(19)대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) 。Int. Cl.
A61K 9/113 (2006.01)
A61K 8/06 (2006.01)

(11) 공개번호 10-2006-0113657
(43) 공개일자 2006년11월02일

(21) 출원번호 10-2006-7003853
(22) 출원일자 2006년02월24일
번역문 제출일자 2006년02월24일
(86) 국제출원번호 PCT/IB2004/002965
국제출원일자 2004년08월20일
(87) 국제공개번호 WO 2005/018530
국제공개일자 2005년03월03일

(30) 우선권주장 60/497,648 2003년08월25일 미국(US)

(71) 출원인 포믹스 리미티드
이스라엘 76124 레호보트 와이즈만 사이언스 파크 홀쯔만 스트리트 2

(72) 발명자 타마르킨, 도브
이스라엘 70400 마카빔 하르 힐라 스트리트 537
프라이드만, 도론
이스라엘 99797 카르메이-요새프, 알론 스트리트 33
에이니, 메이르
이스라엘 74 104 네스 지오나 하샤케드 스트리트 2

(74) 대리인 이종우

심사청구 : 없음

(54) 침투성 약제용 거품제

요약

본 발명은 물, 소수성 용매, 계면활성제 및 겔화제를 포함하는 무알콜 화장료용 거품성 담체 및 약제용 거품성 담체에 관한 것이다. 본 발명의 거품성 담체는 피부침투 능력이 우수한 치료적 특성을 가진 활성제와 부형제를 더 포함한다.

명세서

기술분야

본 발명은 물, 소수성 용매, 계면활성제 및 겔화제를 포함하는 무알콜 화장료용 거품성 담체 및 약제용 거품성 담체에 관한 것이다. 본 발명의 거품성 담체는 유용한 치료적 특성을 가진 활성제와 부형제를 더 포함한다.

배경기술

거품제는 국부적용용 약품 및 화장료에 사용한다.

에어로솔 제품과 특히 거품제는 물리적-화학적 체계가 복잡한 구조물로서 임의의 환경에서는 형성되지 않는다. 특히, 거품을 생성하는 구성성분들간의 특별한 밸런스가 중요하다. 조성의 작은 변화로 인하여 거품이 붕괴될 수 있으며, 따라서 다른 준비가 없을 경우, 그 자체로 활성이 있는 물질들의 배합물은 거품으로서 생성되는 능력이 없게 될 수도 있다.

이에 본 발명의 발명자는 새로운 유제에 기반을 둔 거품 제제들을 개발하게 되었다. 예를 들면, 함께 양도된, 동시 계속 출원 WO 2004/037225과 같은 것이 있다

미국 특허 No. 6,423,323은 필요에 따라 요소(urea)와 젖산을 함유하는 거품성 피부 크림에 관한 것이다. 이 피부 크림의 배합물은 본 발명에서는 고려하고 있지 않은 매우 특정한 성분들로 제한되어 있다.

미국 특허 No. 4,145,411은 미네랄 오일(0.25-1 중량%) 및 요소 (0.001-0.006 중량%)를 낮은 농도로 함유하는 면도용 거품 조성물에 관한 것이다. 정의에 의하면, 면도용 크림은 깨지기가 쉽지 않기 때문에 활성물질을 국소 적용하는 것이 용이하지 않고, 특히 피부를 투과해야 하는 조성물을 국소 적용하는데에는 적합하지 않다.

미국 특허 No. 6,410,036은 하이드록시산과 같은 산 구성성분과 카르보하이드레이트, 폴리올(polyol), 아미노산, 카르복시산으로 이루어진 그룹에서 선택된 구성요소를 함유하는 비거품 화장료 조성물에 있어서 공융혼합물의 예를 제공한다.

발명의 요약

본 발명의 일 양태에 따르면 다음의 그룹 즉, (1) 혼합시 공융혼합물을 형성하는 활성제들의 조합(combination) ; (2) 적어도 2% 농도의 요소; (3) 적어도 1% 농도의 하이드록시산, (4) 치료학적 증강제;로 이루어진 군에서 선택된 적어도 하나의 활성 성분을 함유하는 무알콜 화장료 또는 약제용 거품제 조성물이 제공되며, 상기 조성물은 에어로솔 용기에 액화 기체 추진제와 혼합할 때 깨지기 쉬운 거품을 방출하기 때문에 국소적용에 적합하다. 무알콜 거품제 조성물은 수용성 활성제를 포함시키는데도 적합하고, 지용성 활성제를 포함시키는데도 적합하다. 본 명세서에서, 거품성 조성물은 에어로솔 용기로부터 배출될 때 거품을 형성할 수 있는 제제를 포함한다.

본 발명의 하나 또는 그 이상의 양태에 따른 화장료용 또는 약제용 거품성 조성물은, 물, 소수성 용매, 계면활성제 및 겔화제, 및 다음의 그룹 즉, (1) 혼합시에 공융혼합물을 형성하는 활성제의 조합, (2) 적어도 2% 농도의 요소, (3) 적어도 1% 농도의 하이드록시산, (4) 적어도 2% 농도의 치료학적 증강제; 로 이루어진 군에서 선택된 적어도 하나의 활성 구성성분, 및 총 조성물 중량의 약 3-18%의 양의 액화 기체 추진제를 포함한다.

이러한 조성물은 배출되기 전 상태에서 안정한 수중 유형 유제(oil-in water emulsion)가 된다. 에어로솔 용기로부터 분사되면 이 조성물은 국소 또는 점막 투여에 적합한 깨지기 쉬운 거품 생성물을 형성한다.

본 발명의 하나 또는 그 이상의 양태에 있어서, 거품성 조성물에는 소수성 용매는 5%에서 약 10%(class A)의 농도 또는 10%에서 약 20%의 농도(class B) 또는 약 20%에서 약 50%의 농도(class C)로 포함된다. 계면활성제의 농도는 총 중량의 약 0.1%에서 약 5%이며; 겔화제는 0.01%에서 약 5중량%이며; 액화 기체 추진제는 전체 조성물의 약 3%에서 약 18%의 농도로 포함된다. 물과 임의적인 구성성분들을 가하여 100%를 만든다. 그러나 본 명세서에서 상술된 다른 거품성 조성물 양태에 있어서 소수성 용매는 0% 내지 5% 사이의 범위일 수 있다.

하나 또는 그 이상의 양태에 있어서, 상기 조성물의 각각은 0.1% 내지 5%의 농도 범위에서 다른 거품성 보조제를 필요에 따라 추가로 함유할 수 있다.

거품성 조성물은 짧은 사슬을 갖는 지방성 알콜을 함유하지 않기 때문에 자극성이 없고, 건조함을 주지 않는다.

하나 또는 그 이상의 양태에 있어서, 거품성 조성물은 본 명세서에서 상술하는 바와 같은 거품성 조성물 및 적어도 하나의 치료학적으로 유효한 농도의 활성제를 추가로 포함하는 거품성 조성물을 제공한다. 거품제 담체는 부유성 활성제 (suspended active agents) 뿐만 아니라, 수용성 활성제를 포함시키는데도 적합하고 지용성 활성제를 포함시키는데도 적합하다. 이러한 조성물은 인간과 동물 피부 및 점막 장애나 질환을 국소적으로 치료하는데 사용될 수 있다. 다르게는, 본 조성물은 예를 들어, 클렌징, 미용, 매력증강 또는 신체 구조나 기능에 영향을 주지 않고 외형을 변화시키려는 화장용 처치에 적합하다.

또한, 무알콜 거품 조성물을 사용하는 것이 가장 좋은 처치방법인 미용상, 의학상의 장애가 확인되고, 이러한 담체 및 제품의 장점이 증명된다.

본 발명의 하나 또는 그 이상의 양태에 따른 거품성 담체 및 조성물은 현재 사용되는 거품 조성물에 비하여 다양한 장점을 갖는다.

1. 거품제는 가벼우므로 경제적이다.

2. 거품제는 소수성 용매를 소정의 바람직한 농도로 함유함으로써, 기름을 공급해주며(refatting), 피부를 진정시키는 효과가 있다.

3. 거품제는 수용성, 지용성 활성물질 및 부유성 물질을 함유할 수 있다.

4. 거품제는 잘 퍼지기 때문에 팔, 등, 다리와 가슴과 같은 넓은 부위에도 적용할 수 있다.

5. 거품제의 유동성 때문에, 접힌 부위와 주름에 효과적으로 퍼져나감으로써, 과도하게 문지르지 않아도 활성물질이 균일하게 분포되어 흡수된다.

본 명세서에서, 모든 구성성분의 백분율은 총 조성물의 중량에 의한 퍼센트로 한다.

여기에서 사용된 바와 같이, 조성물에서 중량%를 지칭할 때 사용하는 "약"이라는 용어는 보고된 중량%에서 ±10%인 것을 의미한다. 또한, 조성물의 측정된 특성을 지칭할 때 사용하는 "약'이라는 용어는 기술된 값에서 ±20%인 것을 의미한다.

발명의 상세한 설명

소수성 용매 (Hydrophobic solvent)

본 발명의 거품성 조성물은 소수성 용매를 포함한다. 소수성 용매는 실온에서 증류수 100 mL당 약 1 g 미만, 더 바람직하게는 100 mL당 약 0.5 g 미만, 가장 바람직하게는 100 mL당 약 0.1 g 미만으로 용해되는 물질을 포함하며, 소수성 용매는 실온(예를 들면, 약 20-30℃)에서 액체상태이다.

소수성 용매의 전체 함량은 거품성 조성물에서 5% 내지 50%(w/w)로 다양하게 해도 된다. 그러나, 상이한 범위들(여기서 A-C류 조성물)을 지정함으로써 예상되는 화장료용 또는 약제용 필요에 따라 용이하게 적절한 류를 선택할 수 있도록 하였다. 경험에 의하면, 소수성 용매의 농도가 높아질수록, 건성 피부의 치료, 및/또는 지용성 운반체에 의해 전달되는 약물에 더 잘 반응하는 질환의 치료에 더 적합하고, 목표 부위에 활성성분이 머무르는 시간을 조절하는데 더 적합하다. 또한, 제품의 사용편의성과 내성(tolerability)측면을 고려해야 하는데, 매우 높은 농도의 소수성 용매(조성물의 약 25%부터)를 함유하는 경우에는 도포한 후 오일성 느낌이 남게 되어 제품으로서는 바람직하지 않다. 따라서, 거품성 조성물을 사용할 때, 소수성 용매의 농도는 표적 치료 집단과 의도하는 치료 집단의 특정한 요구의 관점에서 선택한다.

하나의 양태에서, 소수성 용매는 미네랄 오일이다. 미네랄 오일(Chemical Abstracts Service Registry number 8012-95-1)은 석유에서 유래한 지방성, 나프탈렌성, 방향성 액체 탄화수소의 혼합물이다. 이들은 통상적으로 액체이고, 점도는 40℃에서 35 내지 100 CST의 범위를 가지며, 유동점(왁스 결정을 과도하게 형성하지 않고 따라서 유동을 방해하지 않고서 오일을 다룰 수 있는 최저 온도)은 0℃ 이하이다. 대조적으로, 바셀린으로도 불리는 백색 페트로라툼(white petrolatum)은 바셀린의 밀랍성으로 인해 도포 후 끈적끈적한 불쾌한 느낌이 남고, 옷을 더럽힐 수 있는 단점이 있다. 따라서, 본 발명에서, 백색 페트로라툼은 소수성 용매로 적합하지 않다.

또 다른 바람직한 소수성 용매는 식물(vegetable), 해양(marine) 또는 동물에서 유래한 액체 오일을 포함하지만, 이것에 한정되는 것은 아니다. 바람직하게는, 불포화 오일은 올리브유, 옥수수유, 대두유, 카놀라유, 면실유, 코코넛유, 참기름, 해바라기유, 지치씨유(borage seed oil), 시지지움 아로마티쿰유(*Syzigium aromaticum oil*), 삼씨유(hempseed oil), 청어유(herring oil), 대구간유(cod-liver oil), 연어유, 아마인유, 밀맥아유(wheat germ oil) , 앵초유(evening primrose oil) 및 이들의 임의의 비율의 혼합물로 이루어진 군에서 선택된다.

특별한 류의 오일은 예를 들어, 오메가-3 지방산과 오메가-6 지방산 에스테르를 함유하는 다가불포화 오일을 포함한다. 이러한 다가불포화 지방산의 예로는 리놀레산(linoleic acid)과 리놀렌산(linolenic acid), 감마-리놀레산(GLA), 에이코사펜타에노산(eicosapentaenoic acid, EPA), 도코사헥사에노산(docosahexaenoic acid, DHA)가 있다. 따라서, 본 발명의 특정한 양태에서 불포화 지방은 오메가-3 오일과 오메가-6 오일, 및 이들의 혼합물에서 선택된 오일을 적어도 6% 함유한다.

또 다른 오일류로서 정유(essential oil)가 있는데, 이것은 국소적용시 치료효과를 나타내는, 생물학적으로 생기는 활성물질을 함유하는 "치료학적 오일"로 여겨지고 있다. 이러한 오일의 예로 들장미열매 오일(rose hip oil)을 들 수 있는데, 이는 레티노이드류를 함유하고 있고, 여드름과 여드름 흉터를 감소시켜주는 것으로 알려져 있으며, 티 트리 오일(tea tree oil)은 항균, 항진균 및 항바이러스 작용을 하는 것으로 알려져 있다. 다른 정유의 예로는, 바질(basil), 캄포유, 카르다몸유, 당근유, 시트로넬라유, 클레리 세이지유, 크정향, 사이프레스유, 유향유, 생강유, 그레이프프루트유, 히솝유, 쟈스민유, 라벤다유, 레몬유, 중국귤유, 마요라나유, 몰약유, 등화유, 육두구유, 페티그레인유, 세이지유, 텐저린유, 바닐라유, 버베나유가 있으며 기타 약초약제 분야에서 알려진 치료학적으로 유효한 오일이 있다.

또 다른 용매류는, 이것에 한정되는 것은 아니나, 국소적용시 치료학적 유용성을 갖는 것으로 알려진 액체성 소수성 식물유래 오일을 포함한다.

소수성 용매류의 또 다른 류는 "에몰리언트" 군으로서 알려져 있다. 상기 정의의 일반성을 훼손함이 없이, 사용적합한 에몰리언트의 예로는 이소스테아르산 유도체(isostearic acid derivatives), 이소프로필 팔미테이트(isopropyl palmitate), 라놀린 오일(lanolin oil), 디이소프로필 디메레이트(diisopropyl dimerate), 말레이티드 대두유(maleated soybean oil), 옥틸 팔미테이트(octyl palmitate), 이소프로필 이소스테아레이트(isopropyl sostearate), 세틸 락테이트(cetyl lactate), 세틸 리놀레이트(cetyl linoleate), 토코페릴 아세테이트(tocopheryl acetate), 아세틸레이티드 라놀린 알콜(acetylated lanolin alcohol), 세틸 아세테이트(cetyl acetate), 페닐 트리메치콘(phenyl trimethicone), 글리세릴 올레이트(glyceryl oleate), 토코페릴 리놀레이트(tocopheryl linoleate), 밀맥아 글리세리드(wheat germ glycerides), 아라키딜 프로피오네이트(arachidyl propionate), 미리스틸 락테이트(myristyl lactate), 데실 올레이트(decyl oleate), 프로필렌 글리콜 리시놀레이트(propylene glycol ricinoleate), 이소프로필 라놀레이트(isopropyl lanolate), 펜타에리스리틸 테트라스테아레이트(pentaerythrityl tetrastearate), 네오펜틸글리콜 디카프릴레이트/디카프레이트(neopentylglycol dicaprylate/dicaprate), 하이드로제네이티드 코코-글리세라이드(hydrogeneted coco-glycerides), 이소노닐 이소노나노에이트(isononyl isononanoate), 이소트리데실 이소노나노에이트(isotrydecyl isononanoate), 미리스틸 미리스테이트(myristyl myristate), 트리이소세틸 시트레이트(triisocetyl citrate), 옥틸 도데카놀(octyl dodecanol), 지방산의 자당 에스터(sucrose esters of fatty acids), 옥틸 하이드록시스테아레이트(octyl hydroxystearate) 및 이들의 혼합물을 들 수 있다. 또한 다른 적합한 에몰리언트의 예는 코즈메틱 벤취 레퍼런스(Cosmetic Bench Reference), pp. 1.19-1.22(1996)에도 나와 있다.

특정 양태에서, 소수성 용매는 미네랄 오일과 에몰리언트가 2:8 내지 8:2의 중량비로 혼합되어 있는 혼합물을 포함한다.

실리콘 오일은 피부보호특성이 있다고 알려져 있으며, 소수성 용매로 사용될 수 있다. 실리콘 오일에는 휘발성 실리콘 오일과, 비휘발성 실리콘 오일이 있는데, 여기서 디메치콘 코폴리올(dimethicone copolyol)과 같은 수용성 실리콘은 (소수성 용매로서의)실리콘 오일의 정의에 포함되지 않는다.

