

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl<sup>7</sup>

A61K 7/00

A61K 7/48



# [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 01820554.2

[43] 公开日 2004 年 3 月 10 日

[11] 公开号 CN 1481231A

[22] 申请日 2001.11.2 [21] 申请号 01820554.2

[30] 优先权

[32] 2000.12.15 [33] DE [31] 10062610.6

[86] 国际申请 PCT/EP01/12709 2001.11.2

[87] 国际公布 WO02/47617 德 2002.6.20

[85] 进入国家阶段日期 2003.6.13

[71] 申请人 莫茨药物股份两合公司

地址 德国法兰克福

[72] 发明人 V·帕斯帕里瓦库恩

S·沙特施奈德 R·D·布特勒

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商  
标事务所

代理人 吴亦华

权利要求书 3 页 说明书 14 页 附图 3 页

[54] 发明名称 制备及应用含有 HLB - 值为 2 - 6 的  
W/O - 乳化剂的形成泡囊的皮肤油

[57] 摘要

本发明涉及含脂皮肤油，其含有一种或多种油溶性组分、一种或多种 HLB - 值为 2 - 6，优选 5.9 的 W/O - 乳化剂和一种或多种形成泡囊的脂类以及视需要一种或多种选自醚油、抗氧化剂、香料、防腐剂、活性物质、UV - 滤光剂、维生素、稠度调节剂、增溶剂的添加剂，其制备和作为皮肤油，特别是作为皮肤护理油、运动油、按摩油或防晒油的应用。这种皮肤油可以涂敷在干燥和特别是潮湿的皮肤上，在此，其自行乳化并自动形成脂质体。由此其还通过易于被皮肤吸收具有以此为条件的优点，而不在皮肤上遗留下扰人的脂肪膜。

I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

1. 形成泡囊的皮肤油，其含有一种或多种油溶性组分、一种或多种HLB-值为2-6的W/O-乳化剂和一种或多种形成泡囊的脂类以及视需要一种或多种选自活性物质、抗氧化剂、香料、防腐剂、UV-滤光剂、维生素、色素、浓度调节剂、增溶剂的添加剂，含有胆固醇和/或羊毛脂醇的组合成分除外。

2. 根据权利要求1的皮肤油，其特征在于，总共含有油溶性组分50-99%，乳化剂0.5-10%，泡囊形成剂0.01-10%和添加剂0-40%。

3. 根据权利要求1或2的皮肤油，其特征在于，乳化剂选自脱水山梨糖-衍生物、聚乙氧基化的产物、(聚)甘油衍生物、聚醇酯、葡萄糖-衍生物、季戊四醇-衍生物、烷基酚类、聚合物和硅氧烷-衍生物或它们的混合物。

4. 根据权利要求1至3任一项的皮肤油，其特征在于，油组分选自烃类、脂肪醇、脂肪酸酯、脂肪醇醚、聚醇脂肪酸酯、三甘油酯、天然脂肪、油或天然液态蜡或硅油或硅蜡或它们的混合物。

5. 根据权利要求1至4任一项的皮肤油，其特征在于，油组分选自液态石蜡、棕榈酸异丙酯、中等链长的三甘油酯、向日葵油、大豆油、桃仁油、杏仁油、霍霍巴油、硅油或前述组分的混合物。

6. 根据权利要求1至5任一项的皮肤油，其特征在于，W/O-乳化剂的含量为1.0-8%。

7. 根据权利要求1至6任一项的皮肤油，其特征在于，W/O-乳化剂具有HLB-值为2-5.9。

8. 根据权利要求7的皮肤油,其特征在於, W/O-乳化剂具有HLB-值为3.5-5.5。

9. 根据权利要求1至8任一项的皮肤油,其特征在於, 作为乳化剂含有鲸蜡基聚二甲基硅氧烷共聚醇或鲸蜡基聚二甲基硅氧烷共聚醇在与聚甘油-4 异硬脂酸酯和月桂酸己酯的混合物中。

10. 根据权利要求1至9任一项的皮肤油,其特征在於, 形成泡囊的脂选自磷脂类如蛋-或大豆-卵磷脂、磷脂酰胆碱、神经酰胺、植物甾醇类、和它们的具有乙氧化度为5-16的乙氧基化衍生物和具有HLB-值为2-6的聚氧乙烯化的脂肪醇或它们的组合物,特别是上述种类的植物甾醇类与所述乙氧化产物的组合物。

11. 根据权利要求1至10任一项的皮肤油,其特征在於, 皮肤油具有活性物质、防腐剂和维生素作为添加剂。

12. 根据权利要求1至11任一项的皮肤油,其特征在於, 皮肤油具有的添加剂选自抗氧化剂、香料、色素、UV-滤光剂。

13. 根据权利要求11或12的皮肤油,其特征在於, 活性物质选自醚油和萜烯、植物提取液、活血物质、消炎的和抗菌的物质或它们的混合物。

14. 根据权利要求1至13任一项的皮肤油,其特征在於, 香料为通常商购的香料-成分, 防腐剂选自对羟基苯甲酸-甲酯或-丙酯或它们的混合物和/或山梨酸, 抗氧化剂选自丁基羟基甲苯、丁基羟基苯甲醚、棕榈酸抗坏血酸酯、生育酚或它们与配合剂的混合物, 维生素选自维生素E、维生素A、维生素C及其衍生物。

15. 根据权利要求1至14任一项的皮肤油,其特征在於,含有油组分为85-97%, W/O-乳化剂为2-6%, 形成泡囊的脂类为0.5-5%和1-15%的添加剂。

16. 根据权利要求1至15任一项的皮肤油,其特征在於,作为增溶剂的乙醇。

17. 根据权利要求1至16任一项的皮肤油的制备方法,其特征在於,在室温下混合油组分并视情况加热至40-90°C,加入乳化剂,此后冷却至室温并随即使之与添加剂混合。

