[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.
A61K 8/97 (2006.01)
A61Q 19/08 (2006.01)
A61Q 5/00 (2006.01)
A61Q 3/00 (2006.01)

[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200680047059.X

[43] 公开日 2008 年 12 月 24 日

[11] 公开号 CN 101330902A

[22] 申请日 2006.12.12
[21] 申请号 200680047059.X
[30] 优先权
[32] 2005.12.13 [33] US [31] 60/749,911
[86] 国际申请 PCT/US2006/047401 2006.12.12
[87] 国际公布 WO2007/070523 英 2007.6.21
[85] 进入国家阶段日期 2008.6.13
[71] 申请人 宝洁公司
地址 美国俄亥俄
[72] 发明人 R·L·宾德 K·斯里克里施娜 D·J·埃克霍夫 L·R·罗宾逊 R·奥斯伯恩
[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 张 钦

权利要求书 1 页 说明书 24 页

[54] 发明名称

包含 PPAR GAMMA 拮抗剂的个人护理组合物

[57] 摘要

包含一种 PPARG 拮抗剂的个人护理组合物及上述组合物的使用。 所述个人护理组合物可局部使用、口服使用、注射使用、或用作组合摄生法的一部分。

1. 一种包含 PPARG 拮抗剂的个人护理组合物，其中所述组合物包含:

(a) PPARG 拮抗剂;

(b) 皮肤病学、口服或皮下可接受的载体; 和

(c) 至少一种任选成分，其中所述任选成分选自由下列组成的组: 糖胺、维生素 B3、类视色素、肽、植物甾醇、二烷酰基羟脯氨酸、去氧苯比妥、水杨酸、N-酰基氨基酸化合物、防晒活性物质、水溶性维生素、油溶性维生素、它们的衍生物、它们的前体、以及它们的组合。

2. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物，其中所述个人护理组合物基本上不含取代的吲哚。

3. 一种用于调节角质组织美观性的方法，其中所述方法包括向寻求其调节的人的角质组织局部施用包含有效量的 PPARG 拮抗剂的个人护理组合物。

4. 如权利要求 3 所述的方法，其中所述组合物基本上不含取代的吲哚。

5. 如权利要求 4 所述的方法，其中所述方法包括在晚上局部施用所述组合物。

6. 如权利要求 3 所述的方法，其中所述方法包括依照摄生法施用所述组合物，其中所述摄生法包括:

(a)清洁角质组织以形成清洁的角质组织; 和

(b)向所述清洁的角质组织局部施用所述组合物。

7. 如权利要求 6 所述的摄生法，其中所述摄生法在晚上进行。

8. 如权利要求 6 所述的摄生法，其中所述摄生法在上床前进行。

9. 如权利要求 8 所述的摄生法，其中所述摄生法每天进行。

包含 PPAR GAMMA 拮抗剂的个人护理组合物

技术领域

本发明涉及包含 PPARG 拮抗剂以及任选的一种或多种其它成分的个人护理组合物。上述组合物可用于调节哺乳动物的皮肤组织和附属结构（例如，皮肤、毛发、皮脂腺和/或指/趾甲）的状况。

发明背景

消费者目前可获得的许多个人护理产品主要旨在改善皮肤、毛发和/或指甲的健康和/或物理外观。在这些皮肤、毛发或指/趾甲护理产品中，许多产品涉及延迟、最大程度地减少或甚至消除皮肤、毛发或指/趾甲的变化，所述变化典型与老化或环境对人类皮肤、毛发或指/趾甲的损害有关。本领域已经描述了许多可用于调节皮肤、毛发或指/趾甲状况的化合物。

皮肤、毛发和指甲遭受到许多外在和内在因素的侵害。外在因素包括紫外线辐射（如来自日照）、环境污染、风吹、热量、低湿度、有害的表面活性剂、研磨剂等。内在因素包括实足年龄和皮肤、毛发或指/趾甲内的其它生物化学变化。无论是外在因素还是内在因素，这些因素均导致产生皮肤、毛发和指甲老化和环境损伤（如日照损伤、烟熏损伤、以及由污染物质造成的损伤，如氮氧化物、硫氧化物、臭氧和金属如铅）的明显迹象。对多数人而言，皮肤、毛发或指/趾甲魅力的丧失是青春不在的暗示。因此，在现今重视青春的社会中，保持年轻的外观已成为急速发展的行业。可利用多种形式的众多产品和处理，来帮助保持更年轻的皮肤、毛发和指甲外观。

