

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

A61K 7/135

A61K 7/035 A61K 7/48



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 03142938.6

[43] 公开日 2004 年 1 月 14 日

[11] 公开号 CN1466939A

[22] 申请日 2003.4.29 [21] 申请号 03142938.6

[30] 优先权

[32] 2002.6.20 [33] FR [31] 02/07638

[71] 申请人 莱雅公司

地址 法国巴黎

[72] 发明人 B·比尔特里

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 王其颢

权利要求书 3 页 说明书 14 页

[54] 发明名称 组合物的美容和/或皮肤学的用途和美容处理方法

[57] 摘要

含有至少一种由至少一种马来酞共聚物稳定的氧化敏感性亲水活性物质的组合物在化妆品和/或皮肤学中的用途。本发明涉及一种组合物应用于水相的生理上可接受的介质中使皮肤和/或包括体毛的毛发脱色和/或美白的化妆品和/或皮肤学用途，上述组合物含有至少一种选自抗坏血酸及其衍生物的氧化敏感性亲水活性物质和至少一种马来酞共聚物，所述马来酞共聚物包括一种或多种马来酞共聚用单体和一种或多种选自乙酸乙烯酯，乙烯醇，乙烯基吡咯烷酮，含有 2 - 20 个碳原子的石蜡和苯乙烯共聚用单体。

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

1. 一种组合物的美容用途，用于使皮肤和/或包括体毛的毛发的颜色变淡，所述组合物包括在一种含有水相的生理上可接受的介质中的至少一种氧化敏感性亲水活性物质和至少一种马来酞共聚物，所述氧化敏感性亲水活性物质选自抗坏血酸及其衍生物，所述马来酞共聚物包括一种或多种马来酞共聚用单体和一种或多种选自乙酸乙烯酯、乙烯醇、乙烯基吡咯烷酮、包含 2 到 20 个碳原子的烯烃和苯乙烯的共聚用单体。
2. 至少一种氧化敏感性亲水活性物质与至少一种马来酞共聚物的结合在含有水相的美容组合物中用作脱色剂的用途，所述活性物质选自抗坏血酸及其衍生物，所述马来酞共聚物包括一种或多种马来酞共聚用单体和一种或多种选自乙酸乙烯酯、乙烯醇、乙烯基吡咯烷酮、包含 2 到 20 个碳原子的烯烃和苯乙烯的共聚用单体。
3. 至少一种氧化敏感性亲水活性物质和至少一种马来酞共聚物的用途，用于制备一种使皮肤和/或包括体毛的毛发脱色的含有水相的皮肤学组合物，所述活性物质选自抗坏血酸及其衍生物，所述马来酞共聚物包括一种或多种马来酞共聚用单体和一种或多种选自乙酸乙烯酯、乙烯醇、乙烯基吡咯烷酮、包含 2 到 20 个碳原子的烯烃和苯乙烯的共聚用单体。
4. 根据权利要求 1-3 任一项的用途，其特征在于所述亲水活性物质选自抗坏血酸衍生物，如 5,6-二-氧-二甲硅烷基抗坏血酸、dl- α -生育酚基 dl-抗坏血酸基磷酸钾盐、抗坏血酸磷酸镁、抗坏血酸磷酸钠和抗坏血酸葡糖苷。
5. 根据权利要求 1-3 任一项的用途，其特征在于所述氧化敏感性亲水活性物质是抗坏血酸。
6. 根据权利要求 1-5 任一项的用途，其特征在于所述共聚物的马来酞单元以水解形式和碱性盐形式存在。
7. 根据权利要求 1-6 任一项的用途，其特征在于所述氧化敏感性活性物质和所述共聚物同时在水相中。