18. 根据权利要求1至16任一项的皮肤油作为皮肤护理油、皮肤保护油、运动油、按摩油或防晒油的应用。

## 制备及应用含有 HLB-值为 2-6 的 W/O-乳化剂的 形成泡囊的皮肤油

本发明涉及含脂皮肤油，其含有一种或多种油溶性组分、一种或多种 HLB-值为 2-6（优选 2-5.9）的 W/O-乳化剂和一种或多种形成泡囊的脂类以及视需要一种或多种选自醚油、抗氧化剂、香料、防腐剂、活性物质、UV-滤光剂、维生素、稠度调节剂、增溶剂的添加剂，其制备和作为皮肤油，特别是作为皮肤护理油、护肤油、运动油、按摩油或防晒油的应用。这种皮肤油可以涂敷在干燥和特别是潮湿的皮肤上，在此其自行乳化并自动形成脂质体。由此其还通过易于被皮肤吸收具有以此为条件的优点（活性物质载体，皮肤屏蔽的建造），而不在皮肤上遗留下扰人的脂肪膜。

皮肤油在众多化妆护理产品中占有稳固的一席之地。其任务是补充皮肤中脂类的不足，软化皮肤并使之柔韧，提高皮肤弹性或通过形成疏水性膜保护皮肤。在按摩中其作为润滑剂使用。

通过特殊活性物质的混合可以配制所谓的皮肤功能性油，例如防晒油、运动油。

此涉及液态、油性配制品，通过由各种脂肪和油、蜡、脂肪酸酯和液态烃或硅油混合配制。

进一步可以混合稳定剂如抗氧化剂、防腐剂或特殊活性物质，如 UV-滤光剂、维生素、醚油或植物提取液。其含有所谓的亲水性油，附加的一种 O/W-乳化剂，并可以用水通过形成 O/W-乳液洗去。

这种常用的皮肤油在 K. Schrader 的专题著作《化妆品基础和配方（Grundlage und Rezepturen der Kosmetika）》第二版（1989, Hüthig Buchverlag）525-528 页中有描述。

在《化妆品和香料手册》，第三版，1973，482-489 页（Dr. A. Hüthig Verlag Heidelberg）中描述有各种皮肤油。作为组分可以例如使用：不

干油、不同稠度的矿物油、肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、香化的油酸异丙酯、异硬脂酸异丙酯、液态十六烷基醇、异硬脂酸十六烷酯、最纯的油醇(HD-Eutanol)、Cetiol LG、Cetiol HE、Myritol 318、Cremogen HP、Miglyol 812、Cetiol B、油酸油酯、油酸癸酯(Cetiol V)、全氢化角鲨烯(Cosbiol)、液态乙酸甘油酯、Amerchol L-101、Acetulan(美国胆固醇)、羊毛脂衍生物(例如液态羊毛脂; Modulan等)、异十六烷基棕榈基硬脂酸酯(Wickenol 1109-H)、鲸蜡基聚丙二醇醚(P. R. O. 鲸蜡醇 30(Cetyl Alcohol 30))、羊毛脂醇聚丙二醇醚(P. R. O. Lanolin Alcohol 30)、十六烷基聚丙二醇醚(P. R. O. 十六烷醇 30)、硅油、丙二醇二壬酸酯(Emery 3771-D)。

作为添加剂,特别是泛指下述“活性物质”

卵磷脂、液态羊毛脂和羊毛脂衍生物,含油的药物提取液(甘菊、山金车花、金丝桃属植物、金盏草),含油的皮肤提取液(和腺体提取液)、樟脑、薄荷醇、樟脑酚酯(Carmpherphenolat)、鱼油精(油溶性)、硬脂酸铝(也作为增稠剂)、液态聚乙二醇单脂肪酸酯、维生素(A、D<sub>3</sub>、E等)、 $\beta$ -胡萝卜素、叶绿素,油溶性的。

特别是公开了一种配自橄榄油、Eutanol G、Neoba O、卵磷脂油、Purcellin油、香料、色素、防腐剂的擦脸油。此外描述了不同的按摩油、体油和运动油,其主要含有石蜡油(参见487-488页)。

进一步描述了可洗去的皮肤油,其具有上述的O/W-乳化剂。

在Schrader, K. H.,《化妆品基础和配方》1989, 525-528页描述了作为油组分可以具有Cetiol V以及活性物质和卵磷脂的皮肤油。

DE 31 41 761描述了葡萄糖衍生物例如在油中的应用,其中葡萄糖衍生物作为表面活性物质使用。

在SÖFW, 115(1989), 344-350页公开了用于制备无水产品的一般性基础理论并还描述了皮肤油。其特点是作为含脂、无水的液态制剂并可以附加地具有HLB-值大于8的O/W-乳化剂。作为油组分其中描述了普通的石蜡或例如辛基十二烷醇、Myritol 318、Cetiol、Miglyol和进一步视需要的液态羊毛脂、苯基甲基硅。这种皮肤油应该是特别防水的(参

见 345 页, Pt. 2. 1. 1. 2. 6)。

在 SÖFW, 98 (1972), 889-891 页公开了亲水性油, 其除了通常的油组分之外还具有非离子源的乳化剂如 HLB-值为 8-11 的聚氧乙烯化的月桂酸酯/油酸酯和相应的脱水山梨醇衍生物。这种聚氧乙烯化的产品是已知的 O/W-乳化剂并应该构成 O/W-乳液。对此也算上具有总-HLB-值为 8 至 11 的乳化剂组合, 例如 Arlacone<sup>®</sup> T (HLB=9.2), Tween<sup>®</sup> 85 (HLB=11.0) 和 Span<sup>®</sup> 85 (HLB=1.8) 的组合。