外在因素或内在因素可导致皮肤、毛发或指/趾甲变薄以及一般性降解。例如，随着皮肤、毛发和指甲的自然老化，供给皮肤、毛发或指/趾甲的细胞和血管在减少。还有真皮-表皮连接处日益平坦，这造成此连接处的机械抗力变弱，并由于胶原损失造成真皮厚度的下降。参见例如 Oikarinen 的 “ The Aging of Skin: Chronoaging Versus

Photoaging”（Photodermatol. Photoimmunol. Photomed.，第 7 卷，第 3 至第 4 页，1990 年）。

大量的皮肤、毛发和指甲护理活性物质是本领域已知的，并且可用于改善皮肤、毛发或指/趾甲的健康和/或美观性。然而，仍然存在对以下个人护理组合物的需求：其可提供所需的有益效果并且对于具体的应用可以是皮肤制药学和/或美容上优选的。

发明概述

本发明提供一种个人护理组合物，所述组合物包含 PPARG 拮抗剂，其可有助于改善皮肤、毛发或指/趾甲的健康和/或美观性。

个人护理组合物优选以安全和有效量包括一种或多种上述 PPARG 拮抗剂和/或上述 PPARG 拮抗剂的衍生物。

本发明还涉及使用上述组合物以调节哺乳动物的皮肤组织和附属结构（例如，皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲）状况的方法。所述方法通常包括向需要上述处理的哺乳动物的角质组织（例如，皮肤表面、毛发或指/趾甲）和/或向期望上述处理的哺乳动物的角质组织局部施用本发明组合物的步骤。

在另一方面，所述方法包括口服 PPARG 拮抗剂，优选安全和有效量的所述 PPARG 拮抗剂以调节哺乳动物的皮肤组织和附属结构（例如，皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲）状况的步骤。在一个实施例中，所述方法包括双重治疗方案，所述方案包括口服组合物和局部施用组合物，其中至少一种组合物包含如本发明所述的 PPARG 拮抗剂。

在另一方面，所述方法包括注射所述 PPARG 拮抗剂，优选将所述 PPARG 拮抗剂注射进皮肤和/或皮肤下的步骤。在一个具体的实施例中，所述方法包括治疗方案，所述方案包括注射和/或口服和/或局部施用的组合。

对于本领域的技术人员来说，通过阅读本说明书的公开内容，本发明的这些和其它特征、方面和优点将变得显而易见。

具体实施方式

尽管本说明书在结尾的权利要求书中特别指出并清楚地要求保护本发明，但据信通过下列说明可更好地理解本发明。

如本文所用，术语“PPARG”是指过氧化物酶体增殖物激活受体γ。

如本文所用，术语“PPARG 拮抗剂”是指一种或多种 PPARG 或其组合的抑制剂和/或拮抗剂，以及 PPARG 拮抗剂的衍生物。

如本文所用，术语“抑制剂”是指下调、延迟、预防和/或限制基因或其产品（例如 RNA、蛋白质）的表达、活性或影响的物质。

如本文所用，术语“拮抗剂”是指抵消、中和或废除激动剂化合物和/或它们的受体的活性或影响的物质。

除非另外指明，本文中使用的所有百分比和比率均以总组合物的重量计，并且所有的测量均在 25℃ 进行。

如本文所用，术语“皮肤组织”包括但不限于皮肤所有的层和唇缘、毛囊、皮脂腺、汗腺、趾甲、指甲、角质层、蹄等等。

如本文所用，术语“角质组织”是指作为哺乳动物（例如人类、狗、猫等）最外层保护覆盖物的含角质层，其包括但不限于皮肤黏膜的外层和唇缘、以及毛发、趾甲、指甲、角质层蹄等等。

