(19) **日本国特許庁(JP)**

(12) 特 許 公 報(B2)

(11)特許番号

特許第3747069号 (P3747069)

(45) 発行日 平成18年2月22日(2006.2.22)

(24) 登録日 平成17年12月2日(2005.12.2)

(51) Int.C1.

 \mathbf{F} L

A 6 1 K 8/00 (2006.01) A 6 1 Q 15/00 (2006.01) A 6 1 K 7/32

請求項の数8 (全7頁)

(21) 出願番号 特願平10-526159

(86) (22) 出願日 平成9年11月21日 (1997.11.21)

(65) 公表番号 特表2001-505890 (P2001-505890A)

(43) 公表日 平成13年5月8日 (2001.5.8)

(86) 国際出願番号 PCT/EP1997/006676 (87) 国際公開番号 W01998/025583

(87) 国際公開日 平成10年6月18日 (1998. 6. 18)

審査請求日 平成16年9月21日 (2004. 9. 21)

(31) 優先権主張番号 9625562.5

(32) 優先日 平成8年12月9日(1996.12.9)

(33) 優先権主張国 英国(GB)

(73) 特許権者

ユニリーバー・ナームローゼ・ベンノート

シヤープ

オランダ国、エヌ・エル-3013・アー・エル・ロッテルダム、ウエーナ・455

|(74)代理人

弁理士 川口 義雄

|(74)代理人

弁理士 伏見 直哉

(74) 代理人

弁理士 田中 夏夫

|(72)発明者 ホール,リン

イギリス国、ヨークシヤー・ワイ・オー・ 4・2・ジイ・アール、ポツクリントン、 ザ・バーク、ストローザー・クローズ・2

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】制汗化粧品組成物

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

化粧品ベースに懸濁した固体微粒子状制汗活性物質を含むヒトの皮膚への局所塗布のためのスティック形態の懸濁制汗組成物であって、前記制汗活性物質が、容積平均粒子サイズが $0.5 \sim 8 \ \mu$ mの範囲内にある比較的小さい粒子と、容積平均粒子サイズが $12 \ \mu$ mより大きく $50 \ \mu$ mより小さい範囲内にある比較的大きい粒子とのブレンドを含んでいることを特徴とする組成物。

【請求項2】

12~50µmの範囲にある容積平均粒子サイズを有する制汗活性物質が12~35µmの粒子サイズを有する、請求項1に記載のスティック形態の懸濁制汗組成物。

【請求項3】

12~50µmの範囲にある容積平均粒子サイズを有する制汗活性物質が12~25µmの粒子サイズを有する、請求項1に記載のスティック形態の懸濁制汗組成物。

【請求項4】

組成物中における比較的小さい容積平均粒子サイズを有する制汗活性物質と比較的大きい容積平均粒子サイズを有する制汗活性物質の重量比が、5:1~1:5の範囲内にある、請求項1~3のいずれか1項に記載のスティック形態の懸濁制汗組成物。

【請求項5】

前記比が3:1~1:3の重量比の範囲内にある、請求項4に記載の<u>スティック形態の</u>懸 濁制汗組成物。

【請求項6】

制汗活性物質が組成物の10~26重量%を構成する、請求項1~5のNずれか1項に記載のスティック形態の懸濁制汗組成物。

【請求項7】

さらにマスキングオイルを含む、請求項1~6のいずれか1項に記載の<u>スティック形態の</u> 懸濁制汗組成物。

【請求項8】

本質的に無水である、請求項1~7のいずれか1項に記載の<u>スティック形態の</u>懸濁制汗組成物。

【発明の詳細な説明】

本発明は、スティック形態の化粧品組成物に関する。特にこの発明は、ヒトの皮膚への局所塗布用組成物に関しており、これは制汗組成物である。このようなスティック組成物は、一般的には使用に便利なようにスティックホルダーと共に用いることができる。制汗スティックは、例えば制汗活性物質が、エマルジョンの水性内部相に溶解されているエマルジョンタイプのものが知られている。あるいはまた、一般的には金属塩、例えばアルミニウム塩又はジルコニウム塩である制汗活性物質が、固体の化粧品ベース中に小さい粒子として懸濁されていることが知られている。このような懸濁スティックは、典型的には一般にゲル化剤、例えば蝋質物質をベースとしており、多くの場合一般的にはオイル物質、例えばシリコーン油(fluid)であるキャリヤー流体と組合わされている。

