

[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int. Cl⁶

C07C235/08

A61K 7/02

[12]发明专利说明书

A61K 7/075 A61K 7/04

A61K 7/40 A61K 7/48

[21] ZL 专利号 94112831.8

[45]授权公告日 1999 年 5 月 5 日

[11]授权公告号 CN 1043227C

[22]申请日 94.10.12 [24]颁证日 98.12.25

[21]申请号 94112831.8

[30]优先权

[32]93.10.12 [33]FR [31]9312106

[73]专利权人 奥里尔股份有限公司

地址 法国巴黎

[72]发明人 D·塞麦里亚 M·菲利普

C·马海犹

[56]参考文献

EP500437A1 1992. 8.26 C07C233/20

审查员 刘桂明

[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

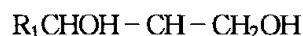
代理人 杜京英

权利要求书 6 页 说明书 29 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 神经酰胺、它的制备方法及其在化妆品和
皮肤药品方面的应用

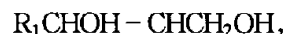
[57]摘要

本发明的神经酰胺是满足下述化学式的化合物:



NHCOR₂ 式中:R₁是 C₁₁-C₂₁烷基或

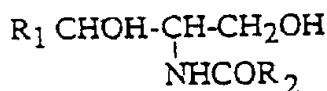
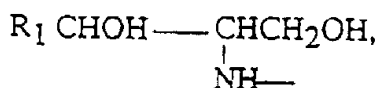
烯基;R₂是 C₁-C₂₉直链或支链羟烷基,或 C₇-C₂₉羟芳
烷基,这些化合物呈赤式与苏式非对映异构的外消旋混
合物形式,对于氨基醇部分:



NH-

赤式与苏式之比为 85:15 至 20:80。

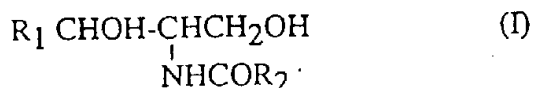
应用于化妆品与皮肤药品的组合物。



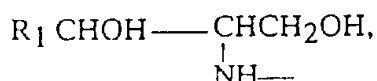
ISSN 1008-4274

权 利 要 求 书

1.一种化合物，其特征在于它满足下述化学式：



式中， R_1 是 $C_{11} - C_{21}$ 烷基或烯基，优选为 $C_{13} - C_{19}$ 烷基或烯基； R_2 是 $C_1 - C_{29}$ 直链或支链羟烷基，或 $C_7 - C_{29}$ 羟芳烷基，羟基处于羰基 α 位，该化合物呈赤式或苏式非对映异构的外消旋混合物形式，对于氨基二醇



其中赤式与苏式之比为 85：15 至 20：80。

2.根据权利要求 1 的化合物，其特征在于赤式与苏式之比为 65：35 至 45：55。

3.根据权利要求 1 或 2 所述的化合物，其特征在于 R_1 是十五烷基。

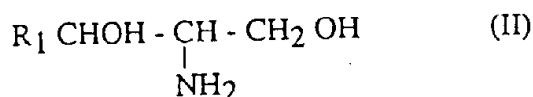
4.根据权利要求 1 或 2 所述的化合物，其特征在于 R_2 选自于 1-羟基十五烷基、1-羟基廿一烷基和 D.L-1-羟基苯甲基。

5.根据权利要求 1 或 2 所述的化合物，其特征在于它们选自于 2-(2'-羟基十六酰基)氨基十八烷-1，3-二醇，2-(2'-羟基二酰基)氨基十八烷-1，3-二醇和 2-(D.L-扁桃酰基)氨基十八烷-1，3-二醇。

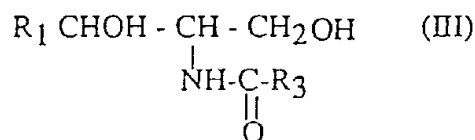
6.制备权利要求 1 所述化学式 (I) 化合物的方法，其特征在

于它包括:

(a)在无水介质中或在适宜的溶剂存在下将具有下述化学式的鞘氨醇或二氢鞘氨醇的胺官能团酰化:



其中 R_1 是 $C_{11} - C_{21}$ 烷基或烯基, 这种化合物是赤式与苏式非对映异构体的外消旋物, 其赤式 - 苏式比例为 85: 15 至 20: 80, 使用的酰化剂选自于: 酰氯、酸酐、混合酸酐、对硝基苯酚酯、琥珀酰亚胺酯、碳二亚胺酯、 $C_1 - C_8$ 低级烷基酯、唑系化合物和相应的 2 - 羟基酸的 O - 羧酸酐, 这样得到具有下述化学式的化合物:



式中 R_1 是如前面所定义, R_3 代表 R_2 基或选自于下述的基团: $C_1 - C_{29}$ 直链或支链烷基, 或在相对于羰基的 α 位取代的 $C_7 - C_{29}$ 芳烷基, 而取代基选自于 - Br、- Cl、- I 和 - OB、而 - OB 是能生成 - OH 的基团;

(b)分离化学式 (III) 化合物, 以及

(c)或许, 当 R_3 与 R_2 不同时, 水解所得到的化学式 (III) 的化合物, 以便将 - OB 基转化成羟基。

7. 根据权利要求 6 所述的方法, 其特征在于在化学式 (II) 的鞘氨醇或二氢鞘氨醇的胺官能团的酰化步骤之后, 在分离化学式 (III) 化合物步骤(b)之前, 该方法包括一个保护羟基的步骤,

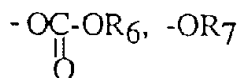
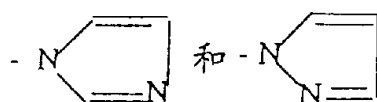
该步骤在于在由步骤(2)得到的混合物中, 让选自于酸酐、酰卤和氯硅烷的 - OH 基保护剂进行反应; 并在分离化学式(III)化合物的步骤(b)之后, 水解化学式(III)化合物; 以及回收化学式(I')化合物。

8. 根据权利要求7所述的方法, 其特征在于羟基保护剂选自于乙酸酐、乙酰氯, 苯甲酰氯、苄基氯、苄基溴、具有化学式 $\text{ClSi}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{ClSi}(\text{CH}_3)_2(\text{tBu})$ 和 $\text{ClSi}(\text{tBu})(-\text{C}_6\text{H}_5)_2$ 的氯硅烷。

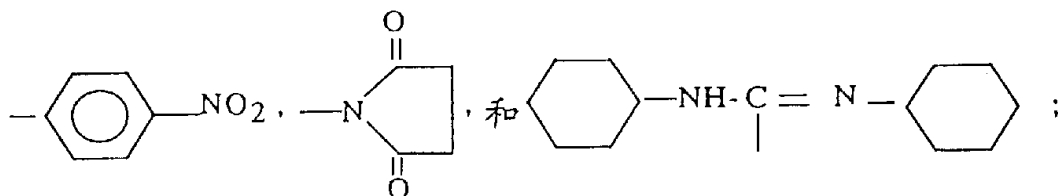
9. 根据权利要求6-8中任一权利要求所述的方法, 其特征在于酰化试剂相应于化学式 R_3COA (IV), 式中 R_3 代表:

或者 R_2 基,

或者选自于下述的基团: $\text{C}_1 - \text{C}_{29}$ 直链或支链烷基, 相对于羰基的 α 位取代的 $\text{C}_7 - \text{C}_{29}$ 芳烷基, 取代基选自于 - Br、- Cl、- I 和 - OB 基团, 而 - OB 是能生成 - OH 基的基团; A 选自于卤素,