本文所用术语“局部施用”、“局部地”和“局部用”是指将本发明的组合物施用（如涂敷、喷雾）到角质组织表面上。

本文所用术语“口服”、“口服地”和“口腔服用”是指口服本发明的组合物。

本文所用术语“皮肤病学可接受的”是指所述组合物或其组分适用于和哺乳动物的角质组织接触，而没有不适当的毒性、不相容性、不稳定性、变应性反应等。

本文所用术语“可口服用的”是指所述的组合物或其组分适于被哺乳动物口服，而没有不适当的毒性、不相容性、不稳定性、变应性反应等。

如本文所用，“有效量”是指足以显著产生积极的皮肤组织有益效果的化合物或组合物量，所述有益效果包括单独的或与本文公开的其它有益效果相组合的有益效果。这意味着制剂中 PPARG 拮抗剂的含量和/或浓度足够大，当以正常频率和常规量施用所述制剂时，所述制剂可对一种或多种非期望皮肤组织状况（例如皮肤皱纹）提供处理。例如，所述量可以是

足以抑制或增强皮肤组织中存在的某些生物化学功能的量。PPARG 拮抗剂的这个量可根据产品的类型、待处理的皮肤组织状况类型等而变化。

本文所用术语“安全和有效量”是指化合物或组合物的量足以显著产生积极的有益效果，优选积极的皮肤组织外观或感觉有益效果，所述有益效果包括独立的或与本文所公开的有益效果相组合的有益效果，同时所述量又足够低以避免严重的副作用，即，在技术人员合理的判断范围内，提供合理的效险比。

本发明的个人护理组合物可用于处理皮肤组织（如毛发、皮肤、皮脂腺或指/趾甲）状况。如本文所用，“处理”或“治疗”或“处理”包括调节和/或即时改善皮肤组织的美观性和/或感觉。本文所用术语“调节”或“调整”是指保持或改善健康和/或美观性，并且包括预防性调节和/或治疗性调节。由于机体的内在因素和/或外在因素可诱发或导致各种状况，所以经常需要对皮肤组织状况，即哺乳动物且尤其是人的皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲状况进行调节。实例包括环境损害、辐射暴露（包括紫外线辐射）、实足年龄、更年期状况（如更年期后皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲的变化）、压力、疾病、失调等。例如，“调节皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲状况”包括预防性调节和/或治疗性调节皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲的状况，并且可涉及下列一种或多种有益效果：增厚皮肤、毛发或指/趾甲（例如，构造皮肤的表皮和/或真皮和/或皮下层 [例如，皮下脂肪或肌肉]，以及指/趾甲和毛干所述的角质层（如果适用的话））以缓解皮肤、毛发、或指/趾甲的萎缩；增加真皮-表皮边界（也称之为网缘）的褶积，防止皮肤或毛发弹性损失（功能的皮肤弹性蛋白的损耗、损害和/或钝化），诸如弹性组织变性、松垂；由变形皮肤或毛发回弹的损失；对于皮肤、毛发或指/趾甲的黑素或非黑素在着色方面的改变，诸如眼袋、疹斑（例如由于红斑痤疮造成的不均匀的红色着色）（下文称作“红斑”）、灰黄（淡白色）；由于毛细管扩张或蛛形血管造成的变色，以及泛灰色毛发和毛孔减小。

本文所用的预防性调节角质组织状况包括延缓、最大程度地减少和/或预防可见的和/或可触及的皮肤组织不连续性（如通过视觉或感觉发现的皮肤、毛发或指甲中的纹理不规则性），包括皮肤、毛发或指甲老化的迹象。这也包括在术语“处理”中。

本文所用的治疗性调节皮肤组织状况包括改善，例如如减少、最大程度地减少和/或消除角质组织（如皮肤、毛发或指/趾甲）中的不连续性。这也包括在术语“处理”中。

如本文所用，“个人护理组合物”包括任何局部施用于角质组织和/或为了处理角质组织（如皮肤、毛发、指/趾甲）口服的产品。

本发明的组合物还可用于即时改善皮肤组织（如皮肤、毛发或指/趾甲）的美观性和/或感觉。例如，本发明的局部用组合物可通过在向皮肤、毛发或指/趾甲施用所述组合物后，在皮肤、毛发或指甲外观上提供即时的视觉改善，以用于调节皮肤、毛发或指/趾甲状况的美观性。一般而言，还包含颗粒物质（如颜料）的本发明的局部用组合物最可用于提供即时的视觉改善。

