

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3545429号
(P3545429)

(45) 発行日 平成16年7月21日(2004.7.21)

(24) 登録日 平成16年4月16日(2004.4.16)

(51) Int. Cl.⁷

F I

A 6 1 K 7/00
A 6 1 K 7/48
A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 7/00 H
A 6 1 K 7/00 J
A 6 1 K 7/00 W
A 6 1 K 7/48
A 6 1 K 47/10

請求項の数 4 (全 7 頁)

<p>(21) 出願番号 特願平4-227728 (22) 出願日 平成4年7月13日(1992.7.13) (65) 公開番号 特開平6-32710 (43) 公開日 平成6年2月8日(1994.2.8) 審査請求日 平成11年3月5日(1999.3.5)</p>	<p>(73) 特許権者 000001959 株式会社資生堂 東京都中央区銀座7丁目5番5号 (74) 代理人 100094570 弁理士 ▲高▼野 俊彦 (72) 発明者 柳田 威 神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株式会社 資生堂研究所 内 (72) 発明者 阪本 興彦 神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株式会社 資生堂研究所 内 審査官 富永 保</p>
---	--

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 レチノール安定配合皮膚外用剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

レチノールとともにポリプロピレングリコールを配合したことを特徴とするレチノール安定配合皮膚外用剤。

【請求項2】

レチノールとともにポリエチレングリコールおよびポリプロピレングリコールを配合したことを特徴とするレチノール安定配合皮膚外用剤。

【請求項3】

ポリプロピレングリコールからなる、皮膚外用剤におけるレチノール安定化剤。

【請求項4】

レチノールを配合した皮膚外用剤に、ポリプロピレングリコールを配合してレチノールを異性化、分解、重合などから構造的に安定化することを特徴とする、皮膚外用剤における安定化方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】

本発明はレチノールの安定性を著しく向上させたレチノール安定配合皮膚外用剤に関するものである。

【0002】

【従来の技術】

レチノールは皮膚角化症等の予防、治療や、皮膚老化の防止、回復に有効な成分であることが知られている。

【0003】

しかしながら、レチノールは構造的に極めて不安定であり、光、空気、熱、金属イオン等により容易に種々の異性化、分解、重合等を起こすため、安定に皮膚外用剤に配合することが困難であった。安定化を目的として脂肪酸エステル化などの手法が試みられているが、エステル化は安定化には効果があるものの皮膚への作用という面ではレチノール自身よりはるかに劣ってしまう。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】

本発明者らは係る事情に鑑み鋭意研究の結果、レチノールとともにポリエチレングリコール（以下PEGと省略する。）、ポリプロピレングリコール（以下PPGと省略する。）の一種または二種以上を配合すればレチノールの安定性が著しく向上することを見出し、本発明を完成するに至った。

【0005】

【課題を解決するための手段】

すなわち本発明の要旨は、レチノールと、PEG、PPGの一種または二種以上を配合することを特徴とする皮膚外用剤のレチノール安定化方法に存在する。

【0006】

以下、本発明の構成について詳述する。

【0007】

本発明に用いられるレチノールは別名ビタミンAと呼ばれ、末端が水酸基であるレチノール自身を示し、その脂肪酸エステルは含まない。a11-トランス型または13-シス型であることが望ましく、それらの混合物であっても構わない。

【0008】

本発明に従って皮膚外用剤に配合される量としては特に制限はないが、レチノールとしての肌への効果を考えると0.0001重量%以上であり、レチノールの効果を強く訴求するためには好ましくは0.001重量%以上である。配合上限は皮膚外用剤としての性質上好ましくは1重量%である。

【0009】

また本発明に配合されるPEG、PPGとしてはPEG200、PEG300、PEG400、PEG1500、PEG4000、PEG6000、PEG20000などや、PPG400、PPG750、PPG1200、PPG2000、PPG3000などがある。

【0010】

これらを一種または二種以上配合するが、本発明の効果を発揮する目的で配合される量としては0.1重量%以上が必要であり、過剰に配合しても本発明の効果を阻害するものではない。しかしながら著しく過剰に配合した場合、皮膚外用剤としての品質を損ねることがあるので注意が必要である。

【0011】

本発明においてレチノールとPEGおよび/またはPPGを配合される皮膚外用剤基剤としては通常の皮膚外用剤基剤ならばいずれのものも利用できる。すなわち、液状、ゲル状、ペースト状、クリーム状、あるいは粉末状、固状などのもので、皮膚外用剤を修飾する成分として保湿剤、油分、界面活性剤、増粘剤、金属封鎖剤、その他の紫外線吸収剤、薬剤、色素、香料などが併用できることは言うまでもない。

