

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

A61K 7/32

A61K 7/00



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 01812366. X

[43] 公开日 2003 年 9 月 3 日

[11] 公开号 CN 1440271A

[22] 申请日 2001.6.30 [21] 申请号 01812366. X

[30] 优先权

[32] 2000. 7. 7 [33] DE [31] 10033022.3

[86] 国际申请 PCT/EP01/07514 2001.6.30

[87] 国际公布 WO02/03927 德 2002.1.17

[85] 进入国家阶段日期 2003.1.6

[71] 申请人 考格尼斯德国两合公司

地址 德国杜塞尔多夫

[72] 发明人 艾伯托·科比拉

克里斯琴·索米格利亚纳

[74] 专利代理机构 北京市柳沈律师事务所

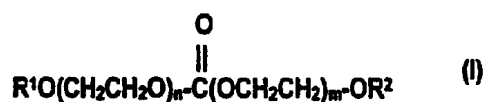
代理人 范明娥 张平元

权利要求书 1 页 说明书 21 页

[54] 发明名称 含有碳酸二烷基酯和推进剂的除臭剂及其作为气溶胶的用途

[57] 摘要

本发明涉及一种新型化妆品和/或药物制剂，含有：(a) 式(I)的碳酸二烷基酯，式中：R¹代表具有 6-22 个碳原子的直链烷基和/或链烯基、2-乙基-己基、异十三烷基或异硬脂基或由具有 2-15 个碳原子和至少 2 个羟基的多元醇衍生的基团，R²代表 R¹或具有 1-5 个碳原子的烷基，n 和 m 各自独立地代表 0 或 1-100 的数，和(b) 推进剂。

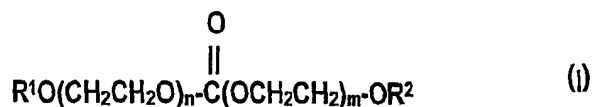


ISSN 1008-4274

1. 化妆品和/或药物制剂，含有

(a) 式(I)的碳酸二烷基酯，

5



式中：R¹代表具有6 - 22个碳原子的直链烷基和/或链烯基、2-乙基-己基、
异十三烷基或异硬脂基或由具有2 - 15个碳原子和至少2个羟基的多元醇
10 衍生的基团，R²代表R¹或具有1 - 5个碳原子的烷基，n和m各自独立地
代表0或1 - 100的数和

(b) 推进剂。

2. 根据权利要求1的制剂，其特征在于：碳酸二烷基酯是碳酸二辛酯和
/或碳酸二烷基酯。

15 3. 根据权利要求1和/或2的制剂，其特征在于：推进剂选自二甲醚、
二氧化碳、氟氯烃、氧化氮和戊烷、丁烷和丙烷和/或它们的异构体。

4. 根据权利要求1 - 3至少一项的制剂，其特征在于：还含有聚合物、
硅氧烷化合物、卵磷脂、磷脂、生物活性物质、防紫外线因子、抗氧化剂、
除臭剂、止汗剂、止屑剂、成膜剂、驱虫剂、自行变黑剂、酪氨酸抑制剂、
20 水溶助剂、增溶剂、防腐剂、芳香油和颜料等。

5. 根据权利要求1 - 4至少一项的制剂，其特征在于：还含有防紫外线
因子、自行变黑剂、除臭剂、止屑剂、生物活性物质、驱虫剂、芳香油和颜
料。

6. 根据权利要求1 - 5至少一项的制剂，其特征在于：按最终组合物计
25 含有

(a) 1 - 50 % (重量)碳酸二烷基酯，

(b) 3 - 95 % (重量)推进剂和任选地

(c) 0 - 30 % (重量)辅剂和添加剂

条件是用水将数量补充到100 % (重量)。

30 7. 权利要求1的制剂作为气溶胶的用途。

8. 权利要求1的制剂作为化妆品气溶胶的用途。

含有碳酸二烷基酯和推进剂的除臭剂 及其作为气溶胶的用途

5

发明领域

本发明涉及含有碳酸二烷基酯和推进剂的除臭剂以及其作为气溶胶的用途。

10

现有技术

气溶胶或喷雾器的特点是不仅易于处理、适于配制和符合卫生要求，而且与外界隔绝的内含物具有始终不变的有效性。由于这个原因，近年来气溶胶广泛地用于化妆品、家庭和工业中，以致不能作喷雾剂用的活性物质几乎都不可想象(Aerosol Spray Report 36, 第3期, 第10页(1997), Aerosol Spray Report 36, 第9期, 第80页(1997), Aerosol Spray Report 36, 第6期, 第34页(1997), allg.:Kirk-Othmer(4.)1,670-685; 22, 670-691, Ullmann(4.)2, 254-259; 7, 114-118;(5.)A12,581-583 is.a.Aerosole.-Zeitschriften u. Organisationen siehe Aerosole)。在迄今为止现有技术公开的气溶胶制剂中，仅能加入少量的油体，例如肉豆蔻酸异丙酯和环聚二甲基硅氧烷。

20

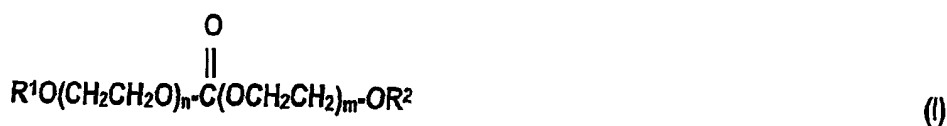
因此，本发明的目的是提供一种新型油体，它可以与现有技术公开的推进剂，优选丁烷和/或丙烷和其衍生物混合，因此可用作气溶胶。同样还可以向这种气溶胶混合物中加入诸如香料、维生素、除臭剂等类的活性物质。

发明描述

25

本发明的主题是化妆品和/或药物制剂，含有

(a) 式(I)的碳酸二烷基酯，



30 式中：R¹代表具有6 - 22个碳原子的直链烷基和/或链烯基、2-乙基-己基、

异十三烷基或异硬脂基或由具有 2 - 15 个碳原子和至少 2 个羟基的多元醇衍生的基团, R^2 代表 R^1 或具有 1 - 5 个碳原子的烷基, n 和 m 各自独立地代表 0 或 1 - 100 的数和

(b) 推进剂。

- 5 令人惊奇地发现可以制备一种可加入碳酸二烷基酯和与已知推进剂充分混合的气溶胶制剂。在本发明中, 同样可以获得推进剂与碳酸二烷基酯摩尔比为 1:1 的气溶胶。另外, 芳香油、UV-滤光剂、除臭剂和视应用目的而加入的其他添加剂能与碳酸二烷基酯一起较好并均匀溶解在气溶胶中。研究还发现了其他优异的效果, 与现有技术相比, 含有碳酸二烷基酯, 特别是碳酸二辛酯和碳酸二己酯的气溶胶使皮肤特别干燥。

气溶胶

- 气溶胶或喷雾器是指装有液态、糊状或粉状物质并处于推进剂或推动气体压力下的已知喷雾装置。容器配有型号各异的能使内含物以雾、烟、泡沫、粉剂、膏或液体形式射出的阀。在本情况下含有碳酸二烷基酯和任选的其他
15 活性物质的活性物质溶液(也称为待雾化产品)与液态的推进剂相混合。通过这种混合, 向各侧施加均匀压力的气态推进剂也位于活性物质-推进剂混合物的液面上。在向按钮加压时, 阀打开。气态推进剂使活性物质-推进剂混合物通过升液管向上压出并通过阀而离开盒。混在活性物质溶液中的推进剂立即蒸发, 使活性物质溶液雾化成极细的雾(雾化)或形成小泡状的泡沫。喷雾器
20 制备等技术参见有关的现有技术。为了测定颗粒大小(喷雾时的一个重要参数), 采用了专门研制的设备或全息照相术、光散射、放射性标记等等。制备、检验和在喷雾器盒内的储存参见某些说明书和规定(工业处理压缩气体和压力罐)。

- 压缩气体容器主要是由金属(铝、白铁皮, <1000 毫升)、防护性的或不
25 易碎的玻璃或塑料(<220 毫升)或易碎的玻璃或塑料(<150 毫升)制的圆柱形容器, 其中选择具有抗压强度和抗破裂性、耐腐蚀性、易于填充性、必要时的可灭菌性等的容器, 但是也应兼顾美观、便于使用、可压性等作用(参见 Rompp Lexikon Chemie-Version 2.0, Stuttgart/New York: Georg Thieme 出版社 1999)。