本文所用术语“松垂”是指由于皮肤弹性蛋白、肌肉和/或皮下脂肪的缺失、损坏、改变和/或畸形而导致出现的皮肤松弛、松懈等状况。

本文所用的术语“光滑”和“软化”是指改变角质组织的表面以改进触感。

“皮肤组织老化迹象”包括，但不限于，因皮肤老化引起的所有外表可见和可触觉感知的迹象，以及其它任何明显或细微的迹象。这些迹象可由如实足年龄和/或环境损害等内在因素或外在因素诱发或导致。这些迹象由以下作用产生，所述作用包括但不限于，纹理不连续性的发展，如皱纹和粗糙深纹；细纹；皮肤条纹；裂纹；肿块；粗大毛孔（如与附属结构诸如汗腺导管、皮脂腺或毛囊相关的）或不平坦性或粗糙性；皮肤弹性的损失（功能的皮肤弹性蛋白的损失和/或钝化）；松垂（包括在眼部区域和面颊的虚胖）；皮肤稳定性的损失；皮肤紧密性的损失；由变形皮肤回弹的损失；变色（包括眼袋）；疹斑；灰黄；皮肤区域色素沉着，诸如老年斑和雀斑；角质化的，异常的分化；过角质化作用；弹性组织变性；胶原分解；以及角质层、真皮、表皮、皮肤血管系统（例如，毛细管扩张或蛛形血管）和皮下组织（例如脂肪和/或肌肉），尤其是最接近皮肤的那些的其它组织学变化。

本发明的组合物将在下文中详细描述。

I. 个人护理组合物

本发明的个人护理组合物可包括:

(1) PPARG 拮抗剂;

(2) 口服或皮肤病学或注射可接受的载体; 和

(3) 任选的任选组分。

本发明的个人护理组合物可为任何适宜的形式。可设想包含 PPARG 拮抗剂的局部用和口服个人护理组合物的所有形式，并且所述形式包括，例如，霜膏、凝胶、洗剂、乳液、胶体、溶液、悬浮液、油膏剂、乳剂、喷剂、胶囊、片剂、液体、棒状物、固体、粉末、致密物、笔类物、喷涂制剂、涂刷制剂、织物、擦拭物等。

无限制地，局部用个人护理组合物的非限制性实例可包括唇膏、睫毛膏、胭脂、粉底、腮红、眼线、唇线、润唇膏、面部或身体粉剂、防晒剂和遮蔽物、指甲油、摩丝、喷剂、定型凝胶、指/趾甲调理剂、沐浴和沐浴凝胶、洗发剂、调理剂、霜膏漱口液、毛发染料和染色产品、免洗型调理剂、防晒剂和防晒霜、唇香膏、皮肤调理剂、雪花膏、保湿剂、发胶、皂、身体擦洗剂、剥脱剂、收敛剂、脱毛剂和烫发溶液、去头皮屑制剂、止汗剂和止汗剂组合物、剃须剂、剃前和剃后产品、保湿剂、除臭剂、雪花膏、清洁剂、皮肤凝胶和漱口液。此外，通过使用贴剂或其它递送装置，也可局部施用所述组合物。递送装置包括但不限于可加热或冷却的那些，以及利用离子电渗或超声波的那些。

口服个人护理组合物的非限制性实例包括但不限于，片剂、药丸、胶囊、饮品、饮料、粉末、维生素、补充物、健康棒、糖果、咀嚼剂和滴剂。

个人护理组合物可包括任何期望的、适宜的任选成分。

在一个特定实施例中，所述组合物不包含取代的吲哚。在另一个实施例中，所述组合物不包含吲哚。还在另一个实施例中，所述组合物基本上不含吲哚。在另一个实施例中，所述组合物基本上不含取代的吲哚。

在另一个方面中，本发明提供了个人护理方案，所述方案包括使用至少一种局部用组合物与至少一种口服组合物的组合。此方案中，至少一种组合物包含如本发明所述的 PPARG 拮抗剂。优选地，所述方案包括至少一种包含上述 PPARG 拮抗剂的局部用组合物和至少一种包含上述 PPARG 拮抗剂的口服组合物。

