

[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

A61K 7/06

A61K 7/48

[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 98812191.3

[43] 公开日 2001 年 1 月 31 日

[11] 公开号 CN 1282237A

[22] 申请日 1998.11.6 [21] 申请号 98812191.3

[30] 优先权

[32] 1997.11.10 [33] US [31] 08/966,834

[86] 国际申请 PCT/IB98/01771 1998.11.6

[87] 国际公布 WO99/24003 英 1999.5.20

[85] 进入国家阶段日期 2000.6.14

[71] 申请人 宝洁公司

地址 美国俄亥俄

[72] 发明人 P·J·德兹维基

J·A·利斯特罗

[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 李 瑛

权利要求书 2 页 说明书 19 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 含液态多元醇脂肪酸多酯与液态油混合物的组合物

[57] 摘要

本发明公开了一种适合局部施用于人体头发或皮肤的组合物,该组合物包括:(a)约0.1% - 99.9% (重量)的液态多元醇脂肪酸多酯,该液态多元醇脂肪酸多酯的熔点约-30℃ - 约30℃,并且含有一个多元醇结构部分和至少一个脂肪酸结构部分,所述多元醇结构部分包含至少4个游离羟基,其中至少60%的游离羟基被约含8 - 22个C原子的一个或多个脂肪酸结构部分所酯化;(b)约0.1% - 99.9% (重量)的液态油,该液态油熔点从约-30℃到低于约30℃,基本上不含液态多元醇脂肪酸多酯,异十六烷,棕榈酸异丙酯,或C₁₃ - C₁₄的异链烷烃,聚丙烯酰胺和月桂基醚-7的混合物。优选该组合物还含有用于液态多元醇脂肪酸多酯和液态油混合物的局部载体。该组合物可提供有效的润肤和美观效果。

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

知识产权出版社出版



权 利 要 求 书

1. 一种包含下列组分的组合物:

(a) 以重量百分比计, 含量为 0.1%~99.9%、熔点为 -30°C ~ 30°C 的液态多元醇脂肪酸多酯, 所述液态多元醇脂肪酸多酯含有一个多元醇结构部分和至少一个脂肪酸结构部分, 所述多元醇结构部分至少含有 4 个游离羟基, 这些游离羟基中至少有 60%被含 8~22 个 C 原子的一个或多个脂肪酸结构部分所酯化; 和

(b) 以重量百分比计, 含量为 0.1%~99.9%、熔点为从 -30°C 到低于 30°C 的液态油, 所述液态油基本上不含液态多元醇脂肪酸多酯、异十六烷、棕榈酸异丙酯、 C_{13} ~ C_{14} 的异链烷烃和聚丙烯酰胺及月桂基醚-7 的混合物, 或它们的组合。

2. 一种包含下列组分的局部组合物:

(a) 以重量百分比计, 含量为 0.1%~99.9%、熔点为 -30°C ~ 30°C 的液态多元醇脂肪酸多酯, 所述液态多元醇脂肪酸多酯含有一个多元醇结构部分和至少一个脂肪酸结构部分, 所述多元醇结构部分至少含有四个游离羟基, 这些游离羟基中至少有 60%被含 8~22 个 C 原子的一个或多个脂肪酸结构部分所酯化;

(b) 以重量百分比计, 含量为 0.1%~99.9%、熔点为从 -30°C 到低于 30°C 的液态油, 所述液态油基本上不含液态多元醇脂肪酸多酯、异十六烷、棕榈酸异丙酯、 C_{13} ~ C_{14} 异链烷烃和聚丙烯酰胺及月桂基醚-7 的混合物, 或它们的组合; 和

(c) 以重量百分比计, 含量为 0.1%~99.9%的局部载体。

3. 如权利要求 1 或 2 所述的组合物, 其中所述的脂肪酸结构部分含 8~18 个 C 原子。

4. 上述权利要求中任一项所述的组合物, 其中所述的多元醇结构部分选自赤藓醇、木糖醇、山梨醇、葡萄糖、蔗糖及其混合物。

5. 如上述权利要求中的任一项所述的组合物, 其中所述的多元醇结构部分是蔗糖。



6. 如上述任一项权利要求所述的组合物, 其中所述的液态油选自矿物油、含 5~16 个 C 原子的烃、含 3~22 个 C 原子的脂肪醇酯、含 3~30 个 C 原子的脂肪酸酯、植物油及其混合物。

7. 如权利要求 2~6 之一所述的组合物, 其中所述的局部载体为水包油型乳液。

8. 如权利要求 2~6 之一所述的组合物, 其中所述的局部载体为非水液体溶剂。

9. 如权利要求 2~8 之一所述的组合物, 其中所述的组合物的形式为下述形式的其中一种或几种的混合: 润手液、体用润肤液、皮肤调理膏、护肤剂、防晒剂、冷霜、抗痤疮组合物、皮肤更新产品、无泡清洁液、润湿剂、面部保湿剂、化妆品、粉底、口红、护唇剂、洗手液、洁面剂、洁身剂、洗浴产品、香波。

10. 一种处理人体头发或皮肤的方法, 该方法包括:

将安全、有效量的上述任一权利要求所述的组合物局部施用于人体需要处理的部位。

含液态多元醇脂肪酸多酯与
液态油混合物的组合物

技术领域

本发明涉及适合局部施用于人体头发或皮肤的组合物，该组合物包括熔点从约 -30°C 到约 30°C 的液态多元醇脂肪酸多酯与熔点从约 -30°C 到低于约 30°C 的选定的液态油的选定的混合物。

发明背景

含润肤剂的局部组合物用于人体头发或皮肤的处理已经有多年历史了。例如，象凡士林那样的堵塞性烃类一直用作局部润肤剂，在人体皮肤表面形成一层保护膜，防止水分蒸发到环境中。凡士林还可以用于诸如调理剂和修饰助剂之类的护发品中。

