylアルコール(および)グリセリルステアレート(および)グリセリン(および)セテアレス-12(および)セチルパルミテート	10.00
キサンタンガム	0.20
ホリアクリル酸ナトリウム(および)水素化ホリテセン(および)PPG-5 ラウレス-5	1.20
雲母(および)二酸化チタン	1.00
相B	
ジカプリルカーボネート	3.00

【0117】

10

20

30

40

【表6】

結果

	感覚的に不快(°C)	痛い(°C)
実施例4に基づく活性成分を2%含むエマルジョンで処理したゾーンにおける温度の知覚変化(生成物の塗布前および塗布してから120分後)(AI)	2.5±0.6	1.7±0.4
プラセボエマルジョンで処理したゾーンにおける温度の知覚変化(生成物の塗布前および塗布してから120分後)(PL)	1.3±0.6	1.2±0.5
差: AI - PL	1.3±0.5	0.5±0.3

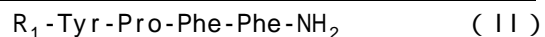
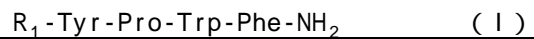
10

【0118】

2%活性成分含有エマルジョンを塗布してから120分後、プラセボゾーンと比較して、「不快」および「痛い」のレベルに対する熱の知覚は著しく減少した。これらの結果は、実施例4の活性成分を2%含むエマルジョンを塗布してから120分後の鎮静効果を示している。

本明細書の当初の開示は、少なくとも下記の態様を包含する。

[1] 式(I)および/または式(II)：



[式中、R₁は、Tyrのアミノ末端部のNH₂基と結合しており、

20

a) -H、

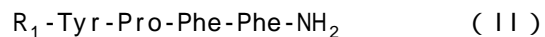
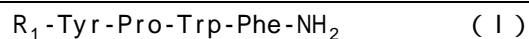
b) -OH、-SH、-COOHまたは-CONH₂基によって官能化され得る、1~24個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、または

c) 二官能性リンカーを介してTyrのアミノ末端部と結合するステロールまたはスフィンゴ脂質基

からなる群から選択される。]

で示されるオリゴペプチドの化粧的使用。

[2] 敏感肌を処置する組成物の製造のための、式(I)および/または式(II)：



30

[式中、R₁は、Tyrのアミノ末端部のNH₂基と結合しており、

a) -H、

b) -OH、-SH、-COOHまたは-CONH₂基によって官能化され得る、1~24個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、または

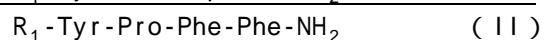
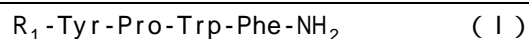
c) 二官能性リンカーを介してTyrのアミノ末端部と結合するステロールまたはスフィンゴ脂質基

からなる群から選択される。]

で示されるオリゴペプチドの使用。

40

[3] 少なくとも1種の式(I)および/または式(II)：



[式中、R₁は、Tyrのアミノ末端部のNH₂基と結合しており、

a) -H、

b) -OH、-SH、-COOHまたは-CONH₂基によって官能化され得る、1~24個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、または

c) 二官能性リンカーを介してTyrのアミノ末端部と結合するステロールまたはスフィンゴ脂質基

50

からなる群から選択される。]

で示されるオリゴペプチド、および

少なくとも1種の、 - ヒドロキシ酸、 - ヒドロキシ酸およびレチノイドからなる群から選択される化粧用剤

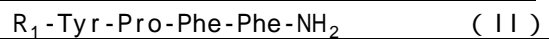
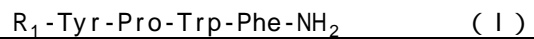
を含んでなる化粧用組成物。

[4] R₁ が、 H、または 1 ~ 12 個の炭素原子、好ましくは 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、最も好ましくはアセチル基である、前記 [1] ~ [3] のいずれかに記載の使用または組成物。

[5] オリゴペプチドを、 0 . 001 ~ 1000 ppm、好ましくは 0 . 05 ~ 500 ppm、最も好ましくは 0 . 1 ~ 100 ppm の濃度で使用することを特徴とする、前記 [1] ~ [4] のいずれかに記載の使用または組成物。

10

[6] 式 (I) および / または式 (II) :



[式中、 R₁ は、 T y r のアミノ末端部の NH₂ 基と結合しており、

b) - OH、 - SH、 - COOH または - CONH₂ 基によって官能化され得る、 1 ~ 24 個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、または

c) 二官能性リンカーを介して T y r のアミノ末端部と結合する、ステロールまたはスフィンゴ脂質基

20

である。]

で示されるオリゴペプチド。

[7] R₁ が、 1 ~ 12 個の炭素原子、好ましくは 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖飽和または不飽和或いは分枝飽和または不飽和アシル基、最も好ましくはアセチル基である、前記 [6] に記載のオリゴペプチド。

【配列表】

0005770965000001.app

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
C 0 7 K 5/107 (2006.01) C 0 7 K 5/107

(74)代理人 100162710

弁理士 梶田 真理奈

(72)発明者 ベロニク・ジロン

フランス、エフ - 5 4 2 7 0 エセイ - レ - ナンシー、リュ・ロジェ・ベラン 7 3 ビス番

(72)発明者 フィリップ・ムソー

フランス、エフ - 5 4 5 1 0 トンブレーヌ、アレー・ジャン - パティスト・クレマン 6 番

(72)発明者 ジャン - リュク・コンテ - オドノー

フランス、エフ - 5 4 1 3 0 サン - マクス、リュ・デ・フクシア 3 番

(72)発明者 オルガ・フレ

フランス、エフ - 5 4 2 8 0 セシャン、アヴニユ・デゼレウー 1 0 番

合議体

審判長 松浦 新司

審判官 小川 慶子

審判官 新居田 知生

(56)参考文献 国際公開第 0 3 / 0 2 0 3 0 4 (W O , A 2)
特開 2 0 0 4 - 1 7 5 6 8 7 (J P , A)

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

A61K8/00-8/99

A61Q1/00-90/00