30 碳酸二烷基酯

尽管本文第一次描述了一些所要求的碳酸酯, 但是构成组分(a)的碳酸二

烷基酯基本上是常见的物质。该物质基本上可按现有技术的方法通过碳酸二甲酯或碳酸二乙酯与所述的羟基化合物进行酯化反应而制备；例如在 Chem. Rev. 96, 951(1996)的综述中可以查到制备方法。特别适合于实现上述目的的式(I)碳酸二烷基酯满足下列条件：

- 5 (A) R^1 代表具有 6 - 18 个碳原子，优选 6 - 16 个碳原子和特别优选 8 - 10 个碳原子的直链烷基，或 2-乙基己基和 R^2 代表 R^1 或甲基；
(B) R^1 代表具有 12 - 18 个碳原子的直链烷基， R^2 代表 R^1 或甲基和 n 和 m 分别代表 1 - 10 的数；
(C) R^1 代表多元醇基团，所述多元醇基团选自甘油、亚烷基二醇、工业级低
10 聚甘油混合物、羟甲基化合物、低级烷基葡萄糖苷、糖醇、糖和氨基糖，和 R^2 代表 R^1 、具有 8 - 12 个碳原子的直链或支链烷基或甲基。

- (A)和(B)两组碳酸二烷基酯的典型实例是碳酸二甲酯和/或碳酸二乙酯与下列醇的全酯化或偏酯化产物，所述醇是己醇、辛醇、2-乙基己醇、癸醇、月桂醇、异十三烷醇、肉豆蔻醇、鲸蜡醇、棕榈油醇、十八烷醇、异十八烷
15 醇、油醇、反十八稀醇、岩芹醇、亚油醇、亚麻醇、桐醇、花生醇、顺式 9-二十碳烯醇、山萹醇、瓢儿菜醇和巴西烯醇以及它们的工业混合物，这些物质是例如在基于由罗林羰基合成法中的脂肪和油或醛工业甲酯的高压氢化中以及在不饱和脂肪醇的二聚中作为单体的溜分而形成的。同样合适的是以
20 含 1 - 100，优选 2 - 50，特别优选 5 - 20 摩尔环氧乙烷的加成物形式存在的低级碳酸酯与所述醇的酯化产物。优选的是碳酸二正辛酯。特别优选碳酸二辛酯或碳酸二己酯。

本文首次提到(C)组的碳酸酯。它们是使碳酸二甲酯和/或碳酸二乙酯与多元醇进行完全或部分酯化反应而获得的物质。本发明中使用的多元醇优选具有 2 - 15 个碳原子和至少 2 个羟基。典型的实例是

- 25 · 甘油
· 亚烷基二醇类，例如乙二醇、二乙二醇、丙二醇、丁二醇、己二醇和平均分子量为 100 - 1000 道尔顿的聚乙二醇；
· 自缩合度为 1.5 - 10 的工业低聚甘油混合物，例如二甘油含量为 40 - 50 % (重量)的工业二甘油混合物；
30 · 羟甲基化合物，特别是三羟甲基乙烷、三羟甲基丙烷、三羟甲基丁烷、季戊四醇和二季戊四醇；

·低级烷基葡糖苷，特别是那些在烷基上具有 1 - 8 个碳原子的烷基葡糖苷，例如甲基葡糖苷和丁基葡糖苷；

·具有 5 - 12 个碳原子的糖醇，例如山梨糖醇或甘露糖醇；

·具有 5 - 12 个碳原子的糖，例如葡萄糖或蔗糖；

5 ·氨基糖，例如葡糖胺。

当然在该反应中，不仅能用多元醇基团取代甲基或乙基，而且也可获得一种多元醇中的多个、甚至全部的羟基与碳酸酯基团结合的混合物，以致需要时甚至形成一种低聚或聚合的网状结构。本发明的通式(I)同样包括这种物质。

10 本发明的制剂可以含有碳酸二烷基酯，优选碳酸二辛酯和/或碳酸二己酯，特别是碳酸二正辛酯，其含量按最终组合物计为 1 - 50 %(重量)，优选 3 - 25 %(重量)，特别优选 5 - 15 %(重量)。

推进剂

合适的推进剂是所有专业人员熟悉的产生液化或压缩气体的推进剂，例如二甲醚、二氧化碳、氟氯烃(FCKW)、氧化氮和戊烷、丁烷和丙烷和它们的异构体。这里根据喷雾产品和应用领域进行选择。在使用一般不溶于液态喷雾器内含物中的诸如氮、二氧化碳或氧化二氮的压缩气体的情况下，靠每个阀门操作而下降所用压力。这种推进剂主要用于无需形成特别细雾状的液态产品中，例如牙膏、护肤霜、防晒霜、果汁浓缩物和香料浓缩物、搅奶油
15 (这里仅用 N_2O ，也可与 CO_2 一起用)、药物喷雾剂(这里因麻醉危险而不适合用 N_2O)、净化喷雾剂、润滑喷雾剂和抛光剂喷雾剂。溶于活性物质或本身作为溶剂使用的液化气体用作推进剂的优点是具有恒定的工作压力和均匀的分布，因为推进剂在空气中突然蒸发，其体积扩大几百倍，致使固态或液态的活性物质分布的很细。通过选择适当的混合比来部分缓和在液化气体的应用
20 中在化妆品喷雾器中经常不希望出现的冷却效果。

自从认识到 FCKW 对臭氧层有破坏作用以来，今天普遍采用特别适合作推进剂的 FCKW 的替代品。优选使用丙烷和丁烷的混合物，也可部分使用二甲醚(Rompp Lexikon Chemie-Version 2.0，Stuttgart/New York: Georg Thieme 出版社 1999)。

30 本发明的制剂含有按最终组合物计 3 - 95 %(重量)，优选 5 - 75 %(重量)，更优选 20 - 65 %(重量)和特别优选 30 - 50 %(重量)的推进剂。

工业实用性

本发明的另一目的是本发明制剂作为气溶胶，特别是化妆品气溶胶的用途。但是本发明涉及所有专业人员熟悉的气溶胶应用领域，优选用在家庭(例如用于净化等)，也涉及行业和工业应用领域。

在本发明的一个优选实施方案中，组合物含有按最终组合物计的下列数量的组分(a)和(b)：

- (a) 1 - 50 %(重量)，优选 3 - 25 %(重量)和更优选 5 - 15 %(重量)碳酸二烷基酯，
- 10 (b) 3 - 95 %(重量)，优选 5 - 75 %(重量)，更优选 20 - 65 %(重量)和特别优选 30 - 50 %(重量)推进剂和任选地
- (c) 0 - 30 %(重量)，优选 1 - 20 %(重量)和更优选 4 - 12 %(重量)辅剂和添加剂。

条件是用水补足该数量至 100 %(重量)。所述条件均是针对最终组合物的。

在本发明的一个优选实施方案中，碳酸二烷基酯与推进剂的摩尔比为 1:5 - 1:1，优选 1:3 - 1:1.5。在本发明另一优选实施方案中，同样可添加其他辅剂和添加剂(参照下文)，例如聚合物、硅氧烷化合物、卵磷脂、磷脂、生物活性物质、防紫外线因子、抗氧化剂、除臭剂、止汗剂、止屑剂、成膜剂、驱虫剂、自行变黑剂、酪氨酸抑制剂、水溶助长剂、增溶剂、防腐剂、芳香油和颜料等，优选防紫外线因子、自行变黑剂、除臭剂、止屑剂、生物活性物质、驱虫剂、芳香油和颜料。在本发明的一个优选实施方案中，碳酸二烷基酯与上述添加剂的摩尔比为 10:1 - 1:10，优选 5:1 - 1:5，更优选 3:1 - 1:3。这种混合物能很好地与本发明的推进剂相混合。

25 辅剂和添加剂

该制剂也可含有作为辅剂和添加剂使用的温和型表面活性剂、油体、乳化剂、稠化剂、增稠剂、富脂剂、稳定剂、聚合物、硅氧烷化合物、脂肪、蜡、卵磷脂、磷脂、生物活性物质、防紫外线因子、抗氧化剂、除臭剂、止汗剂、止屑剂、成膜剂、溶胀剂、驱虫剂、自行变黑剂、酪氨酸抑制剂(脱色剂)、水溶助长剂、增溶剂、防腐剂、芳香油和颜料等。