然而，最有效的且广泛使用的含堵塞性润肤剂的组合物却存在象油腻、发粘这样一些影响美观的负面特性。而且，一些用于在皮肤上形成保护膜的堵塞性润肤剂会阻塞皮肤毛孔和妨碍氧气的流动。皮肤表面的这层障碍以及空气、水分通路或循环受阻限制了上述粘稠的、堵塞性润肤材料的使用。此外，1994年3月2日公开的欧洲专利 EP 458,600B1 公开了一种堵塞性护肤组合物，其中包括一种至少含有4个游离羟基的多元醇脂肪酸多酯，这些羟基至少有60%被含8-22个C原子的一种或多种脂肪酸所酯化。所述组合物在局部施用于皮肤后能够在表面形成一层堵塞性膜。1992年11月3号颁发给 Macaulay 等人的美国专利 5,160,738 进一步公开了一种堵塞性组合物，其中含有两种或更多种多元醇脂肪酸多酯的混合物，该组合物的外观和物理性质与凡士林相同。然而，这些组合物也都具有粘性大、堵塞毛孔、妨碍氧气流动的优点。因此，需要一种能提供润肤和可接受的美观特性的材料，它不发粘，也不会堵塞毛孔。

现在已经发现，可以制得不粘稠的或不油腻的、含非堵塞性润肤

剂的组合物。这些组合物含有熔点约 $-30^{\circ}\text{C} \sim 30^{\circ}\text{C}$ 的液态多元醇脂肪酸多酯和熔点约从 -30°C 到低于约 30°C 的液态油的选定的混合物，其中的液态油基本上不含液态多元醇脂肪酸多酯、异十六烷、棕榈酸异丙酯、或 $\text{C}_{13} \sim \text{C}_{14}$ 的异链烷烃、聚丙烯酰胺和月桂基醚-7的混合物。这些组合物可用于各种各样的产品中，既有润肤作用，又有美观效果。

因此，本发明的一个目的是提供一种具有有效的润肤和可接受的美观特性的组合物，其中含有一种与选定的液态油混合在一起的、非堵塞性润肤剂。本发明的另一个目的是提供含多元醇脂肪酸多酯的局部组合物，该组合物不粘稠，不油腻，可有效用于人体头发或皮肤的处理。

发明概述

本发明涉及适合局部施用于人体头发或皮肤的组合物，该组合物包含：(a)约 $0.1\% \sim 99.9\%$ （重量）的液态多元醇脂肪酸多酯，其熔点约为 $-30^{\circ}\text{C} \sim 30^{\circ}\text{C}$ ，并且含有一个多元醇结构部分和至少一个脂肪酸结构部分，所述多元醇结构部分至少含有4个游离羟基，其中至少60%的游离羟基被约含8~22个C原子的一个或多个脂肪酸结构部分所酯化；(b)约 $0.1\% \sim 99.9\%$ （重量）的液态油，其熔点约从 -30°C 到低于约 30°C ，基本上不含液态多元醇脂肪酸多酯、异十六烷、棕榈酸异丙酯或 $\text{C}_{13} \sim \text{C}_{14}$ 的异链烷烃、聚丙烯酰胺和月桂基醚-7的混合物。优选该组合物还含有用于液态多元醇脂肪酸多酯和液态油混合物的局部载体。

除非特别注明，这里使用的所有百分数和比率都以重量计，所有测定都是在 25°C 进行的。本发明可以包含这里所描述的必需以及任选的成分和组分，或由这些成分组成，或主要由这些成分组成。

发明的详细描述

此处使用的“局部组合物”这一术语是指适合局部施用于人体头发或皮肤的组合物。该术语用来涵盖各式各样的个人护理、美容护理和化妆组合物。局部组合物的例子有：露，膏霜，手用和体用润肤液，皮肤调理液和膏霜，护肤组合物，防晒组合物，冷霜，抗痤疮组合物，

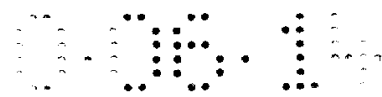
皮肤更新产品，无泡清洁液、润湿剂、面部保湿剂、化妆品、粉底、口红、护唇剂、皮肤清洁剂、手用、面部、体用清洁剂、洗浴产品、香波等等。

此处使用的“局部载体”这一术语，对本领域的普通技术人员来讲是非常熟悉的，是指适用于人体的、一种或多种相容性固体或液体填充稀释剂或介质。此处使用的“相容性”这一术语是指局部载体各组分之间，以及局部载体各组分与本发明各组分之间能够相互混合，混合的方式应该在日常使用情况下不会产生任何明显降低化妆组合物功效或影响美观的相互作用。局部载体必须是药用性载体。此处使用的“药用性”这一术语是指局部载体必须具有足够高的纯度，适用于与人体头发或皮肤接触，不会产生毒性、不相容性、不稳定性及过敏反应等等。

此处使用的“液体”这一术语，如不特别说明，是指在1个大气压、相对湿度约50%、温度为约20~25℃的环境条件下，为可流动流体的材料。

此处使用的“选定的液态油”是指熔点低于约30℃的液态油材料，该液态油材料基本上不含液态多元醇脂肪酸多酯、异十六烷、棕榈酸异丙酯或C₁₃~C₁₄的异链烷烃、聚丙烯酰胺和月桂基醚-7的混合物。这里，“基本上不含”是指当该组合物用于和液态多元醇脂肪酸多酯混合以产生润肤或美观效果时，优选含有少于有效量的上述被排除的材料。通常，该组合物含有少于1%，优选少于0.5%，更优选少于0.25%，进一步优选少于0.1%，最优选为0%（重量）的上述被排除的材料。

液态多元醇脂肪酸多酯和液态油的熔点可以用传统技术测定。这些技术在现有技术中有详细的描述，包括测温法和量热法。优选采用1994年4月26日颁发给Letton等人的美国专利5,306,514中描述的熔点测定技术，在此全文引用该专利作为本发明的参考。一般来讲，该技术涉及用扫描温度为5℃/分钟的差示扫描量热计(DSC)来测定熔点。熔点是基线(即比热线)与吸热峰后缘切线交叉点的温度值。