懸濁スティックに関連する 1 つの問題は、製品の感覚的特性、例えば塗布中の皮膚へのこの製品の感触を改良したいということである。このような懸濁スティックにおいて、懸濁制汗活性物質の容積平均粒子サイズは、一般的には 0.5 ~約8 μ mの範囲内にある。より大きい制汗活性物質粒子(すなわち約 12 μ mより大きく約 5 0 μ mより小さい、一般的には 15 ~25 μ mの範囲にある容積平均粒子サイズを有するもの)をこのような懸濁スティックに組込むことが、塗布の際の化粧品スティックの感覚特性に対してプラスの働きをすることを本発明者らは発見した。特に、皮膚に対するスティックの改良された「すべり」が観察された。

さらには、比較的細かい粒子サイズ(すなわち容積平均粒子サイズ $0.5 \sim 8~\mu$ m)と、比較的大きい粒子サイズの活性物質(一般的には $1.2~\mu$ mより大きく $5.0~\mu$ mより小さい容積平均粒子サイズ、特に $1.5 \sim 2.5~\mu$ mの容積平均粒子サイズのもの)との混合物を、このような局所組成物に使用することによって、比較的細かい粒子サイズの活性物質のみを含んでいるスティックと比較して、感覚的な良い効果が生じることをも発見した。特に比較的大きい平均容積粒子サイズの活性物質と比較的小さい平均容積粒子サイズの活性物質とのこのような組合わせが用いられる時、製品の製造中にこの比較的大きい平均容積粒子サイズの物質の沈降が避けられ、これによって製品中における制汗活性物質の不均一な分布が避けられることを発見した。

従って本発明によれば、化粧品ベース中に懸濁した固体微粒子状制汗活性物質を含むヒトの皮膚への局所塗布用懸濁制汗組成物において、この制汗活性物質は、容積平均粒子サイズが $0.5 \sim 8~\mu$ mの範囲内にある比較的小さい粒子と、容積平均粒子サイズが $1.2~\mu$ m $\sim 5.0~\mu$ mの範囲内にある比較的大きい粒子とを含んでいることを特徴とする組成物が提供される。

好ましくは組成物中における比較的小さい粒子と比較的大きい粒子の比は、5:1~1:5の重量比の範囲内にあり、より好ましくは3:1~1:3の重量比の範囲内にある。当該組成物の化粧品ベース物質は、公知の任意の化粧品ベース組成物であり得るが、好ましくは、ゲル化剤とキャリヤー流体の混合物、例えば長鎖脂肪族アルコールと揮発性シリコーンの混合物をベースとし得る。化粧品ベースが長鎖脂肪族アルコールと揮発性シリコーンの混合物である場合、この脂肪族アルコールは、例えば $C_8~C_{22}$ 脂肪族アルコール、例えばセチルアルコール、ステアリルアルコール、ミリスチルアルコール、ラウリルアルコール、ベヘニルアルコール、及びこれらの混合物であり得る。一般的にはこのような長鎖脂肪族アルコールは、この組成物中に5~25重量%のレベルで存在し得る。

10

20

30

10

20

30

40

50

このような固体スティック組成物において有用な揮発性シリコーンは、3~9個、好ましくは4~5個の珪素原子を含んでいる環式あるいは線状ポリジメチルシロキサンであり得る。適切な物質には、例えばダウ・コーニング社(DowCorning Сorporation)によって提供されるシリコーンが含まれる。例えばダウ・コーニング344、345、及び200、ユニオン・カーバイド社のもの(Union Сarbide)、例えばシリコーン7207及びシリコーン7158、及びスタウファー・ケミカル社(StaufferChemical)のもの、例えばSWS-03314が含まれる。この組成物のその他の適切な成分には、ワックス、例えばヒマワックス(castorwax)、脂肪酸、シリコーンワックス、及びグリセロールモノステアレートが含まれ、ワックスのレベルは一般的には0.5~25重量%の範囲である。

好ましくは本発明による組成物は本質的には無水である。すなわち該組成物は約1重量%より少ない量の水しか含まない。

この組成物中の制汗活性物質は、該組成物中に懸濁可能であるならば、既知のあらゆる制汗活性物質であってもよいが、特にアルミニウム及び / 又はジルコニウムをベースとする金属塩を含み得る。一般的に組成物中に存在する制汗活性物質の総量は、制汗の効果を与えるために、少なくとも 10 重量%又はそれ以上のレベルである。一般的には、この組成物中の制汗活性物質の総量は 26 重量%を越えない。制汗金属活性物質に関するさらなる手引きとしては、制汗金属塩の非限定的リストが、FDAによる「対人体使用のための制汗薬品、試験的最終モノグラフ(Antiperspirant drug products for over the counter humanuse, a tentative final monograph)」、官報第47巻:36592(19824)に挙げられている。

