(19)中华人民共和国国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 113660924 A
(43)申请公布日 2021.11.16

(21)申请号 202080021063.9
(22)申请日 2020.03.27
(30)优先权数据
FR1903283 2019.03.28 FR
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2021.09.14
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2020/058679 2020.03.27
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2020/193743 FR 2020.10.01
(71)申请人 罗盖特公司
地址 法国莱斯特朗
(72)发明人 L·曼廷克 D·威尔斯 G·洛威-波米尔 S·皮奥特
(74)专利代理机构 北京市金杜律师事务所 11256
代理人 孟凡宏
(51)Int.Cl.
A61K 8/49(2006.01)
A61K 8/73(2006.01)
A61Q 11/00(2006.01)
A61Q 15/00(2006.01)

权利要求书1页 说明书6页

(54)发明名称

用于处理人体异味尤其是口臭的局部组合物

(57)摘要

本申请涉及化妆品领域,更具体而言涉及通过杀菌和/或抑菌的局部组合物以及气味捕捉作用进行局部异味护理的领域。根据本发明的局部组合物包含至少一种环糊精、1,4:3,6-二脱水己糖醇和/或1,4:3,6-二脱水己糖醇的衍生物。该局部组合物可用于口腔,但也可用于那些由于微生物活动可能产生异味的皮肤区域,即腋下、胯间和足部。优选地,本发明的局部组合物用于处理口腔,特别优选地用于处理口臭。

CN 113660924 A

1.一种局部组合物,其特征在于所述局部组合物包括:

-至少一种改性环糊精,选自羟丙基α-环糊精、羟丙基β-环糊精、羟丙基γ-环糊精,优选地是羟丙基β-环糊精,

-至少一种1,4:3,6-二脱水己糖醇,选自异山梨醇、异甘露醇、异艾杜醇,优选地是异山梨醇,和/或至少一种1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物。

2.根据前述权利要求所述的局部组合物,其特征在于所述改性环糊精是羟丙基β-环糊精。

3.根据权利要求1或2所述的局部组合物,其特征在于所述羟丙基环糊精的羟丙基取代度为0.1至3,优选地为0.5至2,最优选地为1至1.5。

4.根据前述权利要求中任一项所述的局部组合物,其特征在于所述1,4:3,6-二脱水己糖醇是异山梨醇。

5.根据前述权利要求中任一项所述的局部组合物,其特征在于所述1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物选自1,4:3,6-二脱水己糖醇的单醚或二醚,或1,4:3,6-二脱水己糖醇的单酯或双酯。

6.根据前述权利要求中任一项所述的局部组合物,其特征在于:

-所述改性环糊精的质量含量为0.1%至15%,

-所述1,4:3,6-二脱水己糖醇或所述1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物的质量含量为0.1%至25%,

-水含量为0.5%至95%,优选地为1%至95%,更优选地为10%至95%,最优选地为25%至95%。

7.根据权利要求1至6中任一项所述的局部组合物作为化妆品或皮肤制剂中的抗臭剂的非治疗性美容用途。

8.根据权利要求1至6中任一项所述的局部组合物用于处理人体异味。

9.根据权利要求7所述的用途或用于根据权利要求8所述用途的局部组合物,用于预防、减轻或消除人体异味。

10.根据前述权利要求所述的用途或用于根据前述权利要求所述用途的局部组合物,其特征在于所述异味位于表皮,特别是在腋下、胯间和足部,或位于口腔内。

11.根据前述权利要求所述的用途或用于根据前述权利要求所述用途的局部组合物,其特征在于所述口腔内异味是由口臭引起的。

12.一种化妆品或皮肤制剂,其特征在于所述化妆品或皮肤制剂包括根据权利要求1至6中任一项所述的局部组合物。

13.根据前述权利要求所述的化妆品或皮肤制剂,其特征在于所述化妆品或皮肤制剂形式为口腔喷雾剂、口腔清洗液、口腔冲洗液、牙膏、口腔片剂、口腔分散膜、除臭棒、除臭喷雾。