表面活性剂

表面活性剂物质可以包括阴离子、非离子、阳离子和/或两性的或两性离子表面活性剂。阴离子表面活性剂的典型实例是皂类、烷基苯磺酸盐、烷基磺酸盐、烯属磺酸盐、烷基醚磺酸盐、甘油醚磺酸盐、 α -甲基酯磺酸盐、磺基脂肪酸、烷基硫酸盐、脂肪醇醚硫酸盐、甘油醚硫酸盐、脂肪酸醚硫酸盐、

5 羟基混合醚硫酸盐、单甘油酯(醚)硫酸盐、脂肪酸酰胺(醚)硫酸盐、单-和二烷基磺基琥珀酸盐、单-和二烷基磺基琥珀酰胺酸盐、磺基甘油三酯、酰胺皂类、醚羧酸和其盐、脂肪酸羟乙基磺酸盐、脂肪酸肌氨酸盐、脂肪酸氨基乙磺酸盐、N-酰基氨基酸, 例如酰基乳酸盐(Acylactylate)、酰基酒石酸盐、酰基谷氨酸盐和酰基天冬氨酸盐、烷基低聚葡萄糖苷硫酸盐、蛋白脂肪酸缩合物

10 (尤其是小麦基的植物产物)和烷基(醚)磷酸盐。如果阴离子表面活性剂含有聚乙二醇醚链, 那么它们可具有常规的、但优选窄的同系物分布。非离子表面活性剂的典型实例是脂肪醇聚乙二醇醚、烷基酚聚乙二醇醚、脂肪酸聚乙二醇酯、脂肪酸酰胺聚乙二醇醚、脂肪胺聚乙二醇醚、烷氧基化甘油三酯、混合醚或混合缩甲醛、需要时部分氧化的烷基(亚烷基)低聚葡萄糖苷或葡萄糖衍生物(Glucoron saare derivate)、脂肪酸-N-烷基葡萄糖酰胺、蛋白水解产物(尤其是小麦基的植物产物)、多元醇脂肪酸酯、糖酯、脱水山梨糖醇酯、多山梨糖酸酯和氧化胺。如果非离子表面活性剂含有聚乙二醇醚链, 那么它们可具有常规的、但优选窄的同系物分布。阳离子表面活性剂的典型实例是季铵化合物, 例如二甲基二硬脂氯化铵、和酯季铵盐(Esterquats), 尤其是季铵化的脂

20 肪酸三链烷醇胺酯盐。两性的和/或两性离子表面活性剂的典型实例是烷基甜菜碱、烷基酰胺甜菜碱、氨基丙酸盐、氨基甘氨酸盐、咪唑啉甜菜碱和磺基甜菜碱。列举的表面活性剂中未包括公知的化合物。有关这些表面活性剂的结构和制备方法参见相关的综述, 例如 J.Falbe(ed.), “ Surfactants in Consumer Products ”, Springer 出版社, 柏林, 1987, 第 54-124 页或 J.Falbe(ed.),

25 “ Katalysatoren , Tenside und Mineraloeladditive ”, Thieme 出版社, Stuttgart, 1978, 第 123-217 页。特别适用的温和型典型实例, 即特别适于皮肤的表面活性剂是脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、甘油单硫酸酯盐、单-和/或二烷基磺基琥珀酸盐、脂肪酸羟乙基磺酸盐、脂肪酸肌氨酸盐、脂肪酸氨基乙磺酸盐、脂肪酸谷氨酸盐、 α -烯属磺酸盐、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、两性乙缩醛和/或蛋白脂肪酸缩合物, 蛋白脂

30 肪酸缩合物优选基于小麦蛋白的脂肪酸缩合物。

油体

- 其他油体例如是具有 6-18 个碳原子, 优选 8-10 个碳原子的脂肪醇基的格尔伯特醇、直链 C_{6-22} -脂肪酸与直链或支链 C_{6-22} -脂肪醇的酯或支链 C_{6-13} -羧酸与直链或支链 C_{6-22} -脂肪醇的酯, 例如肉豆蔻酸肉豆蔻酯、棕榈酸肉豆蔻酯、硬脂酸肉豆蔻酯、异硬脂酸肉豆蔻酯、油酸肉豆蔻酯、山萘酸肉豆蔻酯、芥酸肉豆蔻酯、肉豆蔻十六烷酯、棕榈酸十六烷酯、硬脂酸十六烷酯、异硬脂酸十六烷酯、油酸十六烷酯、山萘酸十六烷酯、芥酸十六烷酯、肉豆蔻酸十八烷酯、棕榈酸十八烷酯、硬脂酸十八烷酯、异硬脂酸十八烷酯、油酸十八烷酯、山萘酸十八烷酯、芥酸十八烷酯、肉豆蔻酸异十八烷酯、棕榈酸异十八烷酯、硬脂酸异十八烷酯、异硬脂酸异十八烷酯、油酸异十八烷酯、山萘酸异十八烷酯、油酸异十八烷酯、肉豆蔻酸油酯、棕榈酸油酯、硬脂酸油酯、异硬脂酸油酯、油酸油酯、山萘酸油酯、芥酸油酯、肉豆蔻酸山萘酯、棕榈酸山萘酯、硬脂酸山萘酯、异硬脂酸山萘酯、油酸山萘酯、山萘酸山萘酯、芥酸山萘酯、肉豆蔻酸芥酯、棕榈酸芥酯、硬脂酸芥酯、异硬脂酸芥酯、油酸芥酯、山萘酸芥酯和芥酸芥酯。此外适合的还包括直链 C_{6-22} -脂肪酸与支链醇, 特别是 2-乙基己醇的酯、 C_{18-38} -烷基羟基羧酸与直链或支链 C_{6-22} -脂肪醇的酯(参见 DE19756377A1), 尤其是苹果酸二辛酯、直链和/或支链脂肪酸与多元醇(例如丙二醇、二聚二醇或三聚三醇)和/或格尔伯特醇的酯、 C_{6-10} -脂肪酸基的甘油三酯、液态的 C_{6-18} -脂肪酸基的甘油一酯/甘油二酯/甘油三酯的混合物(参见 EP97/00434)、 C_{6-22} -脂肪醇和/或格尔伯特醇与芳香族羧酸, 特别是苯甲酸的酯、 C_{2-12} -二羧酸与具有 1-22 个碳原子的直链或支链醇或具有 2-10 个碳原子和 2-6 个羟基的多元醇的酯、植物油、支链伯醇、取代的环己烷、苯甲酸与直链和/或支链 C_{6-22} -醇的酯(例如 Finsolv®TN)、直链或支链、对称或非对称的每个烷基上具有 6-22 个碳原子的二烷基醚, 例如二辛酰醚(Cetiol® OE)乙氧基化脂肪酸酯与多元醇的开环产物、硅氧烷油(环聚二甲基硅酮、硅聚二甲基硅氧烷型等)和/或脂族或环烷烃, 例如角鲨烷、角鲨烯或二烷基环己烷。

乳化剂

- 乳化剂的实例包括至少选自下列一种物质的非离子表面活性剂:
- 2-30 摩尔环氧乙烷和/或 0-5 摩尔环氧丙烷在具有 8-22 个碳原子的直链脂肪醇、具有 12-22 个碳原子的脂肪酸、烷基上具有 8-15 个碳原子的烷基苯酚

