

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 03816155.9

[51] Int. Cl.

C07D 295/145 (2006.01)

C07C 255/28 (2006.01)

A61K 8/00 (2006.01)

A61K 8/30 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

[45] 授权公告日 2009 年 4 月 8 日

[11] 授权公告号 CN 100475799C

[22] 申请日 2003.7.1 [21] 申请号 03816155.9

[30] 优先权

[32] 2002.7.10 [33] EP [31] 02405582.4

[86] 国际申请 PCT/EP2003/006955 2003.7.1

[87] 国际公布 WO2004/006878 英 2004.1.22

[85] 进入国家阶段日期 2005.1.7

[73] 专利权人 西巴特殊化学品控股有限公司

地址 瑞士巴塞尔

[72] 发明人 B·瓦纳 T·埃利斯 K·埃欣

[56] 参考文献

US5806834A 1985.5.15

US3723154A 1973.3.27

EP0127819A 1984.12.12

WO0020388A 2000.4.13

审查员 豆波建

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 关立新 赵苏林

权利要求书 6 页 说明书 66 页

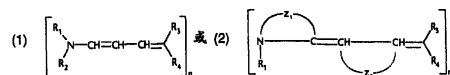
[54] 发明名称

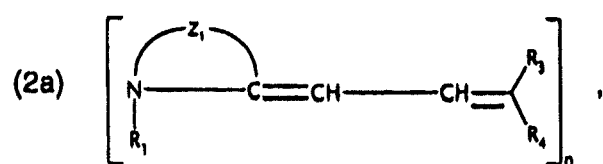
化妆用部花青衍生物

[57] 摘要

描述了式(1)或(2)部花青衍生物在人和动物的头发及皮肤中抵御紫外线辐射的用途,其中, R_1 和 R_2 彼此独立地为氢、 C_1-C_{22} 烷基、环- C_3-C_8 烷基,或未取代的或被 C_1-C_5 烷基或 C_1-C_5 烷氧基取代的 C_6-C_{20} 芳基;或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环; R_3 是氰基、 $-COOR_5$ 、 $-CONHR_5$ 、 $-COR_5$ 或 $-SO_2R_5$; R_4 是氰基、 $-COOR_6$ 、 $-CONHR_6$ 、 $-COR_6$ 或 $-SO_2R_6$; R_5 和 R_6 彼此独立地为 C_1-C_{22} 烷基;或未取代的或被 C_1-C_5 烷基取代的 C_6-C_{20} 芳基;或 R_3 和 R_4 或 R_5 和 R_6 一起形成5到7元单环、碳环或杂环; Z_1 和 Z_2 彼此独立地为 $-(CH_2)_1$ -基团,该基团是连续的或插入了-O-、-S-、或-NR₇-,和/或是未取代的或被 C_1-C_5 烷基取代; R_7 是 C_1-C_5 烷基;l为1到4;m为1到7;n

为1到4;当 $n=2$ 时, R_1 、 R_5 或 R_6 是二价烷基;或 R_1 和 R_2 与和它们连接的两个氮原子一起形成 $-(CH_2)_m$ 环;当 $n=3$ 时, R_1 、 R_5 或 R_6 是三价烷基;当 $n=4$ 时, R_1 、 R_5 或 R_6 是四价烷基;和式(1)中的 R_1 和 R_2 不同时为氢。





其中，在式(1)或(2a)的化合物中，

R_1 和 R_2 彼此独立地为氢、 C_1 - C_{22} 烷基、未取代的或被 C_1 - C_5 烷基或 C_1 - C_5 烷氧基取代的 C_6 - C_{20} 芳基；或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环；

R_3 是氰基、 $-\text{COOR}_5$ 、 $-\text{CONHR}_5$ 、 $-\text{COR}_5$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_5$ ；

R_4 是氰基、 $-\text{COOR}_6$ 、 $-\text{CONHR}_6$ 、 $-\text{COR}_6$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ ；

R_5 和 R_6 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基、未取代的或被 C_1 - C_5 烷基取代的 C_6 - C_{20} 芳基；

或 R_5 和 R_6 一起形成 5 到 7 元碳环或杂环；

Z_1 和 Z_2 彼此独立地为 $-(CH_2)_l$ -基团，该基团是连续的或插入了-O-、-S-或 $-\text{NR}_7$ -，是未取代的或被 C_1 - C_5 烷基取代；

R_7 是 C_1 - C_5 烷基；

l 为 1 到 4；

m 为 1 到 7；

n 为 1 到 4；

当 $n=2$ 时， R_1 、 R_5 或 R_6 是二价烷基；或 R_1 和 R_2 与两个和它们连接的氮原子一起形成 $-(CH_2)_m$ 环；

当 $n=3$ 时， R_1 、 R_5 或 R_6 是三价烷基；

当 $n=4$ 时， R_1 、 R_5 或 R_6 是四价烷基；和

式(1)中的 R_1 和 R_2 不同时为氢。

3. 如权利要求 1 或 2 的用途，其中，在式(1)、(2)、(3)或(2a)的化合物中，

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基；或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环；

R_3 是氰基、 $-\text{COOR}_5$ 、 $-\text{CONHR}_5$ 、 $-\text{COR}_5$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_5$ ；

R_4 是氰基、 $-\text{COOR}_6$ 、 $-\text{CONHR}_6$ 、 $-\text{COR}_6$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ ；

R_5 和 R_6 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基或 C_6 - C_{20} 芳基；和

Z_1 和 Z_2 如权利要求 1 所定义。

4. 如权利要求 1-3 任意之一的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)或(2a)的化合物中,

R_3 是氰基; 和

R_4 是 $-\text{CONHR}_6$; 和

R_6 是 $\text{C}_1\text{-C}_{22}$ 烷基或 $\text{C}_6\text{-C}_{20}$ 芳基。

5. 如权利要求 1-4 任意之一的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)或(2a)的化合物中,

R_6 是 $\text{C}_4\text{-C}_{20}$ 烷基。

6. 如权利要求 1-3 任意之一的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)或(2a)的化合物中,

R_1 和 R_2 彼此独立地为 $\text{C}_1\text{-C}_{22}$ 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入 $-\text{O}-$ 或 $-\text{NH}-$ 的 $-(\text{CH}_2)_m$ 环;

R_3 是 $-\text{COOR}_5$;

R_4 是氰基、 $-\text{COOR}_6$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_6$;

R_5 和 R_6 彼此独立地为 $\text{C}_1\text{-C}_{22}$ 烷基或 $\text{C}_6\text{-C}_{20}$ 芳基; 和

m 为 1 到 7。

7. 如权利要求 6 的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)或(2a)的化合物中,

R_1 和 R_2 彼此独立地为 $\text{C}_1\text{-C}_{22}$ 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入 $-\text{O}-$ 或 $-\text{NH}-$ 的 $-(\text{CH}_2)_m$ 环;

R_3 是 $-\text{COOR}_5$;

R_4 是 $-\text{COOR}_6$;

R_5 和 R_6 彼此独立地为 $\text{C}_1\text{-C}_{22}$ 烷基或 $\text{C}_6\text{-C}_{20}$ 芳基; 和

m 为 1 到 7。

8. 如权利要求 6 的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)或(2a)的化合物中,

R_1 和 R_2 彼此独立地为 $\text{C}_1\text{-C}_{22}$ 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入 $-\text{O}-$ 或 $-\text{NH}-$ 的 $-(\text{CH}_2)_m$ 环;

R_3 是 $-\text{COOR}_5$;

R_4 是氰基;

R_5 是 $\text{C}_1\text{-C}_{22}$ 烷基或 $\text{C}_6\text{-C}_{20}$ 芳基; 和

m 为 1 到 7.

9. 如权利要求 6 的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)或(2a)的化合物中,

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环;

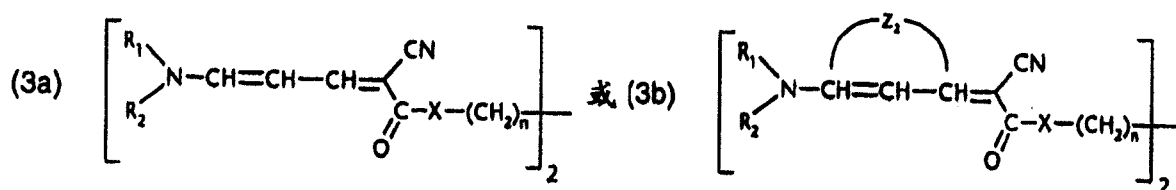
R_3 是 $-COOR_5$;

R_4 是 $-SO_2R_6$;

R_5 和 R_6 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基或 C_6 - C_{20} 芳基; 和

m 为 1 到 7.

10. 如权利要求 1 或 2 的用途, 其中包括使用式(3a)或(3b)化合物,



其中, 在式(3a)或(3b)的化合物中,

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的两个氮原子一起形成 $-(CH_2)_m$ 环;

X 是-O-或-NH-;

Z_2 是 $-(CH_2)_l$ -基团, 该基团是连续的或插入了-O-、-S-或-NR₇-, 是未取代的或被 C_1 - C_6 烷基取代; 和

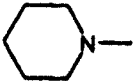
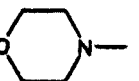
l 是 1 到 4;

m 是 1 到 7;

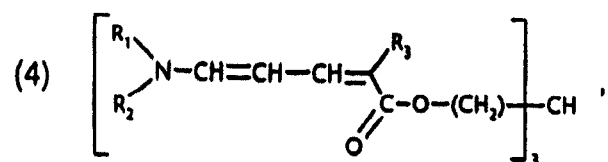
n 是 1 到 3.

11. 如权利要求 10 的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)、(2a)、(3a)或(3b)的化合物中,

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮

原子一起形成 N- 或 N-.

12. 如权利要求 1 的用途, 其中包括使用式(4)化合物,



其中，在式(4)的化合物中，

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环;

R_3 是氨基、 $-\text{COOR}_5$ 、 $-\text{CONHR}_5$ 、 $-\text{COR}_5$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_5$; 和

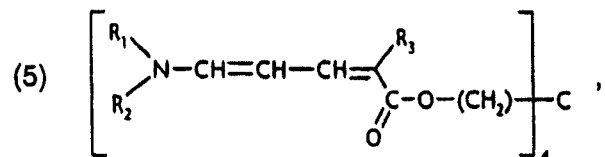
R₅ 和 R₆ 彼此独立地为 C₁-C₂₂ 烷基或 C₆-C₂₀ 芳基.

13. 如权利要求 12 的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)或(4)的化合物中,

R₁ 和 R₂ 彼此独立地为 C₁-C₂₂ 烷基; 或者 R₁ 和 R₂ 与和它们连接的

氮原子一起形成  N— 或  O—N—.

14. 如权利要求 1 或 2 的用途, 其中包括使用式(5)化合物,



其中, 在式(5)的化合物中,

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的两个氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环;

R_1 是氨基、 $-\text{COOR}_2$ 、 $-\text{CONHR}_2$ 、 $-\text{COR}_2$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_2$; 和

R_5 是 C_1 - C_{22} 烷基或 C_6 - C_{20} 芳基.

15. 如权利要求 14 的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)、(2a)或(5)的化合物中,

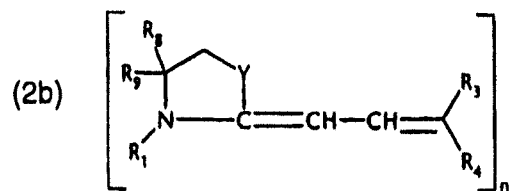
R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基; 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的

氮原子一起形成  N- 或  O N-.

16. 如权利要求 1 到 15 任意之一的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)、(2a)、(3a)、(3b)、(4)或(5)的化合物中,

Z_1 或 Z_2 是引起形成噁唑烷环、吡咯烷环或噻唑烷环的原子组。

17. 如权利要求 16 的用途, 其中对应于式(2b),



其中, 在式(2b)的化合物中,

R_8 和 R_9 彼此独立地为氢或 C_1 - C_5 烷基; 和

Y 是 $-O-$ 、 $-S-$ 或 $-CH_2-$; 和

R_1 、 R_3 、 R_4 和 n 如权利要求 1 所定义。

18. 如权利要求 17 的用途, 其中, 在式(1)、(2)、(3)、(2a)、(3a)、(3b)、(4)、(5) 或(2b)的化合物中,

R_1 是 C_1 - C_{12} 烷基;

R_3 是氰基、 $-\text{COOR}_5$ 、 $-\text{COR}_5$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_5$;

R_4 是 $-\text{COR}_6$ 或 $-\text{COOR}_6$;

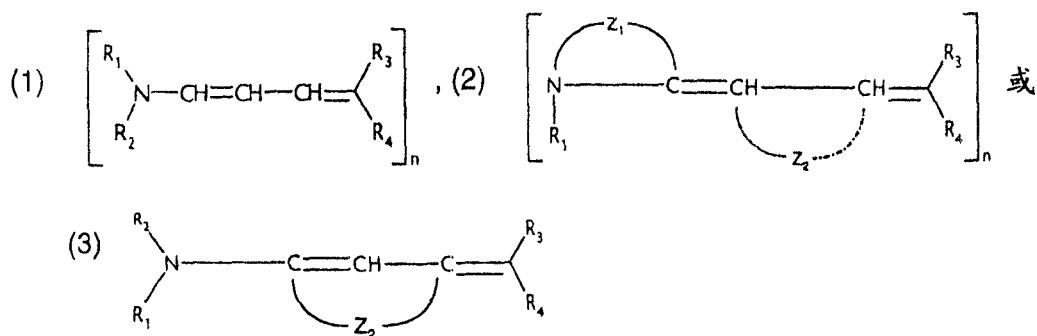
R_5 和 R_6 彼此独立地为未取代的或被 C_1 - C_5 烷基或 C_1 - C_5 烷氧基取代的 C_6 - C_{20} 芳基。

19. 含有至少一个或多个如权利要求 1 所述的式(1)或(2)化合物以及化妆品中可接受的载体或辅剂的化妆品制剂。

化妆用部花青衍生物

本发明涉及部花青衍生物在人和动物的头发及皮肤中抵御紫外线辐射的用途，还涉及包含所述化合物的化妆用组合物。

根据本发明所使用的化合物对应于式(1)、(2)或(3)



其中

R_1 和 R_2 彼此独立地为另一个 (other) 氢、 C_1 - C_{22} 烷基、环- C_3 - C_8 烷基，或未取代的或被 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 烷氧基取代的 C_6 - C_{20} 芳基，或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环；

R_3 是氰基、 $-\text{COOR}_5$ 、 $-\text{CONHR}_5$ 、 $-\text{COR}_5$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_5$ 、 $-\text{CONR}_1\text{R}_5$ ；

R_4 是氰基、 $-\text{COOR}_6$ 、 $-\text{CONHR}_6$ 、 $-\text{COR}_6$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ 、 $-\text{CONR}_2\text{R}_6$ ；

R_5 和 R_6 彼此独立地为另一个 (other) C_1 - C_{22} 烷基、环- C_3 - C_8 烷基，或未取代的或被 C_1 - C_6 烷基取代的 C_6 - C_{20} 芳基；

或 R_3 和 R_4 或 R_5 和 R_6 一起形成 5 到 7 元单环、碳环或杂环；

Z_1 和 Z_2 彼此独立地为另一个 (other) $-(CH_2)_l$ -基团，其是连续的或插入了-O-、-S-、或 $-\text{NR}_7$ -，和 / 或是未取代的或被 C_1 - C_6 烷基取代；

R_7 是 C_1 - C_5 烷基；

l 为 1 到 4；

m 为 1 到 7；

n 为 1 到 4；

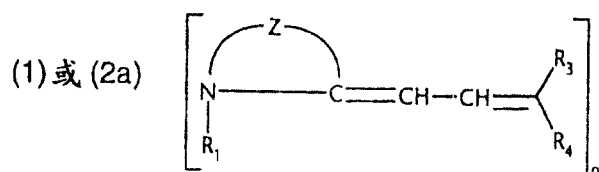
当 $n=2$ 时， R_1 、 R_5 或 R_6 是二价烷基；或 R_1 和 R_2 与两个和它们连接的氮原子一起形成 $-(CH_2)_m$ 环；

当 $n=3$ 时, R_1 、 R_5 或 R_6 是三价烷基;

当 $n=4$ 时, R_1 、 R_5 或 R_6 是四价烷基; 和

式(1)中的 R_1 和 R_2 不同时为氢。

给出了优选使用的式(1)或(2a)化合物, 其中



R_1 和 R_2 彼此独立地为另一个氢、 C_1 - C_{22} 烷基、或未取代的或被 C_1 - C_5 烷基或 C_1 - C_5 烷氧基取代的 C_6 - C_{20} 芳基, 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环;

R_3 是氰基、 $-\text{COOR}_5$ 、 $-\text{CONHR}_5$ 、 $-\text{COR}_5$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_5$;

R_4 是氰基、 $-\text{COOR}_6$ 、 $-\text{CONHR}_6$ 、 $-\text{COR}_6$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_6$;

R_5 和 R_6 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基、或未取代的或被 C_1 - C_5 烷基取代的 C_6 - C_{20} 芳基, 或 R_5 和 R_6 一起形成 5 到 7 元单环、碳环或杂环;

Z 是 $-(CH_2)_l$ -基团, 其是连续的或插入了-O-、-S-、或 $-\text{NR}_7$ -, 和 / 或是未取代的或被 C_1 - C_6 烷基取代;

R_7 是 C_1 - C_6 烷基;

l 为 1 到 4;

m 为 1 到 7;

n 为 1 到 4;

当 $n=2$ 时, R_1 、 R_5 或 R_6 是二价烷基; 或 R_1 和 R_2 与两个和它们连接的氮原子一起形成 $-(CH_2)_m$ 环;

当 $n=3$ 时, R_1 、 R_5 或 R_6 是三价烷基;