8. 根据权利要求 1-7 任一项的用途, 其特征在于所述共聚物中马来酐单元的摩尔分数为 0.1-1。

9. 根据权利要求 8 所述的用途, 其特征在于所述共聚物中马来酐单元的摩尔分数为 0.4-0.9。

5 10. 根据权利要求 1-9 任一项的用途, 其特征在于所述共聚物是苯乙烯与马来酐的共聚物, 苯乙烯与马来酐的比例为 50/50 的。

11. 根据权利要求 1-10 任一项的用途, 其特征在于所述共聚物是铵盐或钠盐形式的苯乙烯与马来酐的共聚物, 苯乙烯与马来酐的比例为 50/50。

10 12. 根据权利要求 1-11 任一项的用途, 其特征在于所述马来酐单体当量与所述氧化敏感性亲水活性物质的摩尔比在 0.005-10 之间变化。

13. 根据权利要求 12 的用途, 其特征在于所述马来酐单体当量与所述氧化敏感性亲水活性物质的摩尔比在 0.01-1 之间变化。

15 14. 根据权利要求 1-13 任一项的用途, 其特征在于所述共聚物浓度在所述水相重量的 0.1 和 40% 之间。

15. 根据权利要求 14 的用途, 其特征在于所述共聚物的浓度在所述水相重量的 0.1%-10% 之间。

20 16. 根据权利要求 1-15 任一项的用途, 其特征在于所述组合物还包括另一种脱色剂或抗色素沉着剂。

17. 根据权利要求 16 的用途, 其特征在于所述脱色剂或抗色素沉着剂选自曲酸; 鞣花酸; 熊果苷及其衍生物; 氢醌; 氨基苯酚的衍生物; 亚氨基苯酚的衍生物; L-2-氧噻唑啉啉-4-羧酸或前半胱氨酸, 和它的盐和酯; 4-丁基间苯二酚或 lucinol; 硫脲及其衍生物; D-泛酰巯基乙胺磺
25 酸钙; 抗坏血酸苷、抗坏血酸磷酸镁; 植物浸出液, 尤其是熊果属植物、桑果和黄芩的浸出液。

18. 用于使皮肤和/或包括体毛的毛发脱色和/或使其颜色变淡的美容处理方法, 该方法包括向皮肤和/或包括体毛的毛发涂敷一种组合物, 所述组合物包括至少一种氧化敏感性亲水活性物质和至少一种马来酐共

聚物，所述氧化敏感性亲水活性物质选自抗坏血酸及其衍生物，所述共聚物包括一种或多种马来酐共聚用单体和一种或多种选自乙酸乙烯酯、乙烯醇、乙烯基吡咯烷酮、包含 2-20 个碳原子的烯烃和苯乙烯的共聚用单体。

组合物的美容和/或皮肤学的用途和美容处理方法

5 技术领域

本发明涉及一种组合物的化妆品/美容和/或皮肤学用途，这种组合物在一种含水相的生理上可接受介质中包含至少一种氧化敏感性亲水活性物质/活性物质(active principle)和至少一种马来酞共聚物。

背景技术

10 已知向化妆品组合物中引入了各种各样的活性物质来向皮肤和/或毛发提供特殊处理。然而，在这些活性物质中有些表现出在水介质中不稳定和与水接触易发生分解的缺点，特别是因为氧化现象。这样随着时间的过去它们很快的失去其活性，这种不稳定性也与期望的效果相冲突。

因而，在长时间里，因为它们的众多有益特性，人们做了很多尝试去配制抗坏血酸或维生素 C。尤其是抗坏血酸可以促进结缔体素特别是胶原质的合成，增强皮肤组织对抗外来伤害（比如紫外线辐射和污染）的抵抗力，补偿皮肤中维生素 E 的不足，使皮肤脱色并起对抗自由基的作用。这些特性中的最后两个使它成为抗皮肤衰老或防皮肤衰老的化妆品或皮肤学活性物质的一种极好选择。遗憾的是因为抗坏血酸的化学结构（ α -酮内酯），它对于某些环境参数特别是氧化现象非常敏感。而在这些参数条件下特别是在氧气、光照或金属离子存在下，由于温度的作用或者在某些 pH 条件下，配制的抗坏血酸必然会迅速地发生分解。（Pharm. Acta. Helv., 1969, 44, 611-667; STP Pharma, 1985, 4, 281-286）

25 因而在现有技术中已经设想了几种解决方法来减少和/或减缓抗坏血酸的分解。

从而人们作出规定以其化学衍生物的形式（抗坏血酸磷酸镁或脂肪酸和抗坏血酸的酯）使用抗坏血酸，但这些衍生物的生物利用率非常低。（J. Am. Acad. Dermatol., 1996, 34, 29-33）

通过使用特殊的包装，抗坏血酸对氧的不稳定性能够得到改善，例

如在专利 US 5 935 584 中公开的在惰性气氛下的双间隔层，或者使用两相乳状液，其中一相由包含抗坏血酸的干粉组成，第二相是液相。两相的混合必须在使用的时候才能进行实现 (WO 98/43598)。这些解决方法在费用和生产操作的复杂性上有缺陷，在应用上有很大的限制。

5 现有技术提供的另外一种解决方法是使用高浓度的乙二醇或多元醇来减少氧在制剂中的溶解度，从而保护抗坏血酸 (WO 96/24325, EP 0 755 674, US 5 981 578)。如专利 US 6 020 367 所公布，多元醇可选加入到脂质体中。然而，这些解决方法表现出导致制剂粘稠的缺点，其美容质量难以提高。另外，存在高浓度的这些化合物会导致发炎现象。

10 抗坏血酸还能够在无水介质里配制，例如硅酮 (US 6 194 452)，能够在抗坏血酸周围建立一个无水的屏障。这种解决方法的一个主要缺点在于应用时缺乏新鲜度。

