

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3655781号

(P3655781)

(45) 発行日 平成17年6月2日(2005.6.2)

(24) 登録日 平成17年3月11日(2005.3.11)

(51) Int. Cl.<sup>7</sup>

A 6 1 K 31/375

A 6 1 K 7/00

F I

A 6 1 K 31/375

A 6 1 K 7/00

H

請求項の数 7 (全 9 頁)

(21) 出願番号	特願平11-238910	(73) 特許権者	000215958
(22) 出願日	平成11年8月25日(1999.8.25)		帝國製薬株式会社
(65) 公開番号	特開2001-64175(P2001-64175A)		香川県東かがわ市三本松567番地
(43) 公開日	平成13年3月13日(2001.3.13)	(74) 代理人	100089244
審査請求日	平成13年5月8日(2001.5.8)		弁理士 遠山 勉
		(74) 代理人	100090516
			弁理士 松倉 秀実
		(74) 代理人	100100549
			弁理士 川口 嘉之
		(72) 発明者	首藤 十太郎
			香川県大川郡大内町三本松567番地
		審査官	加藤 浩

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ビタミンC又はその誘導体を配合したパップ剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

ビタミンC又はその誘導体を含有する架橋高分子のゲルと支持体とを含むパップ剤であって、前記ゲルはメタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル及び塩化アルミニウムの内、2種を含有することにより高分子が架橋されていることを特徴とするパップ剤。

【請求項2】

高分子がゼラチン、アラビアガム、グルコマンナン、キサンタンガム、トラガントガム、ポリアクリル酸、ポリアクリル酸ナトリウム、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドリキシプロピルセルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、メチルセルロース、メチルビニルエーテル・無水マレイン酸共重合体、ポリアルギン酸ナトリウム、ポリエチレンオキサイドからなる群から選択される1または2以上である請求項1に記載のパップ剤。

【請求項3】

ビタミンC又はその誘導体の含有量が架橋高分子のゲル100重量部に対して0.01~10重量部であることを特徴とする請求項1または2に記載のパップ剤。

【請求項4】

メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種の架橋剤の含有量の和が架橋高分子のゲル100重量部に対して0.5~5重量部であることを特徴とする請求項1~3の何れか一項に記載のパップ剤。

10

20

**【請求項 5】**

高分子の含有量が架橋高分子のゲル 100 重量部に対して 1 ~ 40 重量部であることを特徴とする請求項 1 ~ 4 の何れか一項に記載のパップ剤。

**【請求項 6】**

前記ゲルの pH が 5.5 ~ 8.5 の範囲である請求項 1 ~ 5 項の何れか一項に記載のパップ剤。

**【請求項 7】**

前記ゲルは、更に多価アルコールを含む請求項 1 ~ 6 の何れか一項に記載のパップ剤。

**【発明の詳細な説明】****【0001】**

10

**【発明の属する技術分野】**

本発明は、ビタミン C 又はその誘導体を含むパップ剤に関するものである。更に詳しくは、本発明はビタミン C 又はその誘導体を含む架橋高分子のゲルと支持体とを含むパップ剤に関するものである。

**【0002】****【従来の技術】**

従来のパップ剤における水溶性粘着成分は、消炎鎮痛用のパップ剤（外皮用貼付剤）、保湿化粧用パック、冷却ゲルシートなど今日では、広く日常的に用いられおり、カオリン、グリセリンをベースとしてポリアクリル酸ナトリウム、カルボキシメチルセルロースナトリウム等の水溶性高分子物質、各種の有効成分、水等を加えて練合したものに金属架橋剤

20

**【0003】****【発明が解決しようとする課題】**

ビタミン C 又はその誘導体は以前より、皮膚メラニンの生成抑制による色素の異常な沈着を防止する効果が知られており、これを美白作用効果を得るための有効成分として化粧用パック等のパップ剤に配合することも試みられている。しかし、ビタミン C 又はその誘導体を粘着性のパップ剤に添加するとビタミン C 又はその誘導体と金属架橋剤の相互作用により、水溶性高分子間に架橋が形成されないため安定したゲルを形成することはできず、パップ剤としての成形が不可能であるという問題点があった。