当 $n=4$ 时, R_1 、 R_5 或 R_6 是四价烷基; 和

式(1)中的 R_1 和 R_2 不同时为氢。

式(1)化合物可以 E,E-, E,Z-或 Z,Z-异构体的形式存在。

C_1 - C_{22} 烷基指的是直链或支链、未取代或被烷基如甲基、乙基、

丙基、异丙基、n-丁基、n-己基、环己基、n-癸基、n-十二烷基、n-十八烷基、二十烷基、甲氧基乙基、乙氧基丙基、2-乙基己基、羟乙基、氯丙基、N,N-二乙氧基丙基、氰乙基、苯乙基、苯甲基、p-叔-丁基苯乙基、p-叔-辛基苯氧基乙基、3-(2,4-二-叔-戊基苯氧基)-丙基、乙氧基羧甲基-2-(2-羟基-乙氧基)乙基或2-呋喃乙基取代的基团。

C₁-C₆ 烷氧基指的是甲氧基、乙氧基、n-丙氧基、异丙氧基、n-丁氧基、仲-丁氧基、叔-丁氧基、戊氧基、异戊氧基或叔-戊氧基。

C₆-C₁₀ 芳基基指的是例如苯基、甲苯基、茴香基、茱基、氯苯基、2,4-二-叔-戊苯基和萘基。

杂环包含一个、两个、三个或四个相同或不同的杂环原子。给出特别优选的杂环是包含一个、两个或三个，特别是一个或两个，相同或不同杂原子的杂环。杂环可以是单环或多环，例如单环、双环或三环。优选的是单环或双环，特别是单环。环优选包含 5、6 或 7 个环原子。出现在式(1)化合物基团中的单环和双环体系的实例可以是，例如吡咯、呋喃、噻吩、咪唑、吡唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、吡啶、哒嗪、嘧啶、吡嗪、吡喃、噻喃、1,4-二噁烷、1,2-噻、1,3-噻、1,4-噻、吡啶、苯并噻吩、苯并呋喃、吡咯烷、哌啶、哌嗪、吗啉和硫吗啉。

当 R₅ 和 R₆ 一起形成 5 到 7 元单环、碳环或杂环时，这样的环是，例如 1,3-二氧代环己烷环如双甲酮环、1,3-二氧代-5,5-二乙基环己烷环、1,3-二氮杂-2,4,6-三氧代环己烷环如巴比妥酸环、1,3-二甲基巴比妥酸环、1-苯基巴比妥酸环、1-甲基-3-辛基巴比妥酸环、1-乙基-3-辛氧基-羧乙基巴比妥酸环、1,2-二氮杂-3,5-二氧代环戊烷环如 1,2-二氮杂-1,2-二甲基-3,5-二氧代环戊烷环、1,2-二氮杂-1,2-二苯基-3,5-二氧代环戊烷环、或 2,4-二氮杂-1-烷氧基-3,5-二氧代环己烷环如 2,4-二氮杂-1-乙氧基-4-乙基-3,5-二氧代环己烷环、2,4-二氮杂-1-乙氧基-4-[3-(2,4-二-叔-戊基苯氧基)丙基]-3,5-二氧代环己烷等。

给出根据本发明优选使用的式(1)或(2)化合物，其中

R₁ 和 R₂ 彼此独立地为另一个 C₁-C₂₂ 烷基，或者 R₁ 和 R₂ 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的-(CH₂)_m 环；

R₃ 是氰基、-COOR₅、-CONHR₅、-COR₅ 或-SO₂R₅；

R₄ 是氰基、-COOR₆、-CONHR₆、-COR₆ 或-SO₂R₆；

R_5 和 R_6 彼此独立地为另一个 C_1 - C_{22} 烷基、或 C_6 - C_{20} 芳基；和 Z 如权利要求 1 所定义。

给出在这些化合物中特别优选的式(1)或(2)化合物，其中

R_3 是氰基；和

R_4 是 $-\text{CONHR}_6$ ；和

R_6 是 C_1 - C_{22} 烷基或 C_6 - C_{20} 芳基，

以及特别是其中 R_6 是 C_4 - C_{20} 烷基的式(1)或(2)化合物。

给出优选的式(1)或(2)化合物，其中

R_1 和 R_2 彼此独立地为另一个 C_1 - C_{22} 烷基，或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入 $-\text{O}-$ 或 $-\text{NH}-$ 的 $-(\text{CH}_2)_m$ 环；

R_3 是 $-\text{COOR}_5$ ；

R_4 是氰基、 $-\text{COOR}_6$ 或 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ ；

R_5 和 R_6 彼此独立地为另一个 C_1 - C_{22} 烷基、 C_6 - C_{20} 芳基；和

m 为 1 到 7。

给出在这些化合物中优选的化合物，其中

R_1 和 R_2 彼此独立地为另一个 C_1 - C_{22} 烷基，或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入 $-\text{O}-$ 或 $-\text{NH}-$ 的 $-(\text{CH}_2)_m$ 环；

R_3 是 $-\text{COOR}_5$ ；

R_4 是 $-\text{COOR}_6$ ；

R_5 和 R_6 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基、 C_6 - C_{20} 芳基；和

m 为 1 到 7；

对这些式(1)或(2)化合物，其中

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基，或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入 $-\text{O}-$ 或 $-\text{NH}-$ 的 $-(\text{CH}_2)_m$ 环；

R_3 是 $-\text{COOR}_5$ ；

R_4 是氰基；

R_5 是 C_1 - C_{22} 烷基或 C_6 - C_{20} 芳基；和

m 为 1 到 7；

对这些式(1)或(2)化合物，其中

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基, 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的氮原子一起形成连续的或插入-O-或-NH-的 $-(CH_2)_m$ 环;

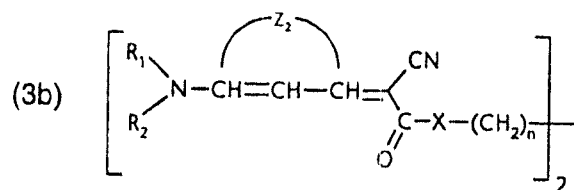
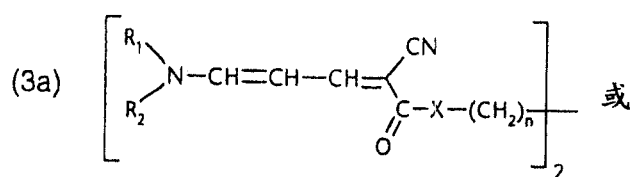
R_3 是 $-COOR_5$;

R_4 是 $-SO_2R_6$;

R_5 和 R_6 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基或 C_6 - C_{20} 芳基; 和

m 为 1 到 7。

另外给出优选使用的式(3a)或(3b)化合物, 其中



R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基, 或者 R_1 和 R_2 与两个和它们连接的氮原子一起形成 $-(CH_2)_m$ 环;

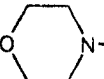
X 是-O-或-NH-;

Z_2 是 $-(CH_2)_1$ -基团, 其是连续的或插入了-O-、-S-或-NR₇-, 和/或是未取代的或被 C_1 - C_6 烷基取代; 和

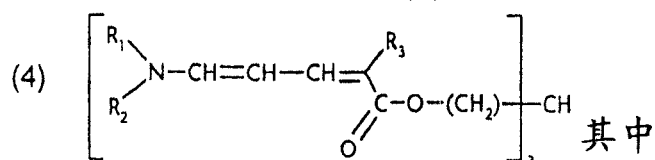
n 为 1 到 3;

特别是其中

R_1 和 R_2 彼此独立地为 C_1 - C_{22} 烷基, 或者 R_1 和 R_2 与和它们连接的

氮原子一起形成 -环或 -的式(3)化合物。

另外给出优选使用的式(4)化合物,



Y 是 -O-、-S- 或 -CH₂-;

以及

R₁、R₃、R₄ 和 n 如权利要求 1 所定义。

给出特别优选的式(2a)化合物, 其中

R₁ 是 C₁-C₁₂ 烷基;

R₃ 是氰基、-COOR₅、-COR₅ 或 -SO₂R₅;

R₄ 是 -COR₆ 或 -COOR₆; 和

R₅ 和 R₆ 彼此独立地为未取代或被 C₁-C₅ 烷基或 C₁-C₅ 烷氧基取代的 C₆-C₂₀ 芳基。

下表 MC1 中列出了根据本发明所使用的其它化合物:

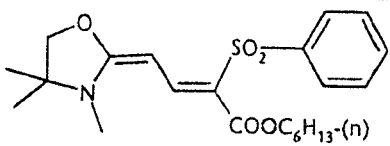
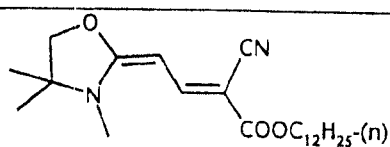
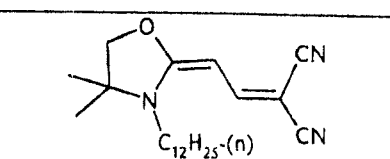
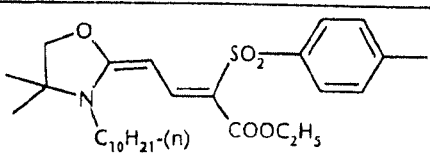
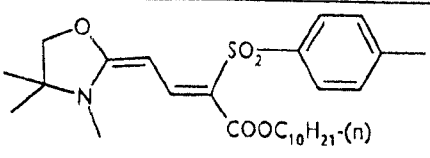
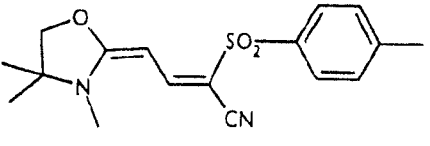
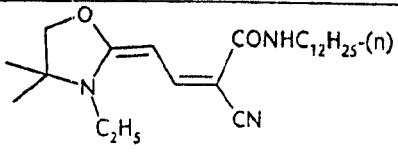
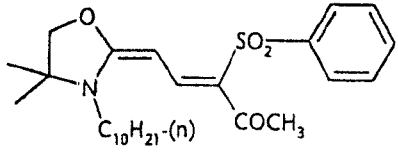
表 MC1		
通式 化合物	结构式	$\lambda_{\max}$ [nm]
MC01		362 (MeOH)
MC02		374 (MeOH)
MC03		372 (MeOH)
MC04		361 (MeOH)
MC05		362 (MeOH)
MC06		374 (MeOH)
MC07		375 (EtOH)
MC08		373 (MeOH)

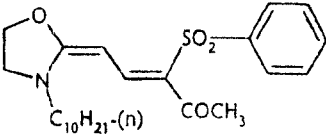
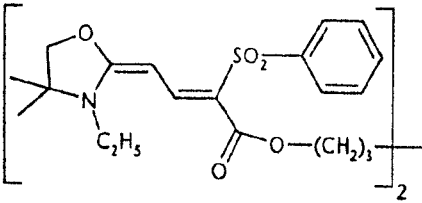
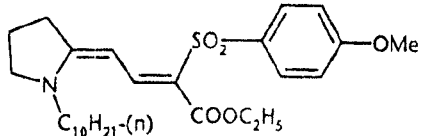
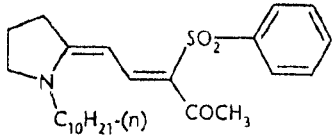
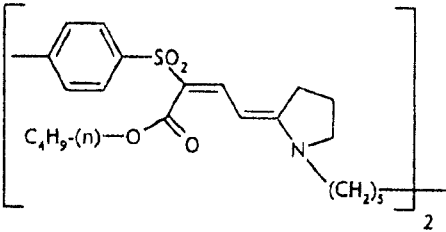
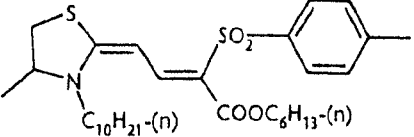
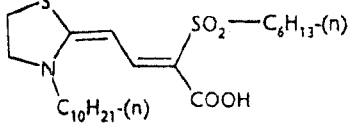
表 MC1		
通式 化合物	结构式	$\lambda_{\max}$ [nm]
MC09		370 (MeOH)
MC10		362 (MeOH)
MC11		375 (MeOH)
MC12		392 (MeOH)
MC13		380 (MeOH)
MC14		392 (MeOH)
MC15		384 (MeOH)

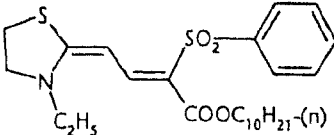
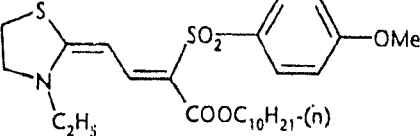
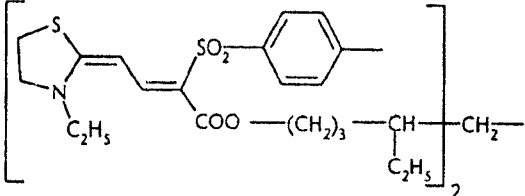
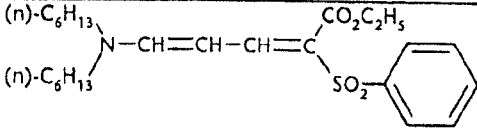
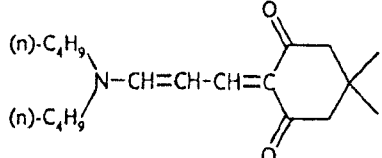
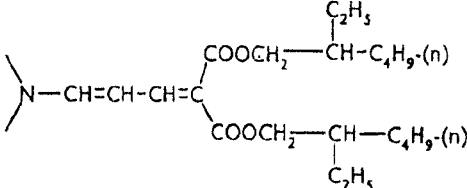
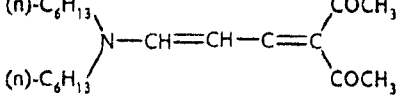
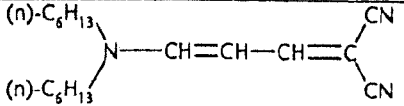
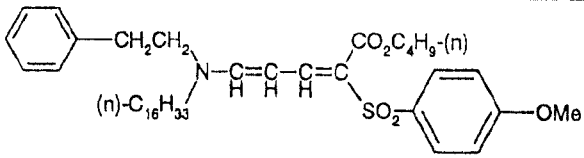
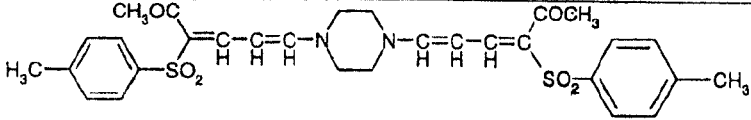
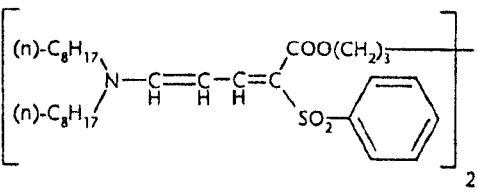
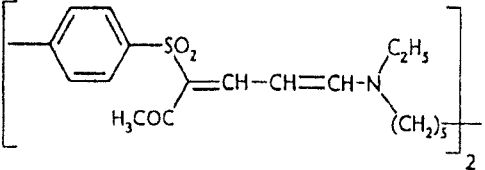
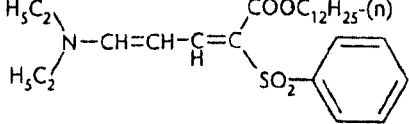
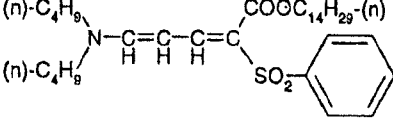
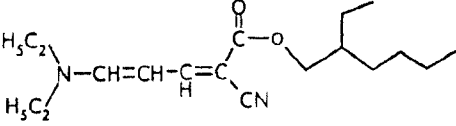
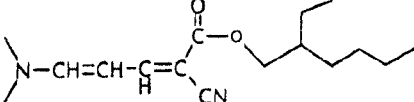
表 MC1		
通式化合物	结构式	$\lambda_{\max}$ [nm]
MC16		390 (MeOH)
MC17		385 (MeOH)
MC18		384 (MeOH)
MC19		373 (MeOH)
MC20		389 (MeOH)
MC21		374 (MeOH)
MC22		395 (MeOH)
MC23		378 (EtOH)

表 MC1		
通式 化合物	结构式	$\lambda_{\max}$ [nm]
MC24		388 (MeOH)
MC25		395 (MeOH)
MC26		374 (MeOH)
MC27		385 (MeOH)
MC28		373 (MeOH)
MC29		383 (MeOH)
MC30		385 (MeOH)
MC31		394 (MeOH)
MC32		387 (MeOH)

表 MC1		
通式 化合物	结构式	$\lambda_{\max}$ [nm]
MC33		375 (MeOH)
MC34		383 (MeOH)
MC35		374 (MeOH)
MC36		385 (MeOH)
MC37		372 (MeOH)
MC38		372 (MeOH)
MC39		380 (EtOH)
MC40		

下表 MC2 中列出了根据本发明所使用的其它部花青衍生物:

表 MC2a				
$ \begin{array}{c} \bullet \rightarrow R_1 \\ \bullet\bullet \rightarrow R_2 \end{array} \begin{array}{c} R_1 \\ \diagdown \\ N \\ \diagup \\ R_2 \end{array} -CH=CH-CH= \begin{array}{c} R_3 \\ \diagup \\ C \\ \diagdown \\ R_4 \end{array} $				
	R_1	R_2	R_3	R_4
MC41	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	-COOC ₆ H ₁₃ -(n)	COOC ₆ H ₁₃ -(n)
MC42	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	COOC ₈ H ₁₇ -(n)	COOC ₈ H ₁₇ -(n)
MC43	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	COOC ₈ H ₁₇ -(i)	COOC ₈ H ₁₇ -(i)
MC44	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	COOC ₈ H ₁₇ -(i)	CN
MC45	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	COOC ₈ H ₁₇ -(n)	CN
MC46	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	COOC ₁₀ H ₂₁ -(n)	CN
MC47	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	COOC ₁₀ H ₂₁ -(n)	SO ₂ C ₆ H ₆
MC48	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	COOC ₁₂ H ₂₅ -(n)	CN
MC49	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	COOC ₁₂ H ₂₅ -(n)	SO ₂ C ₆ H ₆
MC50	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CN	CONHC ₈ H ₁₇ -(n)
MC51	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CN	CONHC ₈ H ₁₇ -(i)
MC52	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CN	CONHC ₁₀ H ₂₁ -(n)
MC53	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CN	CONHC ₁₂ H ₂₅ -(n)
MC54	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₄ H ₉ -(n)	COOC ₄ H ₉ -(n)
MC55	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₆ H ₁₃ -(n)	COOC ₆ H ₁₃ -(n)
MC56	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₆ H ₁₃ -(n)	CN
MC57	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₆ H ₁₃ -(n)	SO ₂ C ₆ H ₆
MC58	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₈ H ₁₇ -(n)	COOC ₈ H ₁₇ -(n)
MC59	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₈ H ₁₇ -(n)	CN
MC60	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₈ H ₁₇ -(n)	SO ₂ C ₆ H ₆
MC61	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₈ H ₁₇ -(i)	COOC ₈ H ₁₇ -(i)
MC62	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₈ H ₁₇ -(i)	CN
MC63	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₈ H ₁₇ -(i)	SO ₂ C ₆ H ₆
MC64	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₁₀ H ₂₁ -(n)	CN
MC65	C ₄ H ₉ -(n)	C ₄ H ₉ -(n)	COOC ₁₀ H ₂₁ -(n)	SO ₂ C ₆ H ₆