用于处理人体异味尤其是口臭的局部组合物

技术领域

[0001] 本申请涉及化妆品领域，更具体而言涉及通过杀菌和/或抑菌的局部组合物以及气味捕捉作用进行局部异味护理的领域。根据本发明的局部组合物可用于口腔，但也可用于那些由于微生物活动可能产生异味的皮肤区域，即腋下、胯间和足部。优选地，本发明的局部组合物用于处理口腔，特别优选地用于处理口臭。

背景技术

[0002] 在专利PCT/FR2018/053059中，申请人提出使用二脱水己糖醇，尤其是异山梨醇，用来消除口腔微生物群中的不良细菌。这种不良细菌的消除效果在于减少牙菌斑、减少牙龈损伤，以及减少牙齿脱矿现象。没有提到关于本申请的发明所消除的细菌的微生物活动所产生的异味。

[0003] 在Yajima的专利US4267166中，一种处理人类口腔异味的方法基于在可食用组合物中使用环糊精。这种组合物不包括任何二脱水己糖醇。

[0004] Henkel的申请WO 2008064948提出了一种包括水、乙醇和至少一种环糊精的漱口水溶液。该漱口水溶液还可以包括多羟基醇，如木糖醇和山梨醇这两种多元醇。该专利中没有提到更具体的多元醇，即二脱水己糖醇，更没有提到异山梨醇。在该漱口水溶液中，乙醇的存在往往会使口腔变干，并对口腔粘膜具有刺激性。

[0005] 根据上述文件，已知使用环糊精来捕捉异味，且已知使用己糖二酐，如脱水己糖醇和二脱水己糖醇，来抑制口腔或皮肤微生物群中细菌或限制其生长。然而，在局部组合物中使用所有这些分子并不为人所知，更不必说同时使用这两种分子或结合这两种分子的作用来预防、减轻或消除人体异味，特别是口腔或皮肤异味。

[0006] 现有技术的文献都没有提出将至少一种二脱水己糖醇和至少一种环糊精结合在局部组合物中，也没有任何文献鼓励这样做以最大限度地处理人体异味，无论是皮肤异味还是口腔异味，更不必说用这种组合物来处理口臭了。

[0007] 处理口臭的通常方法是使用洗必泰，其作为一种杀菌剂，通常在漱口水中使用。这种物质的主要缺点是增加牙菌斑形成、诱发牙齿表面着色以及改变味觉。

[0008] 技术问题

[0009] 本发明的目的是找到一种具有“抗臭”效果的局部组合物，适合在人体各处使用，优选地在口腔中使用，且尤其是替代目前处理口臭的各类方法，这种局部组合物同时：

[0010] -为天然来源，

[0011] -不含酒精，且可能地不含合成防腐剂，以便不会刺激或腐蚀皮肤或粘膜，但其可能有利地使皮肤或粘膜湿润，

[0012] -对微生物群尤其是口腔微生物群有益，即其促进或保持平衡且健康的口腔微生物菌群，

[0013] -且其在使用后的第一时间减轻或消除异味，

[0014] -且可持续地减少异味形成，尤其是减少导致产生异味分子的微生菌株。

[0015] 实施方案描述

[0016] 本发明的一个目的在于一种呈液体或固体形式的局部组合物，包括：

[0017] -至少一种天然或改性环糊精，选自羟丙基α-环糊精、羟丙基β-环糊精、羟丙基γ-环糊精，优选地是羟丙基β-环糊精，

[0018] -至少一种1,4:3,6-二脱水己糖醇，选自异山梨醇、异甘露醇、异艾杜醇，优选地是异山梨醇，和/或至少一种1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物。

[0019] 本发明的第二目的在于根据本发明的局部组合物作为化妆品或皮肤制剂中的抗臭剂的非治疗性美容用途。

[0020] 本发明的第三目的在于根据本发明的局部组合物用于处理人体异味。

[0021] 特别地，本发明涉及上述局部组合物或根据本发明的该局部组合物的用途，用于与预防、减轻或消除人体异味。这些异味位于表皮，特别是在腋下、胯间和足部，或位于口腔内，例如由口臭引起。特别地，将根据本发明的局部组合物的非治疗性美容用途旨在对抗(即预防、减少或消除)口臭，优选地同时对抗口臭的产生和影响。