- 以及烷基上具有 8-22 个碳原子的烷基胺上的加成产物；
- 烷基(亚烷基)上具有 8-22 个碳原子的烷基低聚葡萄糖苷和/或链烯基低聚葡萄糖苷和其乙氧基化的类似物；
 - 1-15 摩尔环氧乙烷在蓖麻油和/或硬化的蓖麻油上的加成产物；
- 5 · 15-60 摩尔环氧乙烷在蓖麻油和/或硬化蓖麻油上的加成产物；
- 甘油和/或脱水山梨糖醇与不饱和、直链或饱和、支链的具有 12-22 个碳原子的脂肪酸和/或具有 3-18 个碳原子的羟基羧酸的偏酯以及其具有 1-30 摩尔环氧乙烷的加成物；
 - 聚甘油(平均自缩合度为 2-8)、聚乙二醇(分子量 400-5000)、三羟甲基丙烷、季戊四醇、糖醇(例如山梨糖醇)、烷基葡萄糖苷(例如甲基葡萄糖苷、丁基葡萄糖苷、月桂基葡萄糖苷)以及聚葡萄糖苷(例如纤维素)与饱和和/或不饱和、直链或支链的具有 12-22 个碳原子的脂肪酸和/或具有 3-18 个碳原子的羟基羧酸的偏酯以及其具有 1-30 摩尔环氧乙烷的加成物；
- 10 · 根据 DE 1165574PS 的季戊四醇、脂肪酸、柠檬酸和脂肪醇的混合酯和/或具有 6-22 个碳原子的脂肪酸、甲基葡萄糖和多元醇，优选甘油或聚甘油的混合酯；
- 磷酸一烷基酯、磷酸二烷基酯和磷酸三烷基酯以及磷酸一-PEG 烷基酯、磷酸二-PEG 烷基酯和/或磷酸三-PEG-烷基磷酸酯和它们盐；
 - 羊毛蜡醇；
- 15 · 聚硅氧烷-聚烷基-聚醚共聚物和/或其相应的衍生物；
- 嵌段共聚物，例如聚乙二醇-30 二多羟基硬脂酸酯；
 - 聚合物乳化剂，例如 Goodrich 的 Pemulen 型(TR-1， TR-2)；
 - 聚(亚烷基)二醇和
 - 甘油碳酸酯。
- 20 · 环氧乙烷和/或环氧丙烷与脂肪醇、脂肪酸、烷基苯酚或蓖麻油的加成产物是熟知的市售产品。因而它们是一种均匀混合物，其平均烷氧基化度相当于环氧乙烷和/或环氧丙烷和与其进行加成反应的物质之间的比例。由 DE 2024051PS 已知，环氧乙烷与甘油加成物的 C_{12/18}-脂肪酸一酯和 C_{12/18}-脂肪酸二酯是常见的化妆品制剂的加脂剂。
- 25 · 环氧乙烷和/或环氧丙烷与脂肪醇、脂肪酸、烷基苯酚或蓖麻油的加成产物是熟知的市售产品。因而它们是一种均匀混合物，其平均烷氧基化度相当于环氧乙烷和/或环氧丙烷和与其进行加成反应的物质之间的比例。由 DE 2024051PS 已知，环氧乙烷与甘油加成物的 C_{12/18}-脂肪酸一酯和 C_{12/18}-脂肪酸二酯是常见的化妆品制剂的加脂剂。
- 30 · 烷基-和/或链烯基低聚葡萄糖苷、其制备方法和其用途由现有技术是已知的。它们主要是通过葡萄糖或低聚糖与具有 8-18 个碳原子的伯醇进行反应制

备的。至于苷基，其中环状糖基通过苷键与脂肪醇连接的单苷和低聚度至多为8的低聚糖苷都是适用的。低聚度是统计学上平均值，一般是根据这类工业产品的同系物分布确定的。

5 适用的偏甘油酯的典型实例包括羟基硬脂酸一甘油酯、羟基硬脂酸二甘油酯、异硬脂酸一甘油酯、异硬脂酸二甘油酯、油酸一甘油酯、油酸二甘油酯、蓖麻酸一甘油酯、蓖麻酸二甘油酯、亚油酸一甘油酯、亚油酸二甘油酯、亚麻酸一甘油酯、亚麻酸二甘油酯、芥酸一甘油酯、芥酸二甘油酯、酒石酸一甘油酯、酒石酸二甘油酯、柠檬酸一甘油酯、柠檬酸二甘油酯、苹果酸一甘油酯、苹果酸二甘油酯和它们的工业混合物，它们还可含有少量的因制备方法所带的甘油三酯。同样适用的是1-30摩尔，优选5-10摩尔环氧乙烷与
10 所述偏甘油酯的加成产物。

脱水山梨糖醇酯包括脱水山梨糖醇一异硬脂酸酯、脱水山梨糖醇倍半异硬脂酸酯、脱水山梨糖醇二异硬脂酸酯、脱水山梨糖醇三异硬脂酸酯、脱水山梨糖醇一油酸酯、脱水山梨糖醇倍半油酸酯、脱水山梨糖醇二油酸酯、脱水山梨糖醇三油酸酯、脱水山梨糖醇一芥酸酯、脱水山梨糖醇倍半芥酸酯、脱水山梨糖醇二芥酸酯、脱水山梨糖醇三芥酸酯、脱水山梨糖醇一蓖麻醇酸酯、脱水山梨糖醇倍半蓖麻醇酸酯、脱水山梨糖醇二蓖麻醇酸酯、脱水山梨糖醇三蓖麻醇酸酯、脱水山梨糖醇一羟基硬脂酸酯、脱水山梨糖醇倍半羟基硬脂酸酯、脱水山梨糖醇二羟基硬脂酸酯、脱水山梨糖醇三羟基硬脂酸酯、脱水山梨糖醇一酒石酸酯、脱水山梨糖醇倍半酒石酸酯、脱水山梨糖醇二酒石酸酯、脱水山梨糖醇三酒石酸酯、脱水山梨糖醇一柠檬酸酯、脱水山梨糖醇倍半柠檬酸酯、脱水山梨糖醇二柠檬酸酯、脱水山梨糖醇三柠檬酸酯、脱水山梨糖醇一马来酸酯、脱水山梨糖醇倍半马来酸酯、脱水山梨糖醇二马来酸酯、脱水山梨糖醇三马来酸酯和它们的工业混合物。同样适用的是1-30摩尔，优选5-10摩尔环氧乙烷与所述脱水山梨糖醇酯的加成产物。
25

合适的聚甘油酯的典型实例是聚甘油基-2-二多羟基硬脂酸酯(Dehymuls® PGPH)、聚甘油基-3-二异硬脂酸酯(Lameform® TGI)、聚甘油基-4-异硬脂酸酯(Isolan® GI 34)、聚甘油基-3-油酸酯、二异硬脂酰基聚甘油基-3-二异硬脂酸酯(Isolan® PDI)、聚甘油基-3-甲基葡萄糖二硬脂酸酯(Tego Care® 450)、聚甘油基-3-蜂蜡(Cera Bellina®)、聚甘油基-4-癸酸酯(聚甘油癸酸酯 T2010/90)、聚甘油基-3-十六醚(Chimexane® NL)、聚甘油基-3-二硬脂酸酯
30

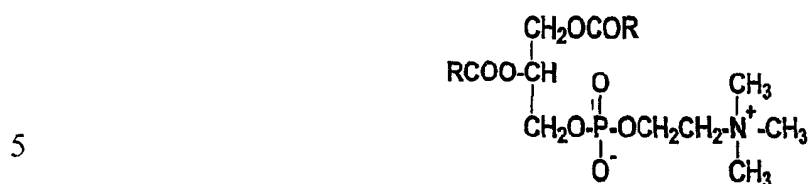
(Cremophor® GS 32)和聚甘油基聚蓖麻醇酸酯(Admul® WOL 1403)、聚甘油基二聚酸酯异硬脂酸酯和它们的混合物。其它适用的多元醇酯的实例包括同样与 1-30 摩尔环氧乙烷反应的三羟甲基丙烷或季戊四醇与月桂酸、椰油脂肪酸、牛油脂肪酸、棕榈酸、硬脂酸、油酸、山萘酸等的一酯、二酯和三酯。