특정 양태에서, 소수성 용매는 적어도 2% 농도의 실리콘 오일을 함유한다.

본 발명의 소수성 용매는 하나 또는 그 이상의 소수성 용매가 어떤 배합으로도 사용될 수 있다.

계면활성제 (Surface-active agents)

본 발명의 거품성 조성물은 계면활성제를 포함한다. 계면활성제는 조성물내에서 오일과 물 성분의 표면 성질을 변화시켜 유제의 형성을 용이하게 해주는 물질이라면 어떤 것이든 포함한다. 계면활성제의 친수성/친유성 밸런스 (hydrophilic/lipophilic balance)(HLB)는 물이나 오일에 대한 유화제의 친화력을 나타낸 것이다. HLB범위는 친수성과 친유성의 양 특성이 균등하게 밸런스를 나타낼 때를 10으로 하고, 1(전체가 친유성)에서 20 (전체가 친수성)까지이다. 친유성 유제(emulsifier)는 유중수형 유제(w/o emulsion)을 형성하는 경향이 있고, 친수성 유제는 수중유형 유제(o/w emulsion)을 헝성하는 경향이 있다. 두 가지 유제를 혼합한 경우 HLB치는 A 유제의 중량 프렉션(fraction) 곱하기 A 유제의 HLB치 더하기 B 유제의 중량 프렉션 곱하기 B 유제의 HLB치이다(가중평균).

음이온성, 양이온성, 비이온성, 즈비터이오닉(zwitterionic), 암포테릭(amphoteric), 암폴리틱(ampholytic) 계면활성제 및 이들의 조합으로부터 선택된 계면활성제라면 어느 것이든 사용될 수 있다. 본 발명의 하나 이상의 양태에 따라서, 계면활성제는 약 9 내지 약 14의 HLB치를 가지며, 상기 HLB치는 대부분의 오일과 소수성 용매의 필수 HLB이다 (주어진 오일의 O/W 유제를 안정화시키기 위해 요구되는 HLB). 따라서, 하나 이상의 양태에서, 조성물은 약 9 내지 14의 HLB치를 갖는 단일 (single) 계면활성제이며, 그리고 하나 이상의 양태에서, 거품 조성물은 하나를 초과하는 계면활성제를 함유하며, 그들의 HLB치의 가중 평균 (weighted average)은 약 9 내지 약 14사이의 범위이다.

계면활성제로는 폴리옥시에틸렌(20) 소르비탄 모노스테아레이트(트윈 60) 과 폴리옥시에틸렌(20) 소르비탄 모노올레이트(트윈 80)과 같은 폴리소르베이트류; Myrj45, Myrj49, Myrj59와 같은 폴리옥시에틸렌(POE) 지방산 에스테르류; 폴리(옥시에틸렌) 세틸 에테르, 폴리(옥시에틸렌) 팔미틸 에테르, 폴리에틸렌 옥시드 헥사데실 에테르, 폴리에틸렌 글리콜 세틸 에테르, brij38, brij52, brij56, brijW1과 같은 폴리(옥시에틸렌) 알킬릴 에테르류; 자당 에스테르류(sucrose esters), 소르비톨과 소르비톨 언하이드라이드(partial esters of sorbitol and sorbitol anhydrides)의 부분 에스테르, 예를 들면, 소르비탄 모노라우레이트와 소르비탄 모노라우레이트-모노 또는 다이글리세리드류, 이소세테스20(isoceteth 20), 소디움메틸 코코일 타우레이트(sodium methyl cocoyl taurate), 소디움 메틸 올레오일 타우레이트(sodium methyl oleoyl taurate), 소디움 라우릴 설페이트, 트리에타놀아민 라우릴 설페이트와 베타인류를 들 수 있지만, 이것에 한정되는 것은 아니다.

본 발명의 몇 양태에서, 계면활성제는 비이온성 계면활성제이다. 대표적인 비이온성 계면활성제는, 수크로글리세라이드로부터의 추출에 의해 또는 식품 지방산의 메틸 및 에틸 에스테르와 자당으로부터 제조된, 식품 지방산과 자당의 모노-, 다이-, 트라이-에스테르류 (mono-, di- and tri-esters of sucrose)를 들 수 있다. 또 다른 예로는 높은 모노에스테르 부분을 가진 자당 에스테르가 있고, 이들은 더 높은 HLB치를 나타낸다.

비이온성 계면활성제와 이온성 계면활성제(예를 들면, 소디움 라우릴 설페이트)를 혼합하여 사용할 수도 있다. 일례로, 비이온성 계면활성제와 이온성 계면활성제는 거품 담체 또는 조성물에서 1:1 과 20:1 사이의 범위 또는 4:1 과 10:1 사이의 범위의 비율로 존재한다.

선행 기술의 거품성 조성물에서와는 달리, 계면활성제의 총량을 낮게 하여도안정한 거품을 얻을 수 있다. 놀랍게도, 계면활성제 레벨을 낮추는 것이 안정한 거품성 조성물을 얻기 위해 필수적이었고, 또한 피부 자극도 줄여주는 것으로 나타났다. 전체 계면활성제의 레벨은 거품성 조성물의 약 0.1 내지 5중량%의 범위에 있으며, 그리고 2중량% 미만, 또는 중량의 1중량% 미만일 수 있다. 따라서, 하나 이상의 양태에서, 계면활성제와 소수성 용매의 비율은 약 1:8 내지 약 1:16의 범위 또는, 약 1:16 내지 약 1:32이다.

거품 보조제 (Foam adjuvants)

본 발명에서 거품 보조제는 거품성 조성물에 필요에 따라 함유될 수 있고, 탄소사슬에 15개 이상의 탄소를 가진 지방 알콜류(fatty alcohols), 예를 들면, 세틸 알콜, 및 스테아릴 알콜(stearyl alcohol)(또는 이들의 혼합물)을 들 수 있다. 다른 지방 알콜류의 예를 들자면, 아라키딜 알콜(arachidyl alcohol, C20), 베헤닐 알콜(behenyl alcohol, C22), 1-트리아콘타놀(1-triacontanol, C30), 및 더 긴 탄소사슬(최대 C50)을 가진 알콜 등을 들 수 있다. 거품 체계를 유지하기 위해 요구되는 지방 알콜류의 농도는 탄소 사슬의 길이와 반비례한다. 대부분의 알콜의 탄소사슬이 최소한 20개의 탄소를 가진 알콜 혼합물을 포함하는 밀랍으로부터 유래한 지방알콜류가 거품보조제로 특히 적합하다.

다른 류의 거품 보조제는 탄소 사슬의 탄소가 16개 이상인 지방산을 포함하며, 예를 들면 헥사데카노산(hexadecanoic acid, C16), 스테아르산(stearic acid, C18), 아라키드산(arachidic acid, C20), 베헨산(behenic acid, C22), 옥타코사노산(octacosanoic acid, C28), 및 더 긴 탄소 사슬을 갖는 지방산(최대 C50)과 이들의 혼합물을 들 수 있다.

필요에 따라, 지방 알콜이나 지방산의 탄소 원자 사슬은 적어도 하나의 이중결합을 가질 수 있다. 또 다른 류의 거품 보조제는 탄소 원자 사슬에 가지가 있는 긴 사슬의 지방 알콜이나 지방산을 포함한다. 또 다른 류의 거품 보조제에서는, 지방산의 탄소 사슬은 하이드록시 기(-OH)로 치환될 수 있는 데, 그 예로 12-하이드록시 스테아르산(12-hydroxy stearic acid)을 들 수 있다.

본 발명의 거품 보조제는 어떠한 혼합비율이어도 무방한 비율로, 지방 알콜, 지방산 및 하이드록시 지방산과 이들의 유도체의 혼합물을 포함하는데, 단, 전체량이 담체 중량의 0.1 내지 5%(w/w)이다. 전체량이 담체 중량의 0.4 내지 2.5%(w/w)일 수 있다.

긴 사슬의 포화 지방 알콜과 단가불포화 지방산, 예를 들어, 스테아릴 알콜, 에리실 알콜, 아라키딜 알콜 및 도코사놀은 항바이러스, 항감염, 증식 억제 및 항염작용을 가지고 있는 것으로 보고되어 있다(미국 특허 No. 4,874,794). 또한 더 긴 사슬의 지방 알콜은, 예를 들어 테트라코사놀, 헥사코사놀, 헵타코사놀, 옥타코사놀, 트리아코탄올 등은 물질대사의 조절 및 조직에 에너지를 주는 성질을 갖고 있다고 알려져 있다. 긴 사슬 지방산은 또한 항감염 특성을 가지고 있는 것으로 알려져 있다. 그러므로, 본 발명의 치료학적 거품 보조제를 포함하는 약제용 또는 화장료용 담체는 현재 사용되는 비활성(inert)의 불활성(non-active) 운반체와 비교해 볼 때, 추가로 치료적인 이익을 제공한다.

겔화제 (Gelling agents)

본 발명의 하나 이상의 양태 중에서 사용할 수 있는 겔화제로는, 로커스트 빈 검, 소디움 알기네이트, 소디움 카제이네이트, 에그 알부민, 젤라틴 아가, 카라지닌 검 소디움 알기네이트, 잔탄 검, 모과씨 추출물, 트라가칸타 검(tragacanth gum), 전분, 화학적으로 변형시킨 전분 등과 같은 천연 중합 물질, 및 셀룰로오스 에테르(예: 하이드록시에틸 셀룰로오스, 메틸 셀룰로오스, 카르복시메틸 셀룰로오스, 하이드록시 프로필메틸 셀룰로오스), 마이크로-크리스탈린 셀룰로오스와 FMC에 의해 제조되는 조성물(Avicel types), 및 폴리비닐피롤리돈, 폴리비닐알콜, 구아검, 하이드록시프로필 구아검, 수용성 전분, 양이온 셀룰로오스, 양이온 구아 등의 반합성 중합물질과, 카르복시비닐 중합체, 폴리비닐피롤리돈, 폴리비닐 알콜 폴리아크릴산 중합체,폴리메타아크릴산 중합체, 폴리비닐 아세테이트 중합체, 폴리비닐클로라이드 중합체, 폴리비닐리덴 클로라이드 중합체 등의 합성 중합물질을 들 수 있지만, 이 것들에 한정되지는 않는다. 필요에 따라 상술한 화합물의 혼합물을 사용할 수도 있다.

본 발명에서 유용한 또 다른 겔화제로는, 예를 들어, B.F.굿리치 사(Goodrich company)에 의해 카르보폴 레지스터드 티엠 레진(Carbopol Registered TM regin)이라는 상표로 시판되는 아크릴산/에틸아크릴레이트 공중합체와 카르복시비닐 중합체가 있다. 이들 수지는 실질적으로 폴리알릴 수크로즈 또는 폴리알릴 펜타에리스리톨과 같은 교차결합제 0.75 내지 2%와 교차결합된 아크릴산의 콜로이드성의 수용성 폴리알케닐 폴리에테르 교차결합한 중합체로 이루어진다. 예를 들면, 페물린(Pemulene) TR1과 TR2, 카르보폴(Carbopol) 934, 카르보폴 940, 카르보폴 950, 카르보폴 980, 카르보폴 951과 카르보폴 981이 포함된다. 카르보폴 934는 평균적으로 각 수크로즈 분자에 약 5.8개의 알릴기를 가진 수크로즈의 폴리알릴 에테르 약 1%와 교차결합한 아크릴산의 수용성 중합체이다.

본 발명의 일 양태에서, 겔화제는 양친매성(amphiphilic) 공중합체류에서 선택된다. 양친매성 공중합체는 소수성기와 친수성기 및 부위를 갖는 중합체를 포함한다. 이 물질은 대신, 중합성 계면활성제(polymeric surfactants)라고 불리기도 하는데, 이는 중합체의 친유성 부위 및 소수성 부위가 각각 조성물의 친수성 성분및 친유성 성분과 상호작용하여 이들을 안정화시키기 때문이다. 상기 공중합체는 그래프트 또는 빗모양 공중합체 (comb copolymer)의 블록 공중합체, 랜덤 공중합체 (random copolymer)일 수 있다. 대표적인 양친매성 중합체로는 생분해성 중합체의 다이-, 트라이- 또는 멀티-블록 중합체 또는 그래프트 중합체가 있다.

양친매성 공중합체는, 소수성 부분이 친수성 중합체에 화학적으로 연결되거나 또는 친수성 부분이 소수성 중합체에 부착되어 있으므로써 양친매성 표면활성 및 표면안정화제로 작용하는 아크릴레이트 공중합체이어도 좋다. 적합한 양친매성 공중합체의 예로는, 페물린(Pemulene) TR1과 페물린(Pemulene) TR2, ETD 2020, 카르보폴 1382(모두, 아크릴레이트/C10-30 알킬 아크릴레이트 교차중합체), 나트로솔 CS 플러스 330(Natrosol CS Plus 330)과 430, 폴리서프(Polysurf) 67 (모두, 세틸 하이드록시에틸 셀룰로오스), 아쿨린 22(Aculyn 22, acrylates/steareth-20 methacrylate copolymer), 아쿨린 25(acrylates/laureth-25 methacrylate copolymer), 아쿨린 28(acrylates.beheneth-25 methacrylate copolymer), 아쿨린 46(PEG-150/stearyl alcohol/SMDI copolymer), 스타빌린 30(Stabylen 30, acrylates/vinyl isodecanoate), 스트럭쳐 2001(Structure 2001, acrylates/steareth-20 itaconate copolymer), 스트럭쳐 3001 (acrylates/ceteth-20 itaconate copolymer), 스트럭쳐 플러스(acrylates/aminoacrylates/C10-30 alkyl PEG-20 itaconate copolymer) 등의 아크릴산과 소수성 공중합체의 가교결합 공중합체를 들 수 있으며, 여기에서 PEG는 폴리에틸렌 글리콜을, PPG는 폴리프로필렌 글리콜을 말한다.

다른 대표적인 양친매성 공중합체의 예로는 양친매성 실리콘 폴리올류와 코폴리올 등과 같은 실리콘 중합체를 들 수 있으며, 예를 들면, 세틸 디메치콘 코폴리올(cetyl dimethicone copolyol), 디메치콘 코폴리올 PPG-3 올레일 에테르 (dimethicone copolyol PPG-3 oleyl ether), 아세틸레이티드 전분 유도체(aceylated starch derivatives), 양친매성 변형 전분(amphiphilic modified starches), 에틸렌 옥사이드(ethylene oxide), 프로필렌 옥사이드 및/또는 프로필렌 글리콜(이른 바 폴록사머)의 양친매성 블록 공중합체(amphiphilic block copolymers)가 있다.

하나 이상의 겔화제를 어떤 조합으로든 혼합해서 사용할 수 있다.

본 발명의 거품성 조성물에서, 겔화제는 약 0.1% 내지 5.0%의 양으로 존재한다. 하나 이상의 양태에 있어서, 겔화제는 일반적으로 거품 조성물 중량의 1% 미만으로 포함될 수 있다.

활성 성분 (Active Component)

활성성분은 활성제의 공융 혼합물일 수 있다. 공융 혼합물은 주어진 성분의 혼합에 의해 얻을 수 있는 가장 낮은 녹는점을 갖는, 물질들의 혼합체이다. 이러한 혼합물은 피부 투과성을 향상시키고, 치료적 효과도 증진시켜준다.

적합한 공융 혼합물에는, 예를 들면 미국 특허 No. 6,410,036에 소개된 것과 같은 국소마취제의 공융혼합물이 포함된다. 소개되어 있는 공융혼합물은 (a) 염형태의 국소마취제가 , (b) 염형태의 다른 하나의 국소 마취제와 혼합되고, 이에 의해 (a)의 국소마취제는 30 내지 50℃의 녹는점을 갖고, (b)의 국소마취제는 30℃이상, 바람직하게는 40℃이상의 녹는 점을 갖는 공융 혼합물이 기술된다. 예를 들면, 프릴로카인, 테트라카인, 부타닐리카인과 트리메카인 등의 화합물을, 벤조카인, 리도카인, 부피바카인, 디부카인, 메피바카인, 에티도카인, 테트라카인, 부타닐리카인, 및 트리메카인 등의 화합물과 혼합할 수 있다. 화장료용 조성물에 있어서, 다른 공융 혼합물의 예로는 미국 특허 No.6,410,036에 소개되어 있는 것이 있는데, 카르보하이드레이트, 폴리올, 아미노산 및 카르복실산으로 이루어진 군에서 선택된 성분, 및 하이드록시산과 같은 주요 산 성분을 포함하는 혼합물과 같은 것이다.