式中 R_6 是 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ 低级烷基, R_7 选自于 $\text{C}_1 - \text{C}_8$ 低级烷基



条件是当 R_3 代表 R_2 基, A 不是 - Cl。

10.根据权利要求 9 所述的方法,其特征在于酰化剂-OB 基选自于乙酰氧基、苯甲酰氧基、苯甲氧基、 $-\text{OSi}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{OSi}(\text{CH}_3)_2(\text{tBu})$ 、 $-\text{OSi}(\text{tBu})(-\text{C}_6\text{H}_5)_2$ 。

11.根据权利要求 9 所述的方法,其特征在于酰化剂选自于 2-羟基十六烷酸琥珀酰亚胺酯,2-羟基十六烷酸二环己基碳二亚胺酯、2-羟基二十二烷酸琥珀酰亚胺酯、2-羟基二十二烷酸二环己基碳二亚胺酯和 D,L 扁桃酸琥珀酰亚胺酯。

12.根据权利要求 11 所述的方法,其特征在于化学式(II)化合物是 2-氨基-十八烷-1,3-二醇。

13.化妆品或皮肤药品组合物,其特征在于它含有权利要求 1 所述的化学式(I)化合物。

14.根据权利要求 13 所述的组合物,其特征在于它含有 0.05-20%(重量)化学式(I)化合物。

15.根据权利要求 13 或 14 所述的组合物,其特征在于它还含有选自于下面的添加剂:脂肪物质、溶剂、水、增稠剂、乳化剂、吸水产品、软化剂、阳光滤剂、杀菌剂、染料、抗氧剂、香料、促进剂和表面活性剂。

16.根据权利要求 13 或 14 所述的组合物,其特征在于它以乳化液形式存在,乳化液的脂肪相为乳化液总重量的 5-60%,脂肪相主要由化学式(I)的化合物与至少一种油的混合物组成,水相是乳化液总重量的 30-85%,乳化剂以乳化液总重量计为 1-20%(重量)。

17.根据权利要求 13 或 14 所述的组合物,其特征在于它以油性洗剂、油-醇洗剂、水-醇洗剂形式存在,或以凝胶、悬浮液

或固体棒、喷雾或气溶胶泡沫形式存在。

18.根据权利要求 13 或 14 所述的组合物，其特征在于它呈类脂化合物球的含水悬浮液形式，其类脂化合物球由包裹被封装的含水相的有机分子层组成，这些层由与至少一种其它类脂化合物缔合的至少一种化学式 (I) 化合物构成。

19.根据权利要求 18 所述的呈类脂化合物小球含水悬浮液形式的组合物，其特征在于其它类脂化合物选自于长链醇和二醇、固醇、磷脂、糖类脂化合物、硫酸胆甾醇酯和磷酸胆甾醇酯，长链胺和它们的季胺衍生物，二羟基烷基胺、聚氧乙烯脂肪胺、长链氨基醇酯、它们的季胺盐与衍生物，脂肪醇磷酸酯、烷基硫酸盐，和呈盐形式的脂肪酸。

20.根据权利要求 18 所述的呈类脂化合物小球的含水悬浮液形式的组合物，其特征在于小球直径为 $0.05\mu\text{m} - 5\mu\text{m}$ 。

21.根据权利要求 18 所述的呈类脂化合物小球的含水悬浮液形式的组合物，其特征在于小球中被封装的水相是水或活性物质水溶液。

22.根据权利要求 18 所述的呈类脂化合物小球的含水悬浮液形式的组合物，其特征在于在小球中封装的水相含有至少一种选自于下面的化妆和/或药品的水溶性活性物质：清凉剂、可能与染料缔合的人工整光剂、水溶性阳光滤剂、防汗剂、除臭剂、收敛药、清凉品、强壮剂、愈合剂、角质溶解剂、脱毛剂、香水、植物组织提取物、水溶性染料、抗膜剂、抗皮脂溢剂、氧化剂、还原剂、维生素、激素、酶、疫苗、消炎剂、抗生素、杀菌剂和细胞毒素剂或抗肿瘤剂。

23.根据权利要求 18 所述的呈类脂化合物小球的含水悬浮液形式的组合物，其特征在于它含有至少一种脂溶性活性物质，这些活性物质选自于脂溶性阳光滤剂供改善干燥或衰老皮肤状态的物质，生育酚、维生素 E、F 或 A 及它们的酯，视黄酸、抗氧化剂、必需脂肪酸、甘草亭酸、角质溶解素和类胡萝卜素。

24.根据权利要求 18 所述的呈类脂化合物小球的含水悬浮液形式的组合物，其特征在于它含有选自如下的与水不混溶的液相：油、烃、卤代烃、全氟三丁基胺、聚硅氧烷、有机酸酯、醚和聚醚。

25.权利要求 1 所述的化学式 (I) 化合物在化妆品中的应用。

26.权利要求 1 所述的化学式 (I) 的化合物在乳化液、分散液、凝胶、固体棒或在化妆用的洗剂中作为具有软化与柔和性质的蜡成分的应用。

27.权利要求 1 所述的化学式 (I) 化合物与至少一种其它类脂化合物配合使用，以生成化妆用类脂化合物小球的分散液。

说明书

神经酰胺、它的制备方法及其在 化妆品和皮肤药品方面的应用

本发明的内容是关于新的神经酰胺，它的制备方法，以及它的应用，尤其是皮肤和头发处理和/治疗(保养)方面的化妆品与皮肤药品的应用。

皮肤受冷，接受太阳光照射、与相对湿度很低的空气接触，反复使用洗涤剂洗涤或者与有机溶剂接触，这些都是在不同程度上引起皮肤表面干燥的因素。皮肤越干燥，柔软性便越差，越不光滑。另外，经常进行某种毛发处理的头发都失去光泽，并且可能变得干燥和易断。

申请人研究过一些组合物，它们能防止或减轻出现表面干燥的这些现象，并能恢复皮肤的柔软性以及头发的亮光和光滑。

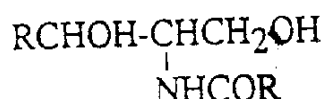
为了解决这个问题，人们已经提出过应用神经酰胺。事实上，人们都知道：这些化合物是角质层intercorn eocy taires类脂化合物的主要组成单元，参与保持皮肤屏障的完整性。根据 Downing (“The Journal of Investigative Dermatology”, vol. 88, NO3, P25-65, 增刊 3月, 1987), 这些化合物约占这些类脂总量的40%。

化妆品中使用的神经酰胺是一些专门从猪皮、牛脑、蛋、血液细胞、植物等得到的天然提取物 (JA 86/260008 和 JA

87/120308专利申请)。为保护头发也曾提出过这类神经酰胺 (EP0278505)。

因而,总是涉及到神经酰胺含量或多或少的混合物,其混合物的组成是难以控制的。此外,这些混合物易受细菌的污染。它们的保存也是很难掌握的。当它们是来自于动物时,还存在被BSE(海绵状牛脑疾病)致病因素污染的危险。

为了解决这些问题,人们提出合成的神经酰胺,尤其是在法国专利申请No. 2673179中提出过。特别地是,该申请描述了具有下述化学式的合成神经酰胺:



式中R定义为C₁₁-C₂₁烷基或烯基, R'定义为直链C₁₁-C₁₉烃基,该基有一个或多个不饱和烯键,或者为饱和或带有一个或多个不饱和烯键的直链C₁₁-C₁₉烃基的混合物,其中饱和基的比例不超过35%,这些化合物呈赤式和苏式非对映异构的外消旋混合物形式,其赤式与苏式之比为85:15至60:40。