在 EP-A 0 467 218 中描述了脂质组合物, 其至少具有 2 种下述的组份: 不饱和脂肪酸和/或其生育酯 (Tocopherylester)、正烷烃、角鲨烯、胆固醇和/或羊毛脂醇、三甘油酯、蜡酯。特别是来源于不饱和脂肪酸/胆固醇/羊毛脂醇的组合物。这种组合应该是作为那种或在含水的基础上加工的在皮肤上可使用的。

EP Nr. 0 523 418、EP 0 557 825、DE 198 54 827 描述了含有脂质体的护理配剂和清洁配剂。其中原则上涉及的是水凝胶、O/W-乳剂或洗涤产品。因此 EP-B 0 557 825 描述了来源于油组份、形成泡囊的脂和 HLB-值为 6-13 的 O/W-表面活性剂的含油盆浴添加剂和淋浴添加剂。这种配剂是清洁产品。EP-B 0 523 418 涉及具有油相和水相的含有脂质体的乳膏, 其使用 HLB-值为 9-13 的某种聚氧乙烯化的表面活性物质作为乳化剂。然而这些却不能达到皮肤油的护理作用。此外在皮肤护理产品中通常只有通过耗费的方法才能制造泡囊, 并加工成所期望的配制。特别是乳剂会出现稳定的问题。

DE 198 54 827 涉及含有表面活性剂的清洁剂, 其无油并具有固醇类作为脂质体形成剂。

本发明的任务因此在于, 提供含油的产品, 其也可以涂敷在潮湿的皮肤上, 产生自行乳化作用并同时形成脂质体, 以使得也达到如同涂敷乳膏的护理效果, 而不需要事先擦干皮肤, 也不会如皮肤油那样留有剩余的脂肪膜, 脂肪膜只有在很长的时间以后或视情况只有通过处理或清洗才能去除。

这项任务根据本发明是一种皮肤油组合成分解决的, 其含有一种或

多种油溶性组份和一种或多种 HLB-值为 2-6, 特别是 2-5.9 的 W/O-乳化剂和一种或多种形成泡囊的脂以及视需要一种或多种添加剂, 该添加剂选自活性物质、抗氧化剂、香料、防腐剂、UV-滤光剂、维生素、色素、增溶剂、稠度调节剂, 除了含有胆固醇和/或羊毛脂醇的组合成分之外。

所述油组份与所描述的 W/O-乳化剂和泡囊形成剂的组合显示, 在涂敷中, 特别是在潮湿的皮肤上, 该油自行乳化, 并因此即可易于施用又无扰人的脂肪膜。令人惊异的是, 因为在此没有用于制备乳剂的常用装置, 特别是搅拌器和高效均化器。另外令人惊异地形成脂质体。这是无法预料到的, 因为在此总共只存在微量的水(大约为 1:1 与油的比例), 而在类似的应用中, 相比于油浴在淋浴或盆浴有更大量的水(约为 10 倍或 100 倍至 1000 倍的)存在, 而泡囊的形成通常需要这样更大量的水。

本发明皮肤油组合成分总共为 50-99%的油溶性组份、0.5-10%的 W/O-乳化剂、0.01-10%的形成泡囊的脂和 0-40%的添加剂, 特别是 0.1-40%, 优选 0.5-20%并完全特别优选为 1-15%。

根据本发明乳化剂可以具有如提及的含量 0.5-10%, 特别是 1.0-8%和特别优选 2-5%, 泡囊形成剂的含量特别为 0.01-10%, 优选 0.5-5%和特别优选 1-3%。

油组份在此的量为 50-99%, 特别是 70-97%和特别优选 85-97%。

在特别优选的配制中, 组合成分可以使用一种或多种具有 HLB-值特别为 3-5.5 且完全特别为 3.5-5.5 的 W/O-乳化剂(单独或相互的混合物中)。

相应于上述给出的量。

在另一个优选的实施例中油组份的量为 85-97%、乳化剂的量为 1-10%(特别是 2-6%且完全特别为 1-5%)、泡囊形成剂的量为 0.5-5%和添加剂的量为 1-20%, 特别是 1-15%。

特别优选的乳化剂如下, 其 HLB-值分别在括号中列出:

#### **脱水山梨醇-衍生物**

脱水山梨醇酯如脱水山梨醇油酸酯(Span<sup>®</sup> 80, HLB=4.5)、脱水山梨醇硬脂酸酯(HLB=5.0)、脱水山梨醇倍半油酸酯(Crill<sup>®</sup> 43, HLB=3.7)、



脱水山梨醇异硬脂酸酯 (Crill<sup>®</sup> 6, HLB=4.7)、脱水山梨醇三硬脂酸酯 (Crill<sup>®</sup> 35, HLB=2.1);

### 聚乙氧基化产品

聚乙氧基化脂肪酸和聚乙氧基化醇类如 PEG-2 油酸酯 (HLB=5.0)、PEG-4-二硬脂酸酯 (HLB=3.0)、PEG-2 硬脂酸酯 (HLB=4.4)、Ceteareth-3 (Volpo<sup>®</sup> CS3, HLB=5.0)、Ceteth-2 (Volpo<sup>®</sup> C2, HLB=5.3);

乙氧基化三甘油酯如 PEG-5 蓖麻油 (HLB=3.9)、PEG-6 二蓖麻醇酸酯 (HLB=5.0)、PEG-7 氢化的蓖麻油 (Cremophor<sup>®</sup> W0 7, HLB=5.0);