因而仍然存在着对可适用于特别是化妆品领域的一种组合物的需求，在这种组合物中一种在氧化介质中不稳定的亲水活性物质变得稳定
15 了，在使用时令人舒适，在使用后不会导致任何的皮肤发炎，且跟它的制造工艺中的工业实现的条件相适应。

抗坏血酸或它的衍生物在色素沉着过程中的活性已被熟知很多年。描述了各种各样的机理来解释它们对黑色素减少的作用。抗坏血酸对酪氨酸酶的抑制作用已经被证实 (J. Soc. Cosmet. Chem., 42, 1991, p, 361-
20 368)。它的一些酯已经在脱色处理中应用多年，也就是指抗坏血酸磷酸镁和抗坏血酸葡糖苷。最近，一项研究表明抗坏血酸磷酸镁能够降低黑色素细胞的枝晶度 (Pigment. Cell. Res., 13, 2000, p.89-98 与 p. 190-192)。

发明内容

25 本发明的目的就是提供一种组合物，这种组合物包含一种选自抗坏血酸及其衍生物的氧化敏感的活性物质，它在触感摸手感和耐受性上都表现出良好的美容特性，随着时间的流逝它的保存不需要特别的防护措施，而且它能够保持活性物质的脱色能力和/或发光/美白能力/使颜色变淡 (lightening/lighten) 的能力。

申请公司偶然发现，在其水相包含一种氧化敏感性活性物质如抗坏血酸的组合物中，马来酐共聚物的使用能使达到上述目标成为可能。

据申请公司所知,这类包含有马来酐单元的聚合物从未曾与易被氧化分解的亲水性活性物质结合使用以提高它们的稳定性。特别对于抗坏血酸更是如此。

因此本发明的一个主题就是一种组合物应用于使皮肤和/或包括体毛的毛发脱色和/或美白/使其颜色变淡/发光的化妆品和/或皮肤学用途，上述组合物在含有一种水相的生理上可接受介质里，含有至少一种选自于抗坏血酸及其衍生物的氧化敏感性亲水活性物质和至少一种马来酐共聚物。共聚物的存在量要足够稳定上述氧化敏感性亲水活性物质，优选的是氧化敏感性活性物质和共聚物都存在于水相中。

此外，这种组合物的用途还显示出既能抑制酪氨酸酶以减少黑色素生成，又能抑制黑色素细胞的枝晶化的优点。因此这种方法获得的脱色效果要远远大于例如单独使用抗坏血酸(它只对黑色素生成起作用)获得的脱色效果。

本发明的另一个主题是至少一种选自抗坏血酸及其衍生物的氧化敏感性亲水活性物质和至少一种马来酐共聚物组成的混合物/结合物/化合物/联合/结合 (combination) 在含有水相的化妆组合物中作为脱色剂的用途。

根据本发明，“亲水活性物质”一词应理解为室温（25 摄氏度）下在水中的溶解度至少为 0.25%的一种化合物。

根据本发明，“氧化敏感性亲水活性物质”一词应理解为任何天然的或人工合成的能够经受一种氧化性分解的活性物质。这种氧化现象有几种成因，特别是氧、光照或金属离子的存在，高温或特定的 pH 条件。

在没有暗指的条件限制下，在抗坏血酸的衍生物中，作为例子可以提到：盐类或酯类，特别是 5,6-二氧二甲基甲硅烷基抗坏血酸酯（参考 PRO-AA, Exsymol 出售），dl- α -生育酚基 dl-抗坏血酸基 磷酸钾盐（dl = 外消旋）（参考 SEPIVITAL. EPC, Senju Pharmaceutical 出售），抗坏血酸磷酸镁,抗坏血酸磷酸钠（参考 Stay-C 50, Roche 出售），和坏血

酸葡糖苷 (Hayashibara 出售)

在一特别有益的方面, 这种氧化敏感性亲水活性物质是抗坏血酸。

根据本发明, “马来酞共聚物”一词应理解为是指由一种或多种马来酞共聚单体与一个或多个选自乙酸乙烯酯, 乙烯醇, 乙烯基吡咯烷酮, 5 包含 2 到 20 个碳原子的烯烃例如十八烯, 乙烯, 异丁烯, 二异丁烯或异辛烯和苯乙烯的共聚单体相聚合所得到的任何聚合物, 马来酞共聚用单体可以选择部分或者完全被水解。优选使用亲水性聚合物, 即在水中的溶解度超过或等于 2 g/l 的聚合物。

尤其适合于实现本发明的共聚物, 是由一种或多种马来酞单元共聚 10 得到的共聚物, 这些马来酞单元是以水解的形式存在并优选是以碱盐的形式存在, 例如以铵盐、钠盐、钾盐或锂盐的形式。