또 피부투과성이나 치료적 효과를 증진시키는 공융 혼합물의 또 다른 예로는 비스테로이드계 항염증약(NSAIDs)가 있으나, 이것에 한정되는 것은 아니다. 예를 들면, 인도메타신, 나프록센, 케토프로펜, 페닐 살리실레이트, 피록시캄, 플루비프로펜 등의 NSAIDs류를 이부프로펜과 같은 다른 NSAID와 혼합하면, 녹는점이 현저하게 떨어지고, 이원의 공융 체계에 있어 확산이 더 잘 되기 때문에 상기 약물을 단독 사용했을 때와 비교해 볼 때 약물의 흡수가 더 잘 된다.

공융 혼합물에 있어서 물질 사이의 비율은 가장 낮은 녹는점과 최상의 피부 투과성을 제공한다. 대표적인 혼합물은 두 물질의 중량비가 20:80 내지 80:20인 경우이다.

다른 양태에 있어서, 염형태의 테트라카인과 리도카인이 30:70 내지 70:30의 중량비로 혼합되거나, 더 바람직하게는 45:55 내지 55:45, 더 더욱 바람직하게는 50:50의 중량비로 혼합된다.

많은 경우, 국소 마취제와 다른 치료제들은 신체의 넓은 부위에 적용하는 경향이 있기 때문에, 거품성 담체에 있어 공융혼합물을 포함하는 혼합물의 사용은 큰 장점을 갖는다. 그러므로, 본 발명의 하나 또는 그 이상의 양태에 따른 거품성 조성물은 치료적으로 유효한 농도의 활성성분으로 이루어진 공융혼합물을 포함한다. 하나의 양태에 있어서, 거품성 조성물은 오일과 물의 유제를 형성한다.

활성제의 공융 혼합물을 함유하는 이러한 조성물은 치료 처치시 더 유용한데, 이는 활성제의 공융 혼합물의 특성상 투과성이 증진되기 때문이다. 조성물은 활성성분에 반응하는 질환이나 장애를 개선하기 위한 국소 적용에 적합하다

하나 또는 그 이상의 양태에 있어서, 요소가 거품성 조성물에 활성 성분으로 포함된다.

요소는 습윤제나 보습제로 작용하는 화장료용 원료로 알려져왔고, 높은 농도의 요소는 단백질을 가용화시키고 변성시키는 작용을 한다는 것(이른 바, 각질 용해, keratolytic activity)이 보고된 바 있다. 높은 농도의 요소는 또한 순한 항균성을 갖는다고 알려져 있다. 요소는 또한 피부를 벗기는 특성을 갖고 있어서, 피부장벽을 통해 활성물질을 통과시키는 것을 조절하는데 유용하다.

요소제제의 경우, 특히 높은 농도의 요소를 함유하는 경우는 젤, 크림, 로숀, 페이스트의 형태이고, 거품형태인 것은 없다. 거품제는 요소가 처치에 필요한 많은 경우에 있어 더 선호된다. 예를 들면 건조증(xerosis)에는 보통 높은 농도의 요소제제를 사용하는데, 건조증은 피부에 넓게 퍼지기 때문에, 비중이 작고 매우 잘 퍼지며 흡수성이 우수한 본 발명의 거품은 이점이 있다.

하나의 양태에 있어서, 요소는 거품성 조성물에 전체 조성물의 약 1% 내지 약 50%의 양이 포함된다. 바람직하게는 사용목적에 따라 약 10% 내지 약 20%나 ,약 20% 내지 50%가 포함될 수 있다.

각질을 용해시키는 성질(keratolytic effect)이 있기 때문에, 요소는 다양한 종류의 약물 또는 화장료용 활성제의 피부 투과성을 좋게 하는 수단으로서 기능할 수 있다. 게다가, 많은 피부 장애에 있어서, 요소는 상기 언급한 장점 이외에도, 약물 또는 화장료용 활성 물질과 함께 치료효과를 상승시키는 시너지 효과를 제공하기도 한다. 이는, 또한 항균성과 항진균성을 갖는 것으로 알려진 요소가 다른 항감염 물질과 혼합된 경우이기도 하다.

그러므로, 본 발명의 하나 이상의 양태에 있어서, 거품성 조성물은 요소와 다음에 언급하는 최소한 하나 이상의 약학적 또는 화장료용 활성제를 포함한다. 활성 물질의 투과는 거품성 조성물에 요소가 존재함으로 인해 증진된다.

그러므로, 본 발명에 있어서 거품제는 치료적으로 유효한 농도의 요소를 함유하는 거품성 조성물을 포함한다. 하나의 양태에 있어서, 거품성 조성물은 본 명세서에서 A류, B류, C류로 기술한 수준의 소수성 용매를 포함하는 오일과 물의 유제를 형성한다.

하나 이상의 양태에 있어서, 거품성 조성물내에 활성 성분으로서 하이드록시산이 포함된다.

하이드록시산은 피부 표면의 투명도를 증진시키고, 세포의 턴오버를 증가시키며, 피부가 빛나게, 피부를 부드럽게 해주는 특성이 있다. 또한 피부를 벗기는 특성을 갖고 있어서, 피부장벽을 통해 활성물질을 통과시키는 것을 조절하는데 유용하다. 적합한 하이드록시산으로는, 알파 또는 베타-하이드록시산, 폴리-하이드록시산 또는 앞서 말한 것의 조합을 들 수 있다. 하이드록시산은 알파-하이드록시산일 수 있다. 이에 구속되는 것은 아니나, 알파 하이드록시산의 예로는 글리콜산, 락트산, 말산, 시트르산, 알파-하이드록시에타노산, 알파-하이드록시옥타노산, 알파-하이드록시카프릴산, 하이드록시카프릴 액시드글리콜산(hydroxycaprylic acidglycolic acid), 타르타르산, 피우르산(pyoric acid), 시트르산과 그들의 염과 약학적으로 허용되는 유도체, 또한 상기 언급한 것들의 조합을 들 수 있다.

아스코르빈산은 피부 침투 및 콜라겐 합성 활성을 갖는다. 베타-하이드록시산은 이에 한정되는 것은 아니나, 살리실산, 베타 하이드록시부타노산, 트로프산, 트레토칸산(trethocanic acid)를 포함한다.

그것의 각질 용해 활성 때문에 하이드록시산은 다양한 약물 또는 화장료용 활성제의 피부투과성 증진 유도 목적으로 사용될 수 있다. 게다가, 다양한 피부 장애에 있어, 요소가 가지는 상기 언급한 유용한 특성이 있기 때문에 약물 또는 화장료용 활성제는 상승효과를 갖게 된다.

그러므로, 본 발명의 하나 이상의 양태에 있어서, 거품성 조성물은 하이드록시산과 하기 언급되는 적어도 하나의 약학적 또는 화장료용 활성제를 포함한다.

하나의 양태에 있어서, 하이드록시산은 거품성 조성물에 전체 조성물의 약 1% 내지 약 30%의 양으로 함유된다. 바람직하게는 약 1% 내지 약 30%를 포함하며, 더 바람직하게는 약 10% 내지 약 30%를 함유한다. 비율은 목적에 따라 다를 수 있다.

하나 이상의 양태에 따르면, 치료학적 증강제가 거품성 조성물에 활성성분으로 포함된다. 본 발명에 있어서, 치료학적 증강제는 목표 부위로 활성제를 잘 가게 하고, 그럼으로써 치료효과를 증진시키게 해준다. 적합한 치료학적 증강제로는 적어도 2개의 -OH를 갖거나 적어도 3개의 -OH를 갖는 폴리하이드릭 알콜(polyhydric alcohols) 또는 폴리하이드릭 알콜유도체가 포함된다.

하기 예에 구속되는 것은 아니나, 프로필렌 글리콜, 부틸렌 글리콜, 글리세롤, 펜타에리트리톨(pentaerythritol), 소비톨(sorbitol), 만니톨, 올리고사카라이드, 다이메틸 이소소르바이드, 에톡실레이티드 글리세라이드의 모노올레이트(monooleate of ethoxylated glycerides, 8 내지 10개의 에틸렌 옥사이드 단위를 가진 것), 폴리에틸렌 글리콜 200-600, 트랜스큐톨(transcutol, diethylene glycol monoethyl ether)와 글리코퓨롤(glycofurol, tetrahydrofurfuryl alcohol PEG ether)가 있다. 치료학적 증강제는 최소한 사이클로덱스트린류 및 관련 화합물을 추가로 포함할 수 있다. 사이클로덱스트린은 구조적으로 관련된 사이클릭 올리고말토오즈로서, 약학 부형제의 새로운 그룹이다. 사이클로덱스트린은 표면이 친수성이고, 가운데 공간부분이 친유성인 원환체 모양의 분자이다. 사이클로덱스트린은 약물 전체 또는 그 일부를 그 공간에 잡음으로써, 다양한 친유성이고 불용성인 약물과 수용성 포유물 복합체를 형성할 수 있다. 사이클로덱스트린 분자는 표면이 수화되면 상대적으로 사이즈가 커지고(분자량이 1000 내지 1500 이상), 정상 조건에서, 사이클로덱스트린 분자는 피부장벽을 투과하기 어렵다. 사이클로덱스트린 분자는 친유성 약물분자를 용액 중에 잡아둠으로써 진정한 전달체로 작용하며, 약물을 피부 표면에 전달해 주는데, 피부표면에서 약물이 사이클로덱스트린 공간으로부터 피부로 분배되어 나온다.

하나의 양태에 있어, 치료학적 증강제는 거품성 조성물에 전체 조성물의 약 2% 내지 약 30%가 포함된다. 조성물은 약 2% 내지 약 10%나, 약 10% 내지 약 30%를 함유할 수 있다. 비율은 사용목적에 따라 다를 수 있다.

활성제 (Active Agents)

거품성 조성물은 피부 장애의 치료 및 피부 케어, 미용 케어를 하는 데 장점을 가지고 있고, 유용하다. 잘 퍼져나가는 거품제 형에 지방을 공급하고(refatting) 보호 및 수분유지 특성을 갖는 오일을 첨가하면, 현재 입수가능한 화장 크림, 로숀, 젤 등을 대신할 수 있다.

본 발명의 하나 이상의 양태에 있어, 거품성 조성물은 의학적 장애나 화장 장애의 치료에 사용될 수 있는 활성제를 포함한다. 활성제는 그것이 제공하는 효능 또는 예상 작용 기전에 따라 분류할 수 있다. 활성제는 어떤 경우에 있어서는 하나 이상의 유용한 점이 있거나, 하나 이상의 예상 작용 기전을 통해 작용할 수 있다. 그러므로, 분류는 편의를 위해 하는 것이고, 활성이 특정 적용례나 하기 언급된 적용례에 국한되지는 않는다. 게다가, 활성 성분이 추가적으로 있거나 없는 거품성 조성물은 "약용화장품" 에 적합하다.

항균제 (Antibacterial agents)

약물의 한 종류로 항균제를 포함한다. 본 명세서에서 "항균"이라는 용어는, 이에 구속되는 것은 아니나, 세균의 성장을 방해하거나 세균의 성장에 파괴적인 물질 또는 세균이나 다른 미생물을 파괴하거나 성장을 방해하는 물질을 포함하며, 이들은 감염성 질병 치료에 사용된다. 세균 감염은 피부, 눈, 점막, 구강, 질 또는 직장 표면에 다양한 장애를 일으킨다고 알려져 있다.. 항균약물은 그람 양성균과 그람 음성균, 원생동물문(protozoa), 호기성 세균 및 혐기성 세균에 대해 활성이 있다.

항균약물은 클로람페니콜, 테트라싸이클린, 합성 및 반합성 페니실린류, 베타-락탐, 퀴놀론, 플루오로퀴놀론, 마크롤라이드 항생제, 메트로니다졸과 메트로니다졸 유도체와 아날로그, 디카르복실산, 예를 들면, 아젤라인산(azelaic acid), 실리실레이트, 펩티드 항생제, 사이클로스포린과 이들을 치료학적으로 유효한 농도로 혼합한 혼합물로 이루어진 군에서 선택된다. 다른 항균제 그룹으로는 비특이적인 것이 있으며, 강한 산화제 및 자유라디칼이 유리되는 물질 예를 들면, 과산화수소, 표백제(예: 소디움, 칼슘, 마그네슘 하이포클로라이트 등), 아이오다인, 클로로헥시딘과 벤조일 퍼옥사이드를 포함한다.

대표적인 거품성 조성물은 피부 구조의 손상(예를 들면, 벤 상처, 창상, 화상 또는 궤양 등)에 수반되는 2차 감염 치료와 예방에 특히 유용하다. 이러한 경우, 본 발명의 제제가 사용하기 쉽고, 적용했을 때, 거품상태로 존재하고, 피부 위에 문지르면 액체상태가 된다.

항균 거품은, 감염의 예방 및 치료에 유용하지만, 세균전 미생물(예를 들면, 탄저균, 천연두)이 침투한 지역에서 오염을 제거하는데 사용할 수도 있다.

항진균제 (Anti-fungal agents)

진균 감염은 본 발명 조성물 사용으로 치료하는 또 하나의 대상이다. 피부 표면의 진균 감염은 실제적으로 가장 흔한 피부 질환 중의 하나이다. 피부사상균감염은 가장 흔한 피부 표면의 진균감염으로 추정된다. 이 질환은 사람 피부 표피, 손발톱 또는 털의 케라틴을 대사시킬 수 있는 진균류에 의해 발생된다. 피부사상균감염을 초래하는 피부사상균에는 마이크로스포룸(microsporum), 트리코피톤(trichophyton) 및 에피더모피톤(epidermophyton)의 3개의 속이 있다.

칸디다증은 진균인 칸디다 알비칸스(Candida albicans)와 같은 효모 또는 간혹 다른 칸디다 종에 의해 초래된다. 칸디다증의 임상적인 증상은 (a) 구강 칸디다증; (b) 피부와 생식기 점막의 칸디다증; (c) 손톱, 발톱에 손상을 주는 손발톱주위염 칸디다증; (d)외음부(genitalia) 및 질(vagina)에 생기는 외음부 및 질 탄디다를 포함한다.

약제용 조성물은 피부사상균과 칸디다균에 대한 활성을 가지는 항진균약물, 예를 들면, 아졸(azoles), 디아졸(diazoles), 트리아졸(triazoles), 미코나졸(miconazole), 플루코나졸, 케토코나졸, 클로트리마졸, 이트라코나졸, 그리세오풀빈, 시클로피록스(ciclopirox), 아모롤핀(amorolfine), 테르비나핀, 암포테리신 B, 요오드화 칼륨, 플루시토신(5FC) 및 이들의 혼합물로부터 치료적으로 효과가 있는 농도로 선택한 항진균 약물을 포함할 수 있다.

본 발명의 하나 또는 그 이상의 양태에 따른 거품성 조성물은 예를 들어, 체부백선, 족부백선, 적색백선(tinea rubrum), 손톱백선, 발톱백선, 완백선, 백선성모창 및 어루러기 뿐만 아니라 칸디다증 및 칸디다 질염과 같은 효모감염의 치료에 유용하다.

항바이러스제 (Anti-viral agents)

치료학적으로 유효한 농도의 알려진 항바이러스 약물은 어떤 것이든 거품성 조성물에 포함시킬 수 있다. 대표적인 조성물은 특히 바이러스 감염의 경우에 있어 유용성을 갖는다. 입가의 발진(cold sores)은 헤르페스 심플렉스 타입 1 (Herpes simplex Type 1) 바이러스에 의해 야기되는데, 때때로 안면 헤르페스라고도 불린다. 몰루스카(mollusca)는 바이러스가 성장하여 생긴 작은 덩어리로 얼굴, 몸, 하복부, 골반, 허벅지 또는 음경에 단독으로 또는 무리를 지어서 나타난다. 대상포진(헤르페스 조이스터)는 일반적으로 일생에 한 번 발생하는 데 발진(붉은 색의 수포 집단)으로 나타난다. 그리고 수두를 일으키는 바이러스와 동일한 바이러스에 의해 야기된다. 사마귀는 흔하게 발생하는 양성 피부 종양으로 바이러스 감염에 의해 발생한다.

항염증제와 항알러지제 (Anti-inflammatory and antiallergic agents)

항염증제와 항알러지제를 활성성분으로 포함할 수 있다. 대표적인 항염증제 및 항알러지제로는 코르티코스테로이드, 비스테로이드계 항염증제(NSIDs), 항히스타민제, 면역조절제, 면역억제제 및 이들의 조합물을 치료적으로 유효한 농도에서 선택할 수 있다.

항염활성이 있는 제제는 코르티코스테로이드이다. 코르티코스테로이드는 클로베타솔 프로프리오네이트, 할로베타솔 프로프리오네이트, 베타메타손 디프로프리오네이트, 베타메타손 발레레이트, 플루오시놀론 아세토니드, 할시노니드, 하이드로코르티손 발레레이트, 트리암시놀론 아세토니드, 하이드로코르티손과 이들의 조합물로 구성된 군에서 치료학적으로 유효한 농도로 선택할 수 있다. 코르티코스테로이드 약물은 전형적으로 소수성이기 때문에 거품성 담체는 소수성 용매를 높은 레벨로 포함하는 것이 좋다. 소수성 용매는 국소분포를 촉진시키고, 코르티코스테로이드 약물의 투과율을 증가시킨다.