**【0004】**

30

**【課題を解決するための手段】**

そこで、この問題を解決するために鋭意検討した結果、架橋剤としてメタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2 種を、水溶性高分子、グリセリン、カオリン、水等の練合物に配合することにより保形性の良いゲル状のパップ剤を得ることができることを見出し、本発明を完成した。

**【0005】**

すなわち、本発明は、ビタミン C 又はその誘導体を含む架橋高分子のゲルと支持体とを含むパップ剤であって、前記ゲルはメタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2 種により高分子が架橋されていることを特徴とするパップ剤である。

40

**【0006】**

本発明においては、高分子はゼラチン、アラビアガム、グルコマンナン、キサンタンガム、トラガントガム、ポリアクリル酸、ポリアクリル酸ナトリウム、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドリキシプロピルセルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、メチルセルロース、メチルビニルエーテル・無水マレイン酸共重合体、ポリアルギン酸ナトリウム、ポリエチレンオキサイドからなる群から選択される 1 または 2 以上であるのが好ましい。

**【0007】**

本発明においては、ビタミン C 又はその誘導体の含有量は架橋高分子のゲル 100 重量部

50

に対して0.01~10重量部であるのが好ましい。

本発明においては、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種の架橋剤の含有量の和は、架橋高分子のゲル100重量部に対して0.5~5重量部であるのが好ましい。

本発明においては、高分子の含有量は架橋高分子のゲル100重量部に対して1~40重量部であるのが好ましい。

【0008】

また、本発明のパップ剤のゲルのpHは5.5~8.5の範囲であるのが好ましい。さらに本発明のパップ剤のゲルは、更に多価アルコールを含む前記パップ剤である。

【0009】

【発明の実施の形態】

以下、本発明を更に詳しく説明する。

本発明は、ビタミンC又はその誘導体を含む架橋高分子のゲルと支持体とを含むパップ剤であって、前記ゲルはメタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種により高分子が架橋されていることを特徴とするパップ剤である。すなわち、本発明のパップ剤は、ビタミンC又はその誘導体とメタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種と高分子とを含むことを特徴とするものである。このパップ剤は、ビタミンC又はその誘導体を有効成分として含むことによりビタミンC又はその誘導体による各種の効果を得ることができ、且つメタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種を架橋剤として含むことによりビタミンC又はその誘導体の存在下でも高分子が架橋されてゲルを形成するため、優れた保形性および粘着性を有することができる。まず、これらの各成分のそれぞれについて以下説明する。

【0010】

<1> ビタミンC又はその誘導体

本発明の架橋高分子のゲルを含むパップ剤は、ビタミンC、すなわちL-アスコルビン酸、またはL-アスコルビン酸の誘導体を含む。L-アスコルビン酸の誘導体には、L-アスコルビン酸ナトリウム、リン酸L-アスコルビルマグネシウム等のL-アスコルビン酸の各種の塩、パルミチン酸L-アスコルビル、ステアリン酸L-アスコルビル、ビタミンCイソプロピルのようなエステル等が挙げられる。これらのビタミンCまたはその誘導体は単独で使用することもできるが、2種類以上を組み合わせ使用することもできる。その配合量は架橋高分子のゲル100重量部に対して、0.01~10重量部であるのが好ましく、1~5重量部であるのが更に好ましい。本発明のビタミンC又はその誘導体を含むため、ビタミンCに由来する各種の効果、例えば皮膚メラニンの生成抑制による美白作用効果等を得ることができる。

【0011】

上記のように本発明のパップ剤はビタミンC又はその誘導体を有効成分として含むが、他の有効成分を含むこともできる。好ましい有効成分としては、ヒアルロン酸ナトリウム、ビタミンA、コラーゲン等が挙げられる。

【0012】

<2> 高分子物質

本発明のパップ剤は高分子を含む。高分子としては、ゼラチン、アラビアガム、グルコマンナン、キサンタンガム、トラガントガム等の天然高分子、ポリアクリル酸、ポリアクリル酸ナトリウム、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、メチルセルロース等のセルロース類、メチルビニルエーテル・無水マレイン酸共重合体、ポリアルギン酸ナトリウム、ポリエチレンオキサイド等の水溶性合成高分子が挙げられる。これらの高分子の分子量は特に限定されるものではない。