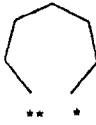
表 MC2a				
$ \begin{array}{l} * \rightarrow R_1 \\ ** \rightarrow R_2 \end{array} \begin{array}{c} \diagup \\ N-CH=CH-CH= \\ \diagdown \end{array} \begin{array}{l} R_3 \\ R_4 \end{array} $				
	R_1	R_2	R_3	R_4
MC66	$C_4H_9-(n)$	$C_4H_9-(n)$	$COOC_{12}H_{25}-(n)$	CN
MC67	$C_4H_9-(n)$	$C_4H_9-(n)$	$COOC_{12}H_{25}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC68	$C_4H_9-(n)$	$C_4H_9-(n)$	CN	$CONHC_8H_{13}-(n)$
MC69	$C_4H_9-(n)$	$C_4H_9-(n)$	CN	$CONHC_8H_{17}-(n)$
MC70	$C_4H_9-(n)$	$C_4H_9-(n)$	CN	$CONHC_8H_{17}-(i)$
MC71	$C_4H_9-(n)$	$C_4H_9-(n)$	CN	$CONHC_{10}H_{21}-(n)$
MC72	$C_4H_9-(n)$	$C_4H_9-(n)$	CN	$CONHC_{12}H_{25}-(n)$
MC73	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_4H_9-(n)$	$COOC_4H_9-(n)$
MC74	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_4H_9-(n)$	CN
MC75	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_4H_9-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC76	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_6H_{13}-(n)$	CN
MC77	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_6H_{13}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC78	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_8H_{17}-(n)$	CN
MC79	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_8H_{17}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC80	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_8H_{17}-(i)$	CN
MC81	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	$COOC_8H_{17}-(i)$	$SO_2C_6H_6$
MC82	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	CN	$CONHC_6H_{13}-(n)$
MC83	$C_8H_{17}-(i)$	$C_8H_{17}-(i)$	CN	$CONHC_8H_{17}-(n)$
MC84			$COOC_4H_9-(n)$	$COOC_4H_9-(n)$
MC85			$COOC_6H_{13}-(n)$	$COOC_6H_{13}-(n)$
MC86			$COOC_8H_{17}-(n)$	$COOC_8H_{17}-(n)$
MC87			$COOC_8H_{17}-(n)$	CN
MC88			$COOC_8H_{17}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC89			$COOC_8H_{17}-(i)$	$COOC_8H_{17}-(i)$
MC90			$COOC_8H_{17}-(i)$	CN
MC91			$COOC_8H_{17}-(i)$	$SO_2C_6H_6$
MC92			$COOC_{10}H_{21}-(n)$	CN

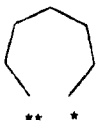
表 MC2a				
$ \begin{array}{l} * \rightarrow R_1 \\ ** \rightarrow R_2 \end{array} \begin{array}{c} \diagup \\ N-CH=CH-CH= \\ \diagdown \end{array} \begin{array}{l} R_3 \\ R_4 \end{array} $				
	R_1	R_2	R_3	R_4
MC93			$COOC_{10}H_{21}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC94			$COOC_{12}H_{25}-(n)$	CN
MC95			$COOC_{12}H_{25}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC96			CN	$CONHC_6H_{13}-(n)$
MC97			CN	$CONHC_8H_{17}-(n)$
MC98			CN	$CONHC_8H_{17}-(i)$
MC99			CN	$CONHC_{10}H_{21}-(n)$
MC100			CN	$CONHC_{12}H_{25}-(n)$
MC101			CN	$CONHC_{18}H_{37}-(n)$
MC102			$COOC_4H_9-(n)$	$COOC_4H_9-(n)$
MC103			$COOC_6H_{13}-(n)$	$COOC_6H_{13}-(n)$
MC104			$COOC_8H_{17}-(n)$	$COOC_8H_{17}-(n)$
MC105			$COOC_8H_{17}-(n)$	CN
MC106			$COOC_8H_{17}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC107			$COOC_8H_{17}-(i)$	$COOC_8H_{17}-(i)$
MC108			$COOC_8H_{17}-(i)$	CN
MC109			$COOC_8H_{17}-(i)$	$SO_2C_6H_6$
MC110			$COOC_{10}H_{21}-(n)$	CN
MC111			$COOC_{10}H_{21}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC112			$COOC_{12}H_{25}-(n)$	CN
MC113			$COOC_{12}H_{25}-(n)$	$SO_2C_6H_6$
MC114			CN	$CONHC_6H_{13}-(n)$
MC115			CN	$CONHC_8H_{17}-(n)$
MC116			CN	$CONHC_8H_{17}-(i)$
MC117			CN	$CONHC_{10}H_{21}-(n)$
MC118			CN	$CONHC_{12}H_{25}-(n)$
MC119			CN	$CONHC_{18}H_{37}-(n)$
MC120				

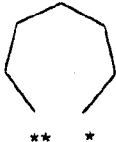
表 MC2c:			
$ \begin{array}{l} * \rightarrow R_1 \\ ** \rightarrow R_2 \end{array} \begin{array}{c} \text{N}-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-\text{R}_3 \\ \quad \quad \\ \text{H} \quad \text{H} \quad \text{H} \end{array} \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH} \end{array} $			
MC151	R_1	R_2	R_3
MC159			$\text{SO}_2\text{C}_6\text{H}_5$
MC160			CN
MC161			$\text{SO}_2\text{C}_6\text{H}_5$

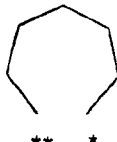
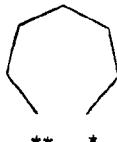
表 MC2d:			
$ \begin{array}{l} * \rightarrow \text{F} \\ ** \rightarrow \text{R}_2 \end{array} \left[\begin{array}{c} \text{R}_1 \\ \\ \text{N}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{C}-\text{R}_3 \\ \quad \quad \quad \\ \text{R}_2 \quad \quad \quad \text{O} \\ \quad \quad \quad \\ \quad \quad \quad \text{OCH}_2-\text{C} \end{array} \right]_4 $			
化合物	R_1	R_2	R_3
MC162	C_2H_5	C_2H_5	CN
MC163	C_2H_5	C_2H_5	$\text{SO}_2\text{C}_6\text{H}_5$
MC164	$\text{C}_4\text{H}_9-(n)$	$\text{C}_4\text{H}_9-(n)$	CN
MC165	$\text{C}_4\text{H}_9-(n)$	$\text{C}_4\text{H}_9-(n)$	$\text{SO}_2\text{C}_6\text{H}_5$
MC166	$\text{C}_8\text{H}_{17}-(i)$	$\text{C}_8\text{H}_{17}-(i)$	CN
MC167	$\text{C}_8\text{H}_{17}-(i)$	$\text{C}_8\text{H}_{17}-(i)$	$\text{SO}_2\text{C}_6\text{H}_5$
MC168			CN
MC169			$\text{SO}_2\text{C}_6\text{H}_5$
MC170			CN

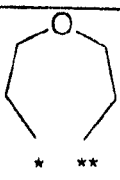
表 MC2d:		
• •• $\left[\begin{array}{c} R_1 \\ \\ N-CH:CH-CH= \\ \\ R_2 \end{array} \begin{array}{c} R_3 \\ \\ C \\ \\ O \\ \\ OCH_2 \\ \\ C \end{array} \right]_4$		
MC171	 ★ ★★	SO ₂ C ₆ H ₆

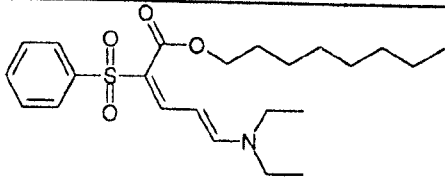
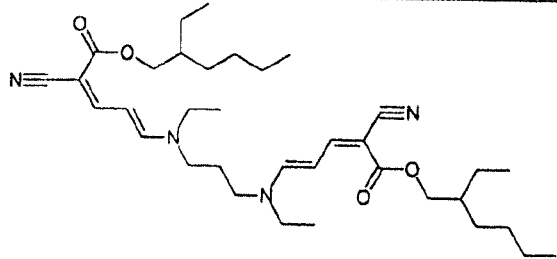
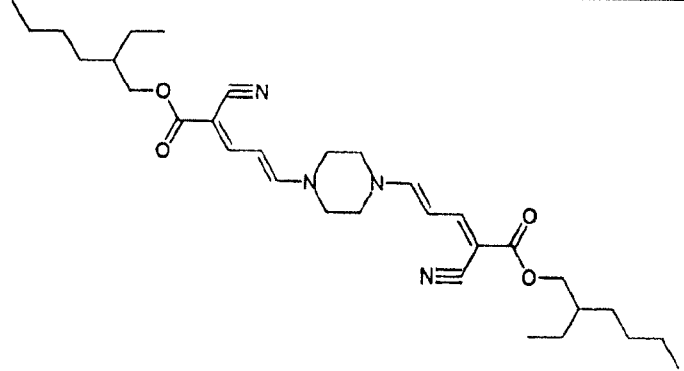
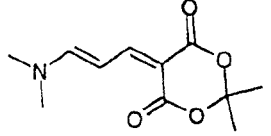
表 MC2e:	
化合物	结构式
MC172	
MC173	
MC174	
MC175	

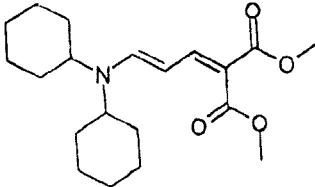
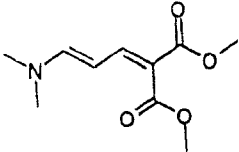
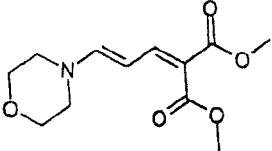
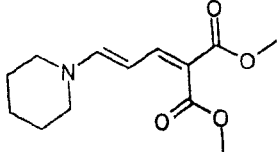
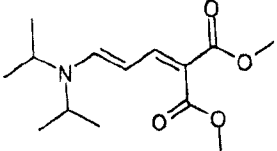
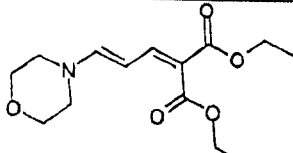
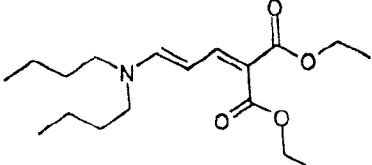
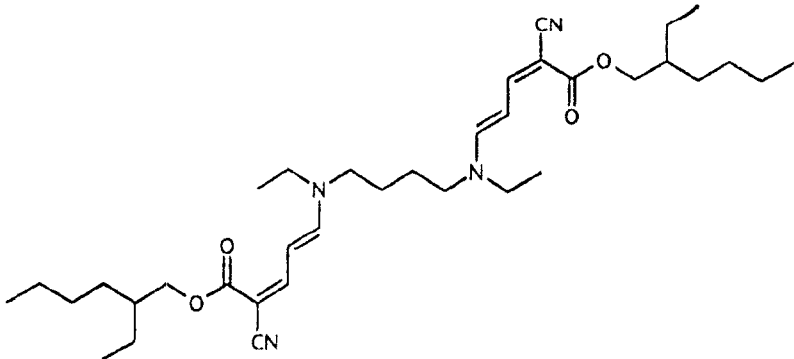
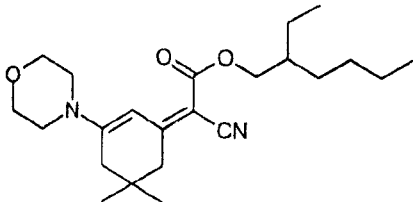
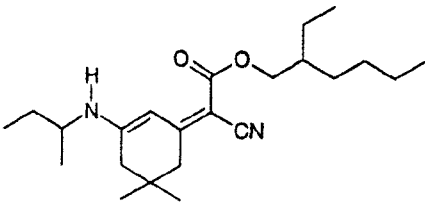
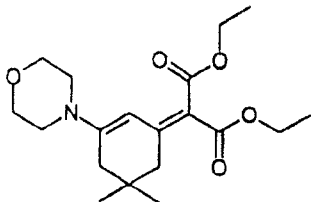
表 MC2e:	
化合物	结构式
MC176	
MC177	
MC178	
MC179	
MC180	
MC181	
MC182	

表 MC2e:	
化合物	结构式
MC183	
MC184	
MC185	
MC186	

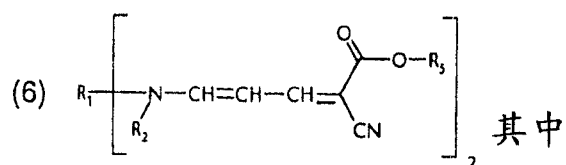
下表 MC3 中列出了根据本发明的一些选择的化合物的光谱数据:

表MC3根据本发明的一些选择的化合物的光谱数据

通式化合物	MW	$\lambda_{\max}$	ϵ	E (1%,1cm)
MC07	403.61	375	66 987	1660
MC37	477.71	371	70 217	1564
MC172	421.60	371	72 697	1724
MC39	306.45	380	62 423	2037
MC173	596.86	390	92 208	1545
MC23	287.45	378	60 076	2090
MC174	552.76	398	146 379	2650
MC187	318.46	382	65 495	2057
MC116	320.44	381	62 217	1942
MC175	225.25	383	68 073	3022
MC177	213.24	373	53 060	2488
MC178	255.27	373	37 684	1476
MC179	253.30	377	49 461	1953
MC180	269.34	378	56 849	2111
MC181	283.33	371	47 704	1684
MC182	325.45	377	60 559	1423
MC183	610.89	386 370 (sh)	110 883	2570
MC184	388.56	399 (乙腈)		
MC185	374.57	388 368 (sh) (乙腈)		
MC186	351.45	376 (乙腈)		

根据本发明所使用的式(1)或(2)部花青化合物，某些是已知化合物，但也包括新化合物。

新化合物对应于式 (6)，



R_1 是 C_1 - C_4 亚烷基;

R_2 是 C_1 - C_5 烷基, 或者 R_1 和 R_2 与两个和它们连接的氮原子一起形成 $-(\text{CH}_2)_m$ -环;

R_5 是 C_1 - C_{22} 烷基; 和

m 为 1 到 7。

根据本发明的紫外线吸收剂能在溶解状态下(可溶性有机过滤剂(filters), 助溶性有机过滤剂)或微粉化状态下(纳米级有机过滤剂, 微粒有机过滤剂, 紫外线吸收剂色素)使用。

任何已知的制造微粒的适宜方法均能用于制备微粉化紫外线吸收剂, 例如:

-湿磨法(对于可用泵抽吸分散体的低粘度微粉化方法), 具有硬磨介质, 例如球磨中的硅酸锆球, 以及在水或适宜有机溶剂中的保护性表面活性剂或保护性聚合物;

-湿捏合法(对于非可泵抽吸糊剂的高粘度微粉化方法), 使用连续或不连续(成批)捏合机。对湿捏合法来说, 可以使用溶剂(水或化妆品中可接受的油)、助磨剂(表面活性剂、乳化剂)和聚合物助磨剂。

这两种方法均优选使用。

-由适宜的溶剂喷雾干燥, 例如水溶性混悬液或含有有机溶剂的混悬液, 或在水、乙醇、二氯乙烷、甲苯或 N-甲基吡咯烷酮等中的真溶液。

-根据 RESS 法(超临界溶液的快速膨胀)使溶解有紫外线过滤剂或过滤剂的超临界液体(如 CO_2)膨胀, 或使液态二氧化碳与在适宜有机溶剂中的一个或多个紫外线过滤剂一起膨胀;

-由包括超临界液体(GASR 法=气体反相溶剂(anti-solvent)重结晶/PCA 法=与压缩的反相溶剂沉淀)的适宜溶剂再沉淀。

为了制备微粉化有机紫外线吸收剂, 可以使用研磨装置, 例如喷

射磨机、球磨机、振动磨机或锤式粉碎机，优选高速混砂机。更优选新式球磨机；生产这些类型研磨机的方法有，例如 Netzsch(LMZ 研磨机)、Drais(DCP-Viscoflow 或 Cosmo)、Buhler AG(离心粉碎机)或 Bachhofer。研磨优选在存在助磨剂的情况下进行。

制备微粉化有机紫外线吸收剂的捏合装置的实例有典型的 sigma-blade 成批 (batch) 捏合机，也可以是一系列成批捏合机 (IKA-Werke) 或连续捏合机 (来自 Werner 和 Pfleiderer 的 Continua)。

在上述所有微粉化方法中均可使用的助磨剂是以下名为“乳化剂”、“表面活性剂”和“脂肪醇”部分中公开的表面活性剂和乳化剂。

用于水分散体中的聚合物助磨剂是化妆品中可接受的 $M_n > 500 \text{ g/mol}$ 的水溶性聚合物，例如：丙烯酸酯 (Salcare 型)、修饰或未修饰的多糖、聚葡萄糖苷或黄原胶。此外可以使用烷基化乙烯吡咯烷酮聚合物、乙烯吡咯烷酮/乙烯醋酸酯共聚物、谷氨酸酰基酯、烷基聚葡萄糖苷、十六/十八醇聚氧乙烯(25)醚或磷脂。油分散体可以含有化妆品中可接受的蜡聚合物或天然蜡作为助磨剂，来调节制备中和制备后的粘度。其它可用的聚合助磨剂实例记载在以下名为“聚合物”的部分中。