조성물은 건선 치료를 위한 활성물질을 포함할 수 있다. 아주 적은 양의 물을 함유하거나 물이 함유되지 않은 코르티코스테로이드 연고, 기름같은 제제(greasy preparation)는 건선치료에 흔히 사용된다. 이들의 큰 단점은 처치를 끝낸 뒤에도 끈적한 느낌이 오래 지속된다는 점과, 이로써 불편함과 부조화감이 오래 지속된다는 점이다. 그러나, 오일(소수성 용매)를 높은 농도로 함유하고 있는 본 발명의 하나 또는 그 이상의 거품성 조성물의 경우, 적용 목적 부위에 매우 쉽게 퍼지며 피부로 흡수되어, 육안으로나 느낌상 불쾌함이 남지 않는다. 스테로이드를 활성제로 포함하는 거품성 조성물에 의해 치료될 수 있는 다른 감염성 장애의 예에는 피부염, 아토피성 피부염, 지루, 얼굴과 몸의 지루성 피부염, 지루성 안검염, 접촉성 피부염, 울체(중력성 습진, 정맥류성 습진), 박탈 피부염(홍피증), 단순태선, 장미색비강진, 천포창이 있다.

현재 시판되고 있는 국소적인 항히스타민제는 1% 및 2%의 디페닐하이드라민(Benadryl, Caladryl), 5% 도세핀(doxepin, Zonalon)크림, 프릴아민 말레이트(phrilamine maleate), 클로르페니라민(chlorpheniramine)과 트리펠렌아민(tripelennamine), 페노티아진(phenothiazines), 프로메타진 하이드로클로라이드(promethazine hydrochloride, Phenergan)과 다이메틴덴 말레이트(dimethindene maleate)를 들 수 있다. 이러한 약물들뿐만아니라 항히스타민을 사용할 수 있다.

또 오메가-3와 오메가-6 지방산[예 : 리놀레산, 리놀렌산, 감마-리놀레 산(GLA), 에이코사펜타에노산(EPA), 도코사헥사에노산(DHA)]을 함유하는 다가불포화지방산이 건선과 다른 피부 염증의 치료에 유익하며, 거품성 조성물에 포함될 수 있다.

본 발명의 거품성 조성물에는 피부와 전신적 생물학적 기형에 유용한 비스테로이드계 항염증제를 첨가할 수 있다. 비스테로이드계 항염증제에 속하는 다양한 화합물은 당업자에게 잘 알려져 있다. 본 발명의 조성물에 유용한 선택적인 비스테로이드계 항염증제에는 다음과 같은 것이 있으나, 이들에 한정되지는 않는다. 옥시캄류(oxicams), 예를 들면, 피록시캄(piroxicam), 이속시캄(isoxicam), 테녹시캄(tenoxicam), 수독시캄(sudoxicam); 살리셀리이트류(salicylates), 예를 들면, 살리실산, 에틸 살리실레이트, 메틸 살리실레이트, 아스피린, 디살시드(disalcid), 베토릴레이트(benorylate), 트릴리세이트(trilisate), 사파프린(safapryn), 솔프린(solprin), 디플루니살(diflunisal), 펜도살(fendosal); 아세트산 유도체(acetic acid derivatives), 예를 들면, 디클로페낙, 펜클로페낙, 인도메타신, 술린닥, 톨메틴(tulmetin), 이소제팍(isoxepac), 퓨로페낙(furofenac), 티오피낙(tiopinac), 지도메타신(zidometacin), 아세마타신(acematacin), 펜티아작(fentiazac), 조메피락(zomepirac), 클린다낙(clindanac), 옥세피낙(oxepinac), 펠비낙(felbinac), 케토롤락(ketorolac);

페나메이트류(fenamates), 예를 들면, 메페나믹(mefenamic), 메클로페나믹(meclofenamic), 플루페나믹(flufenamic), 니플루믹(niflumic), 톨페남산(tofenamic acids); 프로피온 산 유도체(propionic acid derivatives), 예를 들면, 이부프로펜, 나프록센, 베녹사프로펜(benoxaprofen), 플루비프로펜(flubiprofen), 케토프로펜, 페노프로펜(fenoprofen), 펜부펜(fenbufen), 인도프로펜(indoprofen), 피르프로펜(pirprofen), 카르프로펜(carprofen), 옥사프로진(oxaprozin), 프라노프로펜(pranoprofen), 미로프로펜(miroprofen), 티옥사프로펜(tioxaprofen), 수프로펜(suprofen), 알미노프로펜(alminoprofen), 티아프로페닉(tiaprofenic); 피라졸류(pyrazoles), 예를 들면, 페닐부타존, 옥시펜부타존, 레프라존(feprazone), 아자프로파존(azapropazone), 트리메타존(trimethazone)이 있다.

염증 진행과정의 증상을 예방, 완화시키거나 염증 진행과정을 치료하는 효능이 있는 다른 스테로이드계 및 비스테로이드계 화합물이라면 일반적으로 항염증제에 포함될 수 있다.

본 발명의 약제학적 조성물은 향염증성 사이토카인의 발생을 감소시키거나, 향염증성 사이토카인의 작용을 방해하는 항염증제 및/또는 항알러지제를 포함할 수 있다.

또한 어떤 항염증제의 혼합물이라도 본 발명의 조성물에 사용될 수도 있으며, 이들 항염증제의 피부학적으로 허용되는 염, 에스테르, 아마이드, 프로드럭 및 이들의 유도체의 혼합물도 마찬가지다.

안전하고 유효한 양의 비스테로이드계 항염증제(NSAID)를 함유하는 거품제의 국소적용은 류마티스성 관절염 및 골관절염, 통증을 예방 및/또는 완화하는데 유용할 수 있다. 또한, 본 발명의 거품제와 혼합한 국소적인 비스테로이드계 항염증제는 피부질환, 예를 들면, 여드름, 주사(rosacea), 모발 성장 장애, 광선각화증 및 기타 피부암 치료에 사용할 수 있다.

국소 마취제(Local anesthetics)

본 발명의 조성물은 유효한 양의 국소마취제를 함유할 수 있다. 국소 마취제는, 벤조카인(benzocaine), 리도카인(lidocaine), 부피바카인(bupivacaine), 클로르프로카인(chlorprocaine), 디부카인(dibucaine), 에티도카인(etidocaine), 메피바카인(mepivacaine), 테트라카인(tetracaine), 디클로닌(dyclonine), 헥실카인(hexylcaine), 프로카인(procaine), 코카인(cocaine), 케타민(ketamine), 프라목신(pramoxine), 페놀(phenol), 이들의 약제학적으로 허용되는 염, 및 이들 마취제의 혼합물로 이루어진 군에서 선택될 수 있다. 상승적인 이점이 있는 것이라면 상기 마취제의 혼합물은 어떤 것이든 사용할 수 있다.

각질분해제 (Keratolytically active agents)

본 발명의 거품성 조성물에 각질분해제가 활성제로 포함될 수 있다. 본 명세서에서 "각질분해제"라는 용어는 피부의 각질층을 느슨하게 해주거나, 제거하거나 또는 피부의 케라틴 층의 구조를 변경시키는 화합물을 포함한다. 각질분해제는 다음과 같은 피부질환, 즉 건조한 피부, 과도한 각질화(예 : 건선), 피부 가려움증(예 : 건조증), 여드름 및 주사 등의 치료에 사용된다.

적합한 각질분해제는 페놀과 치환된 페놀 화합물을 포함한다. 이러한 화합물은 과도하게 각질화된 조직의 세포간 기질을 용해하고 완화하는 것으로 알려져 있다. 각질분해제는 그 자체로서 피부 질환의 치료에 사용된다. 디하이드록시 벤젠과 그 유도체는 강력한 각질분해제로서 인정되고 있다. 레소시놀(Resorcinol, m-dihydroxybenzene)과 이의 유도체는 항여드름 활성제로 사용되고 있다. 하이드로퀴논(p-dihydroxybenzene)은 색소 침착하는 것을 억제하면서도 각질을 분해하는 물질로 알려져 있다. 또한 이러한 화합물은 방부성을 나타낸다. 또한 크레졸(cresol)은 살균 및 각질분해 특성을 갖는다.

비타민 A와 이의 유도체는 본 명세서에서 "레티노이드"라고 명명되기도 하는데, 예를 들어 레티노 산, 이소레티노 산, 레티놀, 레티날이 있으며 이들은 또 다른 각질분해제이다.

또 하나의 다른 각질분해제 군은 알파-하이드록시산, 예를 들어, 락트산과 글리콜산과 이들 각각의 염 및 유도체와; 베타-하이드록시 산, 예를 들어 살리실산(o-hydroxybenzoic acid)와 살리실산염과 약학적으로 허용이 가능한 유도체를 포함한다.

또 하나의 바람직한 각질분해제류는, 요소와 요소 유도체를 포함한다.

레티노이드(Retinoids)

또 하나의 활성제 군은 레티놀, 레티날, 모든 트랜스 레티노산과 그 유도체, 이성질체 및 아날로그로 이루어지는데, 이를 통틀어 "레티노이드"라고 한다. 에트레티네이트(etretinate), 악티레틴(actiretin), 이소트레티노인(isotretinoin), 아다팔린(adapalene) 및 타자로틴(tazarotene)은 상기 레티노이드 이성질체와 아날로그의 예이다. 레티노이드를 활성 약물로서 함유하는 거품성 조성물은, 여드름, 지루성 피부염, 다양한 피부병, 피부,점막,질 및 직장의 염증, 건선, 광선각화증 및 피부암의 치료를 위해 환부에 발라서 사용할 수 있다.

살충제 및 곤충 방충제 (Insecticide and insect repellents agents)

곤충, 예를 들면, 모기, 무는 파리, 좀진드기, 각다귀, 벼룩, 털진드기, 등에모기, 모래 파리, 이 및 참진드기는 성가시게 하고, 때로는 사람과 동물의 건강에 심각한 위험을 초래한다. 미국의 어떤 지역에서는 모기가 말(equine)과 세인트 루이스 뇌염같은 질병을 전이할 수 있다. 무는 파리는 고통스러운 상처를 남기기도 하는 데, 상처는 수일 동안 지속되기도 하고, 부풀어 오르며, 감염될 수도 있다. 참진드기는 라임병과 록키산 홍반열같은 심각한 질병을 전이시킬 수 있다.

사람과 동물을 파리나 무는 곤충, 거미, 참진드기 및 좀진드기로부터 보호하기 위해 곤충 방충제가 거품성 조성물에 포함될 수 있다.

곤충 방충제는 하기 예에 한정되는 것은 아니나, 디트[DEET(N,N-diethyl-m-toluamide)], 다이메틸 프탈레이트, 피페로닐 부톡사이드 및 퍼메트린(permethrin)이 포함된다. 방충효능이 있는 터페노이드류는 Hwang, et al, J.Chem.Ecol.,11,1297(1985); Ruledge, J. Am. Mosquito Control Assoc. 4, 414(1988)에 소개된 바 있다.

특히 바람직한 곤충 방충제는 미국특허 No. 5,411,992에 기재된 터페노이드화합물을 포함하며, 다음과 같은 것들을 포함한다.

(1) 터페노이드-알콜 또는 터펜-올은 한 개 이상의 하이드록실기(-OH)를 가진 터페노이드이다. 터펜-올의 예로는 $C_{10}H_{16}O$ 화합물, 페릴릴 알콜(perillyl alcohol), 카베올(carveol), 미르테놀(myrtenol) 및 시스-베르베놀; $C_{10}H_{18}O$ 화합물, 미르타놀(myrtanol), 이소-피노캄페올(iso-pinocampheol), 다이하이드로카르베올(dihydrocarveol), 이소풀레골(isopulegol), 터피네올(terpineol), 터피넨-4-올(terpinen-4-ol), 네롤(nerol), 제라니올(geraniol) 및 리날룰(linalool); 및 $C_{10}H_{20}O$ 화합물, 멘톨(menthol), 베타-시트로넬롤(beta-citronellol) 및 다이하이드로-미르세놀(dihydro-myrcenol)을 포함한다.

(2) 터페노이드-에스테르는 적어도 한 개 이상의 에스테르기를 갖는 터페노이드이다. 터페노이드-에스테르는 터펜-올의 하이드록실기와 지방족 사슬에 하이드록실 또는 아민과 같은 기능기를 함유하는 지방족 카르복실산과의 결합에 의한 생성물이다. 적합한 지방족 카르복실산의 예는 아세트산, 프로피온산, 락트산 및 다양한 아미노산을 포함한다. 터페노이드-에스테르의 예는 카르빌 아세테이트(carvyl acetate), 카르빌 프로피오네이트(carvyl propionate) 및 멘틸 락테이트(menthyl lactate)를 포함한다.

(3) 터페노이드를 함유하는 정유와 향수. 고함량의 터펜-올과 에스테르를 가지는 정유의 예에는, 베르가모트(bergamot, 62% 터페노이드), 세이지(sage, 〉 50% 터페노이드), 스티락스(styrax, 〉 50% 터페노이드), 페퍼민트(peppermint, 〉 50% 터페노이드) 및 파인 시베리안(pine Siberian, 〉 75% 터페노이드)가 포함되지만, 이에 한정되는 것은 아니다. 터펜류, 알데하이드류와 케톤류는 그 유용성이 각기 다르지만, 일반적으로 방충제로서 가능성이 있다.

본 발명의 거품성 조성물은 사람과 동물 피부의 넓은 부위에 방충제를 효과적으로 균일하게 도포하기에 특히 적합하다. 소수성 용매가 거품성 조성물에 존재하는 것은 오랜 기간 동안 피부 표면에 방충효과를 지속시키는 데 도움을 준다.

거품성 조성물은 사람과 동물의 감염된 외부 표면에 살충제를 전달하는 데 적합하다. 그러므로, 약제용 또는 화장료용 조성물은 다음의 그룹 즉, 퍼메트린(permethrin), 헥사클로로벤젠(hexachlorobenzene), 카르바메이트(carbamate), 천연에서 유래한 피레스로이드(pyrethroid), 알레스린(allethrin), 말라티온(malathion), 피페로닐 부톡사이드(piperonyl butoxide) 및 이들의 혼합물로 이루어지는 군에서 치료에 유효한 농도로 선택되는 살충제를 포함한다. 상기 조성물은 적용하기에 매우 편리하고, 용이하게 퍼지며, 특히 털이 난 부위에도 용이하게 퍼진다. 거품성 조성물내에 소수성 용매의 존재는 연장된 기간 동안 치료부위에 살충제가 머무는 것을 돕는다. 거품내에 소수성 용매가 존재하면, 빗을 사용하여 이와 서캐를 기계적으로 제거하는 과정을 쉽게 해준다.

항암제 (Anti-cancer drugs)

본 발명은 항암제를, 종양발생 전단계의 급성 각화증 뿐만 아니라, 피부 악성 종양, 예를 들면, 기저 세포 종양, 편평상피세포 악성종양(squamous cell carcinoma), 흑색종, 카포시 육종의 치료를 위한 선택가능한 약제로서 사용할 수 있다. 어떤 경우, 5-플루오로우라실(5-fluorouracil, 5-FU)를 비롯하여 국소적인 세포독성제 및 증식 억제제를 상기 종양을 치료하거나 예방하는 데 사용한다. 5-FU와 종양 치료 기술분야에서 알려진 다른 어떤 항암제도 치료적으로 유효한 농도로 거품제에 포함시킬 수 있다. 본 발명의 거품에 사용하기에 적합한 대표적인 항암제류에는 타목시펜과 같은 항에스트로겐을 포함된다.

광역학적인 치료제(Photodynamic therapy agents)

또한, 본 발명의 거품성 조성물은 감광제(photo-sensitizine agents)를 전달하는데 유용하다. 감광제는 포르피린(porphyrins), 변형된 포르피린, 소랄렌(psoralen), 8-메톡시소랄렌, 5-메톡시소랄렌, 소랄렌 유도체, 클로린(chlorin), 박테리오클로린(bacteriochlorins), 프탈로시아닌(phthalocyanines), 나프탈로시아닌(naphthalocyanines), 페오포르바이드(pheophorbides), 푸르퓨린(purpurins), m-THPC, 모노-L-아스파틸 클로린 e6(mono-L-aspartyl chlorin e6), 박테리오클로린, 프탈로시아닌(phthalocyanines), 벤조포르피린 유도체(benzoporphyrin derivaties) 및 감광제의 전구체, 예를 들면 아미노레불린 산(aminolevulinic acid, ALA)로 이루어진 군에서 선택될 수 있다.