### (聚)甘油基衍生物

聚甘油酯如聚甘油-3 二异硬脂酸酯 (Lameform<sup>®</sup> TGI, HLB=3.5), 聚甘油基-2-二聚羟基硬脂酸酯 (Dehymuls<sup>®</sup> PGPH, HLB=3.5), 二异硬脂酰基聚甘油-3 二异硬脂酸酯 (Isolan<sup>®</sup> PDI, HLB 约为 5), 聚甘油-3 油酸酯 (Isolan<sup>®</sup> GO 33, HLB 约为 5), 聚甘油-3 二油酸酯 (Cremophor<sup>®</sup> GO 32, HLB 约为 5), 聚甘油-4 异硬脂酸酯 (Isolan<sup>®</sup> GI 34, HLB 约为 5);

甘油酯如蓖麻醇酸甘油酯 (Cithrol<sup>®</sup> GMR N/E, HLB=2.7), 月桂酸甘油酯 (Cithrol<sup>®</sup> GML N/E, HLB=4.9), 二油酸甘油酯 S/E (Cithrol<sup>®</sup> GDO S/E, HLB=2.9);

### 多元醇酯

多元醇-酯如乙二醇油酸酯 S/E (Cithrol<sup>®</sup> EGMO S/E, HLB=2.7)、乙二醇蓖麻醇酸酯 (Cithrol<sup>®</sup> EGMR S/E, HLB=2.0)、乙二醇二月桂酸酯 S/E (Cithrol<sup>®</sup> EGD L S/E, HLB=2.0)、丙烯基乙二醇蓖麻醇酸酯 (Cithrol<sup>®</sup> PGMR S/E, HLB=3.6)、丙烯基乙二醇月桂酸酯 (Cithrol<sup>®</sup> PGML N/E, HLB=2.7);

### 葡萄糖-衍生物

葡萄糖酯如甲基葡萄糖二油酸酯 (Isolan<sup>®</sup> DO, HLB 约为 5)、甲基葡萄糖异硬脂酸酯 (Isolan<sup>®</sup> IS, HLB 约为 5);

### 季戊四醇-衍生物

季戊四醇-脂肪酸酯, 如季戊四醇基单月桂酸酯 (HLB=4.8)、季戊四醇基单树脂酸酯 (HLB=4.0) 或混合酯, 例如具有柠檬酸脂肪醇酯的如

Dehymuls<sup>®</sup> E (二可可基季戊四醇基二硬脂酸基柠檬酸酯、脱水山梨糖倍半油酸酯、Cera Alba、硬脂酸铝, HLB=4.0), Dehymuls<sup>®</sup> F (二可可基季戊四醇基二硬脂酸基柠檬酸酯、Cera Microcristallina、油酸甘油酯、硬脂酸铝、丙烯基乙二醇, HLB=4.0);

### 烷基酚类

烷基酚类, 例如 Nonoxynol-2 (HLB 约为 4.5);

### 聚合物

聚合物如聚氧丙烯-聚氧乙烯-嵌段共聚物 (INCI-命名: Poloxamer 类), 例如 Pluronic<sup>®</sup> PE 3100 (HLB=4.5)、Pluronic<sup>®</sup> PE 6100 (HLB=3.0) 或 PEG-30 二聚羟基硬脂酸酯 (Arlacel<sup>®</sup> P 135, HLB 约为 5.5);

### 硅氧烷-衍生物

聚硅氧烷-共聚物, 特别是此类中如下所列举的。

优选乙氧化产物如脂肪酸和三甘油酯如 PEG-2 油酸酯、PEG-7 氯化蓖麻油 (Cremophor<sup>®</sup> WO 7)、(聚)甘油酯以及葡萄糖-酯, 和聚硅氧烷-共聚物或它们的混合物。

特别优选的聚硅氧烷-共聚物如聚硅氧烷-多醚-共聚物, 特别是聚硅氧烷-聚烷基-多醚-共聚物如鲸蜡基聚二甲基硅氧烷共聚醇 (Abil<sup>®</sup> EM 90, HLB 约为 5)、月桂基甲基硅氧烷共聚醇 (Laurylmethicone Copoyol) (Dow Corning<sup>®</sup> Q 2-5200, HLB 约为 4)

进一步特别优选的还有含有硅氧烷-衍生物的乳化剂混合物如通常商购的 Abil<sup>®</sup> WE 09 (HLB 约为 5), 由鲸蜡基聚二甲基硅氧烷共聚醇、聚甘油-4 异硬脂酸酯和月桂酸己酯组成。

可替换的还可以是来源于所举类别的单独的乳化剂或来源于各种类别的组分的乳化剂, 其中优选聚硅氧烷共聚物和聚甘油酯。

常用的, 优选为液态的脂类作为油组份是适宜的, 其可以单独或以混合物存在。特别是如下的类别和实例适用于此:

### 烃类

烃类如角鲨烯、角鲨烷, 特别还有液态石蜡、异石蜡、二辛基环己烷 (Cetiol<sup>®</sup> S), 异十六烷 (Arlamol<sup>®</sup> HD);

脂肪醇如油醇、辛基十二醇 (Eutanol® G);

脂肪酸酯, 如异丙基脂肪酸酯 (棕榈酸酯、肉豆蔻酸酯、异硬脂酸酯、油酸酯), 油酸癸酯 (Cetiol® V)、月桂酸己酯、C12-15 烷基苯甲酸酯 (Finsolv® TN)、碳酸二辛酯 (Cetiol® CC)、二酯如己二酸二丁酯 (Cetiol® B)、丙二醇二壬酸酯、分支的脂肪酸酯如 PCL-liquid® (Cetearyl 辛酸酯) 或混合物如 Cetiol® PGL (己基癸醇和己基癸基月桂酸酯)

脂肪醇醚如二辛酰醚 (Cetiol® OE)

多元醇脂肪酸酯如 Cetiol® HE (PEG-7 甘油基 Cocoate)