可用的溶剂有水、盐水、(聚-)乙二醇、甘油或化妆品中可接受的油。其它可用的溶剂记载在以下名为“脂肪酸酯”、“天然和合成的甘油三酯，包括甘油酯及其衍生物”、“珠光蜡”、“烃油”和“硅酮或硅氧烷”部分中。

得到的微粉化紫外线吸收剂的平均粒径一般为 0.02 到 2 微米，优选 0.03 到 1.5 微米，更优选 0.05 到 1.0 微米。

根据本发明的紫外线吸收剂也可以是干粉形式。为此，紫外线吸收剂就取决于已知的研磨方法，例如真空喷雾、逆流喷雾干燥等。这样的粉末粒径为 0.1 微米到 2 微米。为了防止出现聚集，可在粉碎前用表面活性物质包裹紫外线吸收剂，例如用阴离子、非离子或两性表面活性剂，例如磷脂或已知的聚合物如 PVP、丙烯酸酯等包裹。

根据本发明的紫外线吸收剂可以用在化妆品用特定载体中，例如用在固体脂质纳米粒(SLN)或惰性溶胶微囊中，其中紫外线吸收剂被装入胶囊。

根据本发明的化妆品制剂或药物组合物也可以含有一个或多于一

个表 1-3 中记载的其它紫外线吸收剂。

化妆品或药物制剂可以用常规方法通过将紫外线吸收剂和辅形剂进行物理混合来制备，例如通过单纯搅拌各成分，尤其是利用已知的化妆品紫外线吸收剂如甲氧肉桂酸辛酯、水杨酸异辛酯等的溶解性。例如，紫外线吸收剂不必处理就可使用，或以微粉化形式或粉末形式使用。

化妆品或药物组合物含有占组合物总重 0.05%到 40%重量的一种紫外线吸收剂或紫外线吸收剂的混合物。

给出优选使用的本发明式(1)紫外线吸收剂和任选的其它光保护剂（如表 1-3 所记载）的重量混合比率，是 1:99 到 99:1，尤其是 1:95 到 95:1，优选 10:90 到 90:10。特别令人感兴趣的混合比率是 20:80 到 80:20，尤其是 40:60 到 60:40，优选大约为 50:50。使用这样的混合物尤其可改善溶解度或提高紫外线的吸收。

根据本发明的式(1)吸收剂或紫外线过滤剂组合物可用于保护皮肤、头发和/或天然或人工毛发的颜色。

表 1.可与根据本发明的紫外线吸收剂一起使用的适宜紫外线滤过物 (左栏是紫外线吸收剂的总称(范围), 右栏是具体化合物)
p-氨基苯甲酸衍生物, 例如 4-二甲基氨基苯甲酸 2-乙基己酯;
水杨酸衍生物, 例如水杨酸 2-乙基己酯;
二苯甲酮衍生物, 例如 2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮及其 5-磺酸衍生物;
二苯基丙酸酯, 例如 2-乙基己基 2-氰基-3,3-二苯基丙酸酯, 和 3-(苯并呋喃基)2-氰基丙酸酯;
3-咪唑-4-基丙烯酸和酯;
苯并呋喃衍生物, 特别是 2-(p-氨基苯基)苯并呋喃衍生物, 记载于 EP-A-582 189, US-A-5 338 539, US-A-5 518 713 和 EP-A-613 893 中;
高分子紫外线吸收剂, 例如 EP-A-709 080 记载的丙二酸苯亚甲基酯衍生物;
肉桂酸衍生物, 例如 4-甲氧基肉桂酸 2-乙基己酯和异戊基酯或 US-A-5 601 811 和 WO97/00851 记载的肉桂酸衍生物;
樟脑衍生物, 例如 3-(4'-甲基)苯亚甲基-苄烷-2-酮, 3-苯亚甲基-苄烷-2-酮, N-[2(和 4)-2-氧代亚龙脑 3-基(oxybornylidene)-甲基)-苯甲基]丙烯酰胺聚合物, 3-(4'-三甲基铵)-苯亚甲基-苄烷-2-酮甲基硫酸盐, 3,3'-(1,4-亚苯基-二次甲基)-双(7,7-二甲基-2-氧代-二环[2.2.1] 庚烷-1-甲烷磺酸)和盐, 3-(4'-硫代)苯亚甲基-苄烷-2-酮和盐; 樟脑苄烷铵 N-甲硫酸盐;
羟苯三嗪化合物, 例如 2-(4'-甲氧苯基)-4,6-双(2'-羟基-4'-n-辛基氧苯基)-1,3,5-三嗪; 2,4-双{[4-(3-(2-丙氧基)-2-羟基-丙氧基)-2-羟基]-苯基}-6-(4-甲氧苯基)-1,3,5-三嗪; 2,4-双{[4-(2-乙基-己氧基)-2-羟基]-苯基}-6-[4-(2-甲氧乙基-羧基)-苯基氨基]-1,3,5-三嗪; 2,4-双{[4-(三(三甲基甲硅氧基-甲硅烷基丙氧基)-2-羟基)-苯基]-6-(4-甲氧苯基)-1,3,5-三嗪; 2,4-双{[4-(2''-甲基丙氧基)-2-羟基]-苯基}-6-(4-甲氧苯基)-1,3,5-三嗪; 2,4-双{[4-(1',1',1',3',5',5',5'-七甲基三甲硅烷基-2''-甲基-丙氧基)-2-羟基]-苯基}-6-(4-甲氧苯基)-1,3,5-三嗪; 2,4-双{[4-(3-(2-丙氧基)-2-羟基-丙氧基)-2-羟基]-苯基}-6-[4-乙基羧基)-苯基氨基]-1,3,5-三嗪;
物理遮光剂, 包衣或未包衣, 例如二氧化钛、氧化锌、氧化铁、云母、MnO, Fe ₂ O ₃ , Ce ₂ O ₃ , Al ₂ O ₃ , ZrO ₂ (表面包衣剂: 聚甲基甲基丙烯酸酯、聚甲基硅氧烷(methicone)(CAS 9004-73-3 记载的甲基氢聚硅氧烷), 聚二甲基硅氧烷, 异丙基三异硬脂酸钛盐(如 CAS 61417-49-0 所记载), 金属皂例如硬脂酸镁(如 CAS 4086-70-8 所记载), 磷酸全氟醇酯如磷酸 C ₉ -C ₁₅ 全氟醇酯(如 CAS 74499-44-8; JP 5-86984; JP 4-330007 所记载)). 基本平均粒径为 15nm-35nm, 粒径分布在 100nm-300nm 的范围内。
DE 100 11 317, EP 1 133 980 和 EP 1 046 391 公开的氨基羟基-二苯甲酮衍生物
EP 1 167 358 公开的苯基-苯并咪唑衍生物

表2. 可与根据本发明的紫外线吸收剂一起使用的适宜紫外线滤过物

(缩写T: 表, R: 行, Comp: 化合物, Ex: 专利实施例化合物, p: 页数, 左栏是紫外线吸收剂的总称(范围), 右栏是具体化合物)

DE 10331804	T 1 p 4, T 2 + 3 p 5
EP 613 893	Ex 1-5 + 15, T 1, pp 6-8
EP 1 000 950	在表1中的化合物, pp 18-21
EP 1 005 855	T 3, p 13
EP 1 008 586	Ex 1-3, pp 13-15
EP 1 008 593	Ex 1-8, pp 4-5
EP 1 027 883	化合物 VII, p 3
EP 1 027 883	Comp I-VI, p 3
EP 1 028 120	Ex 1-5, pp 5-13
EP 1 059 082	Ex 1; T 1, pp 9-11
EP 1 060 734	T 1-3, pp 11-14
EP 1 064 922	化合物 1-34, pp 6-14
EP 1 081 140	Ex 1-9, pp 11-16
EP 1 103 549	化合物 1-76, pp 39-51
EP 1 108 712	4,5-二吗啉代-3-羟基吡嗪
EP 1 123 934	T 3, p 10
EP 1 129 695	Ex 1-7, pp 13-14
EP 1 167 359	Ex 1, p 11 和 Ex 2, p 12
EP 1 258 481	Ex 1, pp 7,8
EP 420 707 B1	Ex 3, p 13 (CAS Reg. No 80142-49-0)
EP 503 338	T 1, pp 9-10
EP 517 103	Ex 3,4,9,10 pp 6-7
EP 517 104	Ex 1, T 1, pp 4-5; Ex 8, T 2, pp 6-8
EP 626 950	所有化合物
EP 669 323	Ex 1-3, p 5
EP 780 382	Ex 1-11, pp 5-7
EP 823 418	Ex 1-4, pp 7-8
EP 826 361	T 1, pp 5-6
EP 832 641	Ex 5+6 p 7; T 2, p 8

表2. 可与根据本发明的紫外线吸收剂一起使用的适宜紫外线滤过物

(缩写T: 表, R: 行, Comp: 化合物, Ex: 专利实施例化合物, p: 页数, 左栏是紫外线吸收剂的总称(范围), 右栏是具体化合物)

EP 832 642	Ex 22, T 3, pp 10-15; T 4, p 16
EP 852 137	T 2, pp 41-46
EP 858 318	T 1, p 6
EP 863 145	Ex 1-11, pp 12-18
EP 895 776	48-58行的化合物, p 3; R 25+33, p 5
EP 911 020	T 2, p 11-12
EP 916 335	T 2-4, pp 19-41
EP 924 246	T 2, p 9
EP 933 376	Ex 1-15, pp 10-21
EP 944 624	Ex 1+2, pp 13-15
EP 945 125	T 3 a+b, pp 14-15
EP 967 200	Ex 2; T 3-5, pp 17-20
EP 969 004	Ex 5, T 1, pp 6-8
JP 2000319629	CAS Reg Nos. 80142-49-0, 137215-83-9, 307947-82-6
US 5 635 343	所有化合物 pp 5-10
US 5 338 539	Ex 1-9, pp 3+4
US 5 346 691	Ex 40, p 7; T 5, p 8
US 5 801 244	Ex 1-5, pp 6-7
WO 0149686	Ex 1-5, pp 16-21
WO 0168047	pp 85-96 表
WO 0181297	Ex 1-3, pp 9-11
WO 0238537	所有化合物 p 3, 1-10行的化合物 p 4
WO 9217461	Ex 1-22, pp 10-20
WO 9220690	在实施例3-6中聚合的化合物
WO 9301164	T 1+2, pp 13-22
WO 9714680	Ex 1-3, p 10

表 3.可与根据本发明的紫外线吸收剂一起使用的适宜紫外线滤过物
(左栏是紫外线吸收剂的总称(范围), 右栏是具体化合物)

序号	化学名称	CAS 号
1	(+/-)-1,7,7-三甲基-3-[(4-甲基苯基)亚甲基]双环-[2.2.1]庚-2-酮	36861-47-9
2	1,7,7-三甲基-3-(苯基亚甲基)]双环[2.2.1]庚-2-酮	15087-24-8
3	(2-羟基-4-甲氧基苯基)(4-甲基苯基)亚甲基酮(methanone)	1641-17-4
4	2,4-二羟基二苯甲酮	131-56-6
5	2,2',4,4'-四羟基二苯甲酮	131-55-5
6	2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮	131-57-7
7	2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮-5-硫酸	4065-45-6
8	2,2',-二羟基-4,4'-二甲氧基二苯甲酮	131-54-4
9	2,2'-二羟基-4-甲氧基二苯甲酮	131-53-3
10	α -(2-氧代亚龙脑 3-基) 甲苯-4-硫酸及其盐	56039-58-8
11	1-[4-(1,1-二甲基乙基)苯基]-3-(4-甲氧基苯基)-丙-1,3-二酮	70356-09-1
12	甲基 N,N,N-三甲基-4-[(4,7,7-三甲基-3-氧代二环[2.2.1]2-亚庚基(heptylidene))甲基]苯胺硫酸盐	52793-97-2
22	3,3,5-三甲基-环己基-2-羟基-苯甲酸酯	118-56-9
23	p-甲氧基肉桂酸异戊酯	71617-10-2
27	o-氨基苯甲酸苄基酯	134-09-8
28	水杨酸苄基酯	89-46-3
29	2-氧基-3,3-二苯丙烯酸 2-乙基己酯	6197-30-4
30	4-(二甲基氨基)苯甲酸 2-乙基己酯	21245-02-3
31	4-甲氧基肉桂酸 2-乙基己酯	5466-77-3
32	水杨酸 2-乙基己酯	118-60-5
33	苯甲酸, 4,4',4''-(1,3,5-三嗪-2,4,6-三基三亚胺)三-, 三(2-乙基己基)酯; 2,4,6-三苯胺基-(p-羧-2'-乙基己基-1'-氧代)1,3,5-三嗪	88122-99-0
34	4-氨基苯甲酸	150-13-0
35	苯甲酸, 4-氨基-, 乙基酯, 和环氧乙烷的聚合物	113010-52-9
38	2-苯基-1H-苯并咪唑-5-磺酸	27503-81-7
39	2-丙烯酰胺(propenamide), N-[[4-[(4,7,7-三甲基-3-氧代双环[2.2.1]2-亚庚基)甲基]苯基]甲基]-, 均聚物	147897-12-9
40	水杨酸三乙醇胺酯	2174-16-5

表 3.可与根据本发明的紫外线吸收剂一起使用的适宜紫外线滤过物
(左栏是紫外线吸收剂的总称(范围), 右栏是具体化合物)

41	3,3'-(1,4-亚苯基二亚甲基)双[7,7-二甲基-2-氧代双环[2.2.1]庚烷-1-甲烷磺酸]	90457-82-2
42	二氧化钛	13463-67-7
44	氧化锌	1314-13-2
45	2,2'-亚甲基-双[6-(2H-苯并三唑-2-基)-4-(1,1,3,3-四甲基-丁基)-苯酚]	103597-45-1
46	2,4-双{[4-(2-乙基己氧基)-2-羟基]-苯基}-6-(4-甲氧基苯基)-(1,3,5)-三嗪	187393-00-6
47	1H-苯并咪唑-4,6-二磺酸, 2,2'-(1,4-亚苯基)双-, 二钠盐	180898-37-7
48	苯甲酸, 4,4'-[[6-[[4-[(1,1-二甲基乙基)氨基]羰基]-苯基]氨基]1,3,5-三嗪-2,4-二基]二亚氨基]双-, 双(2-乙基己基)酯	154702-15-5
49	苯酚, 2-(2H-苯并三唑-2-基)-4-甲基-6-[2-甲基-3-[1,3,3,3-四甲基-1-[(三甲基甲硅烷基)氧代]二硅氧烷基]丙基]-	155633-54-8
50	聚二甲硅氧烷(dimethico)二乙基苯亚甲基丙二酸酯	207574-74-1
51	苯磺酸,3-(2H-苯并三唑-2-基)-4-羟基-5-(1-甲基丙基)-,一钠盐	92484-48-5
52	苯甲酸, 2-[4-(二乙氨基)-2-羟苯甲酰基]-, 己基酯	302776-68-7
53	1-十二铵, N-[3-[[4-(二甲基氨基)苯甲酰基]氨基]丙基]-N,N-二甲基-, 与 4-甲基苯磺酸(1:1)形成的盐	156679-41-3
54	1-丙铵, N,N,N-三甲基-3-[(1-氧代-3-苯基-2-丙烯基)-氨基]-, 氯化物	177190-98-6
55	1H-苯并咪唑-4,6-二磺酸, 2,2'-(1,4-亚苯基)双-	170864-82-1
56	1,3,5-三嗪, 2,4,6-三(4-甲氧基苯基)-	7753-12-0
57	1,3,5-三嗪, 2,4,6-三[4-[(2-乙基己基)氧代]苯基]-	208114-14-1
58	1-丙铵, 3-[[3-[3-(2H-苯并三唑-2-基)-5-(1,1-二甲基己基)-4-羟苯基]-1-氧丙基]氨基]-N,N-二乙基-N-甲基, 甲基硫酸酯(盐)	340964-15-0
59	2-丙烯酸, 3-(1H-咪唑-4-基) -	104-98-3
60	苯甲酸, 2-羟基-, [4-(1-甲基乙基)苯基]甲基酯	94134-93-7
61	1,2,3-丙三醇, 1-(4-氨基苯甲酸酯)	136-44-7
62	苯乙酸, 3,4-二甲氧基- α -氧代-	4732-70-1
63	2-丙烯酸, 2-氰基-3,3-二苯基-, 乙基酯	5232-99-5
64	邻氨基苯甲酸, p-苄-3-基酯	134-09-8
65	2,2'-双(1,4-亚苯基)-1H-苯并咪唑-4,6-二磺酸一钠盐或苯基二苯并咪唑四磺酸二钠盐或 Neo-Heliopan AP	349580-12-7

可与根据本发明的紫外线吸收剂一起使用的适宜紫外线滤过物是任何一种紫外线-A 和紫外线-B 的滤过物。

化妆品和药物制剂可以是，例如乳膏、凝胶、乳液、醇和水/醇溶液、乳液、蜡/脂质组合物、棒状制剂、散剂或软膏剂。除了上述紫外线滤过物以外，化妆品或药物制剂还可以含有下述辅形剂。

对于含水和油的乳液（例如 W/O, O/W, O/W/O 和 W/O/W 乳液或微乳）制剂中含有例如占组合物总重 0.1 到 30% 重量，优选 0.1 到 15% 重量，特别是 0.5 到 10% 重量的一或多个紫外线吸收剂，占组合物总重 1 到 60% 重量，特别是 5 到 50% 重量，优选 10 到 35% 重量的至少一种油成分，占组合物总重 0 到 30% 重量，特别是 1 到 30% 重量，优选 4 到 20% 重量的至少一个乳化剂，占组合物总重 10 到 90% 重量，特别是 30 到 90% 重量的水，和占组合物总重 0 到 88.9% 重量，特别是 1 到 50% 重量的其它化妆品上可接受的赋形剂。