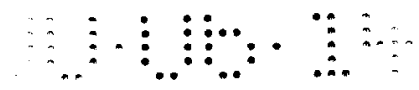
液态多元醇脂肪酸多酯

本发明的组合物含有非堵塞性液态多元醇脂肪酸多酯，浓度范围为约 0.1%~99.9%，优选约 0.5%~75%，更优选约 1%~50%，进一步优选约 2%~25% (以组合物的重量计)。这些液态多元醇脂肪酸多酯的熔点约在 30℃ 以下，来自至少含 4 个游离羟基的脂肪族或芳香族多元醇，这些游离羟基至少有 60% 被含约 8~22 个 C 原子的、一种或多种脂肪酸所酯代。“脂肪酸”也可以称为“羧酸”，因为对本领域的技术人员来讲，这两个术语常常是通用的。

本发明中使用的液态多元醇多酯含有被一个或多个脂肪酸基酯化的某些多元醇，特别是糖或糖醇。因此，原料多元醇必须至少含有 4 个可以酯化的羟基。优选的多元醇的例子为包括单糖和二糖在内的糖类及糖醇。含 4 个羟基的单糖如：木糖、阿拉伯糖和由五羟基木糖形成的糖醇即木糖醇。赤藓糖这种单糖因为只含 3 个羟基，所以不适用于本发明，但是由它形成的糖醇即赤藓醇含 4 个羟基，可以用于本发明。合适的五羟基单糖有半乳糖、果糖和山梨糖。也可以使用由蔗糖的水解产物、葡萄糖和山梨糖等形成的六羟基糖醇，如山梨糖醇。可以使用的二糖多元醇如麦芽糖、乳糖和蔗糖，它们都含 8 个羟基。

用于本发明中液态多元醇酯的多元醇含有大约 4~12 个，优选约 4~11 个，最优选约 4~8 个羟基。用于制备本发明中多酯的优选多元醇选自：赤藓醇、木糖醇、山梨(糖)醇、葡萄糖和蔗糖。尤其优选蔗糖。

至少含 4 个羟基的优选多元醇起始物必须至少有 60% 的羟基被含约 8~22 个，优选约 8~18 个 C 原子的脂肪酸所酯化。这些脂肪酸的例子有：辛酸、癸酸、月桂酸、肉豆蔻酸、肉豆蔻油酸、棕榈酸、棕榈油酸、硬脂酸、油酸、蓖麻油酸、亚油酸、亚麻酸、桐酸、花生酸、花生四烯酸、山萘酸和芥酸。脂肪酸可以衍生于天然存在的或合成的脂肪酸，可以是饱和的，也可以是不饱和的，包括位置异构体和几何异构体。但是，为了提供此处使用的相应类型的液态多酯，掺入多酯分子中的脂肪酸至少应有约一半是不饱和的。尤其优选油酸、亚油酸

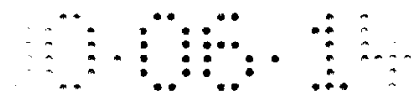


及其混合物。

用于本发明的液态多元醇脂肪酸多酯必须含有一个或多个脂肪酸酯基。多元醇的所有羟基不必全都被脂肪酸所酯化，但是，优选的是至少 60%的羟基被脂肪酸酯化。最优选是多元醇的所有羟基基本上全被脂肪酸酯化，即多元醇结构部分基本上完全酯化。与多元醇分子发生酯化反应的脂肪酸可以是一种或几种的混合物，但如上所述，必须含有足够量的不饱和酸酯基以提供流动性。

为说明上述各点，这里可以用蔗糖二脂肪酸酯，但由于它有多于两个的未酯化羟基，所以不是优选的。同样，也可以用蔗糖四脂肪酸酯，但由于它的未酯化羟基数也超过两个，所以也不是优选的。所有羟基都被脂肪酸酯化的高度优选的化合物包括液态蔗糖八取代脂肪酸酯。

下面列出了适用于本发明的、含一个或多个脂肪酸酯基的具体的液态多元醇脂肪酸多酯的非限制性实例：葡萄糖油酸酯、豆油脂肪酸葡萄糖酯（不饱和）、混合豆油脂肪酸甘露糖酯、油酸半乳糖酯、亚油酸阿拉伯糖酯、木糖亚油酸酯、山梨醇油酸酯、蔗糖油酸酯、葡萄糖二油酸酯、豆油脂肪酸的葡萄糖二酯（不饱和）、混合豆油脂肪酸的甘露糖二酯、半乳糖二油酸酯、阿拉伯糖二亚油酸酯、木糖二亚油酸酯、山梨醇二油酸酯、蔗糖二油酸酯、葡萄糖三油酸酯、豆油脂肪酸的葡萄糖三酯（不饱和）、混合豆油脂肪酸的甘露糖三酯、半乳糖三油酸酯、阿拉伯糖三亚油酸酯、木糖三亚油酸酯、山梨醇三油酸酯、蔗糖三油酸酯、豆油脂肪酸的葡萄糖四酯（不饱和）、混合豆油脂肪酸的甘露糖四酯、半乳糖四油酸酯、阿拉伯糖四亚油酸酯、木糖四亚油酸酯、山梨醇四油酸酯、半乳糖五油酸酯、不饱和豆油脂肪酸的山梨醇六酯、木糖醇五油酸酯、蔗糖四油酸酯、蔗糖五油酸酯、蔗糖六油酸酯、蔗糖七油酸酯、蔗糖八油酸酯及上述各类物质的混合物。优选液态多元醇酯选自：蔗糖五油酸酯、蔗糖六油酸酯、蔗糖七油酸酯、蔗糖八油酸酯及其混合物。更优选蔗糖六油酸酯、蔗糖七油酸酯、蔗糖八油酸酯及其混合物。



本发明优选的液态多元醇脂肪酸多酯的熔点从约 -30°C - 约 30°C ，优选约 -30°C ~ 约 27.5°C ，更优选约 -30°C ~ 约 25°C 。熔点是用传统技术测定的。

适用于此的多元醇脂肪酸多酯可以通过本领域技术人员熟知的各种方法来制备。这些方法包括：多元醇和脂肪酸甲酯、乙酯或甘油酯在各种催化剂作用下的酯基转移反应；多元醇和脂肪酰氯的酰基化反应；多元醇和脂肪酸酐的酰基化反应；多元醇和脂肪酸本身的酰基化反应。参见美国专利 2,831,854; 4,005,196 (Jandacek, 1977 年 1 月 25 日颁发)和 4,005,196 (Jandacek, 1977 年 1 月 25 日颁发)，在此全文引用上述专利作为参考。