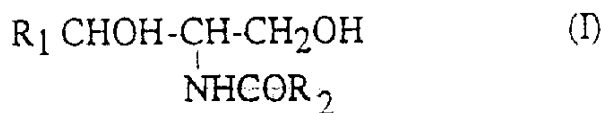
在化妆品或皮肤药品组合物中使用的这些化合物,为了处理或治疗皮肤和头发,都具有吸水(水化)作用,这种作用能防止或减轻皮肤或头发的表观干燥影响。

不过,人们还是希望调整这些化合物(在化妆品或皮肤药品组合物中使用的),使其具有的吸水效果超过法国专利申请n°2673179中化合物的效果。

WO 93/02656专利申请描述了阳离子分散液，其中含有至少一种神经酰胺或甘神经酰胺(glycoceramide)，或天然或合成的神经酰胺和/或甘神经酰胺的混合物，它们的N-酰基链是羰基 α 位带有羟基的饱和或不饱和的链。这些以神经酰胺和/或甘神经酰胺为主要成分的含水悬浮液，在与特定的阳离子表面活性剂配合时，有利于梳理头发，即不使头发加重，也不给头发上油。

那么，本发明的目的在于这样的新化合物，在化妆品或皮肤药品组合物中使用这些新化合物时，它们具有比较好的皮肤和/或头发的吸水能力。

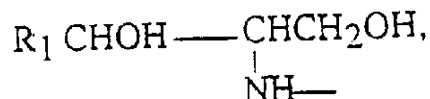
本发明的新化合物满足下述化学式：



式中：

R_1 定义为 C_{11} - C_{21} 烷基或烯基；

R_2 定义为 C_1 - C_{29} 直链或支链羟烷基， C_7 - C_{29} 羟芳烷基，羟基处在羰基 α 位，这些化合物呈赤式和苏式非对映异构的外消旋混合物形式，对于氨基二醇部分



赤式与苏式之比为85:15至20:80，优选为65:35至45:55。

优选地， R_1 定义为 C_{13} - C_{19} 烷基或烯基，尤其是十五烷基。

优选地， R_2 是 C_1-C_{21} 直链1-羟烷基，更具体地为 $C_{15}-C_{21}$ 直链羟烷基，尤其是1-羟基十五烷基和1-羟基廿一烷基，或 C_7-C_{19} 1-羟基芳烷基，尤其是D,L-1-羟基苯甲基。

在研究化妆品或皮肤药品中抗皮肤或头发干燥效果时，本发明化学式(I)化合物是那些特别有效的蜡。

特别是，本发明的化合物在缓慢失水(PEI)试验中具有很强的活性，这个试验是测量屏障作用，在“Dermodiag”试验中该化合物具有很好的活性，这是测量吸水的试验，而类似的化合物(但它们不具有赤式和苏式非对映异构的外消旋混合物形式)在PEI 试验中的活性很低，在“Dermodiag”试验中没有活性，而且这些化合物，即使呈赤式和苏式非对映异构的外消旋混合物形式，但没有N-酰基- α -羟基链，则在“Dermodiag”试验中也不具有活性。

“Dermodiag”试验是测量皮肤与其吸水率相关的导电性。在这个试验中，使用一种“Dermodiag”仪器用来测量表皮上层的吸水率。从电学观点来看，皮肤表现为一种电阻与一个电容并联。这两个元件(尤其是等效电容)主要取决于细胞中水的含量。

该仪器利用皮肤作为闭路电容器，并且按照随上层组织中水量而变化的频率振荡。这些现象都以高频进行(约为几个MHz)。

该仪器有两个置于皮肤上的同心电极，电力线在这两电极之间闭合。仪器上的数字显示表明每次测量所消耗的电流。吸水率越大，显示的值也越大。

另外，这些化合物对皮肤或眼粘膜具有很低的浸蚀性，对于如红血球细胞的细胞膜具有良好的耐受性。

上述化学式(I)的新化合物具有软化和柔和的性质。它们很容

易溶解于化妆品或皮肤药品制剂的脂肪相中。

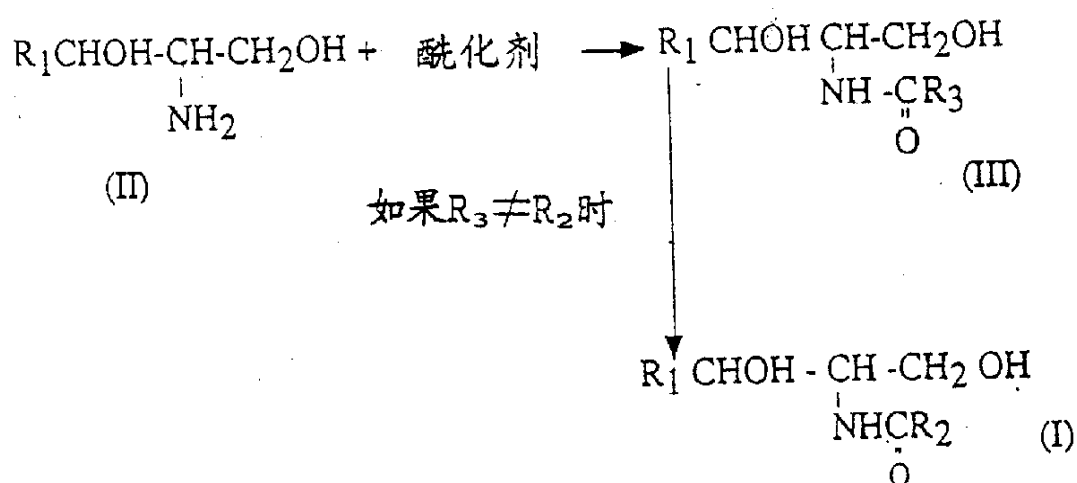
由这些化合物处理的头发，由于脂类物质均匀地分布在头发外皮上而具有亮光，对水敏感性不很大。机械性和不稳定性同样得到改善。

这些化合物与其它脂类一起会生成泡。

可以通过鞘氨醇、二氢鞘氨醇或这些化合物的反应活性衍生物(如盐酸盐)的胺官能团用适当的酰化基进行酰化得到上述化学式(I)神经酰胺。

在本发明中，关于鞘氨醇或二氢鞘氨醇可理解为D,L.化合物，即赤式和苏式非对映异构的外消旋混合物。

本发明另外一个目的是制备化学式(I)化合物的方法，该方法由下述流程图表示：



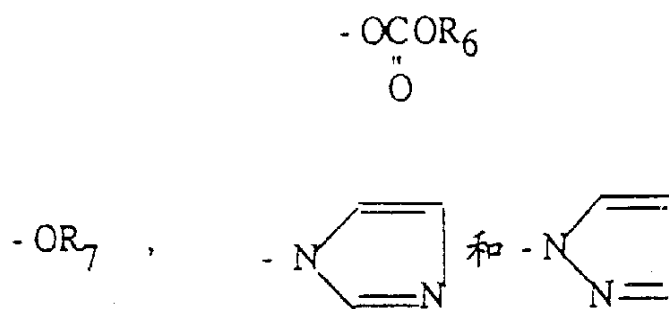
更特别地是，在无水介质中或在适宜的溶剂中，具有上述化学式(II)的鞘氨醇或二氢鞘氨醇的胺官能团(其中 R_1 如前面所定义)用选自下述的酰化剂进行酰化可以得到具有上述化学式(I)的化合