对本发明的有益的方面, 共聚物的马来酞单元的摩尔分数在 0.1 到 1 之间, 更优选在 0.4 到 0.9 之间。

根据本发明的一个有利的方面, 马来酞单元当量与氧化敏感性亲水 15 活性物质的摩尔比在 0.005 到 10 之间变化, 优选在 0.01 到 1 之间。

这种马来酞共聚物的重均分子量将在 1000 到 500000 之间是有利的, 且优选在 1000 到 50000 之间。

优选使用苯乙烯与马来酞比率为 50/50 的共聚物。

例如, 可以使用苯乙烯/马来酞 (50/50) 的共聚物, 共聚物以 30% 20 的铵盐水溶液的形式存在, 由 Atofina 以商品名 SMA1000H[®] 出售或使用苯乙烯/马来酞 (50/50) 的共聚物, 共聚物以 40% 的钠盐水溶液的形式存在, 由 Atofina 出售商品名 SMA1000HNa[®]。

根据本发明这种共聚物在所述的组合物中的量要足以产生所期望的效果, 换句话说就是它的量要足以稳定氧化敏感性亲水活性物质。优选 25 这种共聚物的存在的重量相对于水相的总重量的浓度处在 0.1 和 40% 之间, 特别是在 0.1 和 10% 之间。

根据本发明所用的组合物是用来局部滴旋皮肤和/或皮肤的表面组织的生长, 因此它包含了一种生理可接受的介质, 即一种能够与皮肤组织如皮肤、头皮、睫毛、眉毛、头发、指甲和黏膜相容的介质。这种生理

上可接受的介质可以更特别是由水和任选的的一种选自例如 1 到 8 个碳原子的特别是 1 到 6 个碳原子的低醇，例如乙醇、异丙醇、丙醇或丁醇；含有 6 到 80 个环氧乙烷单元的聚氧乙烯；或者，多元醇，例如丙二醇、异戊二烯二醇、丁二醇、丙三醇或山梨醇的生理上可接受有机溶剂组成。

- 5 当这种生理相容的介质是一种水性介质时，它通常有一个与皮肤相适应的 pH 值，优选从 3 到 9 的，更优选从 3.5 到 7.5。

根据本发明所述的组合物可以是通常用于局部滴旋的任何药剂形式，且其形成特别可以是水或醇溶液、水包油 (O/W) 或油包水 (W/O) 或复合 (三层: W/O/W 或 O/W/O) 乳状液、水凝胶或一个脂肪相以小

10 球分散在水相中的分散液，这些小球可以是聚合体的微小粒子，如毫微球体和毫微胶囊，或离子的或非离子型的脂囊泡 (脂质体、niosomes 或者油质体)。这些组合物是用通常的方法准备的。

另外，根据本发明所用的组合物能够或多或少是流态的，其外观可以是白色或者有色的乳霜、油膏、乳剂、洗液、浆液、糊状物或泡沫。

15 它们还可以选择以气雾剂的形式应用于皮肤。它们还可以是固态形式，如棒形。

当根据本发明所用的组合物包含一种油相时，后者优选包含至少一种油。此外它还可以包含其它脂肪物质。

能用于本发明的组合物的油类物质，可以有，例如：

- 20 -来源于动物的烃油，如全氢化角鲨烯；
- 来源于植物的烃油，例如包含 4 到 10 个碳原子的脂肪酸的液态甘油三酸酯，如庚酸或辛酸的甘油三酸酯，或者还可以选择，如向日葵、玉米、大豆、葫芦、葡萄种子、芝麻、榛子、杏、澳大利亚坚果、arara、蓖麻或鳄梨油的甘油三酸酯，辛酸/癸酸的甘油三酸酯，如 Stéarineries Dubois
- 25 所出售的，或者 Dynamit Nobel 出售的 MIGLYOL 810,812 and 818，加州希蒙得木油，或烛果油；

-人工合成的酯和醚，尤其是脂肪酸如分子式为 R^1COOR^2 和 R^1OR^2 的油类的酯或醚，其中 R^1 代表包含 8 到 29 个碳原子的脂肪酸基， R^2 代表包含 3 到 30 个碳原子的有支链或无支链的烃链，例如 purcellin oil、

异壬酸异壬醇酯、肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸-2-乙基己基酯、2-辛基十二烷基硬脂酸酯、芥酸 2-辛基十二烷酯或异硬脂坏异硬脂酰酯；羧基酯，例如异硬脂酰基乳酸酯、羧硬脂酸辛酯、羧硬脂酸辛基月桂酰酯、苹果酸双异硬脂酰酯、柠檬酸三异鲸蜡酯或庚酸三异鲸蜡酯、脂肪醇的辛酸酯或癸酸酯；多元醇酯，例如丙烯二醇二辛酸酯、新戊二醇二庚酸酯和二甘醇-二异壬酸酯；和季戊四醇酯，例如季戊四醇四异硬脂酸酯；