根据本发明的化妆品或药物组合物/制剂也可以含有一或多个下述的附加化合物。

脂肪醇

基于脂肪醇的具有 6 到 18 个，优选 8 到 10 个碳原子的格尔伯特 (Guerbet) 醇，包括十六醇、硬脂醇、十六/十八醇、油醇、辛基十二烷醇、苯甲酸 C_{12} - C_{15} 醇酯、乙酰化羊毛脂醇等。

脂肪酸酯

直链 C_6 - C_{24} 脂肪酸的直链 C_3 - C_{24} 醇酯，支链 C_6 - C_{13} 羧酸的直链 C_6 - C_{24} 脂肪醇酯，直链 C_6 - C_{24} 脂肪酸的支链醇酯，尤其是 2-乙基己醇、羟基羧酸的直链或支链 C_6 - C_{22} 脂肪醇酯，尤其是苹果酸十六酯，直链和/或支链脂肪酸的多羟基醇（例如丙二醇、二醇二聚体或三醇三聚体（dimer diol or trimer triol））和/或格尔伯特醇酯，例如己酸、辛酸、2-乙基己酸、癸酸、月桂酸、异十三酸、肉豆蔻酸、棕榈酸、棕榈烯酸、硬脂酸、异硬脂酸、油酸、反油酸、岩芹酸、亚油酸、亚麻酸、桐酸、花生酸、鳕油酸、二十二酸和芥酸，及其工业级(technical-grade)混合物（例如在压力下除去天然脂肪和油得到的，在由 Roelen's 羧基合成法还原醛得到的或在饱和脂肪酸的二聚作用下得到的）和醇，

例如异丙醇、己醇、辛醇、2-乙基己基醇、癸醇、月桂醇、异十三醇、肉豆蔻醇、十六醇、棕榈烯(palmoleyl)醇、硬脂醇、异硬脂醇、油醇、反油醇、岩芹醇、亚油醇、亚麻醇、桐醇、花生醇、鳕油醇、二十二醇、芥醇和巴西烯醇及其工业级(technical-grade)混合物(例如在高压下氢化脂肪和油的工业级甲基酯得到的,或由 Roelen's 羰基合成法得到的醛,其作为不饱和脂肪醇二聚作用中的单体部分)形成的酯。

这样的酯油实例有肉豆蔻异丙酯、棕榈酸异丙酯、硬脂酸异丙酯、异硬脂酸异丙酯、油酸异丙酯、硬脂酸 n-丁酯、月桂酸 n-己酯、油酸 n-癸酯、硬脂酸异辛酯、硬脂酸异壬酯、异壬酸异壬酯、棕榈酸 2-乙基己酯、月桂酸 2-己酯、硬脂酸 2-己基癸酯、棕榈酸 2-辛基十二酯、油酸油基酯、芥酸油基酯(erucate)、油酸芥基(erucyl)酯、芥酸芥基酯、辛酸十六/十八酯、棕榈酸十六酯、硬脂酸十六酯、油酸十六酯、山嵛酸十六酯、醋酸十六酯、肉豆蔻酸肉豆蔻酯、山嵛酸肉豆蔻酯、油酸肉豆蔻酯、硬脂酸肉豆蔻酯、棕榈酸肉豆蔻酯、乳酸肉豆蔻酯、二辛酸/癸酸丙二醇酯、庚酸十八酯、苹果酸二异十八酯、羟基硬脂酸辛酯等。

其它赋形剂

2,6-萘酸二乙基己酯(naphthalate)、己二酸二-n-丁酯、己二酸二(2-乙基己基)酯、琥珀酸二(2-乙基己基)酯和醋酸二异十三酯,还有二醇酯,例如二油酸乙二醇酯、二异十三酸乙二醇酯、二(2-乙基己酸)丙二醇酯、二异硬脂酸丙二醇酯、二壬酸丙二醇酯、二异硬脂酸丁二醇酯和二辛酸新戊二醇酯。 C_6 - C_{24} 脂肪醇和/或格尔伯特醇与饱和和/或不饱和芳香羧酸,特别是苯甲酸形成的酯, C_2 - C_{12} 二羧酸与具有 1 到 22 个碳原子的直链或支链醇或具有 2 到 10 个碳原子和 2 到 6 个羟基的多元醇形成的酯,或亚氨基二琥珀酸和亚氨基二琥珀酸盐[CAS 7408-20-0]或胶乳颗粒。

天然或合成的甘油三酯,包括甘油酯及其衍生物

基于 C_6 - C_{18} 脂肪酸的通过与其它醇反应而被修饰的甘油二或三酯(甘油三辛酸/癸酸酯,麦胚甘油酯等)。聚甘油(聚甘油-n 例如聚甘油-4 癸酸酯、聚甘油-2 异硬脂酸酯等)或蓖麻油、氢化植物油、甜杏仁油、麦胚油、芝麻油、氢化棉籽油、椰子油、鳄梨油、玉米油、氢化蓖麻油、牛油树脂、可可脂、大豆油、貂油、向日葵油、红花油、

马卡达姆坚果油、橄榄油、氢化动物脂、杏仁油、榛子油、玻璃苣油等的脂肪酸酯。

蜡，包括长链酸和醇形成的酯以及具有蜡样性质的化合物，例如巴西棕榈蜡、蜂蜡（白或黄）、羊毛脂蜡、蜡大戟蜡、地蜡、日本蜡、石蜡、微精蜡、（纯）地蜡、十六/十八酯蜡、合成蜂蜡等。还有亲水性蜡例如十六/十八醇或部分甘油酯。

珠光蜡：

烯基二醇酯，特别是二硬脂酸乙二醇酯；脂肪酸烷醇酰胺，特别是可可脂肪酸二乙醇酰胺；部分甘油酯，特别是硬脂酸单甘油酯；由未取代或被羟基取代的羧酸和具有 6 到 22 个碳原子的脂肪醇形成的多价酯，特别是酒石酸的长链酯；脂肪物质，例如脂肪醇、脂肪酮、脂肪醛、脂肪醚和脂肪酸酯，其共有至少 24 个碳原子，特别是月桂酮和二硬脂酸醚；脂肪酸，例如硬脂酸、羟基硬脂酸或二十酸，具有 12 到 22 个碳原子的烯环氧化物与具有 12 到 22 个碳原子的脂肪醇和/或具有 2 到 15 个碳原子和 2 到 10 个羟基的多元醇形成的开环产物，及其混合物。

烃油：

矿物油（轻或重）、凡士林（黄或白）、微精蜡、石蜡和异石蜡化合物、氢化异石蜡分子例如聚癸烯和聚丁烯、氢化聚异丁烯、角鲨烷、异十六烷、异十二烷和其它来源于植物或动物的油。

硅酮或硅氧烷（有机取代的聚硅氧烷）

二甲基聚硅氧烷、甲基苯基聚硅氧烷、环硅酮以及氨基-、脂肪酸-、醇-、聚醚-、环氧、氟-、糖苷-和/或烷基-修饰的硅酮化合物，其在室温下可以是液体或树脂形态。直链聚硅氧烷，聚二甲硅氧烷（Dow Corning 200 fluid, Rhodia Mirasil DM）、聚二甲基硅烷醇、环硅酮液体、环戊硅氧烷挥发物（Dow Corning 345 fluid）、聚苯基三甲硅氧烷（Dow Corning 556 fluid）。适宜的还有西甲硅油，它是平均链长为 200 到 300 个二甲基硅氧烷单元的聚二甲硅氧烷和氢化硅酸盐的混合物。另外可以在 Cosm.Toil.91,27(1976)中找到 Todd 等人做出的适宜的挥发性硅酮的详细调查。

氟化或全氟化油

全氟己烷、二甲基环己烷、乙基环戊烷、聚全氟甲基异丙醚。

乳化剂

任何通常使用的乳化剂均能用在组合物中。乳化剂系统可以包含例如：羧酸及其盐：钠、钾和铵的碱性皂、钙或镁的金属皂、有机皂例如月桂、棕榈、硬酯和油酸等。烷基磷酸盐或磷酸酯、酸式磷酸盐、二乙醇酰胺磷酸酯、十六烷基磷酸钾。乙氧基羧酸或聚乙二醇酯、PEG-n 醋酸酯。直链脂肪醇，具有 8 到 22 个碳原子，支链，2 到 30mol 环氧乙烷和/或 0 到 5mol 环氧丙烷，与具有 12 到 22 个碳原子的脂肪酸和在烷基中具有 8 到 15 个碳原子的烷基苯酚（形成的酯）。脂肪醇聚二醇酯例如月桂基乙二醇醚(laureth)-n、十六/十八醇乙二醇醚-n(Ceteareth-n)、硬脂基乙二醇醚(steareth)-n、油基乙二醇醚(oleth)-n。脂肪酸聚二醇酯例如 PEG-n-硬脂酸酯、PEG-n-油酸酯、PEG-n-可可酯(cocoate)。单甘油酯和多元醇酯。C₁₂-C₂₂ 脂肪酸 1 到 30mol 环氧乙烷单和二酯与多元醇的加成产物。脂肪酸和聚甘油的酯例如甘油单硬脂酸酯、二异硬酯酰聚甘油-3-二异硬脂酸酯、聚甘油-3-二异硬脂酸酯、三甘油二异硬脂酸酯、聚甘油-2-倍半异硬脂酸酯或聚甘油二聚物酯(dimerates)。大部分这些类物质的混合物也是合适的。脂肪酸聚二醇酯例如二乙二醇单硬脂酸酯、脂肪酸和聚乙二醇酯，脂肪酸和蔗糖酯例如蔗糖酯，甘油和蔗糖酯例如蔗糖甘油酯。山梨糖醇和脱水山梨糖醇，脱水山梨糖醇脂肪酸（饱和和不饱和，具有 6 到 22 个碳原子）单-和二酯和环氧乙烷的加成产物。聚山梨酯-n 系列，脱水山梨糖醇酯例如倍半异硬脂酸酯、脱水山梨糖醇、PEG-(6)-脱水山梨糖醇异硬脂酸酯、PEG-(10)-脱水山梨糖醇月桂酸酯、PEG-17-脱水山梨糖醇二油酸酯。葡萄糖衍生物，C₈-C₂₂ 烷基-单和寡糖苷和优选作为糖成分的葡萄糖的乙氧基化类似物。O/W 乳化剂例如甲基葡萄糖基聚氧乙烯(20)醚(gluceth-20)倍半硬脂酸酯、脱水山梨糖醇硬脂酸酯/葡萄糖可可酯、甲基葡萄糖倍半硬脂酸酯、十六/十八醇/十六/十八葡萄糖苷。W/O 乳化剂例如甲基葡萄糖二油酸酯/甲基葡萄糖异硬脂酸酯。硫酸酯和磺酸酯衍生物，二烷基硫代琥珀酸酯、琥珀酸二辛酯、磺酸烷基月桂基酯、直链磺化石蜡、磺化四丙烯磺酸酯、月桂硫酸钠、硫酸铵和乙醇胺月桂酯、月桂醚硫酸酯、月桂基乙二醇醚硫酸钠、硫代琥珀酸酯、异硫代硫酸乙酰酯、硫酸链烷醇酰胺酯、氨基乙磺酸、甲基氨基乙磺酸、咪唑磺酸酯。胺衍生物、胺盐、乙氧基化胺、带有含有杂环的链

的 oxy 胺、例如烷基咪唑啉、吡啶衍生物、异喹啉、十六烷基吡啶鎓氯化物、十六烷基吡啶鎓溴化物、四价铵例如十六烷基三甲基铵溴化物 (CTBA)、十八烷基烷基鎓 (stearylalkonium)。酰胺衍生物, 链烷醇酰胺例如酰胺 DEA、乙氧基化酰胺例如 PEG-n 酰胺、氧联二酰胺 (oxydiamides)。聚硅氧烷/聚烷基/聚醚共聚物和衍生物。聚二甲硅氧烷、共聚醇 (copolyols)、硅酮聚乙氧基化物共聚物、硅酮乙二醇共聚物。丙氧基化或 POE-n 醚 (Meroxapols)、伯洛沙姆或聚(氧乙烯) m-片断 (block)-聚(氧丙烯) n-片断 (氧乙烯)。两性离子表面活性剂, 分子中带有至少一个四价铵基团和至少一个羧酸酯和/或硫酸酯基团。两性离子表面活性剂, 特别适合的是甜菜碱, 例如 N-烷基-N,N-二甲铵氨基乙酸盐、可可烷基二甲铵氨基乙酸盐、N-酰胺丙基-N,N-二甲铵氨基乙酸盐、可可酰胺丙基二甲铵氨基乙酸盐和 2-烷基-3-羧甲基-3-羟乙基咪唑啉, 每一个物质的烷基或酰基中均具有 8 到 18 个碳原子, 还有可可酰胺乙基羟乙基羧甲基氨基乙酸盐、N-烷基甜菜碱、N-烷基氨基甜菜碱。烷基咪唑啉、烷基肽、脂酰氨基酸、自乳化基质和在 K. F.DePolo 中, 一本短篇美容学教科书, 第 8 章, 表 8-7, 第 250-251 页记载的化合物。

非离子乳化剂例如 PEG-6 蜂蜡(和)PEG-6 硬脂酸酯(和)聚甘油 2-异硬脂酸酯[Apifac], 硬脂酸甘油酯(和)PEG-100 硬脂酸酯[Arlacel 165]、PEG-5 硬脂酸甘油酯[Arlatone 983 S]、脱水山梨醇油酸酯(和)聚甘油-3-蓖麻油酸盐[Arlacel 1689]、脱水山梨醇硬脂酸酯和蔗糖可可酯[Arlatone 2121]、硬脂酸甘油酯和月桂基聚氧乙烯(23)醚[Cerasynth 945]、十六/十八醇和十六烷基聚氧乙烯(20)醚[cetomacrogol 蜡]、十六/十八醇和聚山梨酯 60 和 PEG-150 和硬脂酸酯-20[palowax GP 200,palowax NF]、十六/十八醇和十六/十八聚葡萄糖苷[Emulgade PL1618]、十六/十八醇和十六/十八醇聚氧乙烯(20)醚-[Emulgade 1000NI,Cosmowax]、十六/十八醇和 PEG-40 蓖麻油[Emulgade F Special]、十六/十八醇和 PEG-40 蓖麻油和十六/十八硫酸钠[Emulgade F]、硬脂醇和硬脂基聚氧乙烯(7)醚和硬脂基聚氧乙烯(10)醚[Emulgade E 2155]、十六/十八醇和硬脂基聚氧乙烯(7)醚和硬脂基聚氧乙烯(10)醚[乳化蜡 U.S.N.F]、硬脂酸甘油酯和 PEG-75 硬脂酸酯[Gelot 64]、丙二醇十六烷基聚氧乙烯(3)醚醋酸酯[Hetester PCS]、丙二醇 isoceth-

3 醋酸酯[Hetester PHA]、十六/十八醇和十六烷基聚氧乙烯(12)醚和油基聚氧乙烯(12)醚[Lanbritol Wax N 21]、PEG-6 硬脂酸酯和 PEG-32 硬脂酸酯[Tefose 1500]、PEG-6 硬脂酸酯和十六烷基聚氧乙烯(20)醚和硬脂基聚氧乙烯(20)醚[Tefose 2000]、PEG-6 硬脂酸酯和十六烷基聚氧乙烯(20)醚和硬脂酸甘油酯和硬脂基聚氧乙烯(20)醚[Tefose 2561]、硬脂酸甘油酯和十六/十八醇聚氧乙烯(20)醚[Teginacid H,C,X]。

阴离子乳化剂例如 PEG-2 硬脂酸酯 SE、硬脂酸甘油酯 SE[Monelgine, Cutina KD]、硬脂酸丙二醇酯[Tegin P]、十六/十八醇和十六/十八硫酸钠[Lanette N, Cutina LE, Crodacol GP]、十六/十八醇和十六/十八硫酸钠[Lanette W]、三羊毛脂醇聚氧乙烯(4)醚(trilaneth-4)磷酸酯和硬脂酸甘油酯和 PEG-2 硬脂酸酯[Sedefos 75]、硬脂酸甘油酯和月桂基硫酸钠[Teginacid Special]。阳离子酸碱例如十六/十八醇和十六烷三甲基溴化铵。

乳化剂的用量可以是例如占组合物总重的 1 到 30%重量,特别是 4 到 20%重量,优选 5 到 10%重量。

当制成 O/W 乳剂时,乳化剂系统的优选量可以是油相的 5%到 20%。

赋形剂和附加剂

化妆品/药物制剂,例如乳膏、凝胶、乳液、醇和水/醇溶液、乳剂、蜡/脂混合物、棒状制剂、散剂或软膏,还可以包含温和的表面活性剂、富脂剂、稠度调节剂、增稠剂、聚合物、稳定剂、生物活性剂、除臭活性剂、去头屑剂、成膜剂、溶胀剂、其它紫外线光保护性因子、抗氧剂、水溶助长剂、防腐剂、驱虫剂、自-晒黑剂、助溶剂、芳香油、着色剂、抑菌剂及类似制剂,作为其它的赋形剂和附加剂。

富脂剂

适合用作富脂剂的物质有例如羊毛脂和卵磷脂还有聚乙氧基化或丙烯酸酯化羊毛脂和卵磷脂衍生物,多元醇脂肪酸酯,甘油单酸酯和脂肪酸链烷醇酰胺,后者同时可作为泡沫稳定剂。

表面活性剂

适宜的温和表面活性剂(也就是尤其能使皮肤较好地耐受的表面活性剂)的实例,包括脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、单酸甘油酯硫酸盐、

硫代琥珀酸单和/或二烷基酯、脂肪酸谷氨酸盐、 α -烯烴磺酸盐、醚羧酸、烷基寡葡萄糖苷、脂肪酸葡萄糖酰胺、烷基酰胺甜菜碱和/或蛋白脂肪酸浓缩产物，后者优选是基于小麦蛋白的产物。