화상, 창상, 벤 상처 및 궤양에 대한 활성제 (Active agents for burns, wounds, cuts and ulcers)

화상, 창상, 벤 상처 및 궤양의 치료에 본 발명 거품성 조성물을 사용하면 특히 유리하다. 거품제는 감염억제제(세균, 진균 및/또는 바이러스), 항염제(스테로이드 및/또는 비스테로이드계 항염증제) 및 진통제를 모두 포함할 수 있다. 적용시, 거품은 용이하게 퍼져서 통증 없이 환부의 표면을 덮어준다.

피부 케어 활성제(Skin Care Active Agents)

본 발명 거품제는 피부 케어와 화장 케어에 유용하며 이점을 가지고 있다. 수분을 유지시키는 성질을 가진 오일과 물의 조합을 도포하기 용이한 거품 형태로 하여, 현재 사용되고 있는 화장용 피부 케어 크림, 로션, 겔 등의 사용을 대체할 수 있다. 더 나아가 본 발명의 화장료용 거품성 조성물은 화장료용 피부 질환, 예를 들어, 노화 피부, 주름, 과색소침착증(기미, 간반, 주근깨 등), 벗겨지는 피부(scaly skin) 및 다른 바람직하지 못한 피부 상태를 치료하기 위한 "코스메슈티컬" 제제(치료효과를 갖는 화장품)로 응용하기에 적합하다.

CTFA 화장품 성분 핸드북에는 매우 다양한 제한되지 않는 화장료용과 약제용 성분이 기재되어 있는데, 피부 케어 산업에 흔히 사용되는 이러한 것들은 본 발명 조성물에서 사용하기에 적합하다. 이러한 성분류의 예로, 연마제, 흡수제, 미용적 화합물, 예를 들면, 방향제, 안료, 색소 및 착색제, 정유, 수렴제 등(예: 클로브 오일, 메탄올, 캄포, 유칼립투스 오일, 유제놀, 멘틸 락테이트, 하마메리스수), 항여드름제, 케이킹 작용 억제제, 거품생성 억제제, 항미생물제(예: iodoproryl butylcarbamate), 항산화제, 결합제, 생물학적 첨가제, 완충제, 증점제, 킬레이트제, 화학적 첨가제, 착색제, 화장료용 수렴제, 화장료용 살생물제, 변성제, 약물 수렴제, 외면 진통제, 중합체와 같은 조성물의 필름형성능과 지속성에 도움을 주는 필름 형성물 또는 필름 물질(예: 에이코센과 비닐 피롤리돈의 공중합체), 불투명제, pH 조절제, 가스 추진제, 환원제, 격리제, 피부 표백제 및 미백제(예: 하이드로퀴논, 코지산, 아스코르빈산, 마그네슘 아스코르빌 포스페이트, 아스코르빌 글루코사민), 피부 컨디셔닝제(예: 잡다한(miscellaneous) 습윤제 및 활성성분이 피부에 남는 것을 조정하는 것이 용이한 습윤제를 포함하는 습윤제), 피부 진정 및/또는 힐링제[예: 판테놀과 그 유도체(예: 에틸 판테놀)], 알로에 베라, 판토텐산 및 이의 유도체, 알란토인, 비사볼롤 및 다이포타시움, 글리시리지네이트, 피부 처리제, 비후제 및 비타민류와 이의 유도체를 들 수 있다.

항여드름 활성제 (Anti-acne active agents)

본 발명의 거품성 조성물에 항여드름제가 포함될 수 있다. 항여드름제는 레소시놀(resorcinol), 황(sulfur), 살리실산, 살리실레이트, 알파-하이드록시산, 비스테로이드계 항염증제, 벤조일 퍼옥사이드, 레티노산(retinoic acid), 이소레티노산(isoretinoic acid) 및 기타 레티노이드 화합물, 아다팔린(adapalene), 타자로틴(tazarotene), 아젤라산(azelaic acid)과 그 유도체, 항생제(예: 에리스로마이신, 클린다마이신, 아연염과 복합체) 및 이들의 혼합물로 이루어진 그룹에서 치료학적으로 유효한 농도로 선택할 수 있다.

주름 억제제/위축증 억제제 및 건성 및 벗겨지는 피부(건조증-xerosis, 어린선-ichthyosis)를 치료하기 위한 약제

본 발명의 거품성 조성물은 유효한 양의 주름 억제제 및/또는 적어도 하나의 위축증 억제 활성물을 포함할 수 있다. 본 발명의 조성물에 사용하기 적합한 주름 억제/위축증 억제제의 대표적인 예는, 유황 함유 D 및 L 아미노산과 이들의 유도체 및 염, 특히 N-아세틸 유도체; 티올(thiol); 하이드록시산(예: 락트산과 글리콜산과 그 유도체 및 염과 같은 알파-하이드록시산; 또는 살리실산과 살리실산 염과 그 유도체와 같은 베타-하이드록시산), 요소, 히알유론산(hyaluronic acid), 피트산(phytic acid), 리포산(lipoic acid); 리소포스파티드산(lysophosphatidic acid), 과피제(skin peel agents, 예: 페놀, 레소시놀 등), 비타민 B3 화합물[예: 니아신아마이드, 니코틴산과 니코틴산 염과 비혈관확장성인 니코틴산의 에스테르(예를 들면, 토코페릴 니코티네이트)를 포함하는 에스테르, 니코티닐 아미노산, 카르복시산의 니코티닐 알콜 에스테르, 니코틴산 N-옥사이드 및 니아신아마이드 N-옥사이드], 비타민 B5와 레티노이드류(예: 레티놀, 레티날, 레티노산, 레티닐 아세테이트, 레티닐 팔미테이트, 레티닐 아스코르베이트)이 있다. 건성이고, 잘 벗겨지는 피부(건조증) 및 어린선과 같은 경우, 이와 같은 제제는 이들 병증과 함께 연관된 가려움을 일시적으로 경감하여 증상을 완화시킬 수 있다.

항산화제/라티칼 소거제 (Anti-oxidants/ radical scavengers)

항산화제/라디칼 소거제를 유효한 농도로 본 발명 조성물이 첨가할 수 있는데, 예를 들어 조성물 내에 약 0.1% 내지 약 10 % (w/w), 또는 약 1% 내지 약 5% (w/w)를 첨가할 수 있다.

항산화제/라디칼 소거제, 예를 들면, 아스코르빈산(비타민 C)와 이의 염, 지방산의 아스코르빌 에스테르, 아스코르빈산 유도체(예: 마그네슘 아스코르빌 포스페이트, 소디움 아스코르빌 포스페이트, 아스코르빌 소르베이트), 토코페롤(비타민 E), 토코페롤 소르베이트, 토코페롤 아세테이트, 기타 토코페롤의 에스테르, 부틸화된 하이드록시 벤조산과 이의 염, 6-하이드록시-2,5,7,8-테트라메틸크로만-2-카르복실산(상품명 Trolox), 갈산과 이의 알킬 에스테르, 특히 프로필 갈레이트, 우르산(uric acid)과 이의 염과 알킬 에스테르, 소르브산과 이의 염, 리포산, 아민(예: N,N-diethylhydroxylamine, amino-guanidine), 설프하이드릴 화합물(예: 글루타치온), 다이하이드록시 푸마르산과 이의 염, 리신 피돌레이트, 알기닌 필롤레이트, 노르다이하이드로구아이아레트산, 바이오플라보노이드, 커커민(curcumin), 리신, 메치오닌, 프롤린, 수퍼옥사이드 디스뮤타제, 실리마린, 차 추출물, 포도 껍질/씨 추출물, 멜라닌 및 로즈마리 추출물을 사용할 수 있다.

본 발명의 거품제는 피부를 보호하고 피부에 활력을 부여하는 항산화제/라디칼 소거제를 전달하는 데 적합하다. 오메가-3와 오메가-6 지방산[예: 리놀레산, 리놀렌산, 감마-리놀레산(GAL), 에이코사펜타에노산(EPA) 및 도코사헥사에노산(DHA)]을 포함하는 다가불포화 지방산이 건선과 다른 피부염증의 치료에 유익하다. 이외에 오일, 실리콘 오일 및 에몰리언트도 피부의 수분유지 및 피부 보호 효과를 제공한다. 그러므로, 소수성 용매의 전부 또는 일부가 불포화 지방산이 풍부한 오일, 실리콘 오일 및 에몰리언트로 이루어진 군으로부터 선택된 용매로 이루어진 피부보호거품이 제공되고, 이러한 경우, 항산화제/라디칼 소거제와 운반체 성분의 치료효과가 상승된다.

자가 태닝 활성제(Self-tanning active agents)

본 발명의 조성물은 특히 피부의 넓은 부위에 태닝 활성제를 균일하게 전달하는 데 특히 적합하다. 조성물은 다이하이드록시아세톤이나 당해 기술분야에 인조태닝제로 알려진 기타 화합물을 조성물 중에 바람직하게는 약 0.1 내지 약 20%를 포함하고, 더욱 바람직하게는 약 2 내지 약 7%를, 더 더욱 바람직하게는 약 3 내지 약 6%를 함유한다.

피부 미백제 (Skin lightening and whitening agents)

본 발명 거품성 조성물은 피부 미백제의 균일한 전달을 위한 조성물을 제공한다. 사용시, 조성물에는 미백제가 약 0.1 내지 약 10% 함유되고, 바람직하게는 약 0.2 내지 약 5%를 함유한다. 적합한 피부 미백제는 당해 기술분야에 알려진 것들을 포함하며, 예를 들면 하이드로퀴논, 아젤라산(azelaic acid) 및 이와 관련된 다이카르복실산, 그들의 염과 유도체, 레티노이드, 코지산, 아르부틴, 니코틴산과 니코틴산 전구물질, 염 및 유도체, 아스코르빈산 및 이들의 염과 유도체(예: 마그네슘 아스코르빌 포스페이트 또는 소디움 아스코르빌 포스페이트), 및 허브 추출물(예: 감초 추출물, 태반 추출물)이 있다.

본 발명의 하나 이상의 양태 중에서, 거품성 조성물은 레티노이드, 각질분해제 및 항염증제에서 선택된 하나 이상의 활성 성분과, 하나 이상의 미백제의 혼합물을 포함한다.

본 발명의 하나 이상의 양태 중에서, 거품성 조성물은 적어도 하나의 미백제 및 알파-하이드록시산, 베타-하이드록시산 및 레티노이드에서 선택되는 적어도 하나의 각질분해제를 혼합한 혼합물을 포함한다.

본 발명의 하나 이상의 양태 중에서, 거품 조성물은 피부 미백제와 무기성 햇볕차단제를 혼합한 것을 포함한다. 티타늄 다이옥사이드와 산화아연같은 무기성 햇볕차단제를 피부에 적용했을 때, 백색으로 코팅되는데, 비록 일시적이기는 하나, 즉시 미백효과를 제공하며, 이는 외모의 즉각적인 변화를 바라는 소비자의 입장에서는 바람직한 점이다. 거품성 담체에서 미백제를 무기성 햇볕 차단제와 혼합하면, 피부 적용부위에 균일하게 도포하는 것이 어려운 크림과는 달리, 피부 표면에 쉽고 균일하게 도포될 수 있어, 즉각적인 미백효과를 나타낸다.

모발 성장 장애에 대한 약제(Agents for Hair Growth Disorders)

모발 성장 패턴에 영향을 주는 약제가 본 발명 거품제에 적합하게 혼합될 수 있다. 대머리의 가장 흔한 원인인 남성형 대머리(MPB)는 남성 호르몬인 다이하이드로테르토스테론(DHT)의 활성에 의해 유도되는 것으로, 이는 테스토스테론 호르몬이 5-알파 환원효소에 의해 전환된 것이다. 최근 MPB 치료에는 미녹시딜과 5-알파 환원효소 억제제인 피나스테라이드, 스피로놀락톤, 아젤라산, 아젤라산 유도체 및 염을 포함하는 제제들이 사용된다. 이러한 약제 및 당해 기술분야에 알려진 기타 약제를 본 발명의 거품 조성물에 혼합하여 사용할 수 있다.

또한, 다가불포화 지방산, 즉, 필수 지방산(EFA's), 예를 들면, 리놀레산, 리놀렌산, 감마-리놀레산(GAL), 에이코사펜타에노산(EPA) 및 도코사헥사에노산(DHA)는 모발 성장을 돕는 것으로 알려져 있다. 그러므로, 바람직한 양태로서, 소수성 용매의 전부 또는 일부가 불포화 지방산이 풍부한 오일로 이루어진 모발 성장 거품제가 제공된다.

조형제 ; 셀룰라이트/ 체중감량 치료 제제 (Figure-forming Agents; Agents to Treat Cellulite/ Slimming)

셀룰라이트(지방축적물) 치료 및 체중감량에 사용하는 조형제는 본 발명의 조성물에 적합한 정도로 혼합될 수 있다. 셀룰라이트 치료 및 체중감량 효과를 유도하는 것으로 알려진 활성물질의 예로는 다음과 같은 것이 있으나, 하기 예에 구속되는 것은 아니다.

- 허브 추출물: 볼더왁 추출물(baldderwack extract), 벗처스 브룸(Butcher's broom), 고추, 민들레, 레드 클로버, 은행, 마로니에, 위치 헤이즐(witch hazel) 및 보리지 오일(borage oil)

- 오메가 3 및 오메가 6 오일

- 카페산과 이들의 염 및 유도체

- 잔틴 제제, 예를 들면, 테오필린 및 펜톡시필린

- 니코틴산 및 이의 염과 유도체

햇볕 화상, 열화상, 방사능 화상, 발진 및 가려움을 치료하는 약제 (Agents to Treat Sunburn, Heat Burn, Radiation Burn, Rash and Itch)

본 발명의 거품성 조성물에는 약제학과 화장기술분야에서, 피부염, 작은 피부 자극, 햇볕 화상, 열화상, 방사능 화상을 치료하고 염증반응을 막는 화장료용과 약제용 성분을 포함시켜 유용하게 사용할 수 있다.

이러한 활성제의 예로는, 카모마일 추출물(matricaria recutitia), 오이 정제수(cucumis sativus), 라벤다수(lavendula angustifolia), 장미수(rosa damascena), 위치 헤이즐(hamamelis virginiana), 알란토인, 비사볼롤, 로즈힙 오일(rosehip oil), 칼렌둘라 오일, 아줄라엔(azulaene), 멘톨 및 캄포가 있다.

기타 피부 케어 활성제 (Other skin care active agents)

활성제는 황-함유 아미노산, 티올 화합물, 알파 하이드록시산, 락트산 및 그의 유도체 및 염, 글리콜산과 그의 유도체 및 염, 베타-히드록시산, 살리실산과 그의 염 및 유도체, 피트산, 리포산, 리소포스파티드산, 과피제(skin peel agents), 페놀, 레소시놀, 비타민 B3 화합물, 니아신아마이드, 니코틴산과 그의 염 및 에스테르, 토코페릴 니코티네이트, 니코티닐 아미노산, 카르복시산의 니코티닐 알콜 에스테르, 니코틴산 N-옥사이드 및 니아신아마이드 N-옥사이드, 레티노이드, 레티놀, 레

티날, 레티노산, 레티닐 아세테이트, 레티닐 팔미테이트 및 레티닐 아스코르베이트, 카페인, 테오필린, 펜톡시필린, 다이하이드록시 아세톤 코지산, 아르부틴, 니z코틴산 및 니코틴산 전구체, 니코틴산염, 니코틴산 유도체, 아스코르빈산, 아스코르빈산 염 및 아스코르빈산 유도체로 이루어진 군에서 선택될 수 있다.

무알콜 (Alcohol free)

미국 특허 No. 6,126,920과 6,358,541에 개시된, 바람직하게는 지방성 알콜을 40-90% 함유하는 조성물과는 달리, 본 발명의 거품성 담체 또는 거품성 조성물은 짧은 사슬 지방성 알콜(즉, 메틸,에틸,이소프로필,부틸 알콜)을 거의 함유하지 않는다. 본 발명의 목적을 위하여, "무알콜" 조건은 탄소 뼈대 중의 탄소가 1개 내지 6개인 지방성 알콜이 약 7.5중량%를 넘지 않는 경우를 말하고, 또는 상기 지방성 알콜의 혼합물이 7.5중량%를 넘지 않는 것을 말한다.

임의성분 (Optional Ingredients)

나아가 본 발명의 약제용 또는 화장료용 거품성 담체는 다양한 약제용 또는 화장료용 성분을 포함하는데, 이들은 제제의 콘시스텐시(consistency)를 정밀하게 조절하기 위해 첨가되며, 분해나 산화로부터 제제의 성분을 보호해주고, 화장 용인성을 준다. 이러한 부형제들은 다이글리세라이드, 트라이글리세라이드, 안정화제, 항산화제, 글리세롤, 향미제, 착색제, 착취제 및 약제학 및 화장료용 처방 기술분야에서 알려진 기타 제제 성분으로 이루어지는 군에서 선택하는 것이 바람직하다. 본 발명에 따른 거품성 담체를 사용하여 제조한 약제용 또는 화장료용 조성물은 사용이 매우 용이하다. 사람이나 동물의 병증이 있는 부위에 바를 때, 거품 상태로 있기 때문에, 흘러내림이 없어 자유롭게 적용할 수 있다. 몸 표면에 조성물을 문지르는 등 기계적인 힘을 추가로 가할 경우, 표면에 잘 퍼지고, 신속하게 흡수된다.