【0013】

これらの高分子は単独で使用しても良いし、2種類以上組み合わせ使用してもよい。これらの高分子の中では、ポリアクリル酸及びポリアクリル酸ナトリウムに他の高分子を混合して使用するのが好ましい。この高分子の配合量は、選択する高分子の種類により適宜選択することができるが、架橋高分子のゲル100重量部に対して1～40重量部であるのが好ましく、5～20重量部であるのが更に好ましい。このような量の高分子を配合することにより、保形性が良く、また、粘着性のよいパップ剤を作製することができる。

【0014】

<3> 架橋剤

本発明の架橋高分子のゲルを含むパップ剤は、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種を架橋剤として含む。

10

【0015】

メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの組み合わせは、製品の貼附部位や粘着力により適宜選択して使用することができる。メタケイ酸アルミン酸マグネシウムは、例えば、富士化学工業(株)からノイシリンとして購入したものを使用することができ、乾燥水酸化アルミニウムゲルは、協和化学工業(株)から乾燥水酸化アルミニウムゲルとして購入したものを使用することができる。塩化アルミニウムについては、和光純薬工業(株)から塩化アルミニウムとして購入したものを使用でき、選択する高分子の種類や求められる粘着力により適宜上記の内2種を選択することができる。

【0016】

本発明で使用するこれらの架橋剤の構造式を以下に示す。

メタケイ酸アルミン酸マグネシウム： $Al_2O_3 \cdot MgO \cdot 2SiO_2 \cdot xH_2O$

乾燥水酸化アルミニウムゲル： $Al_2O_3 \cdot nH_2O$

塩化アルミニウム： $AlCl_3 \cdot 6H_2O$

メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種の配合量は、架橋高分子のゲル100重量部に対して0.5～5重量部であるのが好ましく、0.7～3重量部であるのが更に好ましい。0.5～5重量部の割合でメタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種を配合することにより、ビタミンC又はその誘導体を含む場合でも、高分子を架橋させゲルを形成することができ、ゲルの保形性を長期間維持することができる安定なパップ剤を得ることができる。

20

30

【0017】

パップ剤にビタミンCまたはその誘導体を配合すると、通常、ビタミンCまたはその誘導体と架橋剤との相互作用により、高分子が架橋されなくなるが、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種を架橋剤として用いることにより、高分子に好適に架橋が形成される。

【0018】

<4> パップ剤

本発明の架橋高分子のゲルを含むパップ剤は上記の成分の他に、水を適量含む。水の含有量は架橋高分子のゲル100重量部に対して、20重量部～80重量部であるのが好ましく、30重量部～60重量部であるのが更に好ましい。

40

【0019】

パップ剤は、更に、通常のパップ剤に用いられる種々の添加剤として、グリセリン、ソルビトール、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、エチレングリコール等の多価アルコールを含むのが好ましい。これらの多価アルコールの中ではグリセリン、ソルビトール、プロピレングリコールを使用するのが好ましい。多価アルコールの含有量は、架橋高分子のゲル100重量部に対して、5～40重量部であるのが好ましく、10～30重量部であるのが更に好ましい。これらの多価アルコールを適量な範囲で配合することにより、保形性および粘着性を長期間安定に保持することができる。

【0020】

50

また、本発明のパップ剤は、カオリン、ベントナイト、酸化チタン等の無機物を含むのが好ましい。無機物の中ではカオリンを使用するのが好ましい。これらの無機物の含有量は、架橋高分子のゲル100重量部に対して、0.1重量部～20重量部であるのが好ましく、2重量部～10重量部であるのが更に好ましい。これらの無機物を配合することにより、パップ剤、膏体の凝集力を高めることができる。