[0022] 因此，根据一个优选实施方案，本发明涉及用于处理口臭的上述局部组合物。

[0023] 本发明的第四目的涉及包含上述局部组合物的化妆品或皮肤制剂。优选地，对于口腔而言，该制剂的形式为口腔喷雾剂、口腔清洗液、口腔冲洗液、牙膏、口腔片剂、口腔分散膜。优选地，对于皮肤而言，该制剂的形式为除臭棒、除臭喷雾、走珠除臭剂、除臭口罩。

[0024] 抗臭

[0025] 申请人的“抗臭”一词指根据本发明的组合物能够中和气味，并能够阻止气味形成，尤其是异味形成，优选地源自局部微生物群、特别是人体局部微生物群、最特别地是人体口腔微生物群的细菌活动的异味形成。

[0026] 环糊精

[0027] 在本申请中，术语“环糊精”表示并包括常见的任何一种环糊精，例如含有通过碳1和碳4间共价键连接起6至12个葡萄糖单元的天然和未取代的环糊精，特别是分别含有6个、7个和8个葡萄糖单元的α-、β-和γ-环糊精。这些环糊精的CAS号方面，α-环糊精为10016-20-3，β-环糊精为7585-39-9，且γ-环糊精为17465-86-0。

[0028] “改性环糊精”是至少有一部分OH羟基已被转化为OR基团的环糊精，其中R通常表示烷基或羧烷基。从这个角度来看，环糊精衍生物尤其包括被烷基取代的环糊精，如甲基化环糊精或乙基化环糊精，但也包括被羟烷基取代的环糊精，如羟丙基环糊精和羟乙基环糊精，以及被羧烷基取代的环糊精，如羧甲基环糊精或它们的混合物。

[0029] 由于它们来源完全天然，根据本发明的优选的环糊精为天然α-、β-和γ-环糊精，即未改性的环糊精。根据一个优选实施方案，根据本发明的局部组合物中使用的环糊精为β-环糊精，优选为“天然”环糊精(未经化学改性)。

[0030] 然而，如果天然环糊精的溶解度对于局部组合物或化妆品或皮肤制剂来说不够高，则优选改性环糊精(优选改性β-环糊精)，优选羟烷基环糊精，最优选羟烷基β-环糊精。甚至更优选羟丙基环糊精，最优选羟丙基β-环糊精。对本发明有用的羟丙基环糊精，其羟丙基的取代度记为DS，取代度为0.1至3，优选地为0.5至2，最优选地为1到1.5。

[0031] 当局部组合物呈固体形式时，环糊精可以是结晶、假结晶或无定形粉末的形式。

[0032] 环糊精可呈所谓的“游离”形式，即空腔形式，或为适于解离的包合物的已知形式。

环糊精优选呈游离形式。

[0033] 二脱水己糖醇

[0034] 1,4:3,6-二脱水己糖醇选自:异山梨醇,即1,4:3,6-二脱水山梨醇;异甘露醇,即1,4:3,6-二脱水甘露醇;异艾杜醇,即1,4:3,6-二脱水艾杜醇,以及这些产品中至少两种的混合物。优选地为异山梨醇,其IUPAC名称为(3R,3aR,6S,6aR)-六氢呋喃[3,2-b]呋喃-3,6-二醇。

[0035] 1,4:3,6-二脱水己糖醇,也简称为二脱水己糖醇或异己糖二酐,是例如山梨醇、甘露醇和艾杜醇的C6多元醇(己糖醇)双内脱水的产物。在这方面,申请人指出,二脱水己糖醇的制造通常在其合成过程中产生水;通过在该反应介质中回收所述二脱水己糖醇,可立即获得根据本发明可用的呈二脱水己糖醇水溶液形式的1,4:3,6-二脱水己糖醇。尤其可以根据上述专利申请EP 1 287 000和WO 03/043959中描述的方法获得二脱水己糖醇溶液。可以选择保留二脱水己糖醇制备过程中使用的全部或部分水,或去除全部水以获得固体形式的产品,只需加水即可恢复为水溶液,这构成制备根据本发明可用的二脱水己糖醇水溶液的另一种可能性。