- 5 其他合适的乳化剂是两性离子表面活性剂。两性离子表面活性剂是表面活性的化合物，其分子中含有至少一个季铵基团和至少一个羧酸盐基团和一个磺酸盐基团。特别合适的两性离子表面活性剂是所谓的甜菜碱，例如 N-烷基-N,N-二甲基甘氨酸铵，例如椰油烷基二甲基甘氨酸铵、N-酰基氨基丙基-N,N-二甲基甘氨酸铵，例如椰油酰基氨基丙基二甲基甘氨酸铵、和其烷基或酰基具有 8-18 个碳原子的 2-烷基-3-羧甲基-3-羟乙基咪唑啉和椰油酰基氨基乙基羟乙基羧甲基甘氨酸盐。已知的 CTFA 命名为椰油酰氨基丙基甜菜碱的脂肪酸酰胺衍生物是特别优选的。两性表面活性剂也是适用的乳化剂。两性表面活性剂是表面活性的化合物，其分子中除了含有 C_{8/18}-烷基或酰基外，还含有至少一个游离的氨基和至少一个-COOH-或-SO₃H-基团，并且能够形成内盐。合适的两性表面活性剂例如是 N-烷基甘氨酸、N-烷基丙酸、N-烷基氨基丁酸、N-烷基亚氨基二丙酸、N-羟乙基-N-烷基酰氨基丙基甘氨酸、N-烷基牛磺酸、N-烷基肌氨酸、烷基上具有 8 - 18 个碳原子的 2-烷基氨基丙酸和烷基氨基乙酸。特别优选的两性表面活性剂是 N-椰油烷基氨基丙酸酯、椰油酰基氨基乙基氨基丙酸酯和 C_{12/18}-酰基肌氨酸。此外，乳化剂也可以是阳离子表面活性剂，优选是酯季铵盐型的那些乳化剂，特别优选甲基季铵化二脂肪酸三乙醇胺酯盐。
- 10
- 15
- 20

脂肪和蜡

- 合适的脂肪的典型实例包括甘油酯，即固态或液态的植物或动物产品，它们主要由具有较高脂肪酸的混合甘油酯组成。合适的蜡是天然蜡，例如小
- 25 烛树蜡、巴西棕榈蜡、木蜡、西班牙草蜡、软木蜡、瓜拉那蜡(Guarumawachs)、稻胚油蜡、甘蔗蜡、小冠巴西棕蜡、褐煤蜡、蜂蜡、虫胶蜡、鲸蜡、羊毛脂(羊毛蜡)、尾蜡脂肪(Buerzelfett)、纯地蜡、地蜡、凡士林、石蜡、微蜡；化学改性的蜡(硬蜡)，例如褐煤酯蜡、萨苏尔蜡(Sasolwachse)、氢化忽忽巴蜡以及合成蜡，例如聚亚烷基蜡和聚乙二醇蜡。除脂肪外，作为添加剂也可以是诸如卵磷脂和磷脂类的脂肪物质也是合适的。商品卵磷脂是专业人员熟悉的由脂肪酸、甘油、磷酸和胆碱通过酯化形成的甘油磷脂。在本专业领域，
- 30

也常将卵磷脂称作磷脂酰胆碱(PC)并且具有下列通式



其中R一般代表具有 15-17 个碳原子和至多有 4 个顺式双键的直链脂族烃基团。合适的天然卵磷脂的实例是脑磷脂它也称作磷脂酸并且是 1,2-二酰基-sn-甘油-3-磷酸的衍生物。而磷脂通常是磷酸与统称为脂肪的甘油的一酯和优选磷酸与甘油的二酯(甘油磷酸酯)。除此之外,也包括鞘氨醇或鞘脂类。

稠化剂和增稠剂

作为稠化剂主要使用具有 12-22 个碳原子, 优选 16-18 个碳原子的脂肪醇或羟基脂肪醇, 也包括偏甘油酯、脂肪酸或羟基脂肪酸。优选使用这些物质与烷基低聚葡萄糖苷和/或链长相同的脂肪酸-N-甲基葡萄糖酰胺和/或聚甘油聚-12-羟基硬脂酸酯的组合物。合适的增稠剂是诸如 Aerosil 型(亲水型硅酸)、多糖、特别是黄原胶、瓜耳-瓜耳胶、琼脂、藻酸盐和纤基乙酸钠、羧甲基纤维素和羟乙基纤维素, 还有较高分子量的脂肪酸的聚乙二醇单酯和二酯、聚丙烯酸酯(例如 [Goodrich] 的 Carbopole® 和 Pemulen 型; Synthalene® [Sigma]; Keltrol 型 [Kelco]; Sepigel 型 [Seppic]; Salcare 型 [Allied Colioids])、聚丙烯酰胺、聚合物、聚乙烯醇和聚乙烯吡咯烷酮, 表面活性剂, 例如乙氧基脂肪酸甘油酯、脂肪酸与诸如如季戊四醇或三羟甲基丙烷类的多元醇的酯、有窄的同系物分布的脂肪醇乙氧基化物或烷基低聚葡萄糖苷和电解质, 例如氯化钠和氯化铵。

富脂剂

25 作为富脂剂可使用以下物质: 例如羊毛脂和卵磷脂以及聚乙氧基化或酰基化的羊毛脂和卵磷脂的衍生物、多元醇脂肪酸酯、甘油单酸酯和脂肪酸链烷醇酰胺, 脂肪酸链烷醇酰胺也可用作泡沫稳定剂。

稳定剂

30 作为稳定剂可使用脂肪酸的金属盐, 例如硬脂酸或蓖麻油酸的镁盐、铝盐和/或锌盐。

聚合物

- 合适的阳离子聚合物是诸如阳离子纤维素衍生物类的物质，例如由 Amerchol 获得商品名为聚合物 JR 400®的季铵化羟乙基纤维素，阳离子淀粉、二烯丙基铵盐和丙烯酰胺的共聚物、季铵化的乙烯基吡咯烷酮/乙烯基咪唑聚合物，例如 Luviquat®(BASF)、聚乙二醇和胺的缩合产物、季铵化胶原
- 5 多肽，例如月桂基二铵(Laurydimonium)羟丙基水解胶原(Gruenau 的 Lamequat®L)、季铵化小麦多肽、聚亚乙基亚胺、阳离子硅氧烷聚合物，例如聚二甲基硅氧烷铵(Amodimethicone)、己二酸和二甲基氨基羟丙基二亚乙基三胺的共聚物(Sandoz 的 Cartaretine®)、丙烯酸与二甲基二烯丙基氯化铵的共聚物(Chemviron 的 Merquat®550)，例如在 FR 2252840A 中描述的聚氨基
- 10 聚酰胺和它们的交联水溶性聚合物、阳离子甲壳质衍生物，例如季铵化脱乙酰壳多糖、必要时以微晶分布，由二卤烷诸如二溴丁烷与诸如双-二甲基氨基-1,3-丙烷的双二烷基胺的缩合产物，阳离子瓜耳胶，例如 Celanese 公司的 Jaguar® CBS、Jaguar® C-17、Jaguar® C-16、季铵化的铵盐聚合物，例如 Miranol 公司的 Mirapol® A-15、Mirapol® AD-1、Mirapol® AZ-1。
- 15 合适的阴离子、两性离子、两性的和非离子聚合物是例如乙酸乙烯酯/巴豆酸共聚物、乙烯吡咯烷酮/丙烯酸乙烯酯共聚物、乙酸乙烯酯/马来酸丁酯/丙烯酸异冰片酯的共聚物、甲基乙烯醚/马来酸酐的共聚物和它们的酯、未交联的和与多元醇交联的聚丙烯酸、丙烯基酰氨基丙基三甲基氯化铵/丙烯酸酯的共聚物、辛基丙烯酰胺/甲基丙烯酸甲酯/甲基丙烯酸叔丁基氨基乙酯/
- 20 甲基丙烯酸 2-羟丙酯的共聚物、聚乙烯吡咯烷酮、乙烯吡咯烷酮/乙酸乙烯酯的共聚物、乙烯吡咯烷酮/甲基丙烯酸二甲基氨基乙酯/乙烯基己内酰胺的三元共聚物和任选地衍生的纤维素醚和硅氧烷。Cosmetics & Toiletries Vol. 108 1993 年 5 月，第 95 页列举了其他合适的聚合物和增稠剂。

硅氧烷化合物

- 25 合适的硅氧烷化合物是例如二甲基聚硅氧烷、甲基苯基聚硅氧烷、环状硅氧烷和氨基-、脂肪酸-、醇-、聚醚-、环氧-、氟-、苷-和/或烷基改性的硅氧烷化合物，它们在室温下既可以呈液态，也可以呈树脂状。合适的硅氧烷化合物是 Simethicone，它们是一种具有平均链长为 200-300 的二甲基硅氧烷单元的聚二甲基硅氧烷和氢化的硅酸盐的混合物。合适的挥发性硅氧烷的详细描述可在 Todd 等人的 Cosm.Toil.91，27(1976)中查到。
- 30

防紫外线因子和抗氧化剂

防紫外线因子是例如，室温下呈液态或结晶态的有机物质(UV 滤光剂)，它们能够吸收紫外线的辐射并以长波辐射形式如热量将所吸收的能量释放。UV-B 滤光剂可以是油溶性的或水溶性的。下面例举的是油溶性物质：