液态油

本发明的组合物中含有选定的液态油，用于与所述液态多元醇脂肪酸多酯进行混合。选定的液态油的浓度范围从约 0.1% ~ 约 99.9%，优选约 0.5% ~ 约 75%，更优选约 1% ~ 约 50%，进一步优选约 2% ~ 25% (以组合物的重量计)。

此处使用的液态油是那些基本上不含液态多元醇脂肪酸多酯、异十六烷、棕榈酸异丙酯、或 C_{13} - C_{14} 异链烷烃、聚丙烯酰胺和月桂基醚-7 的混合物的材料，熔点低于约 30°C ，优选从约 -30°C 到低于约 30°C ，更优选从约 -30°C 到约 27.5°C ，进一步优选从约 -30°C 到约 25°C 。通常液态油在水中的溶解性较小，在 25°C ，一般小于约 1% (以重量计)。合适的液态油的例子包括，但不限于：矿物油、含约 5 ~ 16 个 C 原子的烃类、含约 3 ~ 22 个 C 原子的脂肪醇酯、含约 3 ~ 30 个 C 原子的脂肪酸酯、植物油及其混合物。1995 年 1 月 5 日公开的 Gordon 等的 W095-00166 描述了适用于此的其它液态油，这里全文引用该专利申请作为参考。

矿物油，也叫凡士林油，在此是适用的。它是一种从石油中获得的液态烃的混合物。参见《默克索引》，第十版，第 7048 条，p1033, 1983 以及《国际化妆品成分辞典》，第五版，第一卷，p415-417(1993)，在此全文引用上述内容作为参考。

适用于此的选定的烃类液态油的例子包括含约 5~16 个 C 原子的直链和支链烃。这些烃类材料的非限制性实例包括十二烷、异十二烷、氢化聚异丁烯和十六烷。当这些化合物用于与聚丙烯酰胺和月桂基醚-7 混合时,也可以用 C₅-C₁₆ 的异链烷烃(不包括 C₁₃-C₁₄ 的异链烷烃)。上述 C₅-C₁₆ 异链烷烃也称为 C₅-C₁₆ 支链烃。

适合用作选定的液态油的脂肪醇酯包括含约 3~22 个 C 原子的脂肪醇的酯和二酯。也可以用含约 3~28 个 C 原子的脂肪酸酯。这些酯类材料的非限制性例子有:肉豆蔻酸异丙酯、硬脂酸异丙酯、己二酸二异丙酯和癸二酸二辛酯(癸二酸的二辛基酯)。

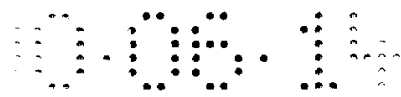
适用于此的其它选定的液态油包括在约 20℃~25℃ 环境温度下呈液态的植物油。合适的植物油例如:鳕鱼肝油、海豚油、猪油、牛蹄油、海豚油、海豹油、鲸蜡油、鲸油、浆柞油、杏仁油、山毛榉坚果油、蓖麻油、菜籽油、豆油、向日葵籽油、花生油、棉籽油、玉米油、红花油、橄榄油、鲱油、芝麻油、蓖麻油、榛子油、大麻子油、亚麻子油、黑芥子油、印度楝树油、花生油、乳香黄连木油、罂粟子油、南瓜子油、桐油、白芥子油、松油、麦胚油和上述物质的衍生物及其混合物。

局部载体

本发明组合物含有约 0.1%~约 99.9%, 优选约 50%~约 99%, 更优选约 60%~约 95%(重量)的用于本发明中液态多元醇脂肪酸多酯与液态油混合物以及其它任选成分的局部载体。

本发明中液态多元醇脂肪酸多酯与液态油的混合物可以制成各种产品类型, 包括: 膏霜、露、奶液、凝胶、手用和体用润肤液、冷霜、无泡清洁液、面部保湿剂、防晒剂、抗痤疮剂、局部止痛剂、睫毛油、口红、皮肤清洁剂、手用、面用和体用清洁剂、洗浴产品、香波等等。配制上述产品所需的载体和附加成分随产品类型而变化, 可以由本领域技术人员进行常规选择。

局部载体的形式可多种多样。例如, 乳液载体包括但不限于水包油、油包水、水包油再包水和硅氧烷包水再包油乳液, 这里都可以使



用。这些乳液的粘度范围很宽，例如约 100cps - 约 200,000cps。其它合适的局部载体包括非水液体溶剂如醇和硅氧烷(例如乙醇、异丙醇、聚二甲基硅氧烷、环甲基硅氧烷等等)；水基单相液体溶剂(例如水-醇溶剂体系)；以及这些非水溶剂和水基单相溶剂的增稠形式(例如，通过加入适当的树脂、蜡、聚合物、盐类等等，提高溶剂粘度，使之形成固态或半固态)。用于本发明的局部载体体系的例子在下列参考文献中得到了描述，在此全文引用它们作为参考：“晒黑产品配方手册”，《化妆品和与盥洗用品》，vol. 105, pp122-139 (1990年12月)；“晒黑产品配方手册”，《化妆品和与盥洗用品》，vol. 102, pp. 117-136 (1987年3月)；1990年10月2日颁发的、Figueroa等的美国专利 4,960,764；1981年3月3日颁发的、Fukuda等的美国专利 4,254,105；1990年12月11日颁发的、Orr等的美国专利 4,976,953；1991年12月17日颁发的、Turner等的美国专利 5,073,372；1996年12月17日颁发的、Ha等的美国专利 5,585,104；1997年3月4日颁发的、Moore等的美国专利 5,607,678；1997年3月4日颁发的、McAtee等的美国专利 5,607,980；1997年4月8日颁发的、Kaleta等的美国专利 5,618,522。