三甘油酯, 特别是中等链长的 (中性油类) 如羊脂酸/羊蜡酸的甘油三酸酯 (Miglyol® 810, 812) 以及其多元醇酯如丙烯基乙二醇二辛酸酯/二癸酸酯 (Miglyol® 840)

天然脂肪和油类如向日葵油、大豆油、桃仁油、杏仁油、葡萄核油、蓖麻油、花生油、杏仁油、貂脂、麦芽油、鳄梨油。

天然液态蜡, 例如霍霍巴油、或其替代物芥子酸油酯 (Cetiol® J 600)

硅油和硅蜡, 例如聚二甲基硅氧烷如 Dow Corning Fluid® 200 (聚二甲基硅氧烷)、环甲基硅氧烷如 Dow Corning Fluid® 345 (环甲基硅氧烷)、苯基甲基聚硅氧烷如苯基聚二甲基硅氧烷 (Abil® AV 8853) 或烷基-聚甲基硅氧烷-共聚物如鲸蜡基聚二甲基硅氧烷 (Abil® Wax 9801)、硬脂基聚二甲基硅氧烷 (Abil® Wax 9800)、二烷氧基二甲基聚硅氧烷如硬脂氧基聚二甲基硅氧烷 (Abil® Wax 2434)、山嵛氧基聚二甲基聚硅氧烷 (Abil® Wax 2440)。

特别优选的油-组分是液态石蜡、脂肪酸酯如棕榈酸异丙酯或肉豆蔻酸异丙酯、中等链长的三甘油酯如前述的 Miglyol 类, 以及所列举的天然脂肪和油, 特别是向日葵油、大豆油、桃仁油、杏仁油, 特别是其混合物, 以及霍霍巴油, 其与前述组分的混合物, 其中基于总量各组分分别约为 1-40%, 或脂肪醇醚或脂肪醇类或它们的混合物或氢化的油类如单独或组合的全氢角鲨烯。

特别优选的是所列举的液态石蜡和所列举的三甘油酯, 也以彼此组

合物的形式。

另外还有上述的二辛基环己烷、异十六烷（特别是后者）、硅油和硅蜡是特别适宜的，首先还有它们的组合物和与前述石蜡、三甘油酯的组合物。然后其还可以与天然脂肪、油类和蜡组合。

作为形成泡囊的脂类，对此特别适宜的是已知的物质（对比 DE 42 05 548 C 2），特别是磷脂类如卵磷脂（蛋-或大豆-卵磷脂），例如 Phosal<sup>®</sup> 50 SA（约为 50%大豆-卵磷脂）、磷脂酰胆碱、磷脂酰丝氨酸或磷脂酰二乙醇胺及其混合物。

用于制备泡囊的其它适宜的组分是鞘脂类（例如神经酰胺、脑苷脂、鞘氨醇、鞘磷脂）、植物甾醇类（基本上是 $\beta$ -谷甾醇、菜油甾醇和柱头甾醇的混合物）以及其衍生物，特别是乙氧基化物如 Generol<sup>®</sup> 122 E 5（PEG-5 大豆甾醇）、Gererol<sup>®</sup> R E5（PEG-5 油菜籽甾醇）。

另外适宜的是聚乙氧基化的脂肪醇以及具有优选为 1-4 环氧乙烷的具有 HLB-值为 2-6 的脂肪酸，其中亲脂性残基优选由 C<sub>16</sub>-C<sub>18</sub>-烷基链组成，聚甘油烷醚、葡糖基二烷醚、蔗糖二醚、胶原水解物酯、季胺化合物和聚氧丙烯-聚氧乙烯-嵌段共聚物。

特别优选的泡囊形成剂是磷脂如蛋-和/或大豆-卵磷脂，（Phosal<sup>®</sup> 50SA），磷脂酰胆碱、神经酰胺、植物甾醇类和它们的具有乙氧化度为 5-16 的乙氧化衍生物和具有 HLB-值为 2-6 的聚氧乙烯化的脂肪醇或它们的组合物，特别是上述种类的植物甾醇类与上述乙氧化产物的组合物。

根据本发明优选，当油-组合成分除了主要成分油/乳化剂/泡囊形成剂之外具有活性物质（其也包括醚油和植物提取液）、防腐剂和维生素作为添加剂。

作为维生素特别适宜的是维生素 A、E、C 及其衍生物，例如视黄醇、乙酸视黄醇酯或棕榈酸视黄醇酯、类胡萝卜素、生育酚或生育酚乙酸酯、棕榈酸抗坏血酸酯。

活性物质优选选自醚油和萜烯，例如迷迭香油、橙油、熏衣草油、酸橙油、肉桂油、天竺葵油、雪松油、红木油、颠草油、依兰油、桉树油、薄荷油、柠檬香草油、柏木油、绿花白千层油、冷杉针油、松针油、

樟脑、薄荷醇。

另外在此还可以使用不饱和必需脂肪酸及其酯，例如亚油酸或亚麻酸、甘油亚油酸酯、甘油亚麻酸酯。

可替换或附加于上述活性物质的还可使用活血物质，例如烟酸衍生物如烟酸甲酯、生育酚烟酸酯； $\alpha$ -和 $\beta$ -醇酸及其衍生物，例如水杨酸，异丙基苄基水杨酸酯，C12-13 烷基乳酸酯 (Cosmacol<sup>®</sup> ELI) 或还可使用消炎的和抗菌的物质如甘草酸或甘草亭酸及其衍生物，例如甘草亭酸十八酯；泛酸衍生物，例如泛酸三乙酸酯、尿囊素、红没药醇、甘菊环（例如母菊萹或愈创木萹）、Triclosan；双氯苯双胍己烷衍生物和/或抗皮屑剂，例如 Climbazol 或 Piroctone Olamine。