物：酸的氯化物、酸酐、混合酸酐、对硝基苯酚酯、琥珀酰亚胺酯、碳二亚胺酯、 C_1-C_8 低级烷基酯、唑系化合物，尤其是咪唑化物和吡唑化物，以及适宜的相应2-羟基酸的O-羧酸酐。

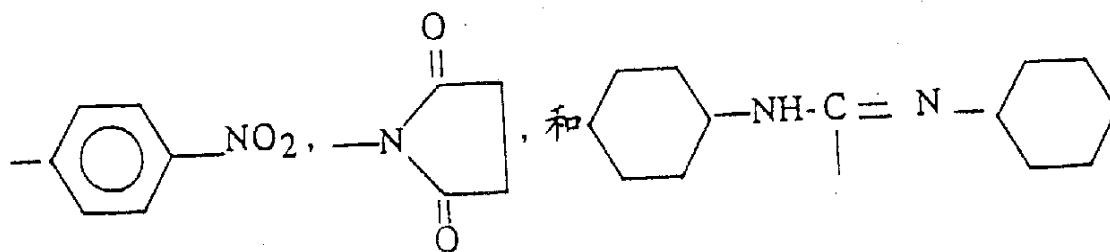
更具体地是，酰化剂选自于相应的2-羟基酸的O-羧酸酐和化学式 R_3COA (IV) 的化合物，式中：

R_3 选自于前面定义的 R_2 基、 C_1-C_{29} 直链或支链烷基，优选为 C_1-C_{21} 直链烷基， C_7-C_{29} 芳烷基，优选为 C_7-C_{19} 芳烷基，它们在相对于羧基的 α 位置上被取代基取代，而取代基选自于-Br，-Cl，-I和-OB，而OB是能生成OH基的基团；

A选自于卤素，



式中， R_6 是 C_2-C_8 低级烷基， R_7 选自于 C_1-C_8 低级烷基，



只要当 R_3 代表 R_2 基，A就不是-Cl。

所推荐的酰化剂是琥珀酰亚胺酯和碳化二亚胺酯。

根据所使用酰化剂的性质，具有化学式(II)的化合物胺基酰化反应在无水状态下或在溶剂存在下进行。

在本发明方法的有效溶剂中，可以列举四氢呋喃、吡啶、二甲基甲酰胺、二氯甲烷、和叔丁基甲基醚。

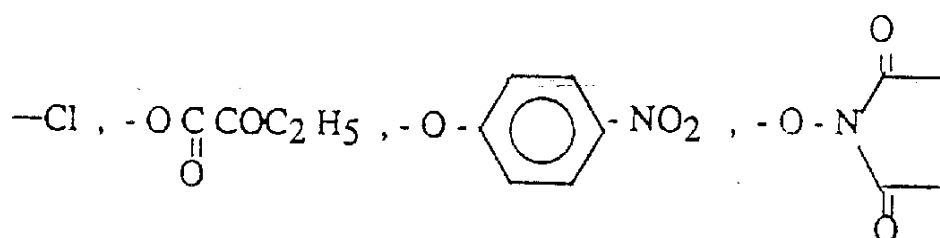
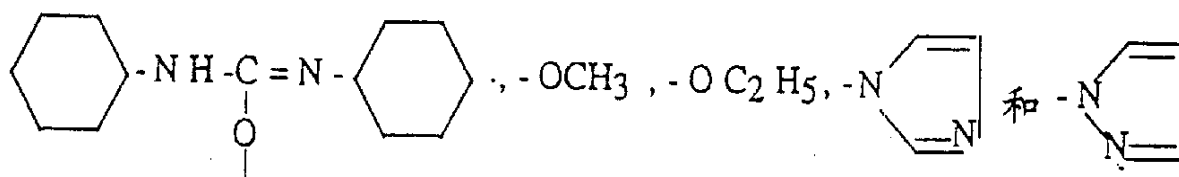
优选地，-OB基选自于下述基团：乙酰氧基、苯甲酰氧基、苄氧基，

-OSi(CH₃)₃，-OSi(CH₃)₂(t-丁基)，和

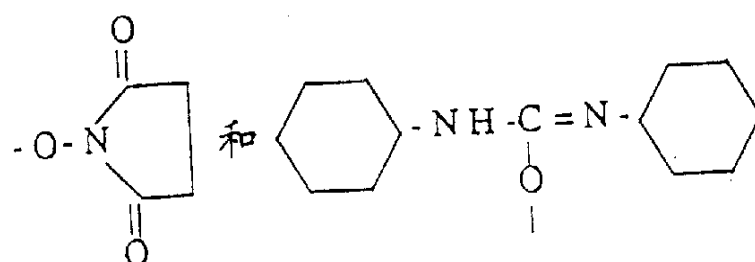
-OSi(t-丁基)(-C₆H₅)₂。

优选地，-OB是乙酰氧基。

优选地，A选自于下述基团：



建议A尤其选用下述基团，



特别推荐的酰化剂是2-羟基十六烷酸琥珀酰亚胺酯, 2-羟基十六烷酸二环己基碳二亚胺酯, 2-羟基二烷酸琥珀酰亚胺酯、2-羟基廿二烷酸二环己基碳二亚胺酯和D,L扁桃酸琥珀酰亚胺酯。

显然, 当 R_3 与 R_2 不同、并且 R_3 代表 C_1 - C_{29} 烷基, 或 C_7 - C_{29} 芳烷基, 正如前面指出的那样, 相对于羰基的 α 位被取代时, 必需有一个或多个附加步骤将相对于羰基的 α 位取代基转变成羟基, 以便得到化学式(I)的化合物。这种转变是人们熟知的, 而且比如可采用水解方法进行。

人们还可以根据本发明将化学式(II)的化合物与相应的2-羟基酸的O-羧酸酐进行反应, 制备出 $R_3=R_2$ 的化学式(III)化合物。

O-羧酸酐是已知的化合物, 它可采用已知的技术让相应的2-羟基酸与碳酰氯或二、三碳酰氯取代物中的一种取代物反应得到。具体地, K.Toyooka 在Heterocycles vol.29, NO5, P.975-978 (1989)中描述过O-羧酸酐及其制备方法。

采用低级烷基酯的酰化反应应在无水状态下进行。具体地, E.F.Jordan在JAOCs P.600-605(1961)中描述过这些反应。

其它的反应可在溶剂中进行, 例如四氢呋喃、吡啶、二甲基甲酰胺和二氯甲烷之类的溶剂。

由琥珀酰亚胺酯和二环己基碳二亚胺酯进行酰化, 具体地Lapidot在J.Lipid Res. 8, 142-145(1967)中作了描述。

关于用对硝基苯酚酯酰化, 具体地Bodansky 在Nature, no. 4459, P.685(1955)中作了描述。

关于用混合酸酐进行酰化, J.L.Torres 在Tetrahedron vol. 43, N°17, P.4031-3(1987)中作了描述。

关于用唑系化合物进行酰化, H.A. Staab 在 Angew, Chem. Internat. Edit. vol.1, N^o.7, P.357-367(1962)中作了描述。

J. March 在 Advanced Organic Chemistry-third edition - John Wiley & Sons-Inc P.370-377(1985)中一般性地描述过酰化反应。

为制备本发明的化合物(I), 还可以使用化合物(II)的盐酸盐。

化合物(II)是已知的化合物, 具体地, D. Shapiro 在 "Chemistry of sphingolipids", Hermann, Paris (1969)中, 描述过这种合成。