局部载体也可以包括具有诸如液晶和晶体凝胶网络之类复合结构的水包油型乳液体系。下列文献进一步描述了液晶的本质、形成、性质及优点：G. Dahms, “具有各向异性层状相的水包油型乳液的性质”，101 《化妆品和与盥洗用品》，pp. 113-115 (1986)；P. Loll, “化妆乳液中的液晶”，《ICI 表面活性剂出版物》RP94-93E；G.M. Eccleston, “多相水包油型乳液”，41, 《化妆品化学会志》，pp. 1-22 (1990年1/2月)，这里全文引用上述所用文献作为参考。

附加成分

可以把各种附加成分混入此处的组合物中。下面举出了一些非限制性例子。

药物活性成分

本发明组合物可以含有安全、有效量的药物活性成分。这里使用

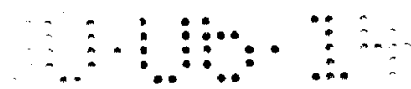
的“安全、有效量”是指在正确的医学判断范围内，活性成分的用量足以显著地或积极地改善所要治疗的病症，而又不会带来严重的副作用(即有合理的利/害比)。药物活性成分的安全、有效量将随着下列因素的不同而变化：具体的活性成分、组合物使其活性成分渗入皮肤的能力、组合物的用量、需要治疗的特殊病症、病人的年龄及身体状况、病情的严重程度、治疗持续的时间、协同疗法的特征等等。

用于本发明组合物中的药物活性成分的含量优选约 0.1%~约 20%，更优选约 0.1%~约 10%，最优选约 0.1%~约 5%(以组合物的重量计)。也可使用药物活性成分的混合物。

下面是药物活性成分的非限制性例子。

用于本发明的组合物中的药物活性成分包括抗痤疮药。这里使用的抗痤疮药包括：溶角蛋白剂，如水杨酸、硫磺、乳酸、乙醇酸、丙酮酸、间苯二酚和 N-乙酰半胱氨酸；类维生素 A，如视黄酸及其衍生物(例如，顺式和反式)；抗生素和抗微生物剂，如过氧化苯甲酰、羟甲辛吡酮、红霉素、锌、四环素、三氯森、壬二酸及其衍生物、苯氧基乙醇和苯氧基丙醇、乙酸乙酯、氯林肯霉素和甲基氯环素；sebastats 如类核黄素、 α -和 β -羟基酸；胆汁盐如硫酸鲨胆甾醇酯及其衍生物，脱氧胆酸酯和胆酸酯。优选的抗痤疮活性物选自：水杨酸、硫磺、间苯二酚、乳酸、锌、红霉素、过氧化苯甲酰，以及上述物质的混合物。更优选是水杨酸。

用于本发明组合物中的药物活性成分包括非甾族消炎药(NSAIDS)。NSAIDS 可以选自下列各类：丙酸衍生物，乙酸衍生物，灭酸衍生物，联苯基羧酸衍生物和 oxicams。所有这些 NSAIDS 在 1991 年 1 月 15 日颁发的、Sunshine 等人的美国专利 4,985,459 中得到了充分的描述，在此引入作为参考。最优选丙酸类 NSAIDS，包括但不限于阿司匹林、扑热息痛、布洛芬、萘普生、苯恶洛芬、氟比洛芬、非诺洛芬、苯布芬、酮基布洛芬、吲哚布洛芬、吡洛芬、卡布洛芬、噁丙嗪、普拉洛芬、咪洛布洛芬(miroprofen)、苯恶硫丙酸、噻丙吩、阿米洛芬、苯噻丙酸、氟联苯丙酸和氟环己苯酰丙酸。也可以用包括



氯化可的松等在内的甾类消炎药。

用于本发明组合物中的药物活性成分包括止痒药。适用的优选止痒药包括甲吡咯嗪和异丁嗪的药用性盐。

用于本发明组合物中的药物活性成分包括麻醉药。适用的优选麻醉药包括下列物质的药用性盐：利多卡因、布比卡因、盐酸普鲁卡因、待布卡因、依铁卡因、甲哌卡因、丁卡因、达克隆、己卡因、普鲁卡因、可卡因、开他敏、丙吗卡因和苯酚。

用于本发明组合物中的药物活性成分包括抗微生物药(抗细菌药、抗真菌药、抗原生动动物药和抗病毒药)。适用的优选抗微生物药包括下列物质的药用性盐：b-内酰胺类药、喹诺酮类药、环丙沙星、诺氟沙星、四环素、红霉素、阿米卡星、三氯森、多西环素、卷曲霉素、洗必太、金霉素、土霉素、氯林可霉素、乙胺丁醇、甲硝唑、戊烷脒、庆大霉素、卡那霉素、林可霉素、甲烯土霉素、乌洛托品、二甲胺四环素、新霉素、萘替米星、巴龙霉素、链霉素、妥布霉素、咪康唑和金刚烷胺。适用的优选抗菌药包括：盐酸四环素、无味红霉素、红霉素硬脂酸酯(盐)、硫酸阿米卡星、盐酸多西环素、硫酸卷曲霉素、葡萄糖酸洗必太、盐酸洗必太、盐酸金霉素、盐酸土霉素、盐酸氯林可霉素、盐酸乙胺丁醇、盐酸甲硝唑、盐酸戊烷脒、硫酸庆大霉素、硫酸卡那霉素、盐酸林可霉素、盐酸甲烯土霉素、马尿酸乌洛托品、孟德立酸乌洛托品、盐酸二甲胺四环素、硫酸新霉素、硫酸萘替米星、硫酸巴龙霉素、硫酸链霉素、硫酸妥布霉素、盐酸咪康唑、盐酸金刚烷胺、硫酸金刚烷胺、三氯森、羟甲辛吡酮、对氯间二甲酚、制霉素、发癣退和克霉唑。

这里也可以用防晒剂。下列文献中描述了各种各样的防晒剂：1992年2月11日颁发的、Haffey等的美国专利5,087,445；1991年12月17日颁发的、Turner等的美国专利5,073,372；1991年12月17日颁发的、Turner等的美国专利5,073,371；Segan'n等，《化妆品科学与技术》，第八章，第189页以及下列等页，在此将上述所有文献全文引入本发明作为参考。其中，用于本发明组合物中的优选防晒