-源自矿物或人工合成的直链或支链烃，例如易挥发的或不易挥发的液态石蜡和它们的衍生物、液态矿脂、聚癸烯或氢化聚异丁烯，例如 parleam oil；

-含有 8 到 26 个碳原子的脂肪醇，例如十六烷醇、十八烷醇以及它们的混合物 (cetearyl alcohol)、辛基十二烷醇、2-丁基辛醇、2-己基癸醇、2-十一烷基十五烷醇、油醇或亚油醇；

-部分含烃和/或含硅的氟化油类，例如在文献 JP-A-2-295912 中所公开的；

-硅油，例如室温下是液体或是糊状的含有一个直链或环状硅链的易挥发或不易挥发的聚甲基硅氧烷 (PDMS)，特别是环聚二甲基硅氧烷 (cyclomethicone)，如环己硅氧烷；在硅链的末端含有 2 到 24 个碳原子的侧烷基、侧烷氧基或侧苯基或烷基、烷氧基或苯基的聚二甲基硅氧烷；或苯基化硅酮，例如苯基三甲硅酮，苯基二甲硅酮，苯基三甲硅氧基二苯基硅氧烷，二苯基二甲硅酮，二苯基甲基二苯基三硅氧烷，(2-苯基乙基)三甲硅氧基硅酸酯和聚甲基苯基硅氧烷；

-它们的混合物。

在上述油类的列举中“烃油”一词应理解为主要由碳原子和氢原子和可选酯、醚、氟化、羧酸和/或醇基团组成的油。

可以存在于油相中的其它脂肪物质有，例如含有 8 到 30 个碳原子的脂肪酸，例如硬脂酸、月桂酸、棕榈酸)和油酸；蜡例如羊毛脂、蜂蜡、巴西棕榈蜡或小烛树蜡、石蜡或褐煤蜡或微晶蜡、纯地蜡或地蜡、或合成蜡如聚乙烯蜡或 Fischer-Tropsch 蜡；硅氧烷树脂，例如三氟甲

基C₁₋₄烷基二甲硅酮和三氟丙基二甲硅酮;和硅酮弹性体,如Shin-Etsu 出售名为“KSG”的产品,Dow Corning 出售“Trefil”,“BY29”或“EPSX”,或Grant Industries 出售的“Gransil”。

本领域技术人员可以用不同的方法选择这些脂肪物质来制备一种拥有期望特性(例如稠度或结构)的组合物。

根据本发明一个特定实施例,本发明所述的组合物是一种油包水(W/O)或水包油(W/O)型乳状液。乳状液中油相的重量占组合物总重量的比例在5%到80%的范围,优选在5%到50%。

这些乳状液通常含有选自两性、阴离子、阳离子或非离子乳化剂中的至少一种乳化剂,可以单独使用也可混合使用,并可选含有一种辅助乳化剂。根据想得到的乳化液(W/O或O/W)可以对乳化剂进行适当选择。这种乳化剂和辅助乳化剂通常在组合物中的比例为,其重量占组合物总重量的比例在0.3%到30%,更优选在0.5%到20%的范围之内。

对于W/O型乳化液,乳化剂可以是,例如二甲硅酮共聚多元醇,如Dow Corning 出售的名为“DC 5225 C”的环二甲硅酮和二甲硅酮共聚多元醇的混合物,和烷基二甲硅酮共聚多元醇,如Dow Corning 出售的名为“Dow Corning 5200 Formulation Aid”的月桂基甲硅酮共聚多元醇和Goldschmidt 出售的名为Abil EM 90^R的鲸蜡基二甲硅酮共聚多元醇。W/O 乳化液的表面活性剂还可以使用含有至少一个氧亚烷基化基团的交

20 联固体有机聚硅氧烷弹性体,例如根据文献US-A-5 412 004 中实施例3、4和8和文献US-A-5 811 487 中的实施例的步骤所获得的产品,特别是专利US-A-5 412 004 中实施例3的(合成例)产品,以及如Shin Etsu 所出售的商品名KSG 21。

对于O/W型乳化液,乳化剂可以是,非离子型乳化剂,例如脂肪

25 酸酯和甘油的氧亚烷基化(特别是聚氧乙烯基化)的酯;脂肪酸和山梨聚糖的氧亚烷基化的酯;脂肪酸的氧亚烷基化(氧乙烯基化和/或氧丙烯基化)的酯;脂肪醇的氧亚烷基化(氧亚乙基化和/或氧亚丙基化)的醚;糖酯,例如蔗糖硬脂酸酯;以及它们的混合物,如硬脂酸甘油酯和PEG-40的硬脂酸酯混合物。