稠度调节剂/增稠剂和流变调节剂

二氧化硅、硅酸镁、硅酸铝、多糖或其衍生物例如透明质酸、黄原胶、瓜耳胶(guar-guar)、琼脂、藻酸盐、角叉菜、gellan、果胶或被修饰的纤维素例如羟基纤维素、羟丙甲纤维素。还有聚丙烯酸酯或交联丙烯酸和聚丙烯酰胺的均聚物、卡波姆(卡波普型号 980, 981, 1382, ETD2001, ETD2020, Ultrez 10)或 Salcare 类例如 Salcare SC80(硬脂基聚氧乙烯(10)醚烯丙基醚/丙烯酸酯共聚物)、Salcare SC81(丙烯酸酯共聚物)、Salcare SC91 和 Salcare AST(丙烯酸钠共聚物/PPG-1 trideceth-6)、Sepigel 305(聚丙烯酰胺/月桂基聚氧乙烯(7)醚)、Simulgel NS 和 Simulgel EG(羟乙基丙烯酸酯/丙烯酰二甲基牛黄酸钠共聚物)、Stabilen 30(丙烯酸酯/乙烯异癸酸酯交联聚合物)、Pemulen TR-1(丙烯酸酯/ C_{10} - C_{30} 烷基丙烯酸酯交联聚合物)、Luvigel EM(丙烯酸钠共聚物)、Aculyn 28(丙烯酸酯/聚氧乙烯(25)山嵛醇醚甲基丙烯酸酯共聚物)等。

聚合物

适宜的阳离子聚合物有例如阳离子纤维素衍生物，例如季铵化羟甲基纤维素 - 从 Amerchol 得到的名为聚合物 JR400 的物质，阳离子淀粉、二丙烯铵盐和丙烯酰胺的共聚物、季铵化乙烯吡咯烷酮/乙烯咪唑聚合物，例如 Luviquat®(BASF)，聚乙二醇和酰胺的缩和产物，季铵化胶原多肽，例如月桂基二 minium(lauryldimonium)羟丙基水解胶原(Lamequat®L/Grunau)，季铵化小麦多肽，聚乙烯亚胺、阳离子硅酮聚合物，例如酰氨基聚甲基硅氧烷，脂肪酸和二甲氨基羟丙基二乙烯三胺的共聚物(Cartaretin/Sandoz)，丙烯酸和二甲基二烯丙基铵氯化物的共聚物(Merquat 550/Chemviron)，聚氨基聚酰胺，例如在 FR-A-2 252 840 中记载的，及其交联的水溶性聚合物，阳离子几丁质衍生物，例如季铵化壳聚糖，任选以微晶形式分布；二卤代烷基的缩合产物，例如二溴丁烷，和双二烷基胺，例如双二甲基氨基-1,3-丙烷，阳离子瓜耳胶，例如 Jaguar C-17, Jaguar C-16 来自 Celanese，季铵化铵盐聚合物，例如 Mirapol A-15, Mirapol AD-1, Mirapol AZ-1 来自

Miranol。可以考虑阴离子、两性离子、两性和非离子聚合物，例如醋酸乙烯酯/巴豆酸共聚物，乙烯吡咯烷酮/丙烯酸乙烯酯共聚物，醋酸乙烯酯/马来酸丁酯/丙烯酸异龙脑基酯共聚物，甲基乙烯醚/马来酸酐共聚物及其酯，非交联聚丙烯酸和与多元醇交联的聚丙烯酸，丙烯酰氧丙基三甲铵氯化物/丙烯酸酯共聚物，辛基丙烯酰胺/甲基甲基丙烯酸酯-叔-丁基氨基乙基甲基丙烯酸酯/2-羟丙基甲基丙烯酸酯共聚物，聚乙烯吡咯烷酮，乙烯吡咯烷酮/醋酸乙烯酯共聚物，乙烯吡咯烷酮/二甲基氨基乙基甲基丙烯酸酯/乙烯己内酰胺三聚物，还有任选衍生的纤维素醚和硅酮。此外，可以使用 EP 1 093 796(第 3-8 页，第 17-68 段)记载的聚合物。

生物活性成分

生物活性成分可理解为是例如生育酚、生育酚醋酸酯、生育酚棕榈酸酯、抗坏血酸、脱氧核糖核酸、视黄醇、没药醇、尿囊素、植烷三醇 (phytantriol)、泛醇、AHA 酸、氨基酸、神经酰胺、伪神经酰胺、精油、植物提取物和维生素复合物。

除臭活性成分

除臭活性成分可认为是例如抗汗剂，如水合氯化铝（参见 J.Soc.Cosm.Chem.24,281(1973)）。在 Hoechst AG，法兰克福(FRG)的商标 Locron® 中，商业上可得到的有例如水合氯化铝相应于式 $\text{Al}_2(\text{OH})_5\text{Cl} \times 2.5\text{H}_2\text{O}$ ，其用途是特别优选的（参见 J.Pharm.Pharmacol.26,531(1975)）。除氯水合物以外，还可以使用羟基醋酸铝和酸性铝/锆盐。还可以加入酯酶抑制剂作为其它的除臭活性成分。这样的抑制剂优选柠檬酸三烷基酯，例如柠檬酸三甲酯、柠檬酸三丙酯、柠檬酸三异丙酯、柠檬酸三丁酯，特别是柠檬酸三乙酯 (Hydagen CAT, Henkel)，其抑制了酶活性，因此减少了臭味的生成。还可以考虑的其它酯酶抑制剂有硫酸或磷酸固醇酯，例如硫酸或磷酸的羊毛甾醇、胆固醇、菜油甾醇、豆甾醇和谷甾醇酯，二羧酸及其酯，例如戊二酸、戊二酸单乙酯、戊二酸二乙酯、己二酸、己二酸单乙酯、己二酸二乙酯、丙二酸和丙二酸二乙酯，和羟基羧酸及其酯，例如枸橼酸、苹果酸、酒石酸或酒石酸二乙酯。影响微生物菌群和杀死或抑制汗分解菌生长的抗菌活性成分同样可以存在于制剂中（特别是棒状制剂中）。其实例包括有壳聚糖、苯氧乙醇和洗必泰葡萄糖酸酯。5-氯-

2-(2,4-二氯苯氧)-苯酚(三氯生、Irgasan, Ciba 专业化学制品公司), 也被证实具有特别的作用。

去头屑剂

可以使用的去头屑剂有例如氯咪巴唑、octopirox 和硫氧吡啶锌。

成膜剂

常规的成膜剂包括有例如壳聚糖、微晶壳聚糖、季铵化壳聚糖、聚乙烯吡咯烷酮、乙烯吡咯烷酮/醋酸乙烯酯共聚物、包含较高比例丙烯酸的季节性纤维衍生物、胶原、透明质酸及其盐和类似的化合物。

抗氧剂

除第一光保护物质以外, 还可以使用抗氧剂类第二光保护物质, 当紫外线辐射穿透皮肤或头发时其阻断了光化学反应的链引发。这种抗氧剂的典型实例有氨基酸(例如甘氨酸、组氨酸、酪氨酸、色氨酸)及其衍生物、咪唑(例如尿刊酸)及其衍生物、肽例如 D,L-肌肽、D-肌肽、L-肌肽及其衍生物(例如鹅肌肽), 类胡萝卜素、胡萝卜素、番茄红素及其衍生物、绿原酸及其衍生物、硫辛酸及其衍生物(例如二氢硫辛酸)、亚金基硫代葡萄糖(aurothioglycose)、丙硫氧嘧啶和其它硫醇(例如硫氧还蛋白、谷胱甘肽、半胱氨酸、胱氨酸、胱胺和糖基, 其 N-乙酰、甲基、乙基、丙基、戊基、丁基、月桂基、棕榈酰基、油基、亚麻基、胆固醇基及甘油基酯)及其盐、硫代二丙酸二月桂酯、硫代二丙酸二硬酯基酯、硫代二丙酸及其衍生物(酯、醚、肽、脂类、核苷酸、核苷及其盐)以及硫代肟(sulfoximine)化合物(例如丁硫肟硫代肟、高半胱氨酸硫代肟、丁硫肟砷、五、六、七-硫肟硫代肟), 还有(金属)螯合物(例如羟基脂肪酸、棕榈酸、植酸、乳铁蛋白)、羧基酸(枸橼酸、乳酸、苹果酸)、腐植酸、胆汁酸、胆汁提取物、胆红素、胆绿素、EDTA、EDDS、EGTA 及其衍生物, 不饱和脂肪酸及其衍生物(例如亚麻酸、亚油酸、油酸), 叶酸及其衍生物, 泛醌和泛醇及其衍生物, 维生素 C 及其衍生物(例如抗坏血酸棕榈酸酯、抗坏血酸磷酸镁、抗坏血酸醋酸酯), 生育酚及其衍生物(例如维生素 E 醋酸酯), 维生素 A 及其衍生物(例如维生素 A 棕榈酸酯), 还有安息香树脂的苯甲酸松柏醇酯, 芸香酸(rutinic acid)及其衍生物, 糖基芦丁, 阿魏酸, 亚糠山梨糖醇, 肌肽, 丁基羧甲苯, 丁基羧茴香醚, 去甲二氢愈创木脂酸, 三羟基丁酰苯, 尿酸及其衍生物, 甘露糖

及其衍生物, 超氧化物歧化酶, N-[3-(3,5-二叔丁基-4-羟苯基)丙酰]对氨基苯磺酸(及其盐, 例如二钠盐), 锌及其衍生物(例如 ZnO , ZnSO_4), 硒及其衍生物(例如蛋氨酸硒), 芪及其衍生物(例如芪氧化物, 反式-芪氧化物)和根据本发明的那些提及的活性成分的适宜衍生物(盐、酯、醚、糖、核苷酸、核苷、肽和脂类)。还提及了 HALS(=“阻碍胺的光稳定剂”)化合物。其它合成和天然的抗氧化剂列于例如专利 WO 0025731 中: 结构式 1-3 (第 2 页), 结构式 4 (第 6 页), 结构式 5-6 (第 7 页) 和化合物 7-33 (第 8-14 页)。

抗氧剂的存在量通常为占式(1)紫外线吸收剂重量的 0.001 到 30% 重量, 优选 0.01 到 3% 重量。

水溶助长剂

为了提高流动性, 可以使用水溶助长剂, 例如乙氧基化或非乙氧基化一醇、二醇或具有低碳原子数的多元醇或其醚(例如乙醇、异丙醇、1,2-二丙二醇、丙二醇、甘油、乙二醇、乙二醇单乙醚、乙二醇单丁醚、丙二醇单甲醚、丙二醇单乙醚、丙二醇单丁醚、二乙二醇单甲醚; 二乙二醇单乙醚、二乙二醇单丁醚及类似物)。考虑到这种用途的多元醇, 其具有优选 2 到 15 个碳原子和至少两个羟基基团。多元醇也可以含有其它官能团, 尤其是氨基, 和/或可以被氮修饰。典型的实例如下: 甘油、亚烷基二醇, 例如乙烯甘油、二乙烯甘油、丙烯甘油、丁烯甘油、己烯甘油, 还有平均分子量为 100 到 1000 道尔顿的聚乙烯甘油; 固有聚合度为 1.5 到 10 的工业级寡甘油混合物, 例如二甘油含量为 40 到 50% 重量的工业级二甘油混合物; 甲基醇化合物, 例如特别是三甲基油烷(olethane)、三甲基丙烷、三甲基丁烷、季戊四醇和二聚戊四醇; 低级烷基糖苷, 特别是那些烷基中有 1 到 8 个碳原子的物质, 例如甲基和丁基糖苷; 具有 5 到 12 个碳原子的糖醇, 例如山梨糖醇或甘露醇; 具有 5 到 12 个碳原子的糖, 例如葡萄糖或蔗糖; 氨基糖, 例如葡萄糖胺; 二醇胺, 例如二乙醇胺或 2-氨基-1,3-丙二醇。

防腐剂和抑菌剂

适宜的防腐剂包括有例如甲基、乙基、丙基和丁基对羟基苯甲酸酯, 苄烷铵氯化物, 2-溴-2-硝基-丙-1,3-二醇, 脱氢乙酸, 二偶氮烷基脒, 2-二氯-苯甲醇, DMDM 乙内酰脲, 甲醛溶液, 甲基二溴谷氨脒

(methyldibromoglutanitrile), 苯氧乙醇, 羟甲甘氨酸钠, 咪唑烷脒, 三氯生以及列于以下参考文献中的其它类物质: K.F.DePolo-短篇美容学课本, 第7章, 表7-2, 7-3, 7-4和7-5,第210-219页。

抑菌剂

抑菌剂的典型实例有具有抗葛兰氏阳性菌特定作用的防腐剂, 例如 2,4,4'-三氯-2'-羟基二苯醚, 氯己定(1,6-二(4-氯苯基-二胍基)己烷)或 TCC(3,4,4'-三氯碳酸苯胺)。许多芳香物质和芳香油也具有抗菌性。典型的实例是丁香油、薄荷油和白里香油中的活性成分定子香酚、薄荷脑和麝香草酚。感兴趣的天然除臭剂是萜烯醇金合欢醇(3,7,11-三甲基-2,6,10-十二三烯甘油-1-酯), 其存在于酸橙花油中。单月桂酸甘油酯也被证实是抑菌剂。加入的抑菌剂的量通常为占制剂固体成分的0.1到2%重量。

芳香油

此处提及的芳香油可以是天然和/或合成的芳香物质的混合物。天然的芳香物质有例如花(百合、薰衣草、玫瑰、茉莉、橙花油、香水树)、茎和叶(天竺葵、广藿香、橙叶)、果实(大茴香、芫荽、carraway、杜松)、果皮(香柠檬、柠檬、橙)、根(肉豆蔻、当归、芹菜、小豆蔻、木香、鳶尾、calmus)、木材(松木、檀香、愈创木、香柏木、红木)、草药和草(龙蒿、柠檬草、鼠尾草、麝香草)、针叶和细枝(云杉、松树、欧洲赤松、山松(mountain pine))、树脂和香胶(古蓬香胶、榄香、安息香胶、没药、乳香、红没药)的提取物。也可以考虑动物原料, 例如灵猫香和海狸香。典型的合成芳香物质有例如酯、醚、醛、酮、醇或烃类产物。酯类芳香物质化合物有例如醋酸苧酯、异丁酸苯氧乙酯、醋酸 p-叔-丁基环己酯、乙酸里哪酯、醋酸二甲基苧基甲酯、醋酸苯乙酯、苯甲酸里哪酯、甲酸苧酯、甘氨酸乙基甲基苧基、丙酸烯丙基环己酯、丙酸苏合香酯和水杨酸苧酯。醚包括例如苧基乙醚; 醛包括例如具有8到18个烃原子的直链链烷醛、柠檬醛、香茅醛、香茅基氧代乙醛、仙客来醛、羟基香茅醛、铃兰醛和 bourgeonal; 酮包括例如紫罗兰酮、异甲基紫罗兰酮和甲基柏木酮; 醇包括例如茴香醚(anethol)、香茅醇、丁子香酚、异丁香酚、香叶醇、里哪醇、苧基乙基醇和双缩松油醇; 烃主要包括萜烯和香胶。然而, 优选使用能共同发出诱人香味的不同芳香物质的混合物。挥发性相对较低的芳

香油，其主要是用作芳香化合物，也是合适的芳香油，例如鼠尾草油、春黄菊油、丁香油、蜜蜂花油、肉桂叶的油、酸橙花油、杜松子油、岩兰油、乳香油、白松香油、岩蔷薇油和杂薰衣草油。优选使用的是香柠檬油、二氢月桂烯醇、铃兰醛、lyral、香茅醇、苯基乙醇、己基肉桂醛、香叶醇、苜蓿基丙酮、仙客来醛、里哪醇、boisambrene forte、降龙涎香醚 (ambroxan)、吲哚、hedione、sandelice、柠檬油、橘子油、橙油、甘醇酸烯丙基戊酯、cyclovertal、杂薰衣草油、麝香葡萄鼠尾草油、二氢大马酮、波旁香叶油、水杨酸环己酯、甲基柏木酮、异-E-Super、Fixolide NP、扁枝衣 (evernyl)、伽马甲基紫罗兰酮、苯基醋酸、醋酸香叶酯、醋酸苜蓿酯、玫瑰氧化物、romillat、irotyl 和 floramat，单独使用或与其它物质混合。

着色剂

可用作着色剂的适宜且可用于化妆品的物质有例如在出版物 "Kosmetische Farbmittel" Farbstoffkommission der Deutschen Forschungsgemeinschaft, Verlag Chemie, Weinheim, 1984, 第 81 到 106 页中汇编的物质。着色剂的常用浓度为占混合物总量的 0.001 到 0.1 % 重量。

其它赋形剂

其它可用在化妆品制剂中的赋形剂有防沫剂例如硅酮、structurants 例如马来酸，助溶剂例如乙二醇、丙二醇、甘油或二乙二醇，遮光剂例如乳胶、苯乙稀 / PVP 或苯乙稀 / 丙烯酰胺共聚物，配位剂例如 EDTA、NTA、丙氨酸乙酰乙酸或膦酸，抛射剂例如丙烷 / 丁烷混合物、N₂O、二甲醚、CO₂、N₂ 或空气，作为氧化染料前体 - 还原剂的所谓耦合剂和显色剂有例如巯基乙酸及其衍生物、硫代乳酸、巯乙胺、硫代苹果酸或巯基乙烷磺酸，或氧化剂例如过氧化氢、溴酸钾或溴酸钠。

适宜的杀虫剂有例如 N,N-二乙基-m-甲苯甲酰胺、1,2-戊二醇或杀虫剂 3535；适宜的自-晒黑剂有例如二羟丙酮和 / 或赤醌酮糖或 WO 01/85124 记载的二羟丙酮和 / 或二羟丙酮前体，和 / 或赤醌酮糖。