剂选自：对甲氧基肉桂酸 2-乙基己酯、N, N-二甲基对氨基苯甲酸 2-乙基己酯、对氨基苯甲酸、2-苯基苯并咪唑-5-磺酸、氰双苯丙烯酸辛酯、羟基甲氧基二苯甲酮、水杨酸高盖基酯、水杨酸辛酯、4, 4'-甲氧基叔丁基二苯甲酰甲烷、4-异丙基二苯甲酰甲烷、3-亚苄基樟脑、3-(4-甲基亚苄基)樟脑、二氧化钛、氧化锌、二氧化硅、氧化铁、以及这些物质的混合物。

1990 年 6 月 26 日颁发的、Sabatelli 的美国专利 4, 937, 370 和 1991 年 3 月 12 日公开的、Sabatelli 等人的美国专利 4, 999, 186 中公开了可以使用的、其它防晒品，在此将上述两专利全文引入作为参考。这些防晒剂的每个分子中具有两个截然不同的发色团，这两个发色团表现出不同的紫外辐射吸收光谱。一个发色团主要吸收 UVB 辐射，另一个则强烈吸收 UVA 辐射。这些防晒剂与传统防晒剂相比，功效更高且更持久，UV 吸收范围更宽，皮肤渗入性也更小。尤其优选的防晒剂的例子为下列一种或几种物质的混合物：2, 4-二羟基二苯甲酮的 4-N, N-(2-乙基己基)甲氧基苯甲酸酯、4-羟基二苯甲酰甲烷的 4-N, N-(2-乙基己基)甲氧基苯甲酸酯、2-羟基-4-(2-羟乙氧基)二苯甲酮的 4-N, N-(2-乙基己基)甲氧基苯甲酸酯、4-(2-羟乙氧基)二苯甲酰甲烷的 4-N, N-(2-乙基己基)甲氧基苯甲酸酯。

通常，组合物中可以含有约 0.5%~约 20%的防晒剂。其准确用量将取决于所选择的防晒剂和所期望的防晒因子(SPF)。SPF 是防晒剂防红斑的光保护作用的常用度量值。参见 Federal Register, Vol. 43, No. 166, pp. 38206~38269 (1978 年 8 月 25 日)，在此将上述内容全文引入本文作为参考。

本发明的组合物中还可以含有非日照型晒黑剂，包括：二羟基丙酮、甘油醛、吡啶及其衍生物等等。这些非日照型晒黑剂也可以与防晒剂结合使用。

其它有用的活性成分包括皮肤增白剂(或光亮剂)，包括：氢醌、抗坏血酸、曲酸和偏亚硫酸氢钠，但是并不仅限于这些。

湿润剂和保湿剂



本发明的组合物除了含有上述成分以外，还可以含有一种或多种附加的湿润或保湿材料。可以使用的这些材料有很多种，每一种的含量约 0.1%~约 20%，更优选约 1%~约 10%，最优选约 2%~约 5%（以重量百分比计）。这些材料包括：脲；乙醇酸和甘醇酸盐（如铵和季烷基铵盐）；乳酸和乳酸盐（如铵和季烷基铵盐）；各种形式的芦荟（如芦荟胶）；多羟基醇如山梨醇、甘油、己三醇、丙二醇、丁二醇、己二醇等等；糖和淀粉；糖和淀粉衍生物（如烷氧基化的葡萄糖）；透明质酸；乳酰胺单乙醇胺；乙酰胺单乙醇胺，以及上述物质的混合物。

乳化剂

此处的组合物可以含有各种乳化剂。这些乳化剂的作用是使组合物中的各种载体组分乳化。合适的乳化剂包括已有专利和其它参考文献中公开的、任何一种非离子型、阳离子型、阴离子型及两性离子型的乳化剂。参见 McCutcheon 的《洗涤剂 and 乳化剂》，北美版，（1986），Allured 出版公司出版；1991 年 4 月 30 日颁发的、Ciotti 等人的美国专利 5,011,681；1983 年 12 月 20 日颁发的、Dixon 等的美国专利 4,421,769；1973 年 8 月 28 日颁发的、Dickert 等的美国专利 3,755,560；在此全文引入上述四篇文献作为参考。

合适的乳化剂类型包括甘油酯、丙二醇酯、聚乙二醇脂肪酸酯、聚丙二醇脂肪酸酯、山梨醇酯、脱水山梨醇酐酯、羧酸共聚物、葡萄糖酯和葡萄糖醚、乙氧基化醚、乙氧基化醇、烷基磷酸酯、聚氧乙烯脂肪醚磷酸盐、脂肪酰胺、酰基乳酰酯、皂类及其混合物。

合适的乳化剂可以包括，但不限于：聚乙二醇(20)脱水山梨醇单月桂酸酯（聚山梨酸酯 20）、聚乙二醇(5)大豆甾醇、Steareth-20、Ceteareth-20、PPG-2 葡萄糖醚二硬脂酸甲酯、Ceteth-10、聚山梨酸酯 80、十六烷基磷酸酯、十六烷基磷酸钾、十六烷基磷酸二乙醇胺、聚山梨酸酯 60、硬脂酸甘油酯、PEG-100 硬脂酸酯以及它们的混合物。

乳化剂可以单独使用，也可以使用两种或多种的混合物。乳化剂的使用浓度为约 0.1%~约 10%，更优选约 1%~约 7%，最优选约 1%~约 5%（以组合物的重量计）。

羧酸共聚物增稠剂

用于此处组合物中的另一成分是羧酸共聚物增稠剂。这些交联聚合物包含衍生于丙烯酸、取代丙烯酸以及这些丙烯酸和取代丙烯酸的盐及酯的一种或多种单体，其中，交联剂含有两个或多个碳-碳双键，来自多元醇。这里使用的优选聚合物通常有两种类型。第一类是丙烯酸单体或其衍生物的交联均聚物(例如，其中丙烯酸的 2C 和 3C 位上具有独立地选自 C_{1-4} 烷基、-CN、-COOH 及其混合基的取代基)。第二类是两种单体的交联共聚物，其中第一种单体选自丙烯酸单体或其衍生物(正如前一句所描述的)，短链醇(即 C_{1-4} 的醇)丙烯酸酯单体或其衍生物(例如，其中酯的丙烯酸部分的 2C、3C 位上具有独立地选自 C_{1-4} 烷基、-CN、-COOH 及其混合基的取代基)，以及上述物质的混合物。第二种单体是长链醇(即 C_{8-40} 的醇)丙烯酸酯单体或其衍生物(例如，其中，酯的丙烯酸部分的 2C、3C 位上具有独立地选自 C_{1-4} 烷基、-CN、-COOH 及其混合基的取代基)。这里也可以使用上述两种类型聚合物的组合。