- 3-亚苄基樟脑或 3-亚苄基降樟脑和其衍生物，例如 EP 0693471 B1 中描述的 3-(4-甲基亚苄基)樟脑；
- 4-氨基苯甲酸衍生物，优选 4-(二甲基氨基)-苯甲酸-2-乙基己酯、4-(二甲基氨基)-苯甲酸-2-辛酯和 4-(二甲基氨基)-苯甲酸戊酯；
- 肉桂酸的酯类，优选 4-甲氧基肉桂酸-2-乙基己酯、4-甲氧基肉桂酸丙酯、4-甲氧基肉桂酸异戊酯、2-氰基-3,3-苯基肉桂酸-2-乙基己酯(氰双苯丙烯酸辛酯)；
- 水杨酸的酯类，优选水杨酸-2-乙基己酯、水杨酸-4-异丙基苄酯、水杨酸高盖酯；
- 二苯甲酮的衍生物，优选 2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮、2-羟基-4-甲氧基-4'-甲基二苯甲酮、2,2'-二羟基-4-甲氧基二苯甲酮；
- 亚苄基丙二酸的酯类，优选 4-甲氧基苄基丙二酸二-2-乙基己酯；
- 三嗪衍生物，例如 EP 0818450 A1 描述的 2,4,6-三苯胺基-(对-羰基-2'-乙基-1'-己氧基)-1,3,5-三嗪和辛基三嗪酮，或二辛基丁酰胺三嗪酮(Uvasorb® HEB)；
- 丙烷-1,3-二酮类，例如 1-(4-叔丁基苯基)-3-(4'-甲氧基苯基)-丙-1,3-二酮；
- 例如 EP 0694521 B1 中描述的酮三环(5.2.1.0)癸烷衍生物。

合适的水溶性物质是：

- 2-苯基苯并咪唑-5-磺酸和其碱金属盐、碱土金属盐、铵盐、烷基铵盐、链烷醇铵盐和葡萄糖铵盐；
- 二苯酮的磺酸衍生物，优选 2-羟基-4-甲氧基二苯酮-5-磺酸和其盐类；
- 3-亚苄基樟脑的磺酸衍生物，例如 4-(2-氧-3-亚冰基甲基)苯磺酸和 2-甲基-5-(2-氧-3-亚冰片基)磺酸和其盐类。

典型的 UV-A-滤光剂特别是苯甲酰甲烷的衍生物，例如 1-(4'-叔丁基苯基)-3-(4'-甲氧基苯基)-丙烷-1,3-二酮、4-叔丁基-4'-甲氧基二苯甲酰甲烷(Parsol 1789)、1-苯基-3-(4'-异丙基苯基)-丙-1,3-二酮和例如 DE 19712033 A1(BASF)中描述的烯胺化合物。当然也可使用 UV-A 和 UV-B 滤光剂及其混合物。特别合适的组合物是由诸如 4-叔丁基-4'-甲氧基二苯甲酰甲烷(Parsol

1789)的苯甲酰甲烷的衍生物和 2-氰基-3,3-苯基肉桂酸-2-乙基己酯(氰双苯丙烯酸辛酯)与肉桂酸酯, 优选 4-甲氧基肉桂酸-2-乙基己酯和/或 4-甲氧基肉桂酸丙酯和/或 4-甲氧基肉桂酸异戊酯的组合。优选地是将这类组合物与诸如 2-苯基苯并咪唑-5-磺酸的水溶性滤光剂和其碱金属盐、碱土金属盐、铵盐、烷基铵盐、链烷醇铵盐和葡糖铵盐的混合。

除了所述的可溶性物质外, 难溶的滤光颜料, 即细分散的金属氧化物或盐也可用于该目的。合适的金属氧化物例如特别是氧化锌和二氧化钛, 此外还有铁、锆、硅、锰、铝和铈的氧化物和它们的混合物。可使用的盐是硅酸盐(滑石)、硫酸钡或硬脂酸锌。氧化物和盐都是以颜料的形式用于护肤和护肤乳液和化妆用化妆品中。因此, 颗粒的平均粒径应小于 100 纳米, 优选在 5-50 纳米之间, 更优选在 15-30 纳米之间。它们可以呈球状但也可使用椭圆形颗粒或其他非球形颗粒, 也可以对颜料的表面进行亲水或疏水处理。典型的实例是涂覆有二氧化钛, 例如二氧化钛 T 805(Degussa)或 Eusolex® T2000(Merck)。疏水涂覆剂主要是硅氧烷, 尤其是三烷氧基辛基硅烷或所述 Simethicone。防晒剂优选使用所谓微米颜料或纳米颜料。优选使用微粉化的氧化锌。其它合适的 UV 滤光剂可从 P.Finkel 的 SOEFW-Journal 122, 543(1996)和 Parfuemerie 以及 Kosmetik 3(1999), 第 11 页的综述中查到。

除了上述两组的一代防光剂外, 也可使用抗氧化型的二代防光剂。当 UV 射线渗入皮肤时能中断所引起的光化学反应链。典型的实例是氨基酸(例如甘氨酸、组氨酸、酪氨酸、色氨酸)和其衍生物, 咪唑(例如尿刊酸)和其衍生物, 肽类, 例如 D,L-肌肽、D-肌肽、L-肌肽和其衍生物(例如鹅肌肽), 类胡萝卜素、胡萝卜素(例如 α -胡萝卜素、 β -胡萝卜素、番茄红素)和其衍生物, 绿原酸和其衍生物, 脂酮酸和其衍生物(例如二氢脂酮酸), 亚金硫葡萄糖、丙硫代尿嘧啶和其硫醇(例如, 硫氧还蛋白、谷胱甘肽、半胱氨酸、胱氨酸、胱胺和其糖基、N-乙酰基-、甲基-、乙基-、丙基-、戊基-、丁基-和月桂基-、棕榈酰-、油酰-、 γ -亚油酰-、胆甾烯基-和甘油的酯)和它们的盐、硫代二丙酸二月桂基酯、硫代二丙酸二硬脂基酯、硫代二丙酸和其衍生物(酯、醚、肽类、类脂类、核苷酸、核苷和盐)以及相容量极低的(例如 $p - \mu$ 摩尔/千克)的磺基亚胺(Sulfoximin)化合物(例如丁硫堇磺基亚胺(Buthioninsulfoximine)、高半胱氨酸磺基亚胺、丁硫堇磺(Butionin)、戊基-、己基-、庚基-硫堇磺基亚胺), 还有(金属)螯合剂(例如 α -羟基脂肪酸、棕榈酸、肌醇六磷酸、乳铁蛋白)、 α -

- 羟基酸(例如柠檬酸、乳酸、苹果酸)、腐植酸、胆汁酸、胆汁提取物、胆红素、胆绿素、EDTA、EGTA和其衍生物、不饱和脂肪酸和其衍生物(例如 γ -亚油酸、亚油酸、油酸)、叶酸和其衍生物、泛醌和泛醌醇和其衍生物、维生素C和衍生物(例如抗坏血酸棕榈酸酯、抗坏血酸磷酸镁、抗坏血酸乙酸酯)、
- 5 生育酚和其衍生物(例如维生素E乙酸酯)、维生素A和其衍生物(维生素A棕榈酸酯)和安息香树脂的苯甲酸松柏酯、芸香亭酸和其衍生物、 α -糖基芸香苷、阿魏酸、亚糠基葡萄糖醇、肌肽、丁基羟基甲苯、丁基羟基茴香醚、去甲二氢愈创木树脂酸、去甲二氢愈创木酸、三羟基丁酰基苯酮、脲酸和其衍生物、甘露糖和其衍生物、过氧化物歧化酶、锌和其衍生物(例如ZnO、
- 10 ZnSO₄)、硒和其衍生物(例如甲硫氨酸硒)、芪和其衍生物(例如芪氧化物、反式芪氧化物)和适合于本发明目的的这些活性物质的衍生物(盐、酯、醚、糖、核苷酸、核苷、肽类和类脂类)。