[0036] 二脱水己糖醇衍生物

[0037] 根据本发明的局部组合物可包括至少一种二脱水己糖醇衍生物。

[0038] 在本申请中,术语"1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物"包括所有通过化学改性或酶改性的1,4:3,6-二脱水己糖醇。根据一个实施方案,该1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物选自一个或两个羟基官能团上发生酯化的1,4:3,6-二脱水己糖醇(将其分别称为单酯和二酯)、在一个或两个羟基官能团上发生醚化的1,4:3,6-二脱水己糖醇(将其分别称为单醚和二醚)。根据一个实施方案,该1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物选自单甲基异山梨醇、二甲基异山梨醇、月桂酸异山梨醇、油酸异山梨醇、二辛酸异山梨醇、二癸酸异山梨醇、二油酸异山梨醇、二亚油酸异山梨醇、二亚油酸异山梨醇。

[0039] α-羟基酸或多羟基酸

[0040] 根据本发明的一个优选实施方案,局部组合物包括至少一种α-羟基酸或多羟基酸或α-羟基酸或多羟基酸前体,例如内酯类,优选地环状内酯,例如葡糖酸内酯,最优选地为葡糖酸-6-内酯。

[0041] α-羟基酸也称为AHA,是在其主碳链上相对于酸官能团的"α"位置具有羟基官能团的羧酸,即由携带酸官能团的碳原子附近的碳原子携带羟基官能团。可用于本发明的AHA选自乙醇酸、苹果酸、乳酸、柠檬酸、酒石酸、葡萄糖酸。

[0042] 根据根据本发明的局部组合物的一个实施方案,所述局部组合物呈液体形式,并包括选自乙醇酸、苹果酸、乳酸、柠檬酸、酒石酸、葡萄糖酸的α-羟基酸,优选地为葡萄糖酸。

[0043] 多羟基酸也称为PHA,是具有至少两个羟基官能团的羧酸,这些羟基官能团由相对于携带羧酸官能团的碳原子而言相邻的或相隔至少一个碳原子的碳原子携带。PHA可以是线性、支链或环状分子。可用于形成本发明的抗臭组合物的PHA选自葡萄糖酸和葡萄糖醛酸。

[0044] α-羟基酸或多羟基酸前体

[0045] 申请人的α-羟基酸或多羟基酸"前体"一词指包括这样的化学官能团的有机分子:能够例如通过在水溶液中水解实现解离,并且从而能够通过化学解离平衡形成具有羧酸官

能团的分子，该分子在α位置具有至少一个羟基(如果是AHA前体)或在碳链上离羧酸官能团更远的位置具有至少一个羟基(如果是PHA前体)。

[0046] 根据一个实施方案，α-羟基酸前体是葡萄糖酸内酯。葡萄糖酸内酯的IUPAC名称为(3R,4S,5S,6R)-3,4,5-三羟基-6-(羟甲基)四氢-2H-吡喃-2-酮，是葡萄糖酸的环状酯。它也被称为葡萄糖酸-δ-内酯。

[0047] 根据根据本发明的局部组合物的一个实施方案，所述局部组合物呈固体形式，并包括α-羟基酸或多羟基酸前体，其选自内酯，优选地选自葡萄糖酸内酯，最优选地选自葡萄糖酸-δ-内酯。

[0048] 补充性多元醇

[0049] 根据一个实施方案，水性组合物另外包含至少一种线性多元醇，选自甘油、氢化葡萄糖糖浆、麦芽糖醇、甘露醇、山梨糖醇、赤藓糖醇、异麦芽酮糖醇、乳糖醇、木糖醇，并且优选地选自木糖醇、麦芽糖醇和山梨糖醇，并且最优选地选自木糖醇和麦芽糖醇。