本发明中的这种美容的或者皮肤病学的组合物按照已知的方式还可以包含在美容或者皮肤病学领域惯用的辅助剂,例如亲水的或亲脂的胶凝剂、防腐剂、溶剂、香料、填料、紫外线屏蔽剂、杀菌剂、吸臭剂、颜料、植物浸出液或盐类。在研究中,这些不同的辅助剂可采用传统用于该领域中的辅助剂的用量,例如用量为这种组合物总重量的 0.01%到 20%。依靠这些辅助剂的特性,它们能够进入油脂相、水相和/或者油脂小球。

能够用于本发明组合物的填料可以是,例如颜料、二氧化硅粉末;滑石;聚酰胺颗粒,尤其是 Atochem 所售的名为 Orgasol 的聚酰胺颗粒;聚乙烯粉末;基于丙烯酸共聚物的微珠,例如由 Dow Corning 所售名为 Polytrap 的由二甲基丙烯酸乙二醇酯/甲基丙烯酸月桂醇酯共聚物制成的微珠;多孔粉末,例如空心的微珠,尤其是 Kemanord Plast 出售的 Expancel 的空心微珠或者 Matsumoto 出售的商品名 Micropearl F 80 ED 的空心微珠;有机硅树脂微珠如 Toshiba Silicone 出售的商品名 Tospearl 微珠和它们的混合物。这些填料能够使用的范围是它们的重量相对于这种组合物总重量的 0 到 20%,而更可取得范围是 1%到 10%。

根据优选实施例,本发明所述的这种组合物另外还能包含至少一种有机光防护剂和/或至少一种无机光防护剂,其紫外线 A 区和/或紫外线 B 区是活性的(吸收剂)它们溶于水或者油脂,否则不溶于常用的化妆品溶剂,它们选自下述的试剂,由 INCI 名称来表示:

对氨基苯甲酸(PABA)的衍生物,尤其是 PABA、乙基 PABA,乙基二羟丙基 PABA、乙己基二甲基 PABA(特别是 ISP 出售的“Escalol 507”),甘油基 PABA 或者 PEG-25 PABA(BASF 出售的“Uvinul P25”)。

水杨酸衍生物,特别是 homosalate (Rona/EM Industries 出售的“Eusolex HMS”)、水杨酸乙基己酯(Haarmann 和 Reimer 出售的“Neo Heliopan OS”),水杨酸二丙二醇酯(Scher 出售的“Dipsal”),或者 TEA 水杨酸酯(Haarmann 和 Reimer 出售的“Neo Heliopan TS”)

二苯甲酰甲烷的衍生物,尤其是丁基甲氧基二苯甲酰甲烷(特别是 Hoffmann-LaRoche 出售的“Parsol 1789”)或异丙基二苯甲酰甲烷。

肉桂酸的衍生物，特别是甲氧基肉桂酸乙基己酯（特别是 Hoffmann-La- Roche 出售的“Parsol MCX”），甲氧肉桂酸异丙酯、甲氧基肉桂酸异戊酯（Haarmann 和 Reimer 出售的“Neo Heliopan E 1000”），甲氧肉桂酸乙酯，DEA 甲氧基肉桂酸酯，甲基肉桂酸二异丙酯，或乙基乙酸酯基二甲氧肉桂酸甘油酯。

β,β -二苯基丙烯酸酯，特别是 octocrylene（特别是 BASF 出售的“Uvinul N539”）或 etocrylene（特别是 BASF 出售的“Uvinul N53”）。

二苯甲酮，尤其是二苯甲酮-1（BASF 出售的“Uvinul 400”），二苯甲酮-2（BASF 出售的“Uvinul D50”），二苯甲酮-3 或羟苯甲酮（BASF 出售的“Uvinul M40”），二苯甲酮-6（Norquay 出售的“Helisorb 11”），二苯甲酮-8（American Cyanamid 出售的“Spectra-sorb UV-24”），二苯甲酮-12，或 2-(4-二乙氨基-2-羟甲苯酰基) 苯甲酸正己酯。

苯亚甲基樟脑的衍生物，尤其是 3-苯亚甲基樟脑（Chimex 生产的“Mexoryl SD”），4-甲基苯亚甲基樟脑（Merck 出售的“Eusolex 6300”）或聚丙烯醛酰氨基甲基苯亚甲基樟脑（Chimex 生产的“Mesoryl SW”）。

三嗪衍生物，尤其是不对称三嗪（Ciba Specialty Chemicals 出售的“Tinosorb S”），乙基己基三嗪酮（特别是 BASF 所售的“Uvinul T150”），二乙基己基丁酰氨基三嗪酮（Sigma 3V 出售的“Uvasorb HEB”）或 2,4,6-三(4'-氨基苯亚甲基丙二酸二异丁酯) 均三嗪。