当R₁定义为烯基时, 以D,L-赤式形式的化合物(II)是鞘氨醇, 它的合成在 "Chemistry of Sphingolipids" 的第21 页中作过描述。

当R₁定义为烷基时, D,L-赤式形式的化合物(II) 是二氢鞘氨醇, 具体地, 它们可由2-乙酰氨基-3-氧代-烷酸甲酸或乙酯制备, 如在 "Chemistry of sphingolipids" 第32页中所描述的。

上面描述的合成鞘氨醇或二氢鞘氨醇的方法可得到赤式和苏式非对映异构的外消旋混合物, 其赤式与苏式之比为85:15至20:80。

来自酰化反应的化学式(III)化合物, 尤其是R₃=R₂的化学式(III)化合物, 可以通过与保护剂反应而保护羟基, 其保护剂选自于酸酐、酸的卤化物和氯硅烷, 反应之后, 分离产物, 最好再在碱性介质中进行水解。

本发明方法有效的保护剂最好选自于乙酸酐、乙酰氯、苯甲酰氯、苯甲基氯、苯甲基溴, 化学式为ClSi(CH₃)₃、ClSi

$(\text{CH}_3)_2(\text{tBu})$ 、 $\text{ClSi}(\text{tBu})(-\text{C}_6\text{H}_5)_2$ 的氯硅烷。

本发明的化合物可得到各种应用，尤其是作为化妆品和皮肤药品组合物的蜡质组分。这些化合物当分散在水中时与其它类脂化合物配合还具有生成小泡的性质。

因此，本发明的内容在于应用化学式(I)的类脂化合物作为乳化液、分散液或洗涤剂中的蜡质组分。本发明还有一个内容是关于与其它类脂化合物一起，应用这些化合物以生成类脂化合物小球。

本发明还有一个目的在于化妆品或皮肤药品用的含化学式(I)化合物的组合物。

化妆品处理皮肤、头发或毛的方法构成本发明另一个目的，该方法在于将足量的含化学式(I)化合物的这种组合物涂敷在皮肤、头发或毛上。

本发明的组合物可以呈乳化液(乳液或软膏)、稀酒精洗涤剂、油性洗涤剂或油醇洗涤剂、凝胶、分散液或固体棒、喷雾剂或气溶胶泡沫剂。

根据本发明，化学式(I)化合物以组合物总重量计为0.05-20%，优选为0.1-10%。

例如，本发明组合物是洗涤剂，乳剂或软膏。治疗皮肤或头发的乳剂或膏，卸妆用的洗涤剂或乳液，颜色底色、防晒洗涤剂、乳剂或软膏，人工晒黑的洗涤剂、乳剂或软膏、刮胡子的软膏或泡沫剂，刮胡子后的洗涤剂，香波或睫毛油。

这些组合物还可以是棒状，以便用于口唇上色或避免口唇裂口，或者眼用化妆品及脸的化妆品与底色。

当本发明的组合物呈现水包油或油包水型的乳化液形式时，脂肪相主要由化学式(I)化合物与至少一种油，并且或许另一种脂肪类化合物的混合物组成。

乳化液的脂肪相可构成乳液总重量的5-60%。

所述乳化液水相最好构成乳化液总重量的30-85%。

乳化剂的比例可以是，以乳化液总重量计为1-20%，优选为2-12%。

当本发明的组合物是油性洗涤剂、油醇洗涤剂或稀酒精洗涤剂时，它们就可以构成例如含吸收紫外(UV)辐射的滤光物的抗晒洗涤剂，皮肤用的软化洗涤剂；油性洗涤剂还可构成含油溶性表面活性剂的泡沫油，洗澡用油等。

在可存在于本发明组合物内的主要添加剂中，可以列举诸如油的脂肪类化合物或矿物蜡、动物蜡或植物蜡，脂肪酸、脂肪酸酯如具有6-18个碳原子的脂肪酸甘油三酯，脂肪醇；氧亚乙基化的脂肪醇或聚丙三醇的烷基醚之类的乳化剂，诸如含1-6个碳原子的低级单元醇或多元醇或水之类的溶剂。

更具体地说，优选的单元醇或多元醇可选自于乙醇、异丙醇、丙撑二醇、甘油和山梨糖醇。

作为脂肪类化合物，在矿物油中可以列举凡士林油；在动物油中可以列举鲸油、海貂油、鲑鱼油、庸鲈鱼肝油、鳕油、金枪鱼油、乌龟油、牛蹄油、马蹄油、绵羊蹄油、水貂油、水獭油、旱獭油等；在植物油中可以列举：扁桃油、麦胚油、橄榄油、玉米胚油、jojoba油、芝麻油、向日葵油、棕榈油、胡桃油、乳油木油、shorea油、马卡达姆坚果油、黑茶藨子

油及类似物。

在脂肪酸酯中，可以使用饱和或不饱和的 C_{12} - C_{22} 酸酯，和如异丙醇或甘油之类的低级醇的酯，或者直链或支链、饱和或不饱和的 C_8 - C_{22} 脂肪醇的酯，或 C_{10} - C_{22} 烷-1,2二醇。

作为脂肪类化合物还可引用凡士林、石蜡、羊毛脂、氢化羊毛脂、油脂、乙酰化的羊毛脂、硅酮油。

在蜡中，可以列举Sipol蜡、羊毛脂蜡、蜂蜡、Candelilla蜡、微晶蜡、Carnauba蜡、鲸蜡、可可油、乳油木蜡、硅酮蜡、在25°C凝固的氢化油、蔗糖甘油酯、钙、镁和铝的油酸盐、肉豆蔻酸盐、亚油酸盐和硬脂酸盐。

在脂肪醇中，可以列举月桂醇、十六烷基醇、肉豆蔻醇、硬脂醇、棕榈醇、油醇、以及如2-辛十二烷醇、2-癸基四癸醇或2-己癸醇之类的Guerbet醇。

作为乳化剂，在多氧亚乙基化脂肪醇中，可以列举月桂醇、十六烷基醇、硬脂醇和油醇，它们含2-20摩尔环氧乙烷，在聚丙三醇的烷基醚中，可以列举 C_{12} - C_{18} 含2-10摩尔丙三醇的醇。

使用诸如纤维素衍生物，聚丙烯酸衍生物，guar胶或豆角胶，或吨胶之类的增稠剂也是有效的。

本发明的组合物还可以含有通常在化妆品或皮肤药品中使用的添加剂，尤其是吸水产品、软化剂、治疗皮肤病的产品、阳光的滤光物、杀菌剂、染料、抗氧剂、香料和推进剂。

当本发明的组合物是分散液时，可能涉及在表面活性剂存在时化学式(I)化合物在水中的分散或类脂小球的含水分散液，这些类脂小球由包裹被封装的含水相的有机分子层组成，这些层由至

少一种化学式(I)的化合物组成,而所述化合物与至少一种其它类脂化合物缔合。

为此,作为类脂化合物可以引用长链醇和二醇、如胆固醇、磷脂、硫酸胆甾醇酯和磷酸胆甾醇酯的固醇,长链胺和它们的季胺衍生物,二羟基烷基胺、聚氧乙烯脂肪胺、长链氨基醇酯、季胺盐与其衍生物,脂肪醇磷酸酯,如二十六烷基磷酸或其钠盐,烷基硫酸盐,如十六烷基硫酸钠,呈盐形式的脂肪酸,或在法国专利 2315991、1477048 和 2091516 中或在国际专利申请 WO83/01571 和 WO92/08685 中叙述的那些类型的类脂化合物。