此外可以在本发明的皮肤油中还使用排斥剂如 N, N-二乙基-间-甲苯酰胺或邻苯二甲酸二甲酯；或抗氧化的以及起保护细胞作用的物质如类黄酮，例如芸香苷、阿魏酸和其酯或辅酶 Q 10，作为有效的添加剂。

除此之外还可使用植物提取液，其本身也可以是活性物质，例如芦荟提取液、菩提花提取液、积雪草提取液、常春藤提取液，可作为有效的活性物质应用。

所述组分也可以组合，分别根据所希望的应用目的。所以特别是优选有香料治疗作用的醚油如迷迭香油、酸橙油和/或柠檬香草油或诃草油、熏衣草油和/或依兰油或活血物质如迷迭香油和烟酸甲酯。

特别优选的活性物质选自醚油和萜烯、植物提取液、活血物质、消炎和抗菌物质、维生素、不饱和的必需脂肪酸或它们的混合物。

作为其它的特别适宜的选自活性物质的添加剂，其还可以是醚油（如上所列举的）并也可以同时是香料，特别适宜的是薄荷油、酸橙油、橙油、杜松子油、诃草油、桉树油、百里香油、玫瑰草油、迷迭香油、熏衣草油、薄荷醇提取液、生姜提取液、菩提花提取液、金盏花提取液、海藻提取液、芦荟提取液、海胆亚目的提取液、常春藤提取液、水杨酸羟乙酯、水杨酸甲酯、烟酸酯或它们的组合，如橙油、熏衣草油、玫瑰草油和诃草油或杜松子油、水杨酸羟乙酯和水杨酸甲酯。在此可以分别依据所意图的活性作用，如改善皮肤结构、提高血流、放松、香料按摩

治疗，诸如此类，添加适宜的活性物质的组合。视需要可以加入其它的回收脂肪（Rueckfetter）如脂肪酸甘油酯及其乙氧化物，如 PEG-6 羊脂酸/羊蜡酸甘油酯（Softigen<sup>®</sup> 767）。

此外优选的是，当皮肤油组合成分附加地或可替换地对于上述三种添加方案，作为添加剂含有的选自抗氧化剂、香料、色素和/或 UV-滤光剂。

抗氧化剂可以优选选自丁基羟基甲苯、丁基羟基苯甲醚、棕榈酸抗坏血酸酯、生育酚、可能的话与配合剂组合，配合剂如 Controx<sup>®</sup> VP（生育酚、卵磷脂、棕榈酸抗坏血酸酯、氢化棕榈甘油柠檬酸酯（Hydrogenated Palm Glycerides Citrate））、五倍子酸烷酯如五倍子酸辛酯、-十二烷酯、和-鲸蜡酯或它们的组合。特别优选的香料是除上述在“活性物质”中列举的醚油还有通常商购的香料-组分。

优选的色素是例如专利蓝、酰胺蓝、橙色 RGL、胭脂红、喹啉黄，特别是与适宜的增溶剂结合。增溶剂可特别地选自乙醇和异丙醇，例如用量 5-30%，优选 5-15%。

特别优选的色素是类胡萝卜素例如  $\alpha$ -或  $\beta$ -胡萝卜素或甘菊环如母菊萹或愈创木萹。

适宜的 UV-滤光剂是如下类型的油溶性 UVB、UVA 和广谱滤光剂：

UV-B 滤光剂：肉桂酸酯，例如甲氧基肉桂酸辛酯（Eusolex<sup>®</sup> 2292, Neo Heliopan<sup>®</sup> AV, Parsol<sup>®</sup> MCX），对-甲氧基肉桂酸异戊酯（Neo Heliopan<sup>®</sup> Galanga）以及 4-甲基亚苄基樟脑（Eusolex<sup>®</sup> 6300），对氨基苯甲酸和对氨基苯甲酸酯如 N,N-二甲基-4-氨基苯甲酸-2-乙基己酯（Eusolex<sup>®</sup> 6007, 辛基二甲基 PABA），水杨酸高薄荷酯（Homomenthylsacilylat）（Homosalate, Eusolex<sup>®</sup> HMS），水杨酸辛酯（Neo Heliopan<sup>®</sup> OS），氰双苯丙烯酸辛酯（Neo Heliopan<sup>®</sup> 303），丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷（Eusolex<sup>®</sup> 9020）；UVA+UVB 滤光剂用于广谱吸收如苯甲酮-3（Neo<sup>®</sup> Heliopan BB, Eusolex<sup>®</sup> 4360）；

UV-A 滤光剂如邻氨基苯甲酸甲酯（Neo Heliopan<sup>®</sup> MA）

特别优选的是对-甲氧基肉桂酸辛酯或对-甲氧基肉桂酸异戊酯，氰

双苯丙烯酸辛酯, 4-甲基亚苄基樟脑, Homosalate 和/或邻氨基苯甲酸甲酯和/或苯甲酮-3。

作为防腐剂可以考虑碘代丙炔基丁基氨基甲酸酯、苯氧基乙醇、和其它常用的防腐剂, 如山梨糖-和脱氢乙酸及其盐、甲基二溴谷氨脒 (Methyldibromoglutanonitril) 等或它们的组合, 或其它酸如苯甲酸或水杨酸, 或苄基醇或酯如对-羟基-苯甲酸酯, 例如对羟基苯甲酸-甲酯、-乙酯、-丙酯、-异丁酯, 优选对羟基苯甲酸-甲酯或-丙酯或它们的混合物或 Climbazol 或所述物质的适宜的组合, 如对羟基苯甲酸-甲酯、-丙酯和山梨酸。

根据本发明含乳化剂的皮肤油组合成分首先特别地具有自行乳化的作用, 特别是涂敷在潮湿的皮肤上结合较大的湿度, 在皮肤上较佳的涂抹而无令人不适的脂肪膜的感觉, 这特别是由本发明的油组分和 W/O-乳化剂组合的结果。