[0050] 根据本发明的组合物的物理形式

[0051] 根据本发明的抗臭局部组合物可以呈固体形式，如粉末或片状，或呈液体形式，如膏、凝胶或溶液。在固体形式的情况下，抗臭局部组合物不一定是完全无水的，因此可能含有少量的水，尤其是按重量计最多约5％。在流体形式的情况下，抗臭局部组合物可以是膏、凝胶或水溶液，其干物质按重量计含量可为1％至95％。优选地，出于物流和储存成本的考虑，同时也为了在生产局部使用的化妆品或皮肤制剂时便于使用，最好是浓缩溶液，即具有按重量计超过30％、优选地超过50％且更优选地超过70％的干物质的浓缩溶液。特别可以使用具有按重量计75％至85％之间的干物质的局部组合物。

[0052] 局部组合物的组分的质量含量

[0053] 根据一个实施方案，根据本发明的局部组合物具有：

[0054] -质量含量为0.1％至15％的天然或改性环糊精，

[0055] -质量含量为0.1％至25％的1,4:3,6-二脱水己糖醇或1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物，

[0056] -含量为0.5％至95％、优选地1％至95％、更优选地10％至95％且最优选地25％至95％的水。

[0057] 根据另一实施方案，根据本发明的局部组合物具有：

[0058] -质量含量为0.1％至15％的天然或改性环糊精，

[0059] -质量含量为0.1％至25％的1,4:3,6-二脱水己糖醇或1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物，

[0060] -质量含量为0.01％至10％的α-羟基酸或多羟基酸或α-羟基酸或多羟基酸前体，

[0061] -含量为0.5％至95％、优选地1％至95％、更优选地10％至95％且最优选地25％至95％的水。

[0062] 根据另一实施方案，根据本发明的局部组合物具有：

[0063] -质量含量为0.1％至15％的环糊精或改性环糊精，

[0064] -质量含量为0.1％至25％的1,4:3,6-二脱水己糖醇或1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物，

[0065] -质量含量为0.01％至10％的α-羟基酸或多羟基酸或α-羟基酸或多羟基酸前体，

[0066] -质量含量为0.1％至25％的选自山梨糖醇、甘露糖醇、木糖醇、赤藓糖醇的线性多元醇，

[0067] -含量为0.5％至95％、优选地1％至95％、更优选地10％至95％且最优选地25％至95％的水。

[0068] 化妆品或皮肤制剂

[0069] 出于本发明的目的，化妆品或皮肤制剂是指旨在与人或动物的皮肤接触的各种化妆品或皮肤制剂。用于局部使用的制剂的非限制性实例包括洗剂、乳膏、精华液、凝胶、软膏、香膏、液体肥皂或沐浴露、洗发水、摩斯、粉底、止汗剂和除臭剂。根据一个实施方案，包括根据本发明的局部组合物的化妆品或皮肤制剂的形式为口腔喷雾剂、口腔清洗液、口腔冲洗液、牙膏、口腔片剂、口腔分散膜、除臭棒、除臭喷雾。

[0070] 除了根据本发明的局部组合物外，这些制剂还可包括通常用于局部使用的制剂的其他成分，例如化妆品或皮肤活性成分以及辅助剂，诸如防腐剂、增溶剂或香水等。局部组合物还可以包括保湿剂，如甜菜碱、甘油或乙酰氨基乙氧基乙醇或其他对皮肤有活性或有感官作用的产品，如淀粉。

[0071] 技术效果

[0072] 包含根据本发明的抗臭组合物的化妆品或皮肤制剂允许消除施用前身体上已经存在的异味，并使身体经过处理的部分保持无味或微弱气味。当根据本发明的局部组合物用于口腔护理或卫生的化妆品制剂时，其允许立即除臭，并减少或抑制口腔微生物群的微生物(尤其是细菌)的生长，这减少或防止由于这些细菌的生物活动而形成异味。根据本发明的局部组合物允许全天保持口气清新，优选地超过一小时的时间。

[0073] 根据本发明的抗臭局部组合物可以抑制口腔菌群中细菌的活性和/或生长，并同时捕捉口腔中已经存在的异味。因此，抗臭局部组合物既作用于异味的生成，也作用于异味本身，这两种作用途径之间没有任何延迟。因此，这允许含有抗臭局部组合物的化妆品制剂通过环糊精具有即时的有益效果，并通过1,4:3,6-二脱水己糖醇和/或1,4:3,6-二脱水己糖醇衍生物具有长期效果。