在第一种类型的交联均聚物中，单体优选地选自丙烯酸、甲基丙烯酸、乙基丙烯酸及其混合物，最优选丙烯酸。在第二种类型的交联共聚物中，丙烯酸单体或其衍生物优选地选自丙烯酸、甲基丙烯酸、乙基丙烯酸及其混合物，最优选丙烯酸、甲基丙烯酸及其混合物。短链醇丙烯酸酯单体或其衍生物优选地选自 C_{1-4} 醇丙烯酸酯、 C_{1-4} 醇甲基丙烯酸酯、 C_{1-4} 醇乙基丙烯酸酯及其混合物，最优选 C_{1-4} 醇丙烯酸酯、 C_{1-4} 醇甲基丙烯酸酯及其混合物。长链醇丙烯酸酯单体选自 C_{8-40} 的烷基丙烯酸酯，优选 C_{10-30} 的烷基丙烯酸酯。

上述两种类型聚合物中的交联剂为每个分子中含有一个以上链烯醚基的多元醇的多链烯基多醚，其中母体多元醇含有至少 3 个碳原子和至少 3 个羟基。优选交联剂选自蔗糖烯丙基醚和季戊四醇烯丙基醚以及它们的混合物。这些适用于本发明的聚合物在美国专利 5,087,445 (Haffey 等, 1992 年 2 月 11 日颁发), 美国专利 4,509,949 (Huang 等, 1985 年 4 月 5 日颁发) 和美国专利 2,798,053 (Brown, 1957 年 7 月 2 日颁发) 中有更为详细的描述。在此，上述文献作为参考引入

考引入本发明。另外可参见：《CTFA 国际化妆品成分辞典》，第四版，1991 年，第 12 页和第 80 页，在此，也将其引入本发明作为参考。

适用于本发明的、商业上可以得到的第一种类型均聚物的例子包括丙烯酸聚合物，即与蔗糖或季戊四醇的烯丙基醚交联的丙烯酸均聚物。这些丙烯酸聚合物可以是 B.F. Goodrich 的 Carbopol[®]900 系列。适用于本发明的、商业上可以得到的第二种类型共聚物的例子包括 C₁₀₋₃₀ 的烷基丙烯酸酯与一种或多种丙烯酸、甲基丙烯酸、或一种它们的短链(即 C₁₋₄ 的醇)酯单体的共聚物，其中交联剂是蔗糖或季戊四醇的烯丙基醚。众所周知，这些共聚物是丙烯酸酯/C₁₀₋₃₀ 烷基丙烯酸酯的交联聚合物，可以从 B.F. Goodrich 买到，其商品名为 Carbopol[®]1342, Pemulen TR-1, 和 Pemulen TR-2。换言之，适用于本发明的羧酸聚合物增稠剂的例子选自丙烯酸聚合物，丙烯酸酯/C₁₀₋₃₀ 烷基丙烯酸酯的交联聚合物，和它们的混合物。

本发明组合物中羧酸聚合物增稠剂的含量为约 0.025% ~ 约 1%，更优选约 0.05% ~ 约 0.75%，最优选约 0.10% ~ 约 0.50% (以重量百分比计)。

其它附加成分

本发明组合物可以包含许多其它附加成分。《CTFA 化妆品成分手册》(1992 年第二版)描述了常用于头发和皮肤护理的、大量非限制性化妆品和药物成分，这些成分均适用于本发明的组合物，在此将该书全文引入本发明作为参考。该书第 537 页描述了功能性类别成分的非限制性例子。这些功能类别的例子包括：吸收剂、研磨剂、抗痤疮剂、防结块剂、消泡剂、杀微生物剂、抗氧化剂、粘合剂、生物添加剂、缓冲剂、填充剂、螯合剂、化学添加剂、着色剂、化妆品收敛剂、化妆品杀生物剂、变性剂、药物收敛剂、成膜剂、香料成分、遮光剂、pH 值调节剂、增塑剂、防腐剂、推进剂、还原剂、附加皮肤调理剂、悬浮剂(非表面活性剂)、紫外光吸收剂和增粘剂(含水的和不含水的)。适用于本发明的、本领域普通技术人员熟知的其它功能性类别材料的例子包括增溶剂和螯合剂等等。

《CTFA 化妆品成分手册》列举的这些附加成分以及适用于本发明的其它材料的非限制性例子包括：维生素及其衍生物[如维生素 C、维生素 A (即视黄酸)，视黄醇，类维生素 A 等]；抗氧化剂；聚乙二醇；有助于组合物的成膜性质和直接性的聚合物(例如二十碳烯和乙烯基吡咯烷酮的共聚物，一个例子可从 GAF 化学公司得到，其商品名为 Ganex[®]V-220)；用于维持组合物抗微生物完整性的防腐剂；抗氧化剂；螯合剂和多价螯合剂；交联和非交联阳离子聚丙烯酰胺[如，CTFA 命名为聚季铵盐 32 (和) 矿物油的 Salcare SC92，和 CTFA 命名为聚季铵盐 37 (和) 矿物油 (和) PPG-1trideceth-6 的 Salcare SC95] 和美感组分，如香料、颜料、着色剂、香精油、皮肤感觉剂 (skin sensates)、收敛剂、润肤剂、皮肤愈合剂等等，这些美感组分的非限制性例子包括丁子香油、薄荷醇、樟脑、桉树油、丁子香酚、乳酸盖基酯、金缕梅馏出物、红没药醇、甘草酸二钾等等。