比較的小さい粒子サイズの物質の容積平均粒子サイズは、 $0.5 \sim 8 \ \mu$ mの範囲内にあり、好ましくは $3 \sim 6 \ \mu$ mの範囲内にある。比較的大きい粒子サイズの物質の容積平均粒子サイズは、 $1.2 \ \mu$ mより大きく $5.0 \ \mu$ mより小さい範囲内にあり、好ましくは $1.2 \sim 3.5 \ \mu$ mの範囲内にあってもよく、より好ましくは $1.5 \sim 2.5 \ \mu$ mの範囲内にあり、最も好ましくは約 $1.8 \ \mu$ mである。大体この容積平均粒子サイズにおいて、最適な感覚的効果が得られ、比較的大きい粒子サイズの物質が沈降しようとする傾向は最小限にされることがわかる。

あるいはまた相対的に大きい粒子サイズの活性物質は、粒子サイズの分布を測定し、粒子サイズのピーク値を導き、ピーク値の両側における粒子サイズの範囲を示すことによって特徴付けることができる。この範囲において、粒子の集団は、ピーク粒子サイズの少なくとも半分であり、ここにおいていわゆる「ピーク高さの半分」と呼ばれる粒子サイズの値の低い方の値は、10 μmよりも大きい。

本発明による組成物における、比較的小さい容積平均粒子サイズの活性物質と比較的大きい容積平均粒子サイズの活性物質との混合物は、レーザー散乱技術を用いて、粒子サイズに対する粒子数の分布として見た時に、2 μ m 以上の1 つ以上のピークを生じる(すなわち2 つの異なるピークが見える)ことが多いことも分かった。

本発明による組成物に用いられる制汗活性物質の容積平均粒子サイズは、光散乱装置、例えばマルバーン・マスターサイザー(Malvern MasterSizer)を用いたレーザー散乱技術によって測定される。用いられる適切な技術は、イギリス国ウオーセスターシャー・マルバーン・スプリング・レーン・サウスのマルバーン・インストルメンツ社(Malvern Instruments Ltd.,Spring LaneSouth,Malvern,Worcestershire,England)のDr.Alan Rawleによる、「粒子サイズ分析の基本原理(The Basic Principles of Particle SizeAnalysis)」において言及されている。

様々な平均容積粒子サイズの制汗物質は、登録商標の物質、例えば A Z G 7 1 6 7 (約 5 μ m の容積平均粒子サイズを有するサミット社(S u m m i t)のもの)、 A Z G 6 3 1 3 (約 1 8 μ m の容積平均粒子サイズを有するサミット社のもの)、及びウエストクロー

ル(Westchlor) ZR30BDM HBD (約35 μ mの容積平均粒子サイズを有するウエストウッド社(Westwood)のもの)として入手しうる。

本発明の好ましい実施態様において、この組成物はさらにはマスキングオイルを含んでいる。これは一般的には組成物の $3 \sim 40$ 重量%のレベルで存在してもよい。適切なマスキングオイルには、例えばポリデセン、ポリブテン、 PPG - 14 ブチルエーテル、非揮発性シリコーン、イソプロピルミリステート、イソプロピルパルミテート、 $C_{12} \sim C_{15}$ アルキルベンゾエート、及び鉱油が含まれる。

本発明による制汗剤組成物は、最終製品に必要とされる特性に従って、その他の成分を含み得る。

場合によっては本発明による組成物における化粧品ベースに存在し得るその他の成分の例には、次のものが含まれる:

- 化粧品として許容しうる賦形剤、例えば直鎖及び枝分れ鎖低級アルコール、例えばエタノール、イソプロパノール、又はイソブタノール;
- 非揮発性シリコーン;
- 脱臭香料(deoperfumes)及び抗菌剤として作用しうる化合物を包含する 脱臭化合物、例えば不飽和脂肪酸、又はその他の抗菌剤、例えばチバガイギー社(Cib a Geigy)のイルガサン(Irgasan)DP300;
- 皮膚感触改良剤、例えばタルク、及び微粉砕ポリエチレン、これの例には、アクミスト(Acumist) B18がある;
- 保湿剤、例えばポリオール、例えばグリセロール;
- 皮膚軟化剤;
- サンスクリーン;
- 香料;
- 保存料及び酸化防止剤;
- 皮膚改良剤、例えばアラントイン;
- 着色剤;
- 皮膚冷却剤、例えばメントール及びメントール誘導体:
- スティック制汗製品に通常用いられているその他の化粧品添加剤。この組成物の残りの部分(すなわち76~90重量%)は、一般的に化粧品ベースにおける前記成分のどれを含んでいてもよい。

本発明による組成物は一般的に、キャリヤー流体(例えば揮発性シリコーン)及び任意のゲル化剤、例えばワックスを80 まで加熱し、この溶融混合物を攪拌することによって調製することができる。ついで、組成物のパウダー成分(例えば制汗活性物質、タルク)を添加し、完全に混合する。ついで、この組成物を65 まで冷却し、香料を添加する。ついで、組成物を58 まで冷却し、スティックバレルに注ぎ入れ、ついでさらに冷却して固体スティックを形成する。