优选的油/乳化剂的组合包括:

石蜡油 (20-40%) 和/或 Miglyol<sup>®</sup> 812 (20-30%) 和/或棕榈酸异丙酯 (15-25%); 或在此还附加加入霍霍巴油 (1-5%) 和/或桃仁油 (3-5%) 和作为乳化剂的 Abil<sup>®</sup> EM 90 和/或 Abil<sup>®</sup> WE 09。在此可以使用上述泡囊形成剂, 特别是 Phosal<sup>®</sup> 50SA 以及添加剂特别是所述的组合, 且完全特别优选的醚油、香料油和/或活血物质以及植物提取液和 UV-滤光剂。

如果本发明的油应当具有稀液的浓度, 也可以加入 5-30%, 优选 5-15% 的乙醇或异丙醇作为浓度调节剂, 特别是乙醇。这也可以作为其它物质的增溶剂使用。

相反可以作为浓度调节剂的还可以加入增稠剂和/或用于改善皮肤感觉或提高防水性的物质, 如具有分子量为 1500-20000 的聚乙烯-蜡如 Lunacera<sup>®</sup> PA 膏、Aerosil<sup>®</sup>、改性的高岭石如 Miglyol<sup>®</sup> Gel B (羊脂酸/羊蜡酸三甘油酯、Stearalkonium 锂蒙脱石、碳酸异丙烯酯)、铝皂及其改性物例如铝/镁氢氧化物硬脂酸盐、烷基化聚乙烯吡咯酮如 Antaron<sup>®</sup> V-216 (PVP/十六烯共聚物) 和 Antaron<sup>®</sup> V-220 (PVP/二十烯共聚物)。

当有某种用意目的时, 例如皮肤护理油、运动油或防晒油或按摩油,

则相应地选取添加剂，如用于皮肤护理油的维生素、植物油和/或植物提取液，用于运动油的活血物质如烟酸甲酯和/或水杨酸羟基乙酯和/或醚油，例如迷迭油，用于防晒油的UV-A-滤光剂、UV-B-滤光剂和广谱滤光剂以及维生素如维生素E、维生素C。用于按摩油的香料治疗的和/或起活血作用的醚油如橙油、熏衣草油、玫瑰草油、酸橙油、柠檬香草油和/或维生素A、维生素E。

其中可以以给出的量附加地存在有防腐剂、抗氧化剂和/或香料。

本发明将依据下列的实施例1-5进一步说明。其中图1-3展示在冰冻蚀刻后的透射电镜下，用水以1:1的比例稀释的实施例1的组合成分在33°C下涂敷后自动产生的脂质体。

本发明的组合成分是如此制备的，室温下在适宜的容器中将液态油（如果存在）均质搅拌，视情况加热到40-90°C以融化可能存在的固体蜡或油脂。之后加入乳化剂进行加工。

在冷却至室温后，特别是25°C，加入所有的添加剂并均质搅拌。

视情况还可以将固态组分事先以适宜的方式加热，并随后在适宜的温度（25-50°C，特别是25-40°C）下加入到非固态组分中。

#### 实施例1 皮肤油

原料	100%配方
Miglyol 812	36.80
桃仁油	3.00
霍霍巴油	1.00
生育酚乙酸酯	1.10
稠的石蜡油	28.40
棕榈酸异丙酯	25.00
Abil <sup>®</sup> EM 90: 鲸蜡基聚二甲基硅氧烷共聚醇	2.00
Phosal <sup>®</sup> 50 SA: 50%卵磷脂	2.00
香料	0.70
总合	100.00

注释:

Abil<sup>®</sup> EM 90: 聚硅氧烷-聚烷基-聚醚-共聚物



### 实施例2 皮肤油

原料	100%配方
Miglyol 812	36.12
桃仁油	4.00
生育酚乙酸酯	1.10
稠的石蜡油	28.40
棕榈酸异丙酯	25.00
Abil <sup>®</sup> EM 90	2.00
Phosal <sup>®</sup> 50 SA: 50%卵磷脂	2.00
颠草油	0.08
雪松油	0.20
红木油	0.10
香料	1.00
总合	100.00

### 实施例3 油性防晒喷剂

原料	100%配方
稀的石蜡油	50.50
Finsolv <sup>®</sup> TN: C12-C15-烷基苯甲酸酯	10.00
Cetiol <sup>®</sup> OE: 二辛酰醚	10.00
Miglyol 812	20.00
Abil <sup>®</sup> EM 90	2.00
Phosal 50 SA: 50%卵磷脂	2.00
UV-滤光剂: Neo Heliopan AV: 甲氧基肉桂酸辛酯	5.00
香料	0.50
总合	100.00

### 实施例4 皮肤油

原料	100%配方
Miglyol 812	37.00
桃仁油	3.00
霍霍巴油	1.00
生育酚乙酸酯	1.10
稠的石蜡油	28.40
棕榈酸异丙酯	25.00
Dehymuls <sup>®</sup> PGPH: 聚甘油-2-二聚羟基硬脂酸酯	2.00
Phosal <sup>®</sup> 50 SA: 50%卵磷脂	2.00
香料	0.50
总合	100.00

### 实施例5 皮肤油

原料	100%配方
Miglyol 812	37.00
桃仁油	3.00
生育酚乙酸酯	1.10
稠的石蜡油	28.40
棕榈酸异丙酯	26.00
Isolan <sup>®</sup> PDI: 二异硬脂醇聚甘油-3 二异硬脂酸酯	2.00
Phosal <sup>®</sup> 50SA: 50%卵磷脂	2.00
香料	0.50
总合	100.00