生物活性物质

- 生物活性物质是例如生育酚、乙酸生育酚酯、棕榈酸生育酚酯、抗坏血
- 15 酸、脱氧核糖核酸、视黄醇、红没药醇、尿囊素、植烷三醇、泛醇、AHA酸、氨基酸、神经酰胺、类神经酰胺、精油、植物提取物和复合维生素。

除臭剂和抗菌剂

- 化妆用除臭剂的作用是抵制、遮盖或消除人体散发的气味。人体气味是通过皮肤细菌对顶泌汗腺的作用而产生的，形成了令人厌恶气味的降解产
- 20 物。与此相应的是除臭剂的活性物质，它们作为抗菌剂、抑霉剂、吸味剂或气味掩盖剂而起作用。合适的抗菌剂是所有抗革兰氏阳性细菌的物质，例如4-羟基苯甲酸和其盐和酯、N-(4-氯苯基)-N'-(3,4-二氯苯基)脲、2,4,4'-三氯-2'-羟基二苯醚(三氯森)、4-氯-3,5-二甲基苯酚、2,2'-亚甲基-双(6-溴-4-氯苯酚)、3-甲基-4-(1-甲基乙基)苯酚、2-苄基-4-氯苯酚、3-(4-氯苯氧基)-1,2-丙
- 25 二醇、3-碘-2-丙炔基丁基氨基甲酸酯、洗必肽、3,4,4'-三氯对称二苯脲(TTC)、抗菌的香料、百里酚、百里油、丁子香酚、丁香油、孟醇、薄荷油、法尼醇、苯氧基乙醇、甘油单癸酸酯(Glycerinmonocaprinat)、甘油单辛酸酯、甘油单月桂酸酯(GML)、二甘油单癸酸酯(DMC)、水杨酸-N-烷基酰胺，例如水杨酸-正-辛基酰胺或水杨酸-正-癸基酰胺。
- 30 抑霉剂例如是酯酶抑制剂。这里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 KGaA, Duesseldorf/FRG)。这些物质有抑制酶的活性, 因而减少了气味的形成。其他的酯酶抑制剂是甾醇硫酸酯或甾醇磷酸酯, 例如羊毛甾醇-、胆甾醇-、野菇菌素-、豆甾醇-和谷甾醇-的硫酸酯和/或磷酸酯、二羧酸和其酯, 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、羟基羧酸和其酯, 例如柠檬酸、苹果酸、酒石酸或酒石酸二乙酯, 以及甘氨酸锌。

适于用作吸味剂的是能够吸收形成气味的化合物并能长期保持的物质。这种吸味剂降低了各成分的分压并且还降低其扩散速度。重要的是必须对香料不影响。吸味剂对细菌不起作用。它们含有例如作为主要组分的有蓖麻油酸的络合锌盐, 或尤其大多数是气味中性的香料, 专业人员已知的“定香剂”, 例如岩蔷薇或苏合香的提取物或某些松香亭酸衍生物。用香料或芳香油作为气味掩盖物质, 除了起气味掩盖物质的作用外, 还具有香味特色。合适的芳香油例如是天然和合成的香料的混合物。天然香料是花、茎、叶、果实、果皮、根、木、草本植物和草、针叶和细枝以及树脂和香脂的提取物。也可以使用动物性原料, 例如麝猫香和海狸香。典型的合成香料化合物是酯、醚、醛、酮、醇和烃的产物。酯类香料化合物例如是乙酸苧酯、对叔丁基环己基乙酸酯、乙酸里哪酯、乙酸苯乙酯、苯甲酸里哪酯、甲酸苧酯、丙酸烯丙基环己酯、丙酸苏合香酯和水杨酸苧酯。醚类香料化合物例如是苧乙基醚, 醛类香料化合物例如是具有 8-18 个碳原子的直链链烷醛、柠檬醛、香茅醛、香茅基氧乙醛、仙克来醛、羟基香茅醛、铃兰醛和波芹醛(Bourgeonal), 酮类香料化合物例如是紫罗酮和柏木甲酮, 醇类香料化合物例如是茴香脑、香茅醇、丁子香酚、异丁子香酚、香叶醇、里哪醇、苯乙醇和松油醇, 烃类香料化合物主要是萜烯和香脂。然而优选使用的是各种香料的混合物使其共同发出宜人香味, 作为芳香油成分经常使用的还有挥发性低的含醚油, 合适的例如鼠尾草油、母菊油、丁子香油、蜂花油、薄荷油、肉桂叶油、椴花油、刺柏果油、岩兰草油、乳香油、古蓬脂油、岩蔷薇油和薰衣草油。优选香柠檬油、二氢香叶烯醇、铃兰醛、新铃兰醛、香茅醇、苯乙醇、 α -己基肉桂醛、香叶醇、苧基丙酮、仙克来醛、里哪醇、Boisambrene Forte、龙涎香醚(ambroxane)、吲哚、二氢茉莉酮、檀香(Sandelice)、柠檬油、橘油、橙油、甘醇酸烯丙基戊酯、cyclovertal、薰衣草油、鼠尾草油、 β -二氢大马酮、香叶油、水杨酸环己酯、Vertofix Coeur、异-E-Super、Fixolide NP、扁枝衣、

γ -甲基紫罗兰酮、苯乙酸、乙酸香叶酯、乙酸苺酯、玫瑰氧化物、Romilat、Irotyl 和 Floramat，这些物质既可以单独使用，也可以混合使用。

止汗剂通过对外分泌汗腺活性的影响而降低了汗液的形成，并因此减轻腋窝的湿度和体味。止汗剂的水性或无水制剂通常含有下列物质：

- 5 · 收敛性的活性物质，
- 油组分，
- 非离子型乳化剂
- 辅助乳化剂，
- 增稠剂，
- 10 · 辅剂，例如稠化剂或络合剂和/或
- 非水溶剂，例如乙醇、丙二醇和/或甘油。

作为收敛止汗剂有效物质适宜的是铝、镓或锌盐。合适的具有抗水有效的活性物质例如是氯化铝、氯化铝水合物、二氯化铝水合物、倍半氯化铝水合物和其与 1,2-丙二醇形成的络合物，如羟基尿囊素铝、氯酒石酸铝、三氯化铝镓水合物、四氯化铝镓水合物、五氯化铝镓水合物和其例如与氨基酸如甘氨酸形成的络合物。此外，止汗剂还可含有少量通常的油溶性和水溶性辅剂。这些油溶性辅剂例如是：

- 消炎、护肤或芳香的含醚油，
- 合成的护肤活性物质和/或
- 20 · 油溶性芳香油。

常见的水溶性添加剂例如是防腐剂、水溶性香料、pH 调节剂，例如缓冲剂混合物、水溶性增稠剂，例如水溶性的天然或合成的聚合物，例如黄原胶、羟乙基纤维素、聚乙烯吡咯烷酮或高分子聚环氧乙烷。

成膜剂

- 25 常用的成膜剂例如是脱乙酰壳多糖、微晶脱乙酰壳多糖、季铵化脱乙酰壳多糖、聚乙烯吡咯烷酮、乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物、丙烯酸系列聚合物、四元纤维素-衍生物、胶原、透明质酸或其盐和类似的化合物。

去头屑活性物质

- 30 合适的去头屑活性物质是 Pirocton Olamin(1-羟基-4-甲基-6-(2,4,4-三甲基戊基)-2-(1H)-吡啶酮单乙醇胺盐)、Baypival®(Climbazole)、Ketoconazol®、(4-乙酰基-1-{4-[2-(2,4-二氯苯基)-2-(1H-咪唑-1-基甲基)-1,3-

- 二氧基 lan-c-4-基甲氧基苯基}咪唑、Ketoconazol、Elubiol、二硫化硒、胶态硫、硫代聚乙二醇脱水山梨糖醇单油酸酯、蓖麻醇聚乙氧基化硫、硫代焦油馏出物、水杨酸(或与六氯苯的混合物)、十一碳烯酸、单乙醇酰胺磺基琥珀酸钠盐、Lamepon®UD(蛋白质-十一碳烯酸缩合物)、2-巯基吡啶氧化
- 5 锌、2-巯基吡啶氧化铝和 2-巯基吡啶氧化镁/二-2-巯基吡啶氧化物-硫酸镁。

溶胀剂

合适的水相溶胀剂例如是蒙脱石、粘土矿物、Pemulen 以及烷基改性的丙烯酸聚合物(Carbopoltypen)(Goodrich)。其他合适的聚合物或溶胀剂可以在 R.Lochhead 的 Cosm.Toil. 108, 95(1993)的综述中查到。