조성물 및 거품제의 물리적인 특징(Composition and Foam Physical Characteristics)

본 발명의 하나 이상의 양태에 의한 거품성 담체를 사용하여 제조된 약제용 또는 화장료용 조성물은 사용이 매우 용이하다. 포유류, 즉 인간 또는 동물의 몸의 병증이 있는 부위에 적용할 때, 거품상태이기 때문에, 흘러내림 없이 자유롭게 적용할 수 있다. 몸 표면에 조성물을 문지르는 등 기계적인 힘을 추가로 가할 경우, 표면에 잘 퍼지고, 신속하게 흡수된다.

물, 소수성 용매, 계면활성제, 겔화제, 추진제를 포함하는 본 발명의 거품성 조성물 또는 담체는 실온에서 적어도 1년 이상 또는 2년 이상의 저장수명을 갖는 안정한 유제가 된다. 화장료용 또는 의학용 사용에 적합한 제품의 특징은 오랜 기간 동안의 안정성(long term stability)이다. 작은 분자량을 가진 탄화수소의 혼합물인 추진제는 유제의 안정성에 악영향을 미치는 경향이 있다. 그러나, 겔화제로서 양친매성 공중합체를 함유하는 거품성 조성물은 놀랄만큼 안정하다는 것이 관찰되었다. 안정성을 높이기 위한 연구를 보면, 그들은 바람직한 구조(texture)를 나타내고; 그들은 표면에 접촉하는 즉시 깨지지 않고, 적용부위에 쉽게 퍼지고, 신속하게 흡수되는 미세한 거품구조를 형성한다.

조성물은 또한 유동성이 좋고, 에어로솔 용기 등의 용기의 구멍을 통해 잘 흘러나와서, 허용가능한 거품제가 된다. 유제의 오일상의 주성분으로서 반-고체 소수성 용매 즉, 예를 들면, 백색 페트롤라툼같은 것을 포함하는 조성물은 점도가 높고, 유동성이 떨어지기 때문에, 거품성 조성물의 후보로 부적합하다.

거품의 질은 다음과 같이 등급을 나눌 수 있다.

E 등급(매우 우수) : 외관상 매우 풍부하고 크림 모양, 거품 구조가 전혀 보이지 않거나 매우 정교한 (작은) 거품 구조가 보임; 신속하게 사라지지 않고; 피부에 퍼질 때, 크림 성질이 오래 지속되고, 물같이 되지 않음.

G 등급(우수) : 외관상 풍부하고 크림 모양, 거품 크기가 매우 작음, 매우 우수한 거품보다는 더 빨리 사라짐, 피부에 퍼질 때 크림 성질이 지속되고, 물같이 되지 않음.

FG 등급(보통 우수) : 크림 모양이 적당한 양 보임, 거품 구조가 보임; 피부에 퍼질 때 신속하게 사라지며 겉보기 점도가 다소 작아짐

F 등급(보통) : 크림 모양이 눈에 아주 조금 보임, 거품 구조가 FG 등급보다 크게 보임, 피부에 퍼질 때 외형상 얇아지고 물같이 됨.

P 등급(나쁨) : 크림 모양이 안 보임, 거품 구조가 큼, 피부에 퍼질 때 매우 얇아지고, 외형상 물같이 됨.

VP 등급(매우 나쁨) : 건조한 거품, 크고 잘 사라지는 거품, 피부에 잘 퍼지지 않음.

국소적으로 적용가능한 거품제는 에어로솔 용기에서 방출되었을 때 E 또는 G 등급의 질이 되어야 한다. 거품이 작을수록 보다 안정한 거품인 것을 의미하며, 용기로부터 방출될 때 자발적으로, 즉시 붕괴되지 않는다. 미세한 거품구조가 더 부드럽게 보이고 느껴지며, 그래서 사용도 및 호감도가 증진된다.

거품제에서 고려해야할 또 하나의 사항은 깨짐성이다. 깨짐성이 있는 거품제는 열적으로 안정하나 전단력(shear force)하에서 깨진다. 거품제의 전단력 깨짐성은 열적으로 유도되는 깨짐성과 비교할 때 분명한 장점이 있다. 열에 민감한 거품제는 피부에 노출된 즉시 피부 온도에 의해 붕괴되고, 그러므로 손으로 적용할 수 없고, 병증 부위에 나중에 전달될 수 없다.

또 다른 거품제의 특성은 에어로솔 캔으로부터 방출된 상태에서 측정되는 비중이다. 전형적으로 거품제는 약 0.01g/mL 내지 약 0.1g/mL의 비중을 갖는다.

또 다른 기술적 파라미터(Further Technical Parameters)

본 발명의 조성물은 용기내에 넣어 두거나 용기에서 방출될 수 있는데, 이 때 용기는 가스 추진제의 압력을 견딜 수 있고 압력을 받아 조성물을 거품으로 방출할 수 있는 적합한 밸브/노즐을 가지고 있어야 한다. 통상의 액화 추진제를 전체 조성물에서 약 3 내지 18%의 양으로 첨가할 수 있다. 액화 가스 추진제는 압력 하에서 액체로서 존재하는 가스인데, 고도로 정제된 탄화수소류, 예를 들면, 프로판, 이소부탄과 n-부탄, 다이메틸 에테르 및 클로로플루오로카본(CFCs)을 포함한다.

본 발명에 따른 특정 양태는, 본 발명의 조성물을 패취에 위치시키고, 경피전달 기구의 피부 접촉면 또는 피부 테이프에 있어 활성 구성성분의 머무름(residence)를 조절하고, 목적물을 피부에 적용함으로써, 효과적인 표면의 치료 또는 피부 또는 피부를 통한 약물의 침투를 증강시키는 것을 포함한다.

이와 같은 방법을 사용해서, 경피전달이 필요한 경우나 현재 전신적으로 투여되고 있는 경우라면, 본 발명의 더 나은 치료 시스템으로 약물을 적용할 수 있다. 이러한 약물의 예로는, 니코틴, 테스토스테론 및 기타 남성 호르몬류, 남성호르몬 전구체, 에스트로겐 및 기타 여성 호르몬제 및 여성호르몬 전구체, 성장호르몬, 인슐린, 카페인, 스테로이드성 및 비스테로이드계 항염증제 및 갑상선 호르몬 대체제 등이 있다.

실시예 1에 대표적으로 예시한 과정을 사용해서 본 발명의 조성물을 생산할 수 있다.

또한 본 발명에 따른 약제용 담체는 피부 케어제 및 향수d 첨가해서 미용 목적의 화장품을 제조하는데 사용될 수 있다.

약제용 적용 분야 (Fields of Pharmaceutical Applications)

적합한 활성 구성성분 및 필요에 따라 적합한 적어도 하나의 활성제를 포함함으로써, 본 발명의 거품성 조성물은 다음에 분류한 바와 같은 다양한 장애의 치료에 유용하게 사용될 수 있다. 그러나 하기 예에 한정되지 않는다.

접촉성 피부염, 아토피성 피부염, 지루성 피부염, 원형 피부염(nummular dermatitis), 손, 발의 만성 피부염, 일반적인 표피박리성 피부염, 울체성 피부염을 포함하는 피부염; 만성 단순성 태선; 기저귀 발진; 봉와직염, 급성 임파선염, 임파절염, 단독, 피부농양, 괴사성 피하감염, 포도상구균에 의한 변색성 피부증후군, 모낭염, 절종, 화농성 한선염, 등창, 손발톱주위염, 홍색음선을 포함하는 세균감염; 피부사상균 감염, 효모 감염을 포함하는 진균감염; 개선, 슬증, 인선병을 포함하는 기생충 감염; 바이러스 감염; 여드름, 주사비, 입주위 피부염, 다모증(hypertrichosis)(여성다모증(hirsutism))을 포함하는 모낭 및 피지선 장애, 남성형 대머리, 원형탈모증, 전신성 탈모증(alopecia universalis and alopecia totalis)을 포함하는 탈모증; 위수염모낭염(pseudofolliculitis barbae), 각질화 포낭(keratinous cyst); 건선, 장미색 비강진, 편평태선, 모공성 홍색 비강진을 포함하는 스케일링 파플러병(scaling popular diseases); 사마귀, 이형성 네비(dysplastic nevi), 스킨 태그(skin tags), 지방종, 혈관종, 화농성 육아종, 지루성 각화증, 피부섬유종, 각질극세포종(keratoacanthoma), 켈로이드를 포함하는 양성 종양; 기저세포암, 편평세포암(squamous cell carcinoma), 악성흑색종, 페제트유암, 카포시육종을 포함하는 악성 종양; 햇볕에 탐, 햇볕에 의한 만성 효과 감광성을 포함하는 햇볕에 대한 반응; 천포창, 수포성 천포창, 포진상 피부염, 선상 이뮤노글로불린A 병(linear IgA disease)을 포함하는 수포성 병; 백반, 피부 백변증, 감염후 저착색증(postinflammatory hypopigmentation)을 포함하는 저착색증 및 과착색증(hyperpigmentation), 흑피증(간반), 약물 유

도성 과착색증, 감염후 과착색증을 포함하는 과착색증을 포함하는 착색장애; 어린선, 모공성 태선, 가골(calluses), 티눈, 화학선 각화증(actinic keratosis)을 포함하는 각질화 장애; 욕창; 발한장애(disorders of sweating); 약물 발진, 독성 상피괴사(toxic epidermal necrolysis)를 포함한 염증 반응; 다형성 홍진, 결절성 홍반, 환상육아종 등의 피부염.

거품성 조성물은 활성제의 국소투여나 경피투여에 대해 반응하는 비피부병학적 장애에도 유용하다. 예를 들면, 국소적 통증 일반, 관절통, 근육통, 등통, 류마티스성 통증, 관절염, 골관절염, 급성 소프트 티슈 상해(acute soft tissue injuries) 및 스포츠 상해(sports injuries) 등을 들 수 있다. 이러한 부류의 다른 장애로는, 호르몬 대체요법, 니코틴 패취적용 등의 호르몬 요법에 대해 반응하는 몸의 이상(conditions), 및 약물전달 기술분야에 알려진 기타 장애 등이 있다.

거품성 조성물은 또한 직장, 질, 음경 요도 및 이도를 포함하는 몸의 공간의 장애나 질병을 치료 및 예방하는데 유용하다.

그러므로, 거품성 조성물은, 생리전 증후군, 미틀쉬머츠(mittelschmerz, 배란에 의해 야기되는 심한 미드사이클 통증), 월경불순(월경주기와 관계된 통증), 자궁내막증, 자궁외 임신, 난소낭포 및 난소종, 급성 골반 감염증, 골반울혈증후군(pelvic congestion syndrome), 외음부통(vulvodynia)을 포함하는 골반통증; 세균성 질선증(bacterial vaginosis), 칸디다질염, 트리코모나스 질염, 헤르페스 심플렉스, 생식기궤양(genital ulcer) 및 생식기 혹(genital warts), 골반 감염성질환(pelvic inflammatory disease, PID), 자궁경관염, 급성 및 만성 이관염을 포함하는 외음부 질염(vulvovaginal infections); 자궁내막증; 자궁내막암, 난소암, 자궁경부암, 외음부암, 질암, 나팔관암, 임신성 영양아층증(gestational trophoblastic disease)을 포함하는 부인과질환성 종양(gynecological neoplasms); 양성종양; 성적 접촉에 의해 전염되는 질병; 성적 흥분장애(sexual arousal disorder), 여성 오르가슴 장애(female orgasmic disorder), 이상성감증 및 질경(vaginismus)을 포함한 약물요법에 반응하는 성기능부전 장애 ; 및 호르몬 요법에 반응하는 다양한 부인과 질환성 장애; 와 같은 다양한 부인과 질환성 장애 중 어느 하나라도 가진 환자를 치료하는데 유용하다. 상기 장애군들은 비제한적인 것으로서 예시목적으로 분류한 것이다.

직장 적용의 예를 들면, 치농양/치루(anal abscess/fistula), 치암(anal cancer), 치혹(anal warts), 크론병, 치질, 항문주위의 아구창(perianal thrush), 항문 열창(anal fissures), 변/뇨실금(fecal incontinence), 변비, 결장 및 직장용종(polyps of the colon and rectum)을 포함한다.

거품성 조성물은 또한 성적 접촉에 의한 질병 및 비성적 접촉성 감염성 질환(STDs)에 의한 질 내부 및 직장 치료에 유용하다.

하나 이상의 양태에 있어, 본 발명은 피부, 점막, 이도, 질, 직장 및 음경 요도 장애의 치료 방법을 제공하며, 이 방법은 본 발명의 거품성 조성물을, 따라서 하나 이상의 활성제를 병증 부위에 치료학적으로 유효한 농도로 국소적용하는 것을 포함한다.

또 다른 양태에 있어, 본 발명은 활성제의 국소적인 전달에 반응하는 비피부학적 장애를 치료하는 방법을 제공하며, 이 방법은 본 발명의 거품성 조성물을, 따라서 하나 이상의 활성제를 병증 부위에 치료학적으로 유효한 농도로 국소적용하는 것을 포함한다.한다.

치료/ 요법 (Treatment/ Therapy)

본 명세서에서 호환되어 사용되고 있는 "치료" 및 "요법"이라는 용어는 질병 또는 장애의 치료를 위한 것을 말한다. 예를 들면,

(i) 질병 또는 장애의 치료

(ii) 질병에 노출되기 전인 환자에게 일어난 그러나 아직 그러한 질병을 가지고 있다고 진단되지 않은 질병 또는 장애의 예방

(iii) 질병 또는 장애의 억제

(iv) 질병 또는 장애의 완화

(v) 질병의 퇴화를 야기

(vi) 면역학적 유용한

효과의 제공

(vii) 질병 또는 장애에 의해 고통받는 환자의 삶의 질 증진; 및 화장료용 치료의 경우

(viii) 클렌징, 미용 증진, 매력의 증진 또는 신체의 구조나 기능에는 영향이 없는 외형의 변화

를 포함한다.

실시예

이하 실시예 및 실험을 몇개 기술하지만, 본 발명의 이것에 구속되는 것은 아니다.

실시예 1 - 약제용 또는 화장료용 거품성 담체 및 조성물의 생산 - 일반적인 방법

약제용 거품성 담체를 생산하는 방법은 일반적으로 다음의 단계를 포함하였다.

1 단계 - 수성 상 (Aqueous Phase) : 겔화제 및 계면활성제를 흔들어서 물에 용해시킨다. 용액을 50-70℃로 가온한다. 수용성 화장료용 또는 약제용 활성성분* 및 임의의 수용성 성분을 흔들면서 수성 상 혼합물에 가한다.

2 단계 - 소수성 상 (Hydrophobic Phase) : 소수성 용매를 같은 온도로 가온해준다. 유용성 화장료용 또는 약제용 활성제* 및 임의의 유용성 성분을 흔들면서 소수성 상 혼합물에 가한다.

3 단계 - 가온한 소수성 상을 점차적으로 가온한 수성 상에 흔들면서 붓는다. 이어서 울트라유락스 균질화(Ultraurax homogenization) 해준다. 혼합물을 실온으로 냉각한다.

4 단계 - 실온에서 혼합물을 에어로솔 용기에 가한다. 용기는 밀봉하고, 적당한 양의 추진제(조성물 질량의 약 10%)를 용기안에 압축시킨다.

* 열 민감성 활성 성분의 경우에는 3 단계 후에 혼합물을 흔들면서 활성제를 가한다.

다음의 예에서는, 거품성 조성물은 상기 설명한 바와 같이 생산되고, 거품의 질을 시험하였다.