ここで本発明をさらに実施例によって記載するが、これは単なる例である。

組成物

次の組成物を前記方法に従って調製する。これらは本発明によるものである。

20

成分	1	2	3
Zr/Al 制汗活性物質(1)	12. 0	6. 0	18. 0
Zr/Al 制汗活性物質(2)	12. 0	18. 0	6. 0
ステアリルアルコール(3)	14. 0	14. 0	14. 0
水素化ヒマシ油(4)	4. 0	4. 0	4. 0
PEG8 ジステアレート(5)	1. 0	1.0	1. 0
タルク(6)	3. 2	3, 2	3, 2
揮発性シリコーン(7)	52. 8	52. 8	52, 8
香料	1.0	1. 0	1. 0

10

特別な記載がなされていない場合、すべての量は組成物の重量割合%である。

- (1)約5µmの容積平均粒子サイズ、サミット社(Summit)製
- (2)約18µmの容積平均粒子サイズ、サミット社製
- (3)ロロール(Lorol)C18 Deo、ヘンケル社(Henkel)製
- (4) カスターワックス (C a s t o r w a x) M P 8 0 、カスケム社 (C a s c h e m) 製

20

- (5)エストール(Estol)EO4DS3724、ユニケマ社(Unichema)
- (6) スープラフィノ(Suprafino) タルク、サイプラス・インダストリーズ社 (Cyprus Industries)製
- (7) DC345、ダウ・コーニング社(Dow Corning)製

テスト

標準的制汗スティック(制汗活性物質のすべてが8μmより小さい容積平均粒子サイズを 有するもの)及び活性物質のすべてがこれより大きい粒子サイズ(16~20μm)のも のであるスティックと共に前記組成物によるスティックを、スティック中の制汗活性物質 の分布に関して評価し、同様に塗布時の滑らかさに関して、ボランティアに対してパネル テストを行なった。

30

スティックの様々な部分における制汗活性物質の濃度の測定方法は、導電率測定によるも のであり、これにはある一定の重量のスティックの一部(すなわち頂部、中間部、あるい は底部)からの製品を制御された温度の水浴に浸漬し、その導電率を測定することが含ま れる。導電率のレベルの向上は、溶液中のイオンのより高い濃度を示しており、これは今 度はスティックのそのセグメントに存在する制汗活性物質のレベルと関係している。

比較的大きい平均容積粒子サイズ(すなわち16~20μm)の活性物質のみを含んでい るスティックに対して実施された導電率測定は、次のことを示した。すなわち、スティッ クが固化するのに要した時間の間に活性物質のある程度の沈降が生じ、このためスティッ クの一部において制汗活性物質の不足があったということである。しかしながら導電率の 測定は次のことを示している。すなわち、この沈降の問題は、比較的大きい粒子サイズの 活性物質と比較的小さい粒子サイズの活性物質とのブレンドを含む組成物 1~3において 緩和されていたということである。

40

さらには下記の平均パネル評点が示しているように、異なる平均容積粒子サイズの制汗活 性物質のブレンドを含む組成物は、細かい(8μmより小さい)活性物質のみを含む標準 的スティックよりも、塗布の際に改良された滑らかさを示し、16~20μmの活性物質 のみを含んでいるスティックと同程度の滑らかさを示した。

スティック

滑らかさの評点

4 3

6 2

16~20µmの活性物質を含むスティック

「標準的スティック」(0.5~8µmの活性物質)

組成物 15 9組成物 26 3組成物 37 2

この分析は、規定の「記述感覚分析方法論(DescriptiveSensory Analysis methodology)」(Stone, H & Sidel, JL;「感覚的評価プラクティス(Sensory Evaluation Practices)」、アカデミックプレス社(Academic Press, Inc.) 1985年)を用いて実施された。この方法では、一連のよく定義された感覚属性を評価するために、訓練を受けた判定者グループを利用して感覚特性が評価されている。ゼロという評点は最小限の滑らかさを示し、一方100という評点は最大限の滑らかさを示している。

フロントページの続き

(72) 発明者 ホウ,ゴードン・チヤールズ イギリス国、マージーサイド・エル・63・3・ジエイ・ダブリユ、ウイラル、ベビントン、クオーリー・ロード・イースト、ユニリーバー・リサーチ・ポート・サンライト気付

審査官 保倉 行雄

(56)参考文献 特開平04-234311(JP,A) 特開昭63-190811(JP,A) 特公昭51-009009(JP,B1)

(58)調査した分野(Int.CI., DB名) A61K 7/00 - 7/50