苯并三唑，特别是苯并三唑基甲基苯酚三硅氧烷（Rhodia Chimie 出售的“Silatrizole”）或亚甲基双苯并三唑基四甲基丁基酚（Fairmount Chemical 所售固体形式的“Mixxim BB/100”或 Ciba Specialty Chemicals 出售的为在水分散系中的微粉化的形式的“Tinosorb M”）。

氨基酸的衍生物，特别是氨基酸薄荷酯（Haarmann 和 Reimer 出售的“Neo Heliopan MA”）。

咪唑啉衍生物，特别是二甲氧基苯亚甲基二氧化咪唑啉丙酸乙基己酯。

丙二酸苯亚甲酯衍生物，特别是含有丙二酸苯亚甲酯官能团的聚硅氧烷（Hoffmann-LaRoche 出售的“Parsol SLX”）；

以及它们的混合物。

特别是在专利申请 EP 518 772 和 EP 518 773 中公开了的选自颜料或者说是纳米颜料（颜料颗粒的平均粒径：通常在 5nm 和 100nm 之间，优选在 10nm 和 50nm 之间）的由涂敷的或非涂敷的金属氧化物制成的无机光防护剂，如氧化钛（在金红石和/或锐钛矿结构时是非晶体或晶体），氧化铁、氧化锌、氧化锆或氧化铈纳米颜料，它们本身都是有名的紫外线光防护剂；传统的涂层剂，如氧化铝和/或硬脂酸铝；由涂敷的或非涂敷的金属氧化物制成的纳米级颜料。

更优选的有机光防护剂选自于水杨酸乙基己酯，甲氧基肉桂酸乙基己酯、octocrylene、二苯甲酮-3、4-甲基苯亚甲基樟脑、2,4,6-三（4'-氨基-苄亚甲基二酸二异丁酯）-均-三嗪、不对称三嗪、乙基己基三嗪酮、二乙基己基丁酰氨基三嗪酮、亚甲基双苯三唑基四甲基丁基苯酚、苯并三唑基甲基苯酚三硅氧烷和它们的混合物。

存在于根据本发明所述的组合物中的光防护剂通常占组合物总重量的 0.1%到 20%，优选 0.2%到 15%。

在本发明的另外一个有利的方面，所用的组合物可以另外包括至少一种其它脱色或防脱色活性物质。

能够掺入本发明所述的组合物的脱色或防脱色剂包含例如以下化合物：曲酸；鞣花酸；熊果苷及其衍生物，如在申请 EP-895 779 和 EP-524 109 中所公开的那些；氢醌；氨基苯酚的衍生物，如申请 WO 99/10318 和 WO 99/32077 中所公开的那些，特别是 N-胆甾烯氧基羰基-对-氨基苯酚和 N-乙氧基羰基-对-氨基苯酚；亚氨基苯酚的衍生物，特别是在申请 WO 99/22707 中所公开的那些；L-2-氧噻唑啉啉-4-羧酸或前半胱氨酸（procysteine），和它的盐和酯；抗坏血酸及其衍生物，特别是抗坏血酸苷和抗坏血酸磷酸镁；4-丁基间苯二酚或 lucinol（没有统一中文译文的科技术语）；硫脲及其衍生物；D-泛酰巯基乙胺磺酸钙；和植物浸出液，特别是熊果属植物、桑果和黄芩的浸出液，但并不仅限于所列出的。

根据本发明所述组合物能够应用于皮肤、包括体毛的毛发、睫毛、

指甲或嘴唇。因此它能应用于一种包括把根据本发明所述的组合物施加在皮肤和/或包括体毛的毛发的使皮肤和/或包括体毛的毛发脱色和/或美白/使其颜色变淡/发光的美容处理过程。

下面的实施例是用于说明本发明的，而不要对本发明进行限制。其中的化合物的引用，视不同情况，是根据化学名或 CTFA 名（国际化妆品组份字典和手册）。

具体实施方式

实施例

实施例 1: 加速贮存试验

10 本试验的目的是为了研究氧化敏感性亲水活性物质在 45℃ 下贮存两个月后的分解。准备了各种不同溶液，它们的组成整理如下表：

表 I:

组合物（水中）	抗坏血酸	聚合物 1	聚合物 2
溶液 A(对照)	15%	-	-
溶液 B	15%	1%	-
溶液 C	15%	-	1%
溶液 D(对照 2)	5%	-	-
溶液 E	5%	1%	-
溶液 F	5%	-	1%