실시예 2 - 트랜스큐톨을 함유하는 디클로페낙 거품성 조성물

구성성분	% w/w
미네랄 오일(소수성 용매)	6.00
이소프로필 미리스테이트 (소수성 용매)	6.00
스테아릴 알콜 (거품 보조제)	1.00
잔탄 검 (겔화제)	0.30
메토셀 K100M (겔화제)	0.30
트윈 80 (계면활성제)	1.00
Myrj 49p (계면활성제)	3.00
코카미도프로필 베타인 (계면활성제)	0.50
트랜스큐톨 피(transcutol p, 치료학적 증강제)	20.00
글리세릴 모노스테아레이트 (공동-유화제)	0.50
디클로페낙 소디움 (활성제)	1.00
페노닢 (방부제)	0.30
부탄/프로판 (추진제)	8.00
물	100으로 맞춤.0
거품제 질	E
밀도	0.028

실시예 3 - 요소, 락트산 또는 치료학적 증강제를 함유하는 국소 마취제 리도카인

구성성분	% w/w				
미네랄 오일	6.00	6.00	6.00	6.00	12.00
이소프로필 미리스테이트	6.00	6.00	6.00	6.00	12.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50	0.50	0.50	0.50	1.00
스테아릴 알콜	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00
잔탄 검	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30
메토셀 K100M	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30
트윈 60	1.00				
트윈 80		1.00	1.00	1.00	2.00
Myrj 49p	3.00	3.00	3.00	3.00	4.00
락트산	10.00	5.00			
글리코퓨롤			1.00	10.00	
요소					10.00
코카미도프로필 베타인	-	0.50	-	0.50	-
리도카인 베이스	4.00	4.00	4.00	4.00	4.00
페노닢	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30
부탄/프로판	8	8	6	10	10
물	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤
거품제 질	E	E	E	E	E
밀도	0.028	0.038	0.044	0.028	0.028

구성성분	% w/w				
미네랄 오일	6.00	6.00	6.00	22.00	6.00
이소프로필 미리스테이트	6.00	6.00	6.00	22.00	6.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50	0.50	0.50	1.00	0.50
스테아릴 알콜	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00
잔탄 검	0.30	0.30	0.30	0.40	0.30
메토셀 K100M	0.30	0.30	0.30	0.40	0.30
트윈 80		1.00	1.00	2.00	1.00
Myrj 49p	1.00	3.00	3.00	4.00	3.00
프로필렌 글리콜	3.00				
트랜스큐톨 피		10.00	1.00	2.00	10.00
코카미도프로필 베타인	0.50	0.50	0.50	0.50	0.50
리도카인 베이스	4.00	4.00	4.00	4.00	4.00
페노닢	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30
부탄/프로판	8	8	6	8	10
물	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤
거품제 질	E	E	E	E	E
밀도	0.032	0.035	0.048	0.075	0.025

실시예 4 - 요소를 함유하는 거품성 조성물

구성성분	% w/w			
미네랄 오일	6.00	6.00	6.00	6.00
이소프로필 미리스테이트	6.00	6.00	6.00	6.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50	0.50	0.50	0.50
스테아릴 알콜	0.20	0.20	0.20	1.00
요소	10.00	10.00	10.00	10.00
잔탄 검	0.30	0.30	0.30	0.30
메토셀 K100M	0.30	0.30	0.30	0.30
Myrj 52				3.00
트윈 80				1.00
Myrj 49p			3.00	
트윈 60	1.00	1.00	1.00	
코카미도프로필 베타인	0.50	0.50	0.50	
페노닢	0.30	0.30	0.30	0.30
부탄/프로판	8.00	8.00	8.00	6.00
물	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤
거품제 질	E	E	E	E
밀도	n/a	0.023	n/a	0.044

구성성분	% w/w			
미네랄 오일	6.00		6.00	
이소프로필 미리스테이트	6.00		6.00	
글리세릴 모노스테아레이트	0.50		0.50	
스테아릴 알콜	1.00		1.00	
요소	40.0	40.00	20.00	20.00
잔탄 검	0.30	0.30	0.30	0.30
메토셀 K100M	0.30	0.30	0.30	0.30
Myrj 52	3.00	3.00	3.00	3.00
트윈 80	1.00	1.00	1.00	1.00
코카미도프로필 베타인	0.50	0.50		0.50
페녹닢	0.30	0.30	0.30	0.30
부탄/프로판	8.00	6.00	8.00	8.00
물	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤	100으로 맞춤
거품제 질	E	E	E	E
밀도	0.022	0.029	0.032	0.024

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드(capric/caprylic triglycerides)	12.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
트윈 80	3.0
페물린 TR1	0.50
친수성 약물	1.0
요소	10.0
페녹닢	0.30
부탄/프로판	8.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.030

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	12.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
트윈 80	3.0
페물린 TR1	0.50
소수성 약물	1.0
요소	10.0
페녹닢	0.30
부탄/프로판	8.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.030

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	25.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
스테아릴 알콜	1.00
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
트윈 80	1.00
MYRJ 52P	3.00
요소	10.00
코카미도프로필 베타인	0.50
친수성 약물	0.1-2.0
페노닢	0.30
부탄/프로판	6.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.034

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	25.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
스테아릴 알콜	1.00
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
트윈 80	1.00
MYRJ 52P	3.00
요소	10.00
코카아미도도프로필 베타인	0.50
친유성 약물	2.0
페노닢	0.30
부탄/프로판	8.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.020

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	12.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
폐물린 TR1	0.50
메토셀 K100M	0.30
잔탄 검	0.30
요소	10.00
케토코나졸	1.0
페노닢	0.30
부탄/프로판	8.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.020

실시예 5 - 공융 혼합물을 함유하는 국소 마취제 거품성 조성물

구성성분	% w/w
미네랄 오일	6.00
이소프로필 미리스테이트	6.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
스테아릴 알콜	1.00
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
트윈 80	1.00
MYRJ 49p	3.00
코카미도프로필 베타인	0.50
트랜스큐톨 피	20.00
리도카인 베이스	2.50
프릴로카인 베이스	2.50
페노닢	0.30
물	100으로 맞춤
부탄/프로판	8.00
거품제 질	E
밀도	0.030

실시예 6 - 트랜스큐톨 또는 글리코퓨롤을 함유하는 거품성 조성물

구성성분	% w/w
이소프로필 미리스테이트	30.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
트윈 80	1.00
MYRJ 49p	3.00
코카미도프로필 베타인	0.50
트랜스큐톨 피	20.00
친수성 약물	1.0
페노닢	0.30
부탄/프로판	8.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.028

구성성분	% w/w
이소프로필 미리스테이트	30.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
트윈 80	1.00
MYRJ 49p	3.00
코카미도프로필 베타인	0.50
트랜스큐톨 피	20.00
소수성 약물	1.0
페노닢	0.30
물	100으로 맞춤
부탄/프로판	8.00
거품제 질	E
밀도	0.030

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	12.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
페물린 TR1	0.50
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
트랜스큐톨	10.00
케토코나졸	1.0
페노닢	0.30
물	100으로 맞춤
부탄/프로판	8.00
거품제 질	E
밀도	0.038

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드)	12.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
페물린 TR1	0.50
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
글리코퓨롤(glycofurol)	10.00
케토코나졸	1.0
페노닢	0.30
물	100으로 맞춤
부탄/프로판	8.00
거품제 질	E
밀도	0.034

실시예 7 - 하이드록시산을 함유하는 거품성 조성물

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	18.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
페물린 TR1	0.50
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
친수성 약물	1.0
락트산	6.0
페노닢	0.30
부탄/프로판	8.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.030

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	18.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
페물린 TR1	0.50
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
소수성 약물	1.0
락트산	6.0
페노닢	0.30
부탄/프로판	6.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.038

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	25.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
스테아릴 알콜	1.00
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
트윈 80	1.00
MYRJ 52P	3.00
글리콜산(glycolic acid)	4.00
코카미도프로필 베타인	0.50
친수성 약물	2.0
페노닢	0.30
부탄/프로판	6.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.044

구성성분	% w/w
카프릭/카프릴릭 트라이그리세리드	25.00
글리세릴 모노스테아레이트	0.50
스테아릴 알콜	1.00
잔탄 검	0.30
메토셀 K100M	0.30
트윈 80	1.00
MYRJ 52P	3.00
글리콜산(glycolic acid)	4.00
코카미도프로필 베타인	0.50
소수성 약물	2.0
페녹닢	0.30
부탄/프로판	12.00
물	100으로 맞춤
거품제 질	E
밀도	0.020

이상에서 본 발명의 가르침이 들어 있는 다양한 양태들을 보여주고 기술하였는데, 당업자라면 이러한 가르침이 들어간 다양한 다른 양태들을 용이하게 고안할 수 있다는 것은 자명하다.

(57) 청구의 범위

청구항 1.

무알콜성이고,

(i) 액상, 비휘발성 소수성 용매 약 5 내지 50 중량%;

(ii) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iv) 하나 이상의 요소 (urea), 하이드록시산 (hydroxy acid), 및 활성제 의 공융혼합물로 이루어진 군으로부터 선택된 활성 성분; 그리고

(v) 전체 조성물의 약 3 내지 약 18 중량%의 농도의 액화 기체 추진제

를 포함하는 분사 전 상태에서 안정한 수중유형 거품성 유제

청구항 2.

제 1항에 있어서, 상기 활성 성분이, 혼합물시에 공융혼합물을 형성하는 활성제의 조합으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 3.

제 1항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 1% 내지 약 50%의 요소로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 4.

제 3항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 10% 내지 약 20%의 요소로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 5.

제 3항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 20% 내지 50%의 요소로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 6.

제 1항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 1% 내지 약 30%의 하이드록시산으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 7.

제 6항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 1% 내지 약 10%의 하이드록시산으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제

청구항 8.

제 6항에 있어서, 상기 활성성분이 약 10% 내지 약 30%의 하이드록시산으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제

청구항 9.

제 1항에 있어서, 상기 활성성분이 약 1% 내지 약 50%의 요소 및 약 1% 내지 약 30%의 하이드록시산의 조합으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 10.

무알콜성이고,

(ⅰ) 액성, 비휘발성의 소수성 용매 약 5-50 중량%;

(ii) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iv) 프로필렌 글리콜, 부틸렌 글리콜, 글리세롤, 펜타에리스리톨, 소르비톨, 만니톨, 올리고사카라이드, 다이메틸 이소소르바이드, 약 8 내지 10의 에틸렌 옥사이드 유닛을 가지는 에톡실레이티드 글리세라이드의 모노올레이트, 폴리에틸렌 글리콜 200-600, 트랜스큐톨, 글리코푸롤 및 사이클로덱스트린으로 이루어진 군에서 선택되는 치료학적 증강제 (therapeutic enhancer);

(ⅴ) 치료학적으로 유효한 농도의 적어도 하나의 활성제; 그리고,

(vi) 전체 조성물의 약 3 내지 약 18 중량%의 농도의 액화 가스 추진제,

를 포함하는 분사 전 단계에서 안정한 수중 유형 거품성 유제.

청구항 11.

제 10항에 있어서, 상기 활성성분이 약 1% 내지 약 10%의 치료학적 증강제로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 12.

제 10항에 있어서, 상기 활성성분이 약 10% 내지 약 30%의 치료학적 증강제로 이루어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 13.

제 3항 또는 제 6항에 있어서, 치료학적으로 유효한 농도의 적어도 하나의 활성제를 추가로 포함하는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 14.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 소수성 용매가 조성물의 약 5-10 중량%로 포함되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 15.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 소수성 용매가 조성물의 약 10-20 중량%로 포함되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 16.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 소수성 용매가 조성물의 약 20-50 중량%로 포함되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 17.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 소수성 용매가 중량 기준으로 2:8 내지 8:2의 비로 미네랄 오일과 완화제의 혼합물을 포함하는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 18.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 계면활성제가, 비이온성 계면활성제, 양이온성 계면활성제, 암포테릭 계면활성제 및 즈비터이오닉 (zwitterionic) 계면활성제로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 19.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 계면활성제가, 1:1 내지 20:1의 비율의 비이온성 계면활성제 및 이온성 계면활성제의 혼합물인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 20.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 계면활성제가 비이온성 계면활성제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 21.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 계면활성제가 9를 초과하는 HLB치를 가지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 22.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 소수성 용매가, 식물성 오일, 마린 오일, 미네랄 오일, 에몰리언트, 실리콘 오일, 식물-유래 치료학적 오일 및 이들의 임의 비율의 혼합물로 이루어진 군에서 선택된 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 23.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 계면활성제와 소수성 용매의 비율이 약 1:8 내지 약 1:16인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 24.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 계면활성제와 소수성 용매의 비율이 약 1:16 내지 약 1:32인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 25.

제1항 내지 제3항, 제6항 또는 제10항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 조성물이 피부, 점막, 질 및 직장 장애의 치료에 사용되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 26.

통증 치료를 위한, 제 2항, 제 3항, 제 6항 및 제 10항 중 어느 한 항에 따른 거품성 유제의 용도.

청구항 27.

피부염, 아토피성 피부염, 지루성 피부염, 원형 피부염(nummular dermatitis), 손, 발의 만성 피부염, 일반적인 표피박리성 피부염, 울체성 피부염 ; 만성 단순성 태선; 기저귀 발진; 봉와직염, 급성 임파선염, 임파절염, 단독, 피부농양, 괴사성 피하 감염, 포도상구균에 의한 변색성 피부증후군, 모낭염, 절종, 화농성 한선염, 등창, 손발톱 주위염, 홍색음선을 포함하는 세

균감염; 피부사상균 감염, 효모 감염을 포함하는 진균감염; 기생충 감염, 개선, 슬증, 인선병; 바이러스 감염, 모낭 장애, 피지선 장애, 여드름, 주사비, 입주위 피부염, 다모증(hypertrichosis), 여성다모증(hirsutism), 남성형 대머리, 원형탈모증, 전신성 탈모증(alopecia universalis and alopecia totalis) ; 위수염모낭염(pseudofolliculitis barbae), 각질화 포낭(keratinous cyst), 스케일링 파퓰러병(scaling popular diseases), 건선, 장미색 비강진, 편평태선, 모공성 홍색 비강진, 양성 종양, 사마귀, 이형성 네비(dysplastic nevi), 스킨 태그(skin tags), 지방종, 혈관종, 화농성 육아종, 지루성 각화증, 피부섬유종, 각질극세포종(keratoacanthoma), 켈로이드; 악성 종양, 기저세포암, 편평세포암(squamous cell carcinoma), 악성흑색종, 페제트유암, 카포시육종; 햇볕에 대한 반응, 햇볕에 탐, 감광성; 천포창, 수포성 천포창, 포진상 피부염, 선상 이뮤노글로불린A 병(linear IgA disease)을 포함하는 수포성 병, 백반, 피부 백변증, 감염후 저착색증(postinflammatory hypopigmentation), 과착색증(hyperpigmentation), 흑피증, 간반, 약물 유도성 과착색증, 감염후 과착색증, 어린선, 모공성 태선, 가골(calluses), 티눈, 화학선 각화증(actinic keratosis); 욕창, 발한장애(disorders of sweating), 다형성 홍진, 결절성 홍반, 환상육아종, 활성제의 국소투여나 경피투여에 대해 반응하는 비피부병학적 장애, 국소적 통증, 관절통, 근육통, 등통, 류마티스성 통증, 관절염, 골관절염, 급성 소프트 티슈 상해(acute soft tissue injuries) 및 스포츠 상해(sports injuries), 호르몬 치료, 호르몬 대체요법, 니코틴 패취적용에 대해 반응하는 몸의 이상(conditions), 골반 통증, 생리전 증후군, 미틀쉬머츠(mittelschmerz), 월경불순, 자궁내막증, 자궁외 임신, 난소낭포 및 난소종, 급성 골반 감염증, 골반울혈증후군(pelvic congestion syndrome), 외음부통(vulvodynia), 외음부질염(vulvovaginal infections), 세균성 질선증(bacterial vaginosis), 칸디다질염, 트리코모나스 질염, 헤르페스 심플렉스, 생식기궤양(genital ulcer) 및 생식기 혹(genital warts), 골반 감염성질환(pelvic inflammatory disease, PID), 자궁경관염, 급성 및 만성 이관염, 자궁내막증, 부인과질환성 종양(gynecological neoplasms), 자궁내막암, 난소암, 자궁경부암, 외음부암, 질암, 나팔관암, 임신성 영양아층증(gestational trophoblastic disease), 양성종양; 성적 접촉에 의해 전염되는 질병; 약물요법에 반응하는 성기능부전 장애, 성적 흥분장애(sexual arousal disorder), 여성 오르가슴 장애(female orgasmic disorder), 이상성감증 및 질경(vaginismus), 치농양/치루(anal abscess/fistula), 치암(anal cancer), 치혹(anal warts), 크론병, 치질, 항문주위의 아구창(perianal thrush), 항문 열창(anal fissures), 변/뇨실금(fecal incontinence), 변비, 결장 및 직장용종(polyps of the colon and rectum), 성적 접촉에 의한 질병 및 비 성적접촉성 질 및 성기 감염 질환으로 이루어지는 군에서 선택되는 장애의 치료를 위한, 제2항, 제3항, 제6항 및 제10항 중 어느 한 항에 따른 거품성 유제의 용도.

청구항 28.

상처, 화상, 벤 상처 및 궤양의 치료를 위한, 제2항, 제3항, 제6항 및 제10항 중 어느 한 항에 따른 거품성 유제의 용도.

청구항 29.

제 2항, 제10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 항균제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 30.