作为 SPF 增强剂的聚合珠或空心球

上述紫外线吸收剂和紫外线吸收剂组合物与 SPF 增强剂，例如非活性成分如苯乙稀 / 丙烯酸酯共聚物、硅石珠、球型硅酸镁、交联聚

甲基甲基丙烯酸酯 (PMMA; Micoparl M305 Seppic) 的组合物, 能够最大限度地发挥防晒产物的紫外线保护作用。空心球添加剂 (Sunpheres[®] ISP, Silica Shells Kobo.) 可使放射线偏转, 因此增加了光子的有效路径长度 (EP 0 893 119)。前面提到的一些珠子在散布时可提供柔软的感觉。此外, 这种珠子例如 Micoparl M305 的光学活性能够通过消除反射现象来调节皮肤的光泽, 并可以间接地分散紫外光。

化妆品或药物制剂

化妆品或药物制剂包含各种化妆品制剂。可以考虑的有例如特别是下列制剂:

- 皮肤护理制剂例如片状或液体皂形式的皮肤洗涤和清洁制剂, 干清洁剂或洗涤膏;
- 洗裕制剂例如液体 (泡沫浴、乳液、淋浴制剂) 或固体洗裕制剂, 例如浴块和浴盐;
- 皮肤护理制剂例如皮肤乳液、复乳或皮肤油;
- 个人美容护理制剂, 例如日霜或粉霜 (powder creams) 形式的面部化妆品, 扑面粉 (散粉或压制粉), 口红或乳膏化妆品, 眼部护理制剂例如眼影膏制剂、睫毛膏、眼线膏、眼部乳膏或眼部修护膏 (eye-fix cream) 唇部护理制剂例如唇膏、润唇膏、唇线笔, 指甲护理制剂例如指甲油、指甲油去除剂、指甲硬化剂或角质去除剂;
- 足部护理制剂例如足浴、足粉、足膏或足香膏, 特别的除臭剂和止汗剂或除茧制剂;
- 光保护制剂例如防晒乳液 (sun milks)、乳液、乳膏或油, 防晒霜或 tropicals、预晒黑制剂或晒后用制剂;
- 皮肤晒黑制剂例如自晒黑膏;
- 脱色制剂例如漂白皮肤的制剂或皮肤增白制剂;
- 驱虫剂例如驱虫油、乳液、喷雾或棒;
- 除臭剂例如除臭喷雾、泵型喷雾剂、除臭凝胶、棒或滚球;
- 止汗剂例如止汗棒、乳膏或滚球;
- 清洁和护理损伤皮肤的制剂, 例如合成的清洁剂 (固体或液体)、剥离或擦洗制剂或剥离面膜;

- 化学品形式的除毛制剂（脱毛）例如除毛粉、液态除毛制剂，乳膏或膏状除毛制剂，凝胶形式或气雾泡沫除毛制剂；
- 剃须制剂例如剃须皂、泡沫剃须乳、无泡沫剃须乳、泡沫和凝胶、干剃须用剃须前制剂，须后水或须后乳；
- 芳香制剂例如香料(eau de Cologne, eau de toilette, eau de parfum, parfum de toilette, perfume)，芳香油或芳香乳膏；
- 美容用处理头发（cosmetic hair-treatment）的制剂，例如香波和护发剂形式的洗发制剂，头发护理制剂例如预处理制剂、养发剂、定型发膏、定型发胶、润发油、护发素、治疗面膜（treatment packs）、强化头发处理，头发造型（hair-structuring）制剂例如形成持久卷发的烫发制剂（热烫、温烫、冷烫）、头发拉直制剂、液态头发定型制剂、头发泡沫、头发定型剂，漂白制剂例如过氧化氢溶液、光亮香波（lightening shampoos）、漂白乳膏、漂白粉、漂白膏或油，暂时、半持久或持久染发剂，含有自氧化染料的制剂，或天然染发剂，例如指甲花或甘菊。

剂型

最终的制剂可以是各种陈述过的形式，例如：

- 液态制剂形式如 W/O、O/W、O/W/O、W/O/W 或 PIT 乳液以及各种类型的微乳，
- 凝胶形式，
- 油、乳膏、乳剂或乳液形式，
- 粉状、漆状、片状或化妆品形式，
- 棒状形式，
- 喷雾（抛射气体喷雾或泵喷雾）或气雾形式，
- 泡沫形式，或
- 膏状形式。

用于皮肤的特别重要的化妆品制剂是光保护制剂，例如防晒乳剂、乳液、乳膏、油、防晒霜或 tropicals，预晒黑剂或晒后制剂，还有皮肤晒黑制剂例如自晒黑乳膏。特别感兴趣的是防晒乳膏、防晒乳液、防晒乳剂和喷雾形式的防晒制剂。

用于头发的特别重要的化妆品制剂是以上提及的头发处理制剂，尤其是香波形式的洗发制剂、头发调理剂，头发护理制剂例如预处理制剂，养发剂、定型乳、定型凝胶、润发油、护发素、治疗面膜、强化头发处理，头发拉直制剂，液态头发定型制剂，头发泡沫和喷发胶。特别感兴趣的是香波形式的洗发制剂。

香波有例如以下组合物：0.01 到 5 % 重量的根据本发明的紫外线吸收剂，12.0 % 重量的月桂基聚氧乙烯(2)醚-硫酸钠，4.0 % 重量的柯卡酰胺丙基甜菜碱 (cocamidopropyl betaine)，3.0 % 重量的氯化钠，水加至 100 %。

例如，特别使用以下头发化妆品制剂：

a₁) 自乳化普通制剂，含有本发明所述的紫外线吸收剂、PEG-6-C₁₀ 含氧醇和倍半油酸山梨醇酯，加入水和任何所需的季铵化合物，例如 4 % 貂酰氨丙基 (minkamidopropyl) 二甲基-2-羟乙铵氯化物或 Quaternium 80；

a₂) 自乳化普通制剂，含有本发明所述的紫外线吸收剂、柠檬酸三丁酯和单油酸 PEG-20-山梨醇酯，加入水和任何所需的季铵化合物，例如 4 % 貂酰氨丙基二甲基-2-羟乙铵氯化物或 Quaternium 80；

b) 本发明所述的紫外线吸收剂在丁基三甘醇和柠檬酸三丁酯中的含水 (quat - doped) 溶液；

c) 本发明所述的紫外线吸收剂和 n-烷基吡咯烷酮的混合物或溶液。

这种制剂中其它的典型成分有防腐剂、杀菌剂和抑菌剂、香料、染料、色素、增稠剂、保湿剂、润湿剂、脂肪、油、蜡或美容和个人护理制剂中的其它典型成分，例如醇、多元醇 (poly-alcohols)、聚合物、电解质、有机溶剂、硅衍生物、润滑剂、乳化剂或乳化的表面活性剂、表面活性剂、分散剂、抗氧剂、抗刺激剂和抗炎剂等。

化妆品和药物制剂的实例(X=优选的组合物)O/W 系统

<u>成分</u>	<u>1</u>	<u>2</u>	<u>3</u>	<u>4</u>	<u>5</u>	<u>6</u>	<u>7</u>	<u>8</u>
<u>乳化剂</u>								
十六烷基磷酸钾 2%-5%	×							
十六/十八醇/磷酸三十二酯/磷酸十六烷基聚氧乙 烯(10)醚酯 2%-6%		×						
十八烷基邻氯甲酰苯甲酸钠 1%-2%			×					
十六/十八醇/山箭三 monium 硫酸二甲酯 1%-5%				×				
Quaternium-32 1%-5%					×			
聚二甲硅氧烷共聚醇/辛基/癸基甘油三酯 1%- 4%						×		
硬脂基聚氧乙烯(2)醚/硬脂基聚氧乙烯(21)醚 2%-5%							×	
聚甘油甲基葡萄糖二硬脂酸酯 1%-4%								×
亲脂性润肤剂/分散剂油 15%-20%	×	×	×	×	×	×	×	×
脂肪醇和/或蜡 1%-5%	×	×	×	×	×	×	×	×
增稠剂(水可溶胀增稠剂) 0.5%-1.5%	×	×	×	×	×	×	×	×
防腐剂 0.5%-1%	×	×	×	×	×	×	×	×
螯合剂(如 EDTA) 0%-0.2%	×	×	×	×	×	×	×	×
抗氧剂 0.05%-0.2%	×	×	×	×	×	×	×	×
去离子水, q.s.100%	×	×	×	×	×	×	×	×

成分	1	2	3	4	5	6	7	8
芳香油 0.1%-0.4%	×	×	×	×	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×	×	×	×	×

W/O 系统

成分	1	2	3	4	5
乳化剂	×	×	×	×	×
聚甘油-2 二聚羟基硬脂酸酯 2%-4%	×	×	×	×	×
PEG-30 二聚羟基硬脂酸酯 2%-4%		×			
油菜籽油山梨醇酯 1%-5%			×		
PEG-45/十二烷基二醇共聚物 1%-5%				×	
脱水山梨糖醇油酸酯/polycerol-3 蓖麻醇酸酯 1%-5%					×
亲脂性润滑剂/分散剂油 10%-20%	×	×	×	×	×
脂肪醇和/或蜡 10%-15%	×	×	×	×	×
电解质 (NaCl, MgSO ₄) 0.5%-1%	×	×	×	×	×
多元醇相 (丙二醇, 甘油) 1%-8%	×	×	×	×	×
防腐剂 0.3%-0.8%	×	×	×	×	×
芳香油 0.1%-0.4%	×	×	×	×	×
螯合剂 (如 EDTA) 0%-0.2%	×	×	×	×	×
抗氧剂 0.05%-0.2%	×	×	×	×	×
去离子水, q.s. 100%	×	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×	×

W/硅酮系统

<u>成分</u>	<u>1</u>	<u>2</u>	<u>3</u>	<u>4</u>
<u>乳化剂</u>				
聚二甲硅氧烷共聚醇/环甲基硅氧烷 5%-10%	×		×	
月桂基甲基硅氧烷共聚醇 5%-10%		×		×
<u>硅酮相</u>				
环戊硅氧烷 15%-25%	×			×
聚二甲硅氧烷 15%-25%		×	×	
<u>硅酮人造橡胶</u>				
聚二甲硅氧烷/乙烯基聚二甲硅氧烷交联共聚物 1%-10%	×	×	×	×
<u>保湿剂 / 多元醇</u> (丙二醇, 甘油...) 2% -8%	×	×	×	×
<u>螯合剂</u> (如 EDTA) 0%-0.2%	×	×	×	×
<u>抗氧化剂</u> 0.05%-0.2%	×	×	×	×
<u>防腐剂</u> 0.3%-0.8%	×	×	×	×
<u>芳香油</u> 0.1%-0.4%	×	×	×	×
<u>去离子水</u> q.s. 100%	×	×	×	×
<u>根据本发明的紫外线吸收剂</u> 0.1%-20%	×	×	×	×
<u>表 1-3 记载的紫外线吸收剂</u> 0%-30%	×	×	×	×

复乳

成分	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12
初乳 W1/O												
PEG-30 二聚羟基硬脂酸酯 2 %-6 %	×									×		×
十六烷基聚二甲硅氧烷共聚醇 1%-3%		×							×			
PEG-30 二聚羟基硬脂酸酯 / 硬 脂基聚氧乙烯(2)醚/硬脂基聚氧乙 烯(21)醚 4%-6%			×					×				
聚甘油-2 二聚羟基硬脂酸酯 1%-3%				×			×					
聚甘油-6 蓖麻油酸酯 1%-3%					×	×					×	
油相 15%-30%												
脂肪酸酯	×	×	×	×	×						×	×
天然和合成的甘油三酯						×	×	×	×	×	×	×
烃油	×	×	×	×	×						×	×
硅油						×	×	×	×	×	×	×
防腐剂 0.3%-0.8%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
去离子水 q.s.100%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
离子单官能团 O/W 乳化剂												
硬脂酸脱水山梨糖醇酯 / 蔗糖可 可酯 3%-7%	×							×				×
蔗糖月桂酸酯 3%-7%		×					×				×	
泊洛沙姆 407 3%-7%			×			×			×			
聚氧乙烯 (20) 山梨酸酯单油酸 酯 3%-5%				×	×					×		
初乳 W1/O 50%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
增稠剂 (水可溶胀聚合物) 0.3%-1%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×

去离子水 q.s.100%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
芳香油 0.1%-0.4%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×

O1/W/O2 乳液

成分	<u>1</u>	<u>2</u>	<u>3</u>	<u>4</u>	<u>5</u>	<u>6</u>	<u>7</u>	<u>8</u>
初乳 O1/W								
PEG-60 氢化蓖麻油 25 %	×			×	×			×
硬脂基聚氧乙烯(25)醚 25%		×	×			×	×	
油相 75 %								
脂肪酸酯	×		×					
天然和合成的甘油三酯		×		×				
烃油					×		×	

成分	<u>1</u>	<u>2</u>	<u>3</u>	<u>4</u>	<u>5</u>	<u>6</u>	<u>7</u>	<u>8</u>
硅油						×		×
防腐剂 0.3%-0.8%	×	×	×	×	×	×	×	×
去离子水 q.s.100%	×	×	×	×	×	×	×	×
非离子多官能团 W/O 乳化剂 2%-5%	×	×	×	×	×	×	×	×
蜡 1%-5%	×	×	×	×	×	×	×	×
油相 20%-30%	×	×	×	×	×	×	×	×
脂肪酸酯								
天然和合成的甘油三酯								
烃油								
硅油								
初乳 O1/W 15%	×	×	×	×	×	×	×	×

电解质(NaCl, MgSO ₄)0.1%-0.5%	×	×	×	×	×	×	×	×
去离子水, q.s.100%	×	×	×	×	×	×	×	×
芳香油 0.1%-0.4%	×	×	×	×	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×	×	×	×	×

微乳

成分	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
表面活性剂										
PEG-8 辛酸/癸酸甘油酯 10%-25%	×			×	×			×	×	
PPG-5-十六烷基聚氧乙烯(20)醚 10%-25%		×	×			×	×			×
联合-表面活性剂										
异硬脂酸聚甘油-6 酯 5%-15%	×		×							
二异硬脂酸聚甘油-3 酯 5%-15%		×		×						
二油酸聚甘油-6 酯 5%-15%					×		×			
PPG-10 十六醚 5%-15%						×		×		
乙氧基二醇 5%-15%									×	×
油相 10%-80%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
苯甲酸异硬脂基酯	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
异硬脂酸异硬脂基酯	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
PEG-7 甘油可可酯	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
环聚甲基硅氧烷	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
多元醇/保湿剂 1%-10%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
防腐剂 0.3%-0.8%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
芳香油 0.1%-0.4%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
去离子水,q.s.100%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×

O/W 喷雾乳液

成分	1	2	3	4	5	6
乳化剂						
硫酸烷基酯 0.1%-5%	×			×	×	
糖苷衍生物 0.1%-5%		×	×			×
助溶剂						
乙氧基化甘油醚 0.1%-1%	×		×			
聚山梨酯 0.1%-1%		×		×		
乙氧基化油醚 0.1%-1%					×	×
成膜剂						
PVP/VA 共聚物 1%-10%	×		×		×	
PVM/MA 共聚物 1%-10%		×		×		×
油相 5%-20%	×	×	×	×	×	×
天然油(绣线菊、霍霍巴、澳洲...)	×	×	×	×	×	×
脂肪酸酯	×	×	×	×	×	×
矿物油	×	×	×	×	×	×
硅油	×	×	×	×	×	×
醇 0%-50%	×	×	×	×	×	×
增稠剂 0.1%-0.5%	×	×	×	×	×	×
聚丙烯酸酯	×	×	×	×	×	×
硅酸铝/镁	×	×	×	×	×	×
橡胶	×	×	×	×	×	×
中和剂 0%-1%	×	×	×	×	×	×
多元醇/保湿剂 1%-5%	×	×	×	×	×	×
螯合剂(如 EDTA) 0%-0.2%	×	×	×	×	×	×
抗氧化剂 0.05%-0.2%	×	×	×	×	×	×
去离子水,q.s.100%	×	×	×	×	×	×
芳香油 0.1%-0.5%	×	×	×	×	×	×
防腐剂 0.4%-1%	×	×	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×	×	×

G-水溶液(G-Aqueous)

<u>成分</u>	<u>1</u>	<u>2</u>	<u>3</u>	<u>4</u>	<u>5</u>	<u>6</u>	<u>7</u>	<u>8</u>	<u>9</u>	<u>10</u>	<u>11</u>	<u>12</u>
增稠剂												
天然增稠剂 1%-5%	×					×	×					×
半合成增稠剂 1%-5%		×			×			×			×	
合成增稠剂 0.3%-1.3%			×	×					×	×		
中和剂 0.5%-1.5%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
多元醇-保湿剂 5%-50%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
<u>成膜剂/调理剂</u>												
聚季铵(quaternium)类 1%-5%	×	×	×				×	×	×			
PVM/MA 共聚物 1%-5%				×	×	×				×	×	×
防腐剂 0.5%-1%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×

<u>成分</u>	<u>1</u>	<u>2</u>	<u>3</u>	<u>4</u>	<u>5</u>	<u>6</u>	<u>7</u>	<u>8</u>	<u>9</u>	<u>10</u>	<u>11</u>	<u>12</u>
螯合剂(如 EDTA)<0.1%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
去离子水,q.s.100%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
芳香油 0.05%-0.4%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
<u>助溶剂</u>												
乙氧基化甘油醚 0.1%-5%	×	×	×									
聚山梨酯 0.1%-5%				×	×	×						
乙氧基化油醚 0.1%-5%							×	×	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×

油凝胶

成分	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
增稠剂										
氢化卵磷脂 1%-10%	×									×
二氧化硅二甲基甲硅烷 1%-10%		×							×	
二氧化硅 1%-5%			×					×		
C ₂₄₋₂₈ 烷基聚二甲硅氧烷 1%-5%				×			×			
硬脂酸铝或镁 1%-5%					×	×				
多元醇-保湿剂 5%-70%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
油相 20%-90%										
二辛酰醚	×					×		×		
苯基聚山甲硅氧烷		×					×			
氢化聚异丁烯			×							
异硬脂酸异丙酯				×					×	
油凝胶基质(矿物油和氢化丁烯/乙烯或乙烯/丙烯苯乙稀共聚物)					×					×
硅酮蜡 1%-10%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
山嵛酸聚二甲硅氧烷醇酯	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
硬脂酸聚二甲硅氧烷醇酯	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
芳香油 0.1%-0.5%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
抗氧化剂 0.05%-0.2%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×	×	×	×	×	×	×