例如,作为其它类脂化合物人们可以使用含12-30个碳原子,饱和或不饱和,支链或直链的亲油性链的类脂化合物,所述亲油性链如油链、羊毛脂链、四癸链、六癸链、异硬脂酸链、月桂链或烷基苯基链。这些类脂化合物的亲水性基团可以是离子或非离子基团。作为非离子基团,可以列举聚乙二醇衍生集团。作为生成层状相的类脂化合物,最好也使用聚丙三醇醚,如在法国专利1477048, 2091516、2465780和2482128中所描述的化合物。

作为离子基团,最好使用两性的、阴离子或阳离子化合物的衍生基团。

在国际专利申请WO83/01571 中作为可生成小泡而使用的所述其它类脂化合物是糖类脂化合物,如乳糖神经酰胺、半乳糖脑苷、神经节苷脂和三己糖神经酰胺,以及磷脂,如磷脂酰甘油和磷脂酰肌醇。

本发明还有一个内容是由化学式(I)化合物的有机分子层和上面定义的一类脂化合物构成的类脂化合物小球分散液,其小球可把

要封装的水相封闭起来。

环绕这些小球的分散液连续相是水相。

分散的小球直径为 $0.05\mu\text{m}$ 至 $5\mu\text{m}$ 。

被封装的水相(在小球中)可以是水或活性物质的水溶液，并且在这种情况下与分散液的连续相相比，最好是等渗透的。

小球可根据本申请人的法国专利2315991中描述的方法得到，根据这种方法，制备一种由含有待封装水相的有机分子层构成的小球分散液，其方法是使与一种或多种上述定义的一类脂化合物缔合的一种或多种化学式(I)类脂化合物同要在小球中待封装的水相进行接触，为保证混合和得到层状相而进行搅拌，然后加入分散的液体，其量超过所得到的层状相的量，并剧烈摇动约15分钟至3小时。

待封装水相相对与构成层状相的类脂化合物缔合的化学式(I)化合物之重量比最好是0.1-20。

添加的分散水相与将其分散的层状相之重量比最好是2-100，分散相与待封装的水相最好是等渗透的。

利用振动搅拌器进行搅拌，该方法最好在温度 $30-120^{\circ}\text{C}$ 下进行。

另一种制备方法在于利用称之REV的方法(反相蒸发法)或Szoka和Papahadjopoulos, Proc. Natl. Acad. Sci. USA., vol. 75, n°9, P. 4194-4198 (1978), 中描述的反相蒸发法。

人们还可以使用下述方法，该方法包括一系列步骤，这些步骤在于将至少一种类脂化合物溶于至少一种与水不相混溶的有机溶剂中；将这样得到的有机相加到水相中；在强搅拌下生成两相

的分散液，在这些相的这种混合过程中，通过改变搅拌速度可以调节水泡的大小；在强搅拌下进行溶剂的蒸发；如有必要，浓缩其分散液。

活性物质可以是具有药用、食用的物质或具有化妆活性的物质。当这些物质是水溶性的，它们则在泡内封装的水相中。

具有化妆和/或药物活性的水溶性物质可以是供治疗或处理皮肤和头发的产品，比如一些润湿剂，诸如丙三醇、山梨糖醇、季戊四醇、吡咯烷酮羧酸及它们的盐；人工整光剂，如二羟基丙酮、赤如糖、甘油醛， γ -二醛，如酒石醛，这些化合物或许与染料缔合；水溶性太阳光滤光物；防汗剂，防臭剂，收敛药，清凉品，强壮剂、愈合剂、角质溶解剂、脱毛剂、香水；植物提取物，如多糖；水溶性染料；抗膜剂；抗皮脂溢剂，氧化剂，如双氧水之类脱色剂，还原剂，如巯基乙酸及其盐。

还可引用维生素、激素、酶，如歧化酶过氧化物，疫苗、消炎剂，如氢化可的松，抗生素、杀菌剂、细胞毒素剂或抗肿瘤剂。

当活性物质是油溶性时，它们都被加入到泡层中。这些活性物质可选自于脂溶性太阳光滤光物，供改善干燥或衰老皮肤状态的物质，生育酚、维生素E、F或A及其酯，视黄酸、抗氧化剂、必需的脂肪酸、甘草亭酸、角质溶解素和类胡萝卜素。

在本发明小球分散液的水相中还可添加与水不混溶的液相L。尤其，本发明的组合物可以含有以该组合物总重量计为2-70%（重量）的与水不混溶的液相L，以分散的液相L计，构成泡的类脂化合物的相对重量比为0.02/1至10/1。

在水相D中已分散的液相L的成分可以选自由下述物质组成的组中：油，如脂肪酸和多元醇的酯，脂肪酸与具有化学式 $R^a - COOR^b$ 的支链醇的酯，式中 R^a 代表含7-19个碳原子以上的脂肪酸残基， R^b 代表有3-20个碳原子的支链烃链；烃，如十六烷，石蜡油、全氢角鲨烯、卤代烃、如萘烷、全氟三丁基胺、聚硅氧烷；有机酸酯，醚和聚醚。液相L可以封闭至少一种香料和/或至少一种脂溶性活性物质。这类脂溶性物质可由脂溶性太阳光滤光物、供改善干燥或衰老皮肤状态的物质、生育酚、维生素E或F、维生素A及其酯，retinoique、抗氧化剂、必需的脂肪酸、甘草亭酸、角质溶解剂和类胡萝卜素所组成。

在本发明小球分散液中还可加各种添加剂，如遮光剂、胶凝剂、芳香剂、香料或染料。

本发明的类脂化合物球的分散液有输送活性物质的作用，因此这些活性物质对下列各种改性剂也有掩蔽和保护作用：氧化剂，更一般地是那些对封装的活性物质可反应的化合物。活性物质的渗透和固定可以通过改变球的大小及其电荷来进行调节。同样这些活性物质的作用也可以这样区分(延迟效应)。最后，由于使用本发明类脂化合物(I)，以及配合的活性物质，就有可能获得所使用活性物质的特别有益的作用，同时，在处理皮肤的情况下这种作用很缓和，很有意义。

本发明还有一个内容在于颗粒状含水分散液在化妆品中的应用，其分散液由与其它类脂化合物配合的类脂化合物(I)有机分子层组成，有机分子层封闭待封装的水相，对于皮肤治疗尤其如此。

本发明还有一个内容在于这类类脂化合物颗粒分散液应用于

皮肤药品或食品工业。

本发明将由下面非限制性实施例作更好地说明。

实施例1

2-(2'-羟基十六烷酰)氨基十八烷-1,3-二醇的制备

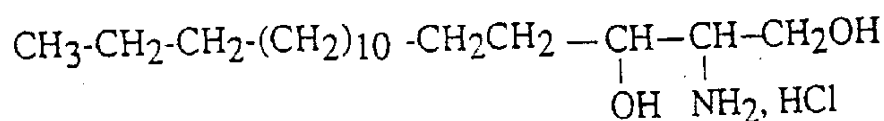
第一步: 具有: $R_1 = C_{15}H_{31}$ 化合物(II)的制备;

2-氨基-1,3-十八烷二醇(赤式-苏式混合物)的盐酸盐

在1升无水乙醇中, 将2-乙酰胺-3-氧十八烷酸甲酯(100克, 即0.27M)制成悬浮液。将反应介质的温度调节到 0°C 以下。在这个温度, 分三次加30.7克(0.8M)硼氢化钠, 并在这个温度维持搅拌3小时。这时让反应介质与溶剂回流3小时。在冷却到室温后, 加 140cm^3 浓盐酸, 再重新让反应介质回流达3小时。过滤其介质, 在焙烧的玻璃上加热。在减压下浓缩滤液至干。