在另一方面，所述方法包括注射所述 PPARG 拮抗剂，优选将所述 PPARG 拮抗剂注射进皮肤和/或皮肤内的步骤。在一个具体的实施例中，所述方法包括治疗方案，所述方案包括注射和/或口服和/或局部施用本发明 PPARG 拮抗剂的组合。

在更进一步的实施例中，所述方法包括每天局部施用所述组合物。在另一个实施例中，所述方法包括在晚上局部施用所述组合物。在一个特定实施例中，所述方法包括在上床前，优选在晚上或在一天休息之前，局部施用所述组合物。还在另一个实施例中，所述方法包括：(a)清洁角质的表面以形成清洁的角质表面；和(b)向所述清洁的角质表面局部施用所述组合物。

II. PPARG 拮抗剂

本发明的组合物包含 PPARG 拮抗剂。如本文所用，术语“PPARG 拮抗剂”足够广泛以包括一种或多种 PPARG 拮抗剂、一种或多种 PPARG 拮抗剂衍生物以及它们的组合。优选地，所述组合物包含有效量的、优选安全和有效量的上述 PPARG 拮抗剂。

在一个实施例中，所述 PARG 拮抗剂可选自由下列物质组成的组：染料木黄酮、T0070907、双酚 A 二缩水甘油醚(BADGE)、GW-9662、PD 068235、SR-202、LG 100641、溶血磷脂酸(LPA)、茶儿茶素、得自木槿的提取物、油酸、10-十九烯酸、11-二十碳酸烯酸、二十一烷酸、红曲米、鞣酸、以及它们的组合。

在一个实施例中，所述个人护理组合物按所述总组合物的重量计能够以约 0.000001% 至约 10%，在另一个实施例中约 0.0001% 至约 5%，在另一个实施例中约 0.001% 至约 1% 的含量包括所述 PPARG 拮抗剂 。

根据本发明，当包含在个人护理组合物中时，优选以安全和有效的量提供所述 PPARG 拮抗剂，以处理至少一种不期望的皮肤组织（例如，皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲）状况的迹象。在此所用的短语“以处理至少一种不期望的皮肤组织（例如皮肤、毛发或指/趾甲）状况”是指，当以有效量局部使用和/或口服使用和/或皮下使用时，所述 PPARG 拮抗剂在其对某些方面的皮肤组织（例如，皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲）状况的功效上，提供可客观测量的增加。这可以是例如在细纹和皱纹外观上更大的减少、增加效能、具有刺激或抑制至少一种皮肤、毛发或指/趾甲中生物化学

工程至更大程度的能力、增加皮肤强度、增加稳定性、减少皮脂腺大小、减少毛囊孔径等等。通常，这是基于和对照物进行比较来确定的。

III. 任选组分/成分

本发明的组合物可包含一种或多种适宜的所需任选组分。例如，所述组合物可任选地包含其它活性或非活性成分。

例如，本发明可包括附加的护肤活性物质，其选自由下列物质组成的组：糖胺、维生素 B3、类视色素、肽、二烷酰基羟脯氨酸、去氧苯比妥、水杨酸、植物甾醇、防晒活性物质、水溶性维生素、油溶性维生素、它们的衍生物、它们的前体、以及它们的组合。

例如，包括 PPARG 拮抗剂和一种附加的皮肤组织活性物质，诸如烟酰胺的组合的组合物，能够提供附加的和/或增效的角质组织（例如皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲）有益效果。