**【0021】**

また、本発明のパップ剤は、通常のパップ剤に用いられる種々の添加剤として、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、亜硫酸水素ナトリウム、エリソルビン酸等の酸化防止剤、メチルパラベン、プロピルパラベン等の防腐剤、硬化ヒマシ油等の界面活性剤、ホホバ油、ユーカリ油等の油分、エデト酸ナトリウム等のキレート剤、水酸化ナトリウム、酒石酸等のpH調整剤、香料、色素等を必要に応じて適宜配合することができる。これらの添加剤の種類は特に限定されるものではなく、従来より、パップ剤、パック、軟膏、ジェル、クリーム等に使用されているものを適宜選択して、使用することができる。また、その含有量についても、特に限定されるものではなく、適宜その使用目的に応じてその含有量を調製することができる。

10

**【0022】**

また、本発明のパップ剤は、pH5.5～8.5において用いるのが好ましく、pH6.0～8.0において用いるのが更に好ましい。pH5.5～8.5において使用すると、パップ剤の保形性および粘着性はよく、長期保存下における安定性がよい。なお、パップ剤のpHは、例えば、通常のpHメーターを用いて測定することができる。

20

**【0023】**

本発明のパップ剤は、使いやすさやビタミンC又はその誘導体あるいは他の有効成分の効果を持続的に得るという点からは、以下に述べるように支持体を含むパップ剤として使用する。

**【0024】**

支持体を含むパップ剤は例えば、以下のようにして製造することができる。すなわち、上記の各成分を均一に練合してペースト状に調製して作製した膏体（ゲル）とを、常法にしたがって、紙、不織布、プラスチックフィルム等の支持体に塗布して展延してパップ剤を得る。パップ剤の保護のために表面に剥離紙を貼りあわせ、所定の大きさに裁断して使用してもよい。パップ剤を製造する方法は特に限定されるものではなく通常パップ剤を製造する際に用いる方法を適宜使用することができる。

30

**【0025】**

支持体としては紙、不織布、プラスチックフィルム等を使用することができ、特に限定されるものではないが、不織布、ニットを使用するのが好ましい。

本発明のパップ剤は、ビタミンCまたはその誘導体と水溶性の高分子と水とを含むペーストに、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2種を架橋剤として用いることにより高分子に架橋を形成し、安定したゲルを成形することができる。そしてこのパップ剤は、固化し難く、離水による分離、支持体からの裏ジミ、支持体から周りへのダレ等が生じず、安定した保形性を有することが分かった。

40

**【0026】****【実施例】**

以下、実施例を示し、本発明を具体的に説明するが、本発明は下記の実施例に限定されるものではない。

**【0027】****【実施例1～6】**

下記の表1に示す成分を混合して、各種の膏体（ゲル）を得た。そして、得られた膏体をポリエステル繊維から成る基布に、1000g/m<sup>2</sup>となるように展延し、剥離紙を前記膏体表面に貼附し、パップ剤を得た。

**【0028】**

50

【表 1】

表 1

成分	実施例						
	1	2	3	4	5	6	
メタケイ酸アルミン酸 マグネシウム	1	3	-	-	1	3	10
乾燥水酸化アルミニウムゲル	-	-	1	3	3	1	
塩化アルミニウム	3	1	3	1	-	-	
L-アスコルビン酸	3	3	3	-	-	-	
リン酸L-アスコルビル マグネシウム	-	-	-	3	3	3	
D-ソルビトール	20	5	-	8	-	15	
グリセリン	18	20	15	-	9	-	
プロピレングリコール	-	-	5	15	10	5	20
ポリエチレングリコール	-	-	-	-	7	13	
カオリン	3	-	2	-	-	-	
酒石酸	-	-	0.4	-	0.1	-	
リンゴ酸	0.5	-	-	-	0.4	-	
トリエタノールアミン	-	1	-	0.5	-	0.3	
水酸化ナトリウム	-	0.2	-	-	-	-	
メチルパラベン	1	1	1	1	1	1	
プロピルパラベン	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	
ポリアクリル酸	4	-	2	-	3	-	30
ポリアクリル酸ナトリウム	4	5	-	7	4	6	
ポリビニルピロリドン	1	-	3	-	-	-	
カルボキシメチルセル ロースナトリウム	-	5	5	3	-	5	
アルギン酸ナトリウム	4	-	-	-	6	-	
EDTA	0.05	0.03	0.02	0.02	0.01	0.01	
精製水	36.95	55.27	59.08	57.98	51.99	47.19	
合計	100	100	100	100	100	100	40
pH	5.5	8.5	6.0	7.5	6.5	7.0	