【0012】

【実施例】

次に本発明をより多くの実施例で詳述するが本発明はこれにより限定されるものではない。

【0013】

10

20

30

40

50

【表1】

【表1】 各種基剤中でのレチノールの安定性測定結果 (重量%)

	実施例1	実施例2	実施例3	比較例1	比較例2
PEG400	99.9	—	—	—	—
PEG1500	—	99.9	—	—	—
PPG1200	—	—	50	—	—
プロピレングリコール	—	—	49.9	29.9	—
スクワラン	—	—	—	70	99.9
レチノール	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
レチノール定量値					
調製直後	100	100	100	100	100
50℃ 5日後	92	93	90	58	39

10

【0014】

実施例1、2および3では比較例に比べレチノールの安定性が向上しているが、これは本発明に係る効果である。

【0015】

レチノールの定量方法

エタノールを溶媒として用いた325nmでの吸光度測定法により定量を実施した。なお計算にあたっては極大吸収325nm $E(1\%, 1\text{cm}) = 1835$ とした。

20

【0016】

配合例1 レチノール安定配合クリーム

(重量%)

A. セタノール	3
グリセリルモノステアレート	2
POE (25) セチルエーテル	1
ステアリン酸	3
ワセリン	3
イソプロピルミリステート	5
スクワラン	5
レチノール	0.1
BHT	0.05
香料	適量
B. PEG1500	3
グリセリン	9
水酸化カリウム	0.2
精製水	全体を100とする量

30

40

Aの油相部分とBの水相部分をそれぞれ70で加熱溶解し、AをBに加え乳化する。そののち冷却処理をしてクリームを得る。

【0017】

実施例4 レチノール安定配合リップスティック		(重量%)	
固形パラフィン		8	
カルナウバロウ		2	
キャンデリラロウ		4	
マイクロクリスタリンワックス		6	
水添ラノリン		15	
イソプロピルパルミテート	全体を100とする量		10
グリセリルジイソステアレート		30	
PPG3000		15	
レチノール		1	
BHT		0.3	
調合色剤 (赤色系)		7	
香料		適量	

上記の各原料を80 で加熱溶解し、そののち所定の容器に流し込みリップスティックを得る。 20

【0018】

配合例2 レチノール安定配合化粧水		(重量%)	
レチノール		0.0001	
オレイルアルコール		0.001	
α -トコフェロール		0.005	
POE (20) オクチルドデカノール		0.8	
エタノール		8	30
PEG300		3	
PEG1500		1	
メチルパラベン		0.15	
乳酸		0.03	
乳酸ナトリウム		0.07	
精製水	全体を100とする量		40

【0019】

実施例5	レチノール安定配合アイリンクルオイル	(重量%)	
	オリーブオイル	40	
	2-エチルヘキサン酸トリグリセリド	26	
	スクワラン	30	
	PPG4000	2	
	PEG20000	0.9	
	δ -トコフェロール	1	10
	レチノール	0.1	

【0020】

配合例3 レチノール安定配合美容ペースト

PEG300	30	
PEG1500	40	
PEG4000	10	
レチノール	0.3	20
イソプロピルミリステート	5	
POE(25)セチルエーテル	2	
ステアリン酸	5	
精製水	全体を100とする量	

【0021】

配合例4 レチノール安定配合ナイトクリーム

スクワラン	15	30
イソプロピルミリステート	5	
二酸化ケイ素	3	
ワセリン	6	
グリセリルモノイソステアレート	2	
POE(7)硬化ヒマシ油	1.5	
プロピルパラベン	0.2	40
レチノール	0.4	
PEG6000	3	
PEG400	3	
グリセリン	17	
精製水	全体を100とする量	

【0022】

実施例及び配合例の皮膚外用剤は日常的な使用においてレチノールの安定性に優れたものであった。

【 0 0 2 3 】

【 発明の効果 】

本発明のレチノール安定配合皮膚外用剤においてはポリエチレングリコールおよび/またはポリプロピレングリコールを配合することによりレチノールの安定性を著しく向上させることができる。

フロントページの続き

(56)参考文献 特開昭56-055307(JP,A)
特開昭52-018811(JP,A)
特開昭01-268617(JP,A)

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