任何适宜的其它任选组分也可包含于本发明的个人护理组合物中，如常规用于指定产品类型中的那些成分。“CTFA Cosmetic Ingredient Handbook”第十版（由 Cosmetic，Toiletry，and Fragrance Association，Inc.，Washington，D.C. 公布）(2004)（下文称为“CTFA”）描述了各种各样可加入到本文组合物中的非限制性物质。这些成分种类的实例包括但不限于研磨剂、吸收剂、美学组分，诸如芳香剂、颜料、染色/着色剂、精油、皮肤增感剂、收敛剂等等（例如丁香油、薄荷醇、樟脑、桉树油、丁子香酚、乳酸薄荷酯、金缕梅馏出液）、抗痤疮剂、抗结块剂、消泡剂、抗微生物剂（例如丁基氨基甲酸碘丙酯）、抗氧化剂、粘合剂、生物添加剂、缓冲剂、增量剂、螯合剂、化学添加剂、着色剂、美容收敛剂、化妆品杀虫剂、变性剂、药物收敛剂、外用止痛剂、成膜剂或材料，例如，用于帮助成膜性能和组合物亲和性的聚合物（例如二十碳烯和乙烯基吡咯烷酮的共聚物）、不透明剂、pH 调节剂、推进剂、还原剂、多价螯合剂、皮肤漂白和淡色剂、（例如对苯二酚、曲酸、抗坏血酸、抗坏血酸磷酸镁、抗坏血酸基葡糖苷、吡哆素）、皮肤调理剂（例如湿润剂和吸留性试剂）、皮肤抚慰和/或康复剂及衍生物（例如泛醇及衍生物，诸如乙基泛醇、芦荟、泛酸及其衍生物、尿囊素、红没药醇和甘草酸二钾盐）、皮肤处理剂（例如，维生素 D 化合物、一、二、和三萜系化合物、β-亚诺抗氧化添加剂、雪松醇）、增稠剂和维生素及其衍生物。

其它活性物质

本发明的组合物可包含安全和有效量的以下一种或多种其它活性物质或成分：脂肪酸（尤其是多不饱和的脂肪酸）、葡糖胺、1-氧-2-巯基吡啶锌(ZPT)、杀真菌剂、硫醇化合物（例如 N-乙酰基半胱氨酸、谷胱甘肽、硫基乙醇酸盐）、其它维生素（维生素 B12）、β-胡萝卜素、辅酶 Q、艾地苯醌、氨基酸等等。

IV. 载体

根据所需的产品形式，本发明的组合物可包含口服用、皮肤病学或注射/皮下可接受的载体。

A. 皮肤病学可接受的载体

本发明的局部用组合物还可包含用于所述组合物的皮肤病学可接受的载体。在一个实施例中，所述载体的含量按所述组合物的重量计为约 50% 至约 99.99%，优选为约 60% 至约 99.9%，更优选为约 70% 至约 98%，并且甚至更优选为约 80% 至约 95%。

所述载体可呈各种形式。非限制性实例包括简单溶液（水基的或油基的）、乳液和固体形式（凝胶、棒状物）。例如，乳液载体包括但不限于，水包油乳液、油包水乳液、硅氧烷包水乳液、水包油包水乳液和硅氧烷包水包油乳液。

根据所需的产品形式，优选的载体可包括乳液，如水包油乳液（如水包硅氧烷乳液）和油包水乳液（如硅氧烷包水乳液）。正如技术人员所理解的那样，给定组分将主要分配到水相或油相中，这取决于该组分在组合物中的水溶性/可分配性。在一个实施例中，水包油乳液是尤其优选的。

如本发明所述的乳液可包括含水相和类脂或油。类脂和油可得自动物、植物、或石油，并且可以是天然或合成的（即人工制得的）。优选的乳液还包含湿润剂，例如甘油。乳液还包含按所述组合物的重量计约 0.1% 至约 10%，更优选约 0.2% 至约 5% 的乳化剂。乳化剂可以是非离子、阴离子或阳离子的。适宜的乳化剂公开于例如美国专利 3,755,560、美国专利 4,421,769 以及 McCutcheon 的“Detergents and Emulsifiers”北美版第 317 至第 324 页(1986)中。取决于所需的产品形式，合适的乳液可具有范围很宽的粘度。

本发明的组合物可以为可倾倒的液体形式（在环境条件下）。因此，所述组合物包含含水载体，其含量典型为约 20% 至约 95%，优选为约 60% 至约 85%。所述含水载体可包括水，或水与有机溶剂的可混溶混合物，但优选包括具有最低含量或无显著量有机溶剂的水，除非所述有机溶剂被另外附带掺入到组合物中，以作为其它基本或任选组分的微量成分。

b. 口服用载体

如果本发明的组合物是可吞咽的，则它们还可包含口服用载体。可使用任何适宜的口服用载体，或本领域或其它领域已知的载体形式。口服用个人护理组合物的非限制性实例包括但不限于片剂、药丸、胶囊、饮品、饮料、粉末、维生素、补充物、健康棒、糖果、咀嚼剂和滴剂。

c. 可注射的液体

如果本发明的组合物是将被注射的，则所述组合物还包含适于注射到皮肤中和/或皮肤下的液体。可使用本领域或其它领域已知的任何适宜的可接受液体。

V. 组合物制备

可通过常规方法，如制备局部用组合物和口服组合物以及注射组合物领域已知的方法来制备用于本发明方法中的组合物。通常，上述方法典型涉及在一步或多步中，在需要或不需要加热、冷却、施加真空等条件下，将成分混合至比较均匀的状态。