【0029】

【比較例 1 ~ 3】

実施例 1 ~ 3 の成分より、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムを除去し、代わりに水酸化アルミナマグネシウムを同量配合したパップ剤を比較例 1 ~ 3 として製造した。

【0030】

## 【比較例 4 ~ 6】

実施例 4 ~ 6 の成分より、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムを除去し、代わりに合成ヒドロタルサイトを同量配合したパップ剤を比較例 4 ~ 6 として製造した。

## 【0031】

## 【比較例 7 ~ 9】

実施例 1 ~ 3 の成分より、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムを除去し、代わりにジヒドロキシアルミニウムアミノアセテートを同量配合したパップ剤を比較例 7 ~ 9 として製造した。

## 【0032】

## 【比較例 10 ~ 12】

実施例 4 ~ 6 の成分より、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムを除去し、代わりに水酸化アルミニウムを同量配合したパップ剤を比較例 10 ~ 12 として製造した。

## 【0033】

<パップ剤の評価>

実施例および比較例で製造したパップ剤は、以下のように評価した。すなわち、室温  $40 \pm 2$ 、相対湿度 (RH) 75% に調節した恒温恒湿器に、上記の実施例 1 ~ 6 及び比較例 1 ~ 12 の各パップ剤をそれぞれ袋に入れて密封して 2 週間保存した。その後、各パップ剤を恒温恒湿器から取り出して室温に戻し、袋を開封した後、各パップ剤を評価した。すなわち、膏体のはみ出し、不織布への裏ジミ、ポリエチレンフィルムを剥がした時のフィルムへの膏体付着、人の皮膚に貼付した後に剥がした時の皮膚への膏体付着を、下記の表 2 の評価基準に従ってそれぞれ官能試験により評価した。結果を下記の表 3 に示す。なお、人の皮膚に貼付した後に剥がした時の皮膚への膏体付着の評価は、上記のパップ剤を皮膚に貼付して、2 時間後に皮膚から剥がすことにより評価した。

## 【0034】

## 【表 2】

表 2 評価基準

—	: 全くなし
±	: わずかにあり
+	: 多量にあり

## 【0035】

## 【表 3】

10

20

30

表 3

	膏体の はみ出し	不織布への 裏ジミ	フィルムへの 膏体付着	人皮膚への 膏体付着
実施例 1	—	—	—	—
実施例 2	—	—	—	—
実施例 3	—	—	—	—
実施例 4	—	—	—	—
実施例 5	—	—	—	—
実施例 6	—	—	—	—
比較例 1	+	+	+	+
比較例 2	+	+	+	+
比較例 3	+	±	+	+
比較例 4	±	+	±	+
比較例 5	+	+	±	±
比較例 6	+	+	+	+
比較例 7	+	±	+	+
比較例 8	+	+	+	±
比較例 9	+	±	+	+
比較例 10	±	+	±	+
比較例 11	+	+	+	+
比較例 12	+	+	+	±

10

20

上記の表 3 の結果から明かなように、本発明のパップ剤は、パップ剤として膏体のはみ出しや、裏ジミ、膏体付着の無い、優れた保形性を有する。実施例 1 ~ 3 のパップ剤は、上記の試験方法にしたがって 40 で 1 ヶ月、3 ヶ月、6 ヶ月間保存した場合も、同様に膏体のはみ出し、裏ジミ、膏体付着は認められなかった。

30

【 0 0 3 6 】

【 発明の効果 】

本発明のビタミン C 又はその誘導体を配合したパップ剤は、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、塩化アルミニウムの内、2 種を含有することにより高分子が架橋されてゲルを形成することにより優れた保形性を有する。

---

フロントページの続き

(56)参考文献 特開平07-258060(JP,A)  
特公平05-080939(JP,B2)

(58)調査した分野(Int.Cl.<sup>7</sup>, DB名)

A61K 31/375

CA(STN)

MEDLINE(STN)

WPI(DIALOG)

PubMed

BIOSIS(DIALOG)