10 驱虫剂

合适的驱虫剂是 N,N-二乙基-间-甲苯甲酰胺、1,2-戊二醇或丁基乙酰基氨基丙酸乙酯。

自行褐色剂和脱色剂

- 作为自褐色剂适宜的有二羟基酮。作为酪氨酸抑止剂，它能抑止黑色素的形成并在脱色剂中应用的，有例如熊果苷、曲酸、香豆酸和抗坏血酸(维生素 C)。
- 15

水溶助剂

- 用于改善流动性的水溶助剂例如是乙醇、异丙醇或多元醇。合适的多元醇优选具有 2-15 个碳原子和至少 2 个羟基。多元醇还可具有其它官能基，特别是氨基和/或被氮改性的。典型的实例是：
- 20

- 甘油；
- 亚烷基二醇，例如乙二醇、二甘二醇、丙二醇、丁二醇、己二醇以及平均分子量为 100-1000 道尔顿的聚乙二醇；
- 自缩合度在 1.5-10 的工业低聚甘油混合物，例如二甘油含量为 40-50 重量
- 25 %的工业用二甘油混合物；
- 羟甲基化合物，例如优选三羟甲基乙烷、三羟甲基丙烷、三羟甲基丁烷、季戊四醇和二季戊四醇；
- 低级烷基葡萄糖苷，优选烷基上具有 1-8 个碳原子的烷基葡萄糖苷，例如甲基葡萄糖苷和丁基葡萄糖苷；
- 30 · 具有 5-12 个碳原子的糖醇，例如山梨糖醇或甘露糖醇；
- 具有 5-12 个碳原子的糖，例如葡萄糖或蔗糖；

- 氨基糖，例如葡萄糖胺；
- 二链烷醇胺，例如二乙醇胺或 2-氨基-1,3-丙二醇。

防腐剂

- 合适的防腐剂是例如苯氧基乙醇、甲醛溶液、对羟基苯甲酸酯、戊二醇
- 5 或山梨酸以及化妆品条例(Kosmetikverordnung)附件 6 的 A 和 B 部分中列举的其它类物质。

芳香油

- 合适的芳香油是天然和合成的香料的混合物。天然香料是花(百合、熏衣草、玫瑰、茉莉、苦橙花、依兰香)、茎和叶(老鹳草、广藿香、甜橙)、果(茴香、芫荽、蒿、欧洲刺柏)、果皮(香柠檬、柠檬、橘子)、根(肉豆蔻、当归、芹、小豆蔻、闭鞘姜、鳶尾、菖蒲)、木(松木、檀香木、愈创木、香柏木、玫瑰木)、草本植物和草(龙蒿、柠檬草、鼠尾草、百里香)、针叶和细枝(云杉、冷杉、松树、矮松)、树脂和香膏(古蓬香脂、榄香、安香息、没药、乳香、红没药)的提取物。也可使用动物原料，例如灵猫香和海狸香。典型的合成香
- 15 料化合物是酯、醚、醛、酮、醇和烃型产品。酯类香酯型芳香化合物例如是乙酸苄酯、异丁酸苯氧基乙酯、环己基乙酸对叔丁酯、乙酸里哪酯、乙酸二甲基苄基甲酯、乙酸苯乙酯、苯甲酸里哪酯、甲酸苄酯、乙基甲基苄基甘氨酸酯、丙酸烯丙基环己酯、丙酸苏合香酯和水杨酸苄酯。醚类香料化合物例如是苄乙醚，醛类香料化合物例如是具有 8-18 个碳原子的直链烷醛、柠檬
- 20 醛、香茅醛、香茅氧乙醛、仙克来醛、羟基香茅醛、铃兰醛和 Bourgeonal，酮类香料化合物例如是紫罗兰酮、 α -异甲基紫罗兰酮和柏木甲酮，醇类香料化合物例如是茴香脑、香茅醇、丁子香酚、异丁子香酚、香叶醇、里哪醇、苯乙醇和松油醇，烃主要是萜烯和香脂。但是，优选使用各种能一起产生宜人香味的香料化合物的混合物。主要作为芳香油使用的挥发性较低的含醚油
- 25 也适于用作香料油。例如鼠尾草油、母菊油、丁子香油、蜂花油、薄荷油、肉桂叶油、椴花油、刺柏果油、岩兰草油、乳香油、古蓬香脂、岩蔷薇油(labolanunmeil)和薰衣草油。优选香柠檬油、二氢香叶烯醇、铃兰醛、新铃兰醛、香茅醇、苯乙醇、 α -己基肉桂醛、香叶醇、苄基丙酮、仙克来醛、里哪醇、Boisambrene Forte、龙涎香醚、吲哚、二氢茉莉酮、Sandelice、柠檬
- 30 油、橘油、橙油、甘醇酸烯丙基戊酯、cyclovertal、薰衣草油、鼠尾草油、 β -二氢大马酮、香叶油、水杨酸环己酯、Vertofix Coeur、异-E-Super、Fixolide

NP、扁衣枝、 γ -甲基紫罗兰酮、苯乙酸、乙酸香叶酯、乙酸苺酯、玫瑰氧化物、Romillat、Irotyl 和 Floramat，这些物质既可以单独使用，也可以混合使用。

颜料

- 5 合适的颜料是任何适合于化妆品目的和允许使用的物质，例如在 Farbstoffkommission der Deutschen Forschungsgemeinschaft，化学出版社，Weinheim，1984，第 81-106 页的“化妆品颜料”出版物中列举的。这些颜料的常规用量按混合物总量计为 0.001-0.1 % (重量)。

- 辅剂和添加剂的总量按制剂计可在 0-30 % (重量) 范围内，优选 1-20 % (重量)，特别优选为 4 ~ 12 % (重量)。制剂可按常规的冷却法或加热法制备；优选用转相温度法生产。

实施例

- 在下表中试验了本发明油体(实施例 1 - 6 ; 表 1)和推进剂丁烷与非本发明油体(V1 - V3)的溶解性(+ = 良好混合；- = 离析)。评估了 5 位测试者一组的皮肤感觉(tt=极干燥；t=干燥)。结果示于表 1 和 2 中。

表 1：含碳酸二烷基酯的气溶胶制剂的可混性(添加量按重量 % 计)

组分	1	2	3	4	5	6	V1	V2	V3
Cetiol CC 碳酸二正辛酯	50	25	43	15	8	20	-	-	-
IPM/IPM-PH 肉豆蔻酸异丙酯	-	-	-	-	-	-	50	20	-
Cetiol OE 二正辛醚	-	-	-	-	-	-	-	-	25
丁烷	50	72	55	85	50	75.9	50	75.9	72
香料	-	3	-	-	-	1	-	1	3
氯化铝水合物	-	-	2	-	-	3	-	3	-
脱乙酰壳多糖	-	-	-	-	-	0.1	-	0.1	-
溶解性	+	+	+	+	+	+	+	+	-
皮肤感觉	tt	tt	tt	tt	tt	tt	t	t	t

表 2：喷雾制剂-组成和特性(添加量按重量%计)

组分	1	2	3	V1	V2
Cetiol®CC 碳酸二正辛酯	8	18	8	-	-
IPM/IPM-PH 肉豆蔻酸异丙酯	-	-	-	18	8
氯化铝水合物	3	-	-	-	3
Miglyol Gel B 辛酸/癸酸甘油三酯(和)stearalkonium 水 辉石(和)碳酸丙烯酯	4	4	-	4	4
Cetiol OE 二正辛醚	5	-	-	-	5
Cetiol B 己二酸二正丁酯	6	-	-	-	6
Hydagen DCMF(4 % 溶液) 脱乙酰壳多糖	0.3	-	-	-	0.3
Profumo Moussage 香料	1	1	-	1	1
乙醇	2	-	8	-	2
Hydagen CAT 柠檬酸三乙酯	1.5	-	-	-	1.5
Parsol MCX 甲氧基肉桂酸乙基己酯	-	1	-	1	
Parsol 1789 丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷	-	0.5	-	0.5	
环聚二甲基硅氧烷	-	-	10	-	
丙烷/丁烷	69.2	75.5	74	75.5	69.2

(1)除臭喷剂, (2)防晒喷剂, (3)头发增亮喷剂