得到的固体在 300cm^3 (己烷: 乙酸乙酯=90:10)混合溶剂中重结晶。分离出88克白色固体, 其固体用苏打N/10溶液在乙醇中测定酸值是2.99毫克当量/克。

这种固体的 RMN^{13}C 谱符合期望结构:



这涉及到呈赤式-苏式D.L 外消旋混合物形成的神经酰胺氢氯化物。

第二步: 其中 $-\text{COR}_2$ 是2-羟基十六烷酰基的化合物(I)的制备

在800ml乙酸乙酯中, 于 65°C 溶解100克2-羟基十六烷酸(D. L

混合物)。加41克N-羧基-琥珀酰亚胺，再让温度调到30°C。在200ml乙酸乙酯中溶解83克二环己基碳二亚胺，然后将这种溶液在20分钟加到反应介质中。在室温下继续搅拌5小时。在烧结玻璃n°3上过滤所沉淀的盐，再用100ml 40°C乙酸乙酯洗涤。将滤液蒸发至干，再将它放到200ml四氢呋喃中。将保持在60°C的这种溶液在30分钟加到回流溶解108克2-氨基-十八烷二醇(在800ml四氢呋喃和3ml三乙基胺中)所得到的溶液中。在60°C继续搅拌达2小时。加16ml水，在室温下放置过夜。在烧结玻璃n°3上过滤所生成的不溶物，然后用4次100ml 40°C四氢呋喃洗涤。

在搅拌下，将汇集的滤液倒入6升水和1ml浓盐酸中。在烧结玻璃n°1上过滤其沉淀，然后用300ml丙酮洗涤。该产品在烘箱中干燥。将该衍生物于700ml二氯甲烷中制成悬浮液，然后在烧结玻璃n°3上过滤并于真空下干燥。这样得到130克(65%所需粗衍生物)，它在350ml吡啶中再制成悬浮液。一次加入90ml乙酸酐。当全部乙酸酐溶解时，加60ml乙酸酐。继续搅拌4小时(在室温下)。在由2.3升甲醇和1升水构成的混合物中于+4°C在搅拌下沉淀其反应介质。过滤沉淀，再用200ml水洗涤并干燥(脱水)。然后，沉淀用1升热庚烷溶解，再在硫酸钠上干燥并过滤。往滤液加130克二氧化硅，并搅拌30分钟。进行过滤，用两次100ml热庚烷洗涤二氧化硅。收集滤液并蒸发至干。这样得到粗过乙酰化衍生物150克，然后在稍微加热的条件下将该衍生物溶于1升甲醇中。将3.7克甲醇溶液加到30%甲醇钠中，并搅拌达2小时。用24ml的混合物中和，混合物为22ml水和2ml浓盐酸。生成的沉淀经过滤然后干燥。

得到98克固体产物，它在60°C再溶于1升乙酸乙酯中，并且在+4°C重结晶达16小时。在过滤与干燥之后，得到93克(47%) 纯产物。

元素分析

	%C	%H	%N	%O
理论值	73.46	12.51	2.52	11.81
测定值	73.56	12.55	2.53	11.68

熔点=89°C

氨基二醇链的赤式/苏式之比为55/44

R.M.N. ^{13}C 谱符合期望的结构

实施例2

2-(2'-羟基 二烷酰)氨基十八烷-1,3-二醇的制备

在65°C，将50克2-羟基-二十二烷酸(D/L混合物)溶于400ml四氢呋喃中。加15.6克N-羟基琥珀酰亚胺。将31.9克二环己基碳二亚胺溶于100ml四氢呋喃中，然后，当全都溶解时，缓慢地在20分钟将这种溶液加到反应介质中。

继续搅拌2小时30分钟。在烧结玻璃n°3上过滤这些盐，而且该盐还用50ml四氢呋喃洗涤。这种溶液，保持在60°C，于30分钟将其加到在400ml四氢呋喃和1.5ml三乙基胺中回流溶解41.4克 2-氨基-十八烷-1,3-二醇(实施例1的步骤1中得到的) 所得到的溶液中。在60°C搅拌2小时。加16ml水，并在室温下放置一夜，在烧结玻璃n°3上过滤所生成的不溶产物，然后用45°C 100ml 四氢呋喃洗涤。

在搅拌下于20分钟将滤液倒入3.5升水和0.5ml浓盐酸中。得

到的沉淀在烧结玻璃n°1上过滤，脱水，用300ml丙酮洗涤，然后干燥。将所得的产物在200ml二氯甲烷中制成悬浮液，在烧结玻璃n°3上过滤并脱水。这样得到75克粗衍生物，它在180ml吡啶中再制成悬浮液。一次加入50ml乙酸酐。当全部溶解时，加50ml乙酸酐。在室温下继续搅拌4小时。在由2升甲醇和0.5升水组成的混合物中，于+4°C搅拌使反应介质沉淀。生成的沉淀过滤，然后用200ml水洗涤并脱水。该沉淀用600ml热庚烷再溶解，并在硫酸钠上干燥并过滤。往滤液中加80克二氧化硅，并搅拌45分钟。进行过滤，二氧化硅用二次60ml二氯甲烷洗涤。将滤液汇集并蒸发至干。得到81克粗过乙酰化衍生物，然后将它溶于55ml二氯甲烷和770ml甲醇中。将1.78克甲醇溶液加到30%甲基钠中，并继续搅拌达30分钟。用12ml由11ml水和1ml浓盐酸组成的混合物进行中和。生成的沉淀经过滤后进行干燥。这样得到53克固体产物，它再溶解于530ml 60°C乙酸乙酯中，并且在+4°C重结晶过夜。在过滤与干燥后，得到48克(71%)纯产物。

元素分析:	%C	%H	%N	%O
理论值	75.06	12.76	2.19	10
测定值	75.05	12.77	2.11	10.3

熔点=93°C

2-氨基十八烷-1,3-二醇的赤式/苏式比: 54/46

RMN¹³C谱符合期待的结构

实施例3

2-(D,L-扁桃酰基)氨基十八烷-1,3-二醇的制备

将10克D,L扁桃酸溶于50ml四氢呋喃中，然后加7.6克N-羟基

琥珀酰亚胺。将14.95克二环己基碳二亚胺溶于50ml四氢呋喃中，然后将这种溶液加到反应介质中。在室温下继续搅拌3小时，然后在烧结玻璃NO3上过滤生成的盐并用50ml四氢呋喃洗涤。

在30分钟将保持在60°C的这种溶液加到在100ml四氢呋喃中回流溶解18.8克2-氨基-十八烷-1, 3-二醇(在实施例1的步骤1得到的)所得到的溶液中。

继续在60°C搅拌3小时，然后将其混合物倒入水中。

生成的沉淀经过滤、洗涤，再在40°C真空下干燥。

得到的粗产物在250ml乙酸甲酯中进行重结晶。

这样得到20克纯产物(产率74%)

元素分析

	%C	%H	%N	%O
理论值	71.68	10.41	3.22	14.69
测定值	71.7	10.48	3.29	14.89

熔点: 98-115°C

RMN¹³C谱符合期待的结构

质谱符合期待的结构

氨基二醇链的赤式/苏式比为: 61/39

实施例A

保护底色

制备了具有下述组成的底色:

- 铝和镁的硅酸盐 0.50克
- 由Aqualon公司以商品名“BLanose 7 LF”
销售的羧甲基纤维素 0.15克

-甘油	3.00克
-抗氧剂	适量
-2-(2'-羟基十六酰基)-氨基十八烷-1,3- 二醇(实施例1的化合物)	1.00克
-羊毛脂醇	1.50克
-硬脂酸甘油酯	1.00克
-硬脂酸	2.50克
-三乙醇胺	1.50克
-由Hüls公司以商品名“Miglyol 812”销 售的癸酸/辛酸的甘油三酸酯	6.00克
-角鲨烷	10.00克
聚乙烯粉末	3.00克
颜料	10.00克
去矿化水	适量至100克

得到的底色具有优良的吸水效果

实施例B

加工的口红

制备了具有下述组成的口红:

-液体羊毛脂	17.50
-微晶蜡	15.00克
-由Hüls公司以商品名“Miglyol 812”销售的 癸酸/辛酸的甘油三酸酯	11.00克
-廿二烷酸辛基甘油酯	11.0克
-2-(2'-羟基-十六烷酰)-氨基十八烷-1,3-	

二醇(实施例1的化合物)	0.20克
Micatitane	10.00克
有机颜料	8.00克
蓖麻油	适量至100克

得到的口红具有良好的吸水效果

实施例C

化妆膏

制备了具有下述组成的化妆膏:

硬脂酸三乙醇胺酯	10.0克
小烛树蜡	15.0克
蜂蜡	17.0克
咕吨胶	1.0克

2-(2'-羟基-十六烷酰)氨基十八烷-1,3-

二醇(实施例1的化合物)	0.5克
黑铁氧化物	5.0克
氨基硅酸盐的多硫化物	4.0克
抗氧化剂	适量
水	适量至100g

得到的化妆膏具有良好的吸水性

实施例D

手用护肤膏

制备具有下述组成的手用护肤膏:

-由ICI公司以“Tween60”商品名销售的

20摩尔环氧乙烷聚氧乙烯脱水山梨醇硬脂酸酯 2.0克

-十六烷醇	1.0克
-粘度为200厘斯托克斯的硅酮油 ($2 \times 10^{-4} \text{m}^2/\text{s}$)	7.0克
-丙二醇	2.0克
-由goodrich公司以“Carbopol 940”商品名销售的 交联聚丙烯酸	0.3克
-对羟基苯甲酸甲酯	0.3克
2-(2'-羟基己基十六烷酰基)氨基十八 烷-1,3-二醇(实施例1的化合物)	0.5克
去矿化水	适量至 100克

得到的护肤膏具有良好的吸水效果。

实施例E

带色的E/H治疗膏

制备具有下述组成的治疗膏:

-由Goldschmidt公司以商品名“Abil EM90” 销售的Céthyldiméthicone copolyol	5.0克
-Stearalkonium hectorite	2.0克
-辛基十二烷醇	8.0克
-癸烷基环戊硅氧烷	20.0克
香料	适量
抗氧化剂	适量
甘油	3.0克
由Miyoshi Kasei 公司以商品名“Cosmétique White SIC”销售的包裹硅酮的钛氧化物	4.9克
由Miyoshi Kasei 公司以商品名“Cosmétique	

black SIC” 销售的以硅酮包裹的黑铁氧化物	0.7克
由Miyoshi Kasei 公司以商品名 “Cosmétique	
Yellow SIC” 销售的以硅酮包裹的黄铁氧化物	0.7克
由Miyoshi Kasei公司以商品名 “Cosmétique	
Russet SIC” 销售的以硅酮包裹的红铁氧化物	0.7克
实施例2的化合物	0.50克
氯化钠	1.50克
去矿化水	适量至 100克

得到的膏具有良好的吸水效果。

实施例F

防晒膏

制备具有下述组成的防晒膏：

由ICI公司以商品名 “ARLACEL 165” 销售的

可自乳化的硬脂酸甘油酯	3.0克
十六醇	0.5克
硬酯醇	0.5克
角鲨烷	15.0克
芝麻油	10.0克
硬脂酸	3.0克
由BASF公司以商品名 “Uvinul M40”	
销售的2-羟基-4-甲氧基二苯	
甲酮	1.0克
甘油	5.0克
对羟基苯甲酸甲酯	0.3克

实施例2的化合物		0.3克
去矿化水	适量至	100克

得到的膏具有良好的吸水效果。

实施例G

Mascara (化妆品)

制备具有下述组成的化妆品:

硬脂酸三乙醇胺		15.0克
石蜡		3.0克
蜂蜡		8.0克
实施例2的化合物		0.5克
松香		2.0克
地蜡		10.0克
抗氧化剂	适量	
阿拉伯胶		0.5克
由Croda 公司以商品名 "Kerazol"		
销售的角蛋白水解物		1.0克
颜料		6.0克
去矿化水	适量至	100克

得到的化妆品具有良好的吸水效果

实施例H

指甲用划线底

制备具有下述组成的指甲划线底:

硝基纤维		12.0克
甲苯磺酰胺-甲醛树脂		9.0克

樟脑	1.0克
酞酸二丁酯	6.05克
乙酸丁酯	24.0克
乙酸乙酯	9.05克
异丙醇	6.0克
Stéaralkonium heetorite	1.0克
实施例2的化合物	0.01克
柠檬酸	0.02克
甲苯	适量至 100克

得到的划线底具有良好的吸水效果。

实施例I

口红

制备具有下述组成的口红：

香料	0.50克
由hüls公司以商品名“Miglyol 812” 销售的甘油三酸癸/辛酯	9.10克
蓖麻油	9.10克
丁羟基甲苯	0.16克
液体羊毛脂	12.80克
异丙基羊毛脂	4.50克
实施例2的化合物	0.50克
微晶蜡	11.0克
乙酸乙烯酯/硬脂酸烯丙酯按比例 为65/35的共聚物	4.50克

山萘酸辛基甘油酯	9.10克
颜料	9.00克
芝麻油	适量至 100克

得到的口红具有良好的吸水效果

实施例J

脸用防晒霜

第一相

类脂相

实施例1的化合物	1.0克
----------	------

棕榈酸脱水山梨糖酯	1.0克
-----------	------

胆固醇	0.7克
-----	------

由Ajinomoto公司以商品名“HS11”

销售的酰基谷氨酸钠	0.3克
-----------	------

α 生育酚的乙酸酯	0.3克
------------------	------

水相

甘油	3.0克
----	------

抗氧化剂	0.4克
------	------

柠檬酸	0.02克
-----	-------

去矿化水	适量至 50克
------	---------

第二相

挥发的硅酮油	10.0克
--------	-------

杏仁油	10.0克
-----	-------

香料	0.2克
----	------

由Goodrich公司以商品名“Carbopol 940”

销售的羧基丙烯酸混合物

0.42克

三乙醇胺

适量 pH6.5

去矿化水

适量至 100克

在第一相中，通过以不同的两性类脂化合物的液体形式混合组分制备该类脂相，其两性类脂化合物与 α -生育酚的乙酸酯缔合。在水相存在下处理所得到的类脂相，以便得到层状相。

在所得到的已水合的层状相中加入第二相。在均质器中剧烈搅拌其混合物以便分散在分散水相中的水泡。

这样得到一种白色的膏，粘度为15泊(1.5Pa/s)。得到的膏具有良好的吸水效果。

实施例1的化合物可用实施例2的化合物代替。