[0074] 根据本发明的抗臭局部组合物具有快速的杀菌和/或抑菌作用，特别是抗菌和/或抗真菌作用，因此可以减少或消除口腔中涉及口臭的微生物的存在，从而在很长一段时间内保持口气清新，通常是数小时。此外，根据本发明的局部组合物具有中度至强度的去污活性，不会引起刺激，并确保使用舒适。

[0075] 成膜聚合物可以有利地添加到根据本发明的局部组合物中，以便在皮肤或口腔粘膜的表面形成一层膜，根据本发明的活性组合物可以在其中或上面持续存在并继续起作用以处理口臭。这种聚合物可以是例如合成聚合物，如聚乙烯胺、聚乙烯吡咯烷酮、苯乙烯丙烯酸酯，或者优选地是天然来源的聚合物，如纤维素或淀粉衍生物。

[0076] 根据本发明的局部组合物的用途

[0077] 本发明还涉及根据本发明的局部组合物作为化妆品或皮肤制剂中的抗臭剂的非治疗性美容用途。

[0078] 本发明还涉及用于处理人体异味、优选地用于处理口臭的根据本发明的局部组合物。

[0079] 根据一个实施方案，根据本发明的局部组合物或其根据本发明的用途允许预防、

减轻或消除人体异味。这些异味位于表皮，特别是在腋下、胯间和足部，或位于口腔内。

[0080] 根据一个变型例，局部组合物的非治疗性美容用途允许消除口臭，优选地同时对抗口臭的生成并消除口臭的影响。

实施例

[0081] 实施例1：抗口臭水溶液的制备

[0082] 根据下表1的质量组成，按照以下方案，以水溶液的形式制备根据本发明的抗臭局部组合物。

[0083] [表1]

[0084]

根据本发明的水溶液组合物			
	INCI 名称	商品名	%
A 相	水	软化水	qsp 100
	异山梨醇	Beauté by Roquette PO500（Roquette）	5.00
	木糖醇	Beauté by Roquette PO370（Roquette）	10.00
	山梨醇	Beauté by Roquette PO160（Roquette）	10.00
	羟丙基环糊精	Beauté by Roquette CD100（Roquette）	1.00
	薄荷香精	薄荷粉末香精编码 023C301（Colin Ingredients）	1.00

[0085]

B 相	苯甲酸钠	Microcare NB（Thor）	0.50
	苯甲酸钾	Microcare KS（Thor）	0.50
C 相	CI 42090	FDC 蓝 1 号（Sensient Cosmetic Technologies）	qs
D 相	葡萄糖酸内酯	Beauté by Roquette GA290（Roquette）	Qs pH 5.8

[0086] 首先，制备相A。在22℃左右，将木糖醇粉末(来自Roquette®的Beauté by Roquette®PO370)和山梨糖醇粉末(来自Roquette®的Beauté by Roquette®PO160)溶于水，水的体积大约等于待制备溶液体积的一半，同时用反絮凝桨叶搅拌。然后依次加入羟丙基环糊精粉末(来自Roquette®的Beauté by Roquette®CD110)和异山梨醇水溶液(来自Roquette®的Polysorb®LP)，同时用反絮凝桨叶轻轻搅拌，等待两者完全溶解。然后加入薄荷香精(来自Colin Ingredients®的粉末薄荷香精023C301)。

[0087] 可选地，然后可以将由山梨酸钾(来自Thor©的Microcare KS)和苯甲酸钠(来自Thor©的MicrocareNB)组成的B相添加到A相中，但这些防腐剂对于本发明不是必需的。这些防腐剂仅用于确保微生物稳定性。

[0088] 可选地，还可以将染料添加到先前获得的溶液中，例如这里是由Sensient Cosmetic Technologies以商品参号“FDC蓝1号”出售的蓝色染料“CI 42090”。

[0089] 以计量方式加入10％m的葡萄糖酸内酯水溶液(D相)，直到pH值达到5.8，从而完成制备。葡糖酸内酯由Roquette提供，商品参号为Beauté by Roquette®GA290。