使用方法

以常规方式使用本发明的组合物，可以赋予产品适当的化妆或药物效果，例如，防晒，抗痤疮，抗皱和防止皮肤老化，人工晒黑，止痛，皮肤调理，面部保湿，护唇，皮肤清洁，修饰等等。这些使用方法取决于所用组合物的类型，但通常都包括将有效量的产品局部施用于人体头发或皮肤。“有效量”是指用量足以提供所期望的效果。本发明组合物应用于头发或皮肤的典型用量取决于组合物类型和预期效果，然而，通常，典型用量范围为约 1g ~ 约 25g，一般用约 2g。

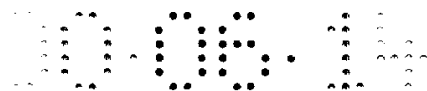
实施例

下面的实施例进一步描述并说明本发明范围内的技术方案。这些实施例仅用来说明本发明，而不是对本发明的限制，因为有可能对本发明做出许多改动而不脱离本发明的实质和范围。

成分采用化学名称或 CTFA 名称。

实施例 1

采用传统混合技术将下列成分混合，制得浴用产品形式的局部组合物。该组合物利用了非堵塞性液态多元醇脂肪酸多酯(液态蔗糖多酯)



和液态油的混合物，具有润肤和美观效果，而不会使皮肤感到发粘或油腻。

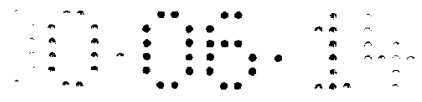
成分	重量百分比
C _{12/14} 烷基醚甘油磺酸钠	12.0
月桂基醚-3 硫酸铵	3.00
肉豆蔻酸	1.00
肉豆蔻醇	1.00
椰油酰胺丙基甜菜碱	3.00
液态蔗糖多酯 ¹	15.3
EDTA 四钠盐	0.13
甘油	6.24
香料	0.80
聚季铵盐-10 (JR-30M)	0.30
Glydant	0.20
马来酸化大豆油	1.00
水	加至 100

¹液态蔗糖多酯是蔗糖六酯、七酯和八酯的混合物，主要是用混合大豆油脂肪酸酯化的八酯。

将聚季铵盐-10 加入到盛有蒸馏水的适当容器中，混合直至完全水化，再加入表面活性剂和水溶性成分，将混合物在搅拌下加热至 70-80℃。在另一个容器中，将液态蔗糖多酯和液态油混合，边混合边加热直至均匀，然后加入到前面已加热至 70-80℃的混合物中。继续搅拌，将混合物冷却至 25-35℃。然后，搅拌下加入 Glydant 和香料，将混合物冷却至室温。

实施例 2

采用传统混合技术将下列成分混合，制得浴用产品形式的局部组合物。该组合物利用了非堵塞性液态多元醇脂肪酸多酯(液态蔗糖多酯)和液态油的混合物，具有润肤和美观效果，且不会使皮肤感到发粘或油腻。



成分	重量百分比
月桂基硫酸铵	3.15
月桂基醚-3 硫酸铵	9.45
月桂酰两性乙酸钠	5.40
聚季铵盐-10	0.30
液态蔗糖多酯 ¹	15.3
矿物油	3.00
EDTA 四钠盐	0.13
甘油	3.00
香料	0.80
柠檬酸	0.76
月桂醇	2.00
水	加至 100

¹ 液态蔗糖多酯是蔗糖六酯、七酯和八酯的混合物，主要是用混合大豆油脂肪酸酯化的八酯。

将聚季铵盐-10 加入到盛有蒸馏水的适当容器中，混合直至完全水化，再加入表面活性剂和水溶性成分，将混合物在搅拌下加热至 70-80℃。在另一个容器中，将液态蔗糖多酯和液态油混合，边混合边加热直至均匀，然后加入到前面已加热至 70-80℃ 的混合物中。继续搅拌，将混合物冷却至 25-35℃。然后，搅拌下加入 Glydant 和香料，将混合物冷却至室温。

实施例 3

采用传统混合技术将下列成分混合，制得浴用产品形式的局部组合物。该组合物利用了非堵塞性液态多元醇脂肪酸多酯(液态蔗糖多酯)和液态油的混合物，具有润肤和美观效果，且不会使皮肤感到发粘或油腻。

成分	重量百分比
十六醇	1.80
硬脂酸	0.25

硬脂醇	1.20
聚乙二醇(100)硬脂酸酯	0.25
矿物油	2.00
液态蔗糖多酯 ¹	4.00
聚二甲基硅氧烷 350 ²	0.50
对羟基苯甲酸丙酯	0.10
Arlatone (RTM) 2121 ³	1.00
甘油	9.00
尿素	2.00
甲氧基肉桂酸辛酯	2.00
苯氧基乙醇	0.25
Carbomer 1382 ⁴	0.05
Carbomer 954 ⁵	0.35
EDTA 四钠盐	0.10
二氧化钛	0.15
对羟基苯甲酸甲酯	0.20
NaOH	0.22
聚二甲基硅氧烷 Q-21403 ⁶	1.00
水	加至 100

¹ 液态蔗糖多酯是蔗糖六酯、七酯和八酯的混合物，主要是用混合大豆油脂肪酸酯化的八酯。

² Dow Corning 公司的 Dow Corning[®] 200 流体(350 厘沲)。

³ 95% (重量) 的脱水山梨醇硬脂酸酯和 5% (重量) 的蔗糖椰子酸酯。

⁴ B. F. Goodrich 公司的 Carbopol[®] 1382。

⁵ B. F. Goodrich 公司的 Carbopol[®] 954。

⁶ Dow Corning 公司的 Dow Corning[®] Q-2 1403, 是 85% (重量) 的聚二甲基硅氧烷和 15% (重量) 的聚二甲基硅氧烷醛 (dimethiconal)。

将液态蔗糖多酯、Arlatone 2121 和其它水溶性成分与水混合，并加热，制得第一种预混物。将除硅氧烷以外的油相成分混合并加热，制得第二种预混物，把它加到前面的水相预混物中。将得到的混合物冷却。然后向该水包油型乳液中加入硅氧烷，将混合物冷却，最后再加入其它次要成分。