淡/干化妆油(light/dry cosmetic oils)

<u>成分</u>	<u>1</u>	<u>2</u>	<u>3</u>	<u>4</u>
<u>亲脂性基质</u>				
烃油 30%-70%	×			×
脂肪酸酯,支链或非支链 10%-50%		×	×	
轻质感(light-feel)剂				
硅酮/硅氧烷 0%-10%	×		×	
全氟油 and 全氟醚 0%-10%		×		×
粘度剂(viscosifying agents) 0%-10%	×	×	×	×
蜡				
长链酸和醇的酯 0%-2%	×	×	×	×
抗氧化剂 0.1%-1%	×	×	×	×
助溶剂/分散剂 0%-5%	×	×	×	×
芳香油 0.1%-0.5%	×	×	×	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×	×	×

泡沫/摩斯制品

<u>成分</u>	
SD 醇 40 0%-8%	×
抛射剂 8%-15%	×
非离子乳化剂/表面活性剂 0.5%-3%	×
腐蚀抑制剂 0%-1%	×
芳香油 0.1%-0.5%	×
防腐剂 0.1%-1%	×
其它(miscellaneous) 0%-1%	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×

棒状制品

<u>成分</u>	
蜡 15%-30%	×
天然油和硅油 20%-75%	×
羊毛脂衍生物 5%→50%	×
羊毛脂酯	×
乙酰化羊毛脂	×
羊毛脂油	×
着色剂和色素 10%-15%	×
抗氧剂 0.1%-0.8%	×
芳香油 0.15-2%	×
防腐剂 0.1%-0.7%	×

<u>成分</u>	
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×

粉液(liquid)和粉饼

<u>成分</u>	1	2
<u>液体基质</u>		
粉相 10%-15%	×	
油相 30%-40%; 75%(仅在水形式中)	×	
增稠剂/混悬剂 1%-5%	×	
成膜聚合物 1%-2%	×	
抗氧剂 0.1%-1%	×	
芳香油 0.1%-0.5%	×	
防腐剂 0.1%-0.8%	×	
去离子水,q.s. 100%	×	
<u>压型粉体</u>		
粉相 15%-50%		×
油相 15%-50%		×

多元醇相 5%-15%		×
抗氧化剂 0.1%-1%		×
芳香油 0.1%-0.5%		×
防腐剂 0.1%-0.8%		×
对于这两个制品形式		
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×	×
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×	×

调理香波

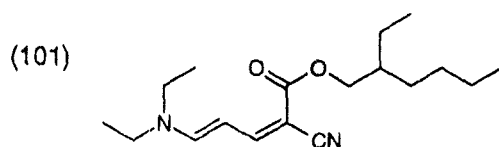
成分	1
第一表面活性剂(如前所列) 5%-10%	×
第二表面活性剂(如前所列) 5%-15%	×
泡沫稳定剂(如前所列) 0%-5%	×
去离子水,40%-70%	×
活性物(activities) 0%-10%	×
调理剂	×
重富脂剂(refatting agent)	×
保湿剂	×
增稠剂/流变调节剂 0%-3%	×
润湿剂 0%-2%	×
PH-调节剂 0%-1%	×
防腐剂 0.05%-1%	×
芳香油 0.1%-1%	×
抗氧化剂 0.05%-0.20%	×
螯合剂(EDTA) 0%-0.2%	×
遮光剂 0%-2%	×
根据本发明的紫外线吸收剂 0.1%-20%	×

成分	1
表 1-3 记载的紫外线吸收剂 0%-30%	×

在以下实施例中，百分比是重量百分比。

制备实施例

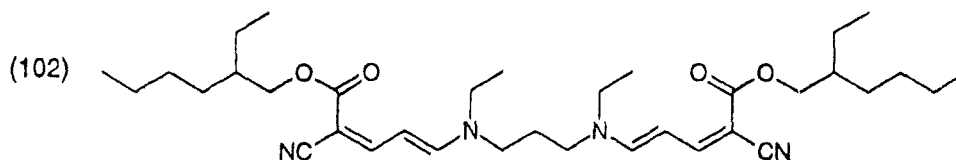
实施例 1: 制备式(101)化合物



将 N-(3-苯胺基-亚丙烯基)-苯胺(4.5g,0.02mol)和氰基醋酸 2-乙基己酯(4.2g,0.021mol)在 10ml 乙酰氢化物(acetanhydride)中于 85-90°C 搅拌 2 小时。真空除去多余的乙酰氢化物后，将反应物(reaction batch)倒入冰中，过滤得到的沉淀物，并用大量水洗涤。60°C 真空干燥后，将中间产物置于 10ml 干燥乙醇中，再加入二乙胺(3.1g,0.042mol)。反应混合物在 50-55°C 下搅拌 2 小时。然后真空蒸馏乙醇和多余的胺。将甲苯和丙酮混合物(9.5:0.5)中的剩余物在硅胶 60(来自 Merck)中分流过滤并分离。60°C 高真空下干燥纯产物。

产率: 4.5g(理论值 73.5%)。

实施例 2: 制备式(102)化合物



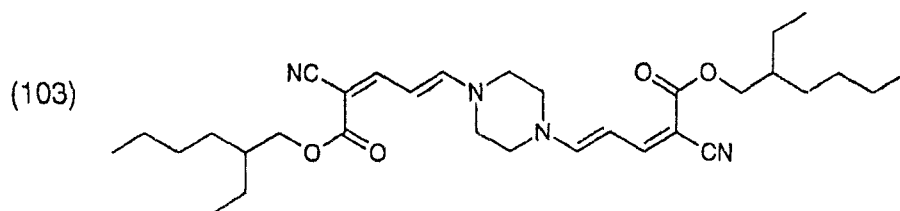
将 N-(3-苯胺基-亚丙烯基)-苯胺(4.5g,0.02mol)和氰基醋酸 2-乙基己酯(4.2g,0.021mol)在 10ml 乙酰氢化物中于 85-90°C 搅拌 2 小时。真空除去多余的乙酰氢化物后，将反应物倒入冰中，过滤得到的沉淀物，并用大量水洗涤。60°C 真空干燥后，将中间产物置于 10ml 干燥乙醇

中，再加入二乙基-1,3-丙二胺(3.1g,0.01mol)。

反应混合物在 50°C 下搅拌 2 小时。然后蒸馏尽乙醇，将甲苯和丙酮混合物(9:1)中的剩余物在硅胶 60(来自 Merck)中分流过滤并分离。60°C 高真空下干燥纯产物。

产率：4.4g(理论值 73%)。

实施例 3：制备式(103)化合物



将 N-(3-苯胺基-亚丙烯基)-苯胺(4.5g,0.02mol)和氰基醋酸 2-乙基己酯(4.2g,0.021mol)在 10ml 乙酰氢化物中于 85-90°C 搅拌 2 小时。真空除去多余的乙酰氢化物后，将反应物倒入冰中，过滤得到的沉淀物，并用大量水洗涤。60°C 真空干燥后，将中间产物置于 10ml 干燥乙醇中，再加入哌嗪(0.8g,0.01mol)。50-55°C 下搅拌 2 小时后，真空蒸馏尽乙醇。然后经过硅胶 60(来自 Merck)柱色谱，使用甲苯和丙酮的混合物(9:1)洗脱，得到纯产物，产物在 60°C 真空下干燥。产率：3.9g(理论值 69%)。

应用实施例

实施例 4：O/W 乳液

(A):

式(101)紫外线吸收剂	3g
芝麻油	10g
硬脂酸甘油酯	4g
硬脂酸	1g
十六醇	0.5g
聚山梨酯 20	0.2g

(B):

丙二醇	4g
尼泊金丙酯	0.05g
尼泊金甲酯	0.15g
三乙醇胺	0.1g
卡波姆 934	0.1g
水	加至 100ml

制备乳液

相(A):

首先，将紫外线吸收剂溶于芝麻油中。然后加入其它(A)成分并混合。

相(B):

将尼泊金丙酯和尼泊金甲酯溶于丙二醇中。然后加入 60ml 水，加热到 70°C，然后使卡波姆 934 在其中乳化。

乳液:

应用机械能在强力搅拌下将(A)缓慢加入(B)中。加水调节至 100ml。

实施例 5: 日常护理霜, O/W 型

	<u>INCI 名称</u>	<u>% W/W</u> <u>(使用)</u>
A 部分	硬脂酸甘油酯(和)十六/十八醇(和)棕榈酸十六酯 (和)可可甘油酯	4.0
	十六/十八醇聚氧乙烯(12)醚	4.0
	十六/十八醇	2.0
	二辛酰醚	4.5
	硬脂酸乙基己酯	4.0
	月桂酸己酯	3.5
	乙基己基三嗪酮	1.0
	苯亚甲基丙二酸酯聚硅氧烷	2.0
	HDI/三甲基醇己内酯交联共聚物(和)二氧化硅	5.0
	硬脂基聚二甲硅氧烷	1.0
	聚二甲硅氧烷	2.0
	十六醇	0.8
	式(101)化合物	2.0
B 部分	水	Q.s.100
	水(和)scleroglucan(和)苯氧乙醇	2.0
	甘油	2.0
C 部分	硬脂基聚氧乙烯(10)醚烯丙醚 / 丙烯酸酯共聚物	0.45
	苯氧乙醇(和)尼泊金甲酯(和)尼泊金乙酯(和)尼泊 金丁酯(和)尼泊金丙酯(和)尼泊金异丁酯	0.7

	<u>INCI 名称</u>	<u>% W/W</u> <u>(使用)</u>
D 部分	水(和)生育酚醋酸酯(和)甘油三辛酸/癸酸酯(和) 聚山梨酯 80(和)卵磷脂	4.0
E 部分	水(和)氢氧化钠	q.s.
	芳香剂	q.s.

制备过程:

分别将 A 部分和 B 部分加热至 80°C。把 A 部分倒入 B 部分中，不断搅拌。然后用 Ultra Turrax 在 11000rpm 下均化混合物 20 秒。混合物冷却到 60°C，加入 C 部分。在低于 30°C 的温度下加入 D 部分，用氢氧化钠调节 pH 值至 6.5 和 7.0 之间。最后加入芳香剂。

实施例 6: 防晒霜, O/W 型

<u>INCI 名称</u>		<u>%(W/W)</u> <u>(使用)</u>
A 部分	聚甘油-3 甲基葡萄糖二硬脂酸酯	2.0
	油酸癸酯	5.7
	棕榈酸异丙酯	5.8
	甘油三辛酸/癸酸酯	6.5
	式(101)化合物	2.0
	甲氧基肉桂酸乙基己酯	5.0
	十六醇	0.7
B 部分	甘油	3.0
	卡波姆	0.3
	水	q.s.100
C 部分	苯氧乙醇(和) 尼泊金甲酯(和)尼泊金乙酯 (和)尼泊金丁酯(和)尼泊金丙酯(和)尼泊金异 丁酯	0.5
D 部分	亚甲基双-苯并三嗪四甲基丁基苯酚(和)水 (和)癸基葡萄糖苷(和)丙二醇(和)黄原胶	8.0
	水	20.0
E 部分	水(和)氢氧化钠	q.s.
	芳香剂	q.s.

制备过程:

分别将 A 部分和 B 部分加热至 75°C。把 A 部分倒入 B 部分中，不断搅拌。用 Ultra Turrax 在 11000rpm 下均化混合物 15 秒。混合物冷却到 60°C，加入 C 部分和 D 部分。混合物再均化一小段时间(5 秒/11000rpm)然后在缓和搅拌下冷却。在室温下，以氢氧化钠溶液调节

pH 值至 5.5 和 6.0 之间。最后加入芳香剂。

实施例 7: 日常护理紫外线-防护乳液

<u>INCI 名称</u>		<u>%(W/W)</u> <u>(使用)</u>
A 部分	油基聚氧乙烯(3)醚磷酸酯	0.8
	硬脂基聚氧乙烯(21)醚	2.5
	硬脂基聚氧乙烯(2)醚	1.0
	十六醇	0.8
	硬脂醇	1.5
	三山嵛 (tribehenin)	0.8
	异十六烷	8.0
	式(101)化合物	5.0
B 部分	水	q.s.100
	甘油	2.0
	亚甲基双-苯并三嗪四甲基丁基苯酚(和)水(和)	3.0
	癸基葡糖苷(和)丙二醇(和)黄原胶	
	EDTA 二钠	0.1
C 部分	水	20.0
	二偶氮烷基脲(和)氨基甲酸碘丙炔丁酯	0.15
	丙二醇	4.0
D 部分	丙烯酸钠共聚物(和)液体石蜡(和)PPG-1 三癸基聚氧乙烯(6)醚	1.5
	环戊硅氧烷	4.5
	PEG-12 聚二甲硅氧烷	2.0
	生育酚醋酸酯	0.45
	水(和)枸橼酸	q.s.
	E 部分 芳香剂	q.s.

制备过程:

分别将 A 部分和 B 部分加热至 75°C。把 A 部分倒入 B 部分中, 不断搅拌。乳化后立即加入 D 部分中的 SF1202 和 SF1288 混合物。

然后用 Ultra Turrax 在 11000rpm 下均化混合物 30 秒。冷却到 65°C，并加入 SALCARE®SC91。在低于 50°C 的温度下加入 C 部分。在 35°C 或低于 35°C 下加入维生素 E 醋酸酯，然后以枸缘酸调节 pH 值。在室温下加入 E 部分。

实施例 8: 防晒霜, O/W 型

<u>INCI 名称</u>		<u>%(W/W)</u> <u>(使用)</u>
A 部分	聚甘油 - 3 甲基葡萄糖二硬脂酸酯	0.8
	油酸癸酯	2.5
	棕榈酸异丙酯	1.0
	甘油三辛酸 / 癸酸酯	0.8
	式(101)化合物	1.5
	甲氧基肉桂酸乙基己酯	0.8
	十六醇	8.0
B 部分	甘油	3.0
	卡波姆	0.3
	水	q.s.100
C 部分	苯氧乙醇(和)尼泊金甲酯(和)尼泊金乙酯(和)尼泊金丁酯(和)尼泊金丙酯(和)尼泊金异丁酯	0.5
D 部分	亚甲基双-苯并三嗪四甲基丁基苯酚(和)水(和)癸基葡萄糖苷(和)丙二醇(和)黄原胶	8.0
	水	20.0
E 部分	水(和)氢氧化钠	q.s.
	芳香剂	q.s.

制备过程:

分别将 A 部分和 B 部分加热至 75°C。把 A 部分倒入 B 部分中，不断搅拌。用 Ultra Turrax 在 11000rpm 下均化混合物 15 秒。混合物冷却到 60°C，加入 C 部分和 D 部分。混合物再均化一小段时间(5 秒/11000rpm)。在缓和搅拌下再次冷却后，在室温下以氢氧化钠调节 pH 值。得到 pH 值在 5.50 和 6.00 之间的溶液。最后加入芳香剂。

实施例 9: 防晒霜, O/W 型

<u>INCI 名称</u>		<u>%(W/W)</u> <u>(使用)</u>
A 部分	聚甘油-3 甲基葡萄糖二硬脂酸酯	2.0
	油酸癸酯	5.7
	棕榈酸异丙酯	5.8
	甘油三辛酸/癸酸酯	6.5
	式(101)化合物(50%)和 Uvinul A Plus CAS 登记 号 302776-68-7(50%)的混合物	2.0
	甲氧基肉桂酸乙基己酯	5.0
	十六醇	0.7
B 部分	甘油	3.0
	卡波姆	0.3
	水	q.s.100
C 部分	苯氧乙醇(和)尼泊金甲酯(和)尼泊金乙酯(和)尼泊 金丁酯(和)尼泊金丙酯(和)尼泊金异丁酯	0.5
D 部分	亚甲基双-苯并三嗪四甲基丁基苯酚(和)水(和)癸 基葡萄糖苷(和)丙二醇(和)黄原胶	8.0
	水	20.0
E 部分	水(和)氢氧化钠	q.s.
	芳香剂	q.s.

制备过程:

分别将 A 部分和 B 部分加热至 75°C。把 A 部分倒入 B 部分中, 不断搅拌。用 Ultra Turrax 在 11000rpm 下均化混合物 15 秒。冷却到 60°C 后, 加入 C 部分和 D 部分。混合物再均化一小段时间(5 秒/11000rpm)。在缓和搅拌下再次冷却后, 于室温下以氢氧化钠溶液调节 pH 值至 5.50 和 6.00 之间。最后加入芳香剂。

实施例 10: 防晒霜, O/W 型

<u>INCI 名称</u>		<u>%(W/W)</u> <u>(使用)</u>
A 部分	聚甘油-3 甲基葡萄糖二硬脂酸酯	2.0
	油酸癸酯	5.7
	棕榈酸异丙酯	5.8
	甘油三辛酸/癸酸酯	6.5
	式(101)化合物(50%)和苯亚甲基卡波姆, CAS 登记号 36861-47-9(50%)的混合物	2.0
	甲氧基肉桂酸乙基己酯	5.0
	十六醇	0.7
B 部分	甘油	3.0
	卡波姆	0.3
	水	q.s.100
C 部分	苯氧乙醇(和)尼泊金甲酯(和)尼泊金乙酯(和)尼泊金丁酯(和)尼泊金丙酯(和)尼泊金异丁酯	0.5
D 部分	亚甲基双-苯并三嗪四甲基丁基苯酚(和)水(和)癸基葡萄糖苷(和)丙二醇(和)黄原胶	8.0
	水	20.0
E 部分	水(和)氢氧化钠	q.s.
	芳香剂	q.s.

制备过程:

分别将 A 部分和 B 部分加热至 75°C。把 A 部分倒入 B 部分中, 不断搅拌。用 Ultra Turrax 在 11000rpm 下均化混合物 15 秒。冷却到 60°C 后, 加入 C 部分和 D 部分。混合物再均化一小段时间(5 秒/11000rpm)。在缓和搅拌下再次冷却后, 于室温下以氢氧化钠调节 pH 值。得到 pH 值在 5.50 和 6.00 之间的溶液。最后加入芳香剂。