所有溶液都用 8.9mol/L KOH 溶液调整 pH 值为 6。

聚合物的百分含量按活性物质给出。

15 共聚物 1: 苯乙烯/马来酐 (50/50) 共聚物，以 30% 的铵盐水溶液的形式，由 Atofina 出售商品名 SMA 1000H。

共聚物 2: 苯乙烯/马来酐 (50/50) 共聚物，以钠盐的形式，由 Atofina 出售商品名 SMA 1000HNa。

测出的分解程度由比率给出：

20 $(C_0 - C_{2\text{个月}}) / C_0$

其中 C_0 和 $C_{2\text{个月}}$ 分别表示在上表所示条件下 $t=0$ 和 $t=2$ 个月时抗坏血酸的浓度。

抗坏血酸的浓度由 HPLC 法(LaChrom Merck 系统)测定, 分析条件如下:

色谱柱: Lichrosphere 100 RP18 (250mm)

洗提液: 0.1M 磷酸缓冲液, pH 值为 2.1

5 流量: 1ml/min

检测波长为 257nm

稀释样品以使抗坏血酸的浓度在 0.05 和 1mg/ml 之间。

10 获得的结果整理如下面表 II:

	于 45℃ 下 2 个月后的分解程度 (%)	
	空气中, 淡黄色玻璃瓶	氮气中, 铝制瓶
溶液 A (对照 1)	43	19.4
溶液 B	16	13.8
溶液 C	17.6	9.7
溶液 D (对照 2)	45.4	29.6
溶液 E	13.4	4.1
溶液 F	9	5.1

由表 II 可知, 浓度为 5 或 15% 的抗坏血酸, 在有本发明的聚合物 1 和聚合物 2 存在时, 甚至在大气氧存在时, 跟对照样相比, 其稳定性得到了改进。

15 因为提到的这些共聚物是亲水性的, 所以把它们加入到抗坏血酸水溶液中能够充分稳定抗坏血酸。

实施例 2: 黑色素细胞的枝晶度活性的证明:

本试验的目的是为了表明抗坏血酸与一种根据本发明所述的共聚物的组合对调节人体角质化细胞-黑色素细胞的联合培养的黑色素生成的效果。

20 方法:

用抗坏血酸/苯乙烯/马来酐(50/50)共聚物(40%的钠盐水溶液形式)组合物,对细胞进行7天的处理以接种。

检测:

用 NK1beteb 抗体(绿色)对黑色素细胞进行示踪,其能够在黑色素成熟的每个阶段识别黑素体。所有黑色素细胞和角质化细胞的细胞核用 propidium 碘(红色)来着色。

结果:

• 在无抗坏血酸/苯乙烯/马来酐(50/50)共聚物(40%的钠盐水溶液形式)组合物,联合培养基内的黑色素细胞是高度枝晶状的。色素显然传给了相邻的角质化细胞。

• 在抗坏血酸/苯乙烯/马来酐(50/50)共聚物(40%的钠盐水溶液形式)组合物存在时,大多数黑色素细胞枝晶度降低,且一些黑色素细胞变成两极细胞。

• 在更高的浓度,大多数黑色素细胞成为两极细胞,且传给角质化细胞的色素的量减少。

实施例 3: O/W 抗斑霜

以下组合物以本领域技术人员的惯用方法制备。

A ₁	◆ 三硬脂酸脱水山梨糖醇酯	0.7g
	◆ 聚乙二醇(40 EO)硬脂酸酯	1.6g
	◆ 十六醇	3.2g
	◆ 一、二、三棕榈酸/硬脂酸甘油酯	2.4g
	◆ 十四酸十四烷基酯	2g
	◆ Karite buffer 的液体馏分	2g
	◆ 防腐剂	0.2g
A ₂	◆ 环戊二甲基硅氧烷	15g
B	◆ 软化水	58.29g

◆ 甘油	3g
◆ 抗坏血酸	5g
◆ 50%的氢氧化钾	2.97g
◆ 苯乙烯/马来酐共聚物, 30%的铵盐水溶液 (SMA1000H®, Atofina)	3.34g
◆ 防腐剂	0.2g
C ◆ 香料	0.1g

这种使用时柔软的面霜,使得减少色斑成为可能且能赋予抗坏血酸良好的稳定性。

实施例 4: 脱色凝胶

5 以下组合物以本领域技术人员的惯用方法制备。

◆ 软化水	76.28g
◆ 聚丙烯酰胺/C ₁₃ -C ₁₄ 异链烷烃/Laureth-7(Sepigel 305)	2g
◆ 硅油	10g
◆ 抗坏血酸	5g
◆ 50%的氢氧化钾	2.97g
◆ 苯乙烯/马来酐 (50/50) 共聚物, 40 的%钠盐水溶液 (SMA1000HNa®, Atofina)	2.5g
◆ 防腐剂	0.25g
◆ 螯合剂	0.1g

得到一种新调制的凝胶,这种凝胶使得抗击皮肤斑成为可能,且其中的抗坏血酸有良好的稳定性。