003469 MERZ N20000 <-->.350μ  
皮肤油 17/1 US0-0000 I21E-11

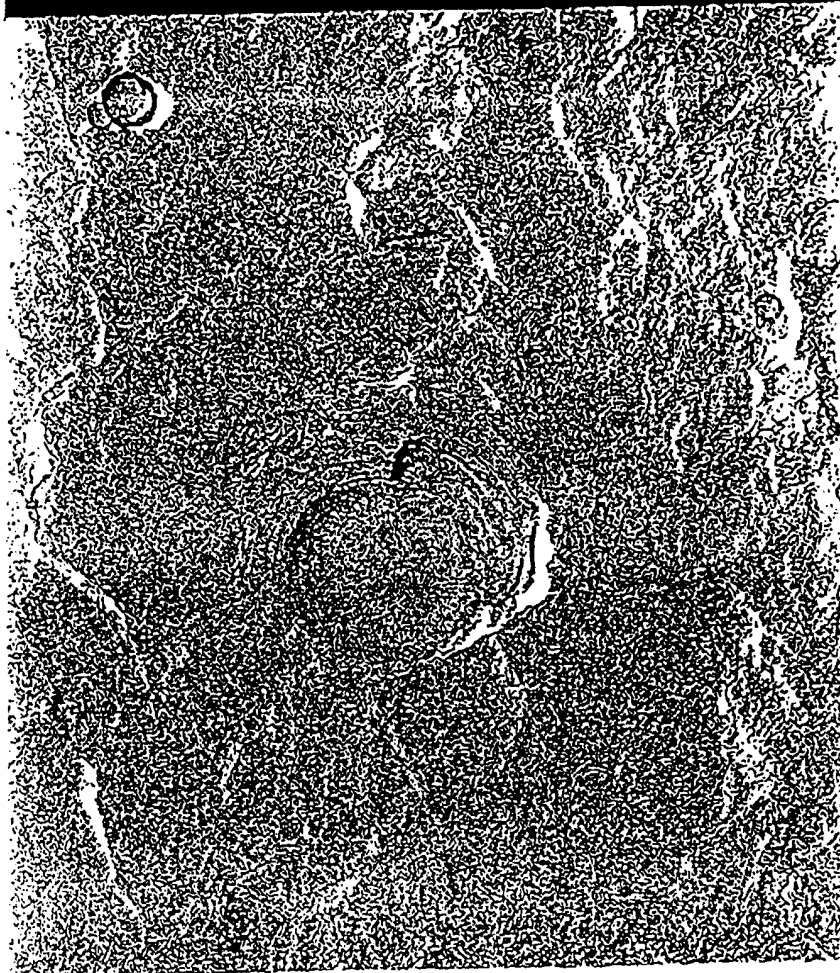


图1

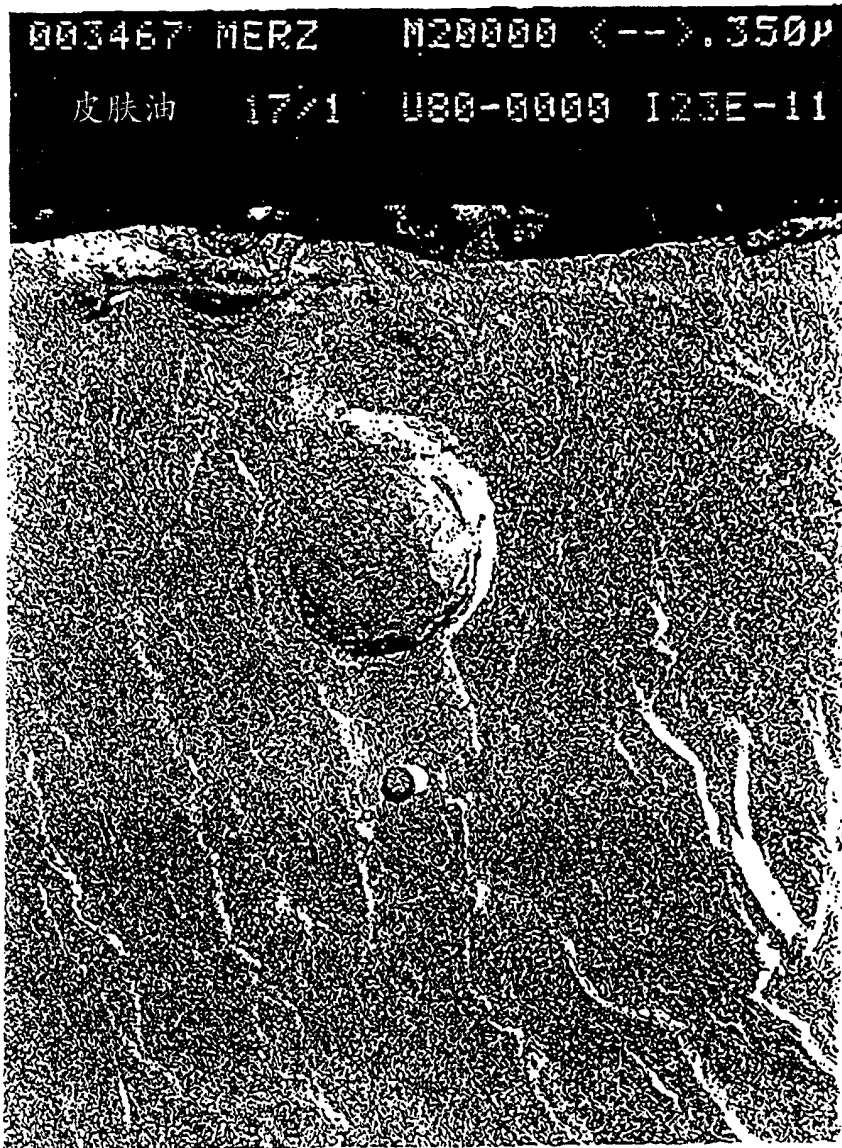


图2



图3