제 29항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 클로람페니콜, 테트라사이클린, 합성 및 반합성 페니실린, 베타-락탐, 퀴놀론, 플루오로퀴놀론, 마크롤라이드계 항생제, 펩타이드 항생제, 사이클로스포린, 메트로니다졸, 자유 라디칼 발생제, 요오드, 클로로헥시딘, 벤조일 퍼옥사이드, 하이드로젠 퍼옥사이드 및 이들을 치료학적으로 유효한 농도로 혼합한 혼합물로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 31.

제 2항, 제10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 항진균제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 32.

제 31항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 아졸, 다이아졸, 트라이아졸, 미코나졸, 플루코나졸, 케토코나졸, 클로트리마졸, 이트라코나졸 그리세오풀빈, 시클로피록스, 아모롤핀, 테르비타핀, 암포테리신 B, 포타시움 아이오다이드, 플루사이토신(5FC) 및 이들을 치료학적으로 유효한 농도로 혼합한 혼합물로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 33.

제 2항, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제는 항바이러스제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 34.

제 33항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 비다라빈, 아시클로버, 간시클로버, 뉴클레오사이드-아날로그 리버스 트랜스크립타제 억제제, AZT(지도부딘), ddI(디다노신), ddC(잘시타빈), d4T(스타부딘), 3TC(라미부딘), 비-뉴클레오사이드 리버스 트랜스크립타제 억제제(non-nucleoside reverse transcryptase inhibitors), 네비라핀, 델라버딘(delavirdine), 프로테아제 억제제(protease inhibitors), 사퀴나버(saquinavir), 리토나버, 인디나버, 넬피나버, 리바비린, 아만타딘, 리만타딘 및 인터페론으로 이루어지는 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 35.

제 10항 또는 제 13항에 있어서, 적어도 하나의 활성제가 항염증제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 36.

제 10항 또는 제 13항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 항알러지제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 37.

제 35항 또는 제 36항에 있어서, 상기 적어도 활성제가 코르티코스테로이드, 비스테로이드계 항염증제, 항히스타민제, 면역조절제, 면역억제제 및 이들을 치료학적으로 유효한 농도로 혼합한 혼합물로 이루어진 군에서 선택된 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 38.

제 35항에 있어서, 상기 항염증제가 클로베타솔 프로프리오네이트, 할로베타솔 프로프리오네이트, 베타메타손 다이프로프리오네이트, 베타메타손 발레레이트, 플루오시놀론 아세토니드, 할시노니드, 하이드로코르티손 발레레이트, 트리암시놀론 아세토니드, 하이드로코티손 및 이들을 치료학적으로 유효한 농도로 혼합한 혼합물로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 39.

제 35항에 있어서, 상기 항염증제가 비스테로이드계 항염증제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 40.

제 39항에 있어서, 상기 항염증제가 옥시캄, 피록시캄, 이속시캄, 테녹시캄, 수독시캄, 살리실레이트, 아스피린, 다이살시드, 베노릴레이트, 트릴리세이트, 사파프린, 솔프린, 디플루니살, 펜도살, 디클로페낙, 펜클로페낙, 인도메타신, 술린닥, 톨메틴, 이속제팍(isoxepac), 퓨로페낙, 티오피낙, 지도메타신, 아세마타신, 펜티아작, 조메피락, 클린다낙, 옥세피낙, 펠비낙, 케토롤락, 페나메이트, 메클로페나믹, 플루페나믹, 니플루믹, 톨페남산, 프로피온산 유도체, 이부프로펜, 나프록센, 베녹사프로펜, 플루르비프로펜, 케토프로펜, 페노프로펜, 펜부펜, 인도프로프펜, 피르프로펜, 카르프로펜, 옥사프로진, 프라노프로펜, 미로프로펜, 티옥사프로펜, 수프로펜, 알미노프로펜, 티아프로페닉, 피라졸, 페닐부타존, 옥시펜부타존, 페프라존, 아자프로파존 및 트리메타존으로 이루어지는 군에서 선택된 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 41.

제 36항에 있어서, 상기 항알러지제가 디펜하이드라민, 독세핀, 프릴라민 말레이트, 클로르페니라민 및 트리펠렌아민, 페노티아진, 프로메타진 하이드로클로라이드, 디메틴덴 말레이트(dimethindene maleate) 및 이들을 치료학적으로 유효한 농도로 혼합한 혼합물로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 42.

제 2항, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 항암제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 43.

제 2항, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 활성제가 광역학적 치료제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 44.

제 2항, 제10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 국소 마취제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 45.

제 44항에 있어서, 상기 국소 마취제가 벤조카인, 리도카인, 부피바카인, 클로르프로카인, 디부카인, 에티도카인, 메피바카인, 테트라카인, 디클로닌, 헥실카인, 프로카인, 코카인, 케타민, 프라목신 및 페놀로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 46.

제 2항, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 활성제가 레티노이드인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 47.

제 46항에 있어서, 상기 레티노이드가 레티놀, 레티날, 모든 트랜스 레티노산, 에트레티네이트, 악티레틴, 이소트레티노인, 아다팔린 및 타자로틴으로 이루어지는 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 48.

제 2항, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 주름 억제제로 하는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 49.

제 2, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 아스코르브산 및 이의 염, 지방산의 아스코르빌 에스테르, 마그네슘 아스코르빌 포스페이트, 소디움 아스코르빌 포스페이트, 아스코르빌 소르베이트, 토코페롤, 토코페롤 소르베이트, 토코페롤 아세테이트, 기타 토코페롤 에스테르, 부틸레이티드 하이드록시 벤조산 및 그들의 염, 6-하이드록시-2,5,7,8-테트라메틸크로만-2-카르복시산, 갈산 및 이의 알킬 에스테르, 프로필 갈레이트, 요산 및 이의 염 및 알킬 에스테르, 소르브산 및 이의 염, 리포산, N,N-다이에틸하이드록실아민, 아미노-구아니딘, 설프하이드릴 화합물, 글루타치온, 다이하이드록시 푸마르산 및 이들의 염, 리신 피돌레이트, 아르기닌 필롤레이트, 노르다이하이드로구아이아레트산, 바이오플라보노이드, 커커민, 리신, 메치오닌, 프롤린, 수퍼옥사이드 디스뮤타제, 실리마린, 차 추출물, 포도 껍질/씨 추출물, 멜라닌 및 로즈마리 추출물로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 50.

제 2항, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 자가-태닝제 (self-tanning agent)인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 51.

제 2항, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 활성제가 항여드름 활성제 (anti-acne active agent)인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 52.

제 51항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 레소시놀, 황, 살리실산, 살리실레이트 염, 벤조일 퍼옥사이드, 레티노산, 이소트레티노인, 아다팔린, 타자로틴, 아젤라산 및 아젤라산 유도체, 항생제, 에리스로마이신, 클린다마이신 및 아연염 및 복합체로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 53.

제 2항, 제 10항 및 제 13항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 피부미백제인 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 54.

제 2항 또는 제 13항에 있어서, 상기 적어도 하나의 활성제가 경피 전달용으로 의도된 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 55.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 거품 보조제를 추가로 포함하는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 56.

제 1항 또는 제 10항에 있어서, 상기 거품성 유제의 방출 시에, 약 0.01 g/mL 내지 약 0.1 g/mL의 비중을 가진, 무알콜성 거품이 얻어지는 것을 특징으로 하는 거품성 유제.

청구항 57.

무알콜성이고, 약 0.01g/mL 내지 약 0.1g/mL의 비중을 가지며,

(i) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(ii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 활성제의 공융혼합물; 그리고

(iv) 물을 포함하는 거품.

청구항 58.

무알콜성이고, 약 0.01g/mL 내지 약 0.1g/mL의 비중을 가지며,

(i) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(ii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 약 10% 내지 40%의 요소; 그리고

(iv) 물을 포함하는 거품.

청구항 59.

무알콜성이고, 약 0.01g/mL 내지 약 0.1g/mL의 비중을 가지며,

(i) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(ii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 약 10% 내지 30%의 하이드록시산; 그리고

(iv) 물을 포함하는 거품.

청구항 60.

무알콜성이고, 약 0.01g/mL 내지 약 0.1g/mL의 비중을 가지며,

(i) 액성, 비휘발성 소수성 용매 약 5 내지 50 중량%;

(ii) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 양친매성 공중합체를 포함하는 겔화제 약 0.1% 내지 5 중량%; 그리고

(iv) 하나 이상의 요소, 하이드록시산, 활성제의 공융혼합물 및 치료학적 증강제로 이루어지는 군으로부터 선택되는 활성 성분을 포함하는 거품.

청구항 61.

피부, 점막, 이도(ear channel), 질, 직장 및 음경 요도 장애로 이루어진 군에서 선택되는 장애의 치료를 위한, 제1항, 제10항, 및 제57항 내지 제60항 중 어느 한 항에 따른 거품의 용도.

청구항 62.

접촉성 피부염, 아토피성 피부염, 지루성 피부염, 원형 피부염(nummular dermatitis), 손, 발의 만성 피부염, 일반적인 표피박리성 피부염, 울체성 피부염; 만성 단순성 태선, 기저귀 발진; 봉와직염, 급성 임파선염, 임파절염, 단독, 피부농양, 괴사성 피하감염, 포도상구균에 의한 변색성 피부증후군, 모낭염, 절종, 화농성 한선염, 등창, 손발톱주위염, 홍색음선을 포함하는 세균감염; 피부사상균 감염, 효모 감염을 포함하는 진균감염; 기생충 감염, 개선, 슬증, 인선병; 바이러스 감염, 모낭장애, 피지선 장애, 여드름, 주사비, 입주위 피부염, 다모증(hypertrichosis), 여성다모증(hirsutism), 남성형 대머리, 원형 탈모증, 전신성 탈모증(alopecia universalis and alopecia totalis); 위수염모낭염(pseudofolliculitis barbae), 각질화 포낭(keratinous cyst), 스케일링 파퓰러병(scaling popular diseases), 건선, 장미색 비강진, 편평태선, 모공성 홍색 비강진, 양성 종양, 사마귀, 이형성 네비(dysplastic nevi), 스킨 태그(skin tags), 지방종, 혈관종, 화농성 육아종, 지루성 각화증, 피부섬유종, 각질극세포종(keratoacanthoma), 켈로이드; 악성 종양, 기저세포암, 편평세포암(squamous cell carcinoma), 악성흑색종, 페제트유암, 카포시육종; 햇볕에 대한 반응, 햇볕에 탐, 감광성; 천포창, 수포성 천포창, 포진상 피부염, 선상 이뮤노글로불린A 병(linear IgA disease)을 포함하는 수포성 병, 백반, 피부 백변증, 감염후 저착색증(postinflammatory hypopigmentation), 과착색증(hyperpigmentation), 흑피증, 간반, 약물 유도성 과착색증, 감염후 과착색증, 어린선, 모공성 태선, 가골(calluses), 티눈, 화학선 각화증(actinic keratosis); 욕창, 발한장애(disorders of sweating), 다형성 홍진, 결절성 홍반, 환상육아종, 활성제의 국소투여나 경피투여에 대해 반응하는 비피부병학적 장애, 국소적 통증, 관절통, 근육통, 등통, 류마티스성 통증, 관절염, 골관절염, 급성 소프트 티슈 상해(acute soft tissue injuries) 및 스포츠 상해(sports injuries), 호르몬 요법, 호르몬 대체요법, 니코틴 패취적용에 대해 반응하는 몸의 이상(conditions), 골반 통증, 생리전 증후군, 미틀쉬머츠(mittelschmerz), 월경불순, 자궁내막증, 자궁외 임신, 난소낭포 및 난소종, 급성 골반 감염증, 골반울혈증후군(pelvic congestion syndrome), 외음부통(vulvodynia), 외음부질염(vulvovaginal infections), 세균성 질선증(bacterial vaginosis), 칸디다질염, 트리코모나스 질염, 헤르페스 심플렉스, 생식기궤양(genital ulcer) 및 생식기 혹(genital warts), 골반 감염성질환(pelvic inflammatory disease, PID), 자궁경관염, 급성 및 만성 이관염, 자궁내막증, 부인과질환성 종양(gynecological neoplasms), 자궁내막암, 난소암, 자궁경부암, 외음부암, 질암, 나팔관암, 임신성 영양아층증(gestational trophoblastic disease), 양성종양; 성적 접촉에 의해 전염되는 질병; 약물요법에 반응하는 성기능부전 장애, 성적 흥분장애(sexual arousal disorder), 여성 오르가슴 장애(female orgasmic disorder), 이상성감증 및 질경(vaginismus), 치농양/치루(anal abscess/fistula), 치암(anal cancer), 치혹(anal warts), 크론병, 치질, 항문주위의 아구창(perianal thrush), 항문 열창(anal fissures), 변/뇨실금(fecal incontinence), 변비, 결장 및 직장용종(polyps of the colon and rectum), 성적 접촉에 의한 질병 및 비 성적접촉성 질 및 성기 감염 질환으로 이루어지는 군에서 선택되는 장애의 치료를 위한, 제1항, 제10항 및 제57항 내지 제60항 중 어느 한 항에 따른 거품의 용도.

청구항 63.

거품이 무알콜성이고, 약 0.01 g/mL 내지 약 0.1 g/mL의 비중을 가지며,

(i) 액성, 비휘발성 소수성 용매 약 5 내지 50 중량%;

(ii) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iv) 치료학적 증강제 및 활성제의 공융혼합물, 하이드록시산, 요소로 이루어진 군에서 선택되는 활성 성분; 그리고

(v) 전체 조성물의 약 3% 내지 약 18 중량%의 농도의 액화 기체 추진제를 포함하는 거품 조성물을 치료가 필요한 피부병학적 또는 점막 장애가 있는 표면에 적용하는 것을 포함하는,

피부병학적 또는 점막의 장애를 치료, 완화 또는 예방하는 방법.

청구항 64.

거품이 무알콜성이고, 약 0.01 g/mL 내지 약 0.1 g/mL의 비중을 가지며,

(i) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(ii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 활성제의 공융 혼합물을 포함하는 거품 조성물을, 치료가 필요한 피부병학적 또는 점막 장애가 있는 표면에 적용하는 것을 포함하는,

피부병학적 또는 점막의 장애를 치료, 완화 또는 예방하는 방법.

청구항 65.

거품이 무알콜성이고, 약 0.01 g/mL 내지 약 0.1 g/mL의 비중을 가지며,

(i) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(ii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 약 10 내지 40%의 요소를 포함하는 거품 조성물을, 치료가 필요한 피부병학적 또는 점막 장애가 있는 표면에 적용하는 것을 포함하는,

피부병학적 또는 점막의 장애를 치료, 완화 또는 예방하는 방법.

청구항 66.

거품이 무알콜성이고, 약 0.01 g/mL 내지 약 0.1 g/mL의 비중을 가지며,

(i) 계면활성제 약 0.1 내지 5 중량%;

(ii) 겔화제 약 0.1 내지 5 중량%;

(iii) 약 1 내지 30%의 하이드록시산을 포함하는 거품 조성물을 치료가 필요한 피부병학적 또는 점막 장애가 있는 표면에 적용하는 것을 포함하는,

피부병학적 또는 점막의 장애를 치료, 완화 또는 예방하는 방법.

청구항 67.

제 63항 내지 제 66항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 겔화제가 양친매성 공중합체를 포함하는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 68.

제 63항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 1 내지 약 50%의 요소로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 69.

제 68항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 10 내지 20%의 요소로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 70.

제 68항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 20 내지 50%의 요소로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 71.

제 63항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 1 내지 30%의 하이드록시산으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 72.

제 71항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 1 내지 10%의 하이드록시산으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 73.

제 71항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 10 내지 30%의 하이드록시산으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 74.

제 63항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 1 내지 50%의 요소 및 약 1 내지 30%의 하이드록시산의 조합으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 75.

제 63항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 1 내지 10%의 치료학적 증강제로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 76.

제 63항에 있어서, 상기 활성 성분이 약 10 내지 30%의 치료학적 증강제로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 77.

제 75항 또는 제 76항에 있어서, 상기 치료학적 증강제가 프로필렌 글리콜, 부틸렌 글리콜, 글리세롤, 펜타에리스리톨, 소르비톨, 만니톨, 올리고사카라이드, 다이메틸 이소소르바이드, 약 8 내지 10개의 에틸렌 옥사이드 유닛을 갖는 에톡실레이티드 글리세라이드의 모노올레이트, 폴리에틸렌 글리콜 200-600, 트랜스큐톨, 글리코푸롤 및 사이클로덱스트린으로 이루어진 군에서 선택되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 78.

제 63항 내지 제 68항, 제 71항, 및 제 75항 내지 제 77항 중 어느 한 항에 있어서, 적어도 하나의 활성제를 치료학적으로 유효한 농도로 추가로 포함하는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 79.

제 63항 내지 제 67항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 계면활성제와 소수성 용매의 비율이 약 1:8 내지 약 1:16인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 80.

제 63항 내지 제 67항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 계면활성제와 소수성 용매의 비율이 약 1:16 내지 약 1:32인 것을 특징으로 하는 방법.