VI. 用于处理皮肤组织状况的方法

本发明的组合物可用于处理众多哺乳动物皮肤组织状况。皮肤组织状况的上述处理可包括预防性和治疗性调节。更具体地讲，上述处理方法可针对但不限于预防、延迟和/或治疗不均匀的肤色；减少哺乳动物皮肤毛孔大小；调节哺乳动物皮肤油质/发亮外观；增厚皮肤组织（即，构造皮肤的表皮和/或真皮和/或皮下层以及指/趾甲和毛干所述的角质层（如果适用的话））；通过将其用作淡色或减少色素沉着的美容试剂预防、延迟和/或治疗不均匀的肤色；预防、延迟和/或处理哺乳动物皮肤的萎缩、软化和/或平滑哺乳动物的唇缘、毛发和指/趾甲；预防、延迟、和/或处理哺乳动物皮肤瘙痒；预防、延迟和/或处理黑眼圈和/或肿眼外观；预防、延迟和/或处理哺乳动物皮肤灰黄；预防、延迟和/或处理哺乳动物皮肤松垂（即糖化作用）；预防和/或延迟哺乳动物皮肤晒成褐色；脱落、剥落和/或增加哺

乳动物皮肤代谢回转；预防、延迟和/或处理色素沉着过度，诸如发炎后色素沉着过度；预防、延迟和/或处理哺乳动物皮肤上蛛形血管和/或红斑外观；预防、延迟和/或处理哺乳动物皮肤细纹和皱纹；预防、延迟和/或处理皮肤干燥（即粗糙、剥落、片状剥落）和预防、延迟和/或处理哺乳动物皮肤脂肪团外观。在一个优选的实施例中，所述组合物被用于处理老化迹象；在一个方面，所述组合物被用于调节老化迹象；在另一方面，所述组合物被用于减少或降低老化迹象；在还有另一个方面，所述组合物被用于防止皮肤组织（例如，皮肤、毛发、皮脂腺或指/趾甲）老化迹象。

例如，本发明可用于治疗性调节哺乳动物皮肤组织中可见的和/或可触及的不连续性，包括皮肤肌理和颜色的不连续性。例如，可减小毛孔的表观直径，紧靠毛孔口的组织表观高度可达到汗腺间的高度，皮肤色调/颜色可变的更均匀，和/或细纹和/或皱纹的长度、深度和/或其它尺寸可减小。此外，本发明的组合物还可用于清洁（如毛发、身体、面部），改善角质组织感觉（润湿和干燥）（如对毛发而言，如改善外观/外表，抗缠结，改善光泽，改善光彩，降低摩擦系数，增加光滑度，保持颜色，减少头发分叉，防止毛发破损，防止环境损伤，如日照损伤、烟熏损伤、以及由污染物质造成的损伤，如氮氧化物、硫氧化物、臭氧和金属如铅），气味调节，油性调节，调理，毛发体积调节，毛发生长和毛发生长抑制。

调节角质组织状况涉及向角质组织局部施用安全和有效量的本发明组合物。组合物的施用量、施用频率和使用周期将根据所给组合物中的组分含量以及所需的调节程度而有很大不同，例如根据现有或预计出现的皮肤组织损伤程度。

此外，调节皮肤组织状况可涉及口服安全和有效量的本发明组合物。组合物的口服量、口服频率和使用周期将根据所给组合物中的组分含量以及所需的调节程度而有很大不同，例如根据现有或预计出现的皮肤组织损伤程度。

在一个实施例中，所述组合物长期施用于皮肤，如局部施用于皮肤。“长期施用”是指在受试者的一生中，长期持续局部施用组合物，优选时间为至少约一个星期，更优选至少约一个月，甚至更优选至少约三个月，甚至更优选至少约六个月，并且还更优选至少约一年。尽管有益效果在各种不同的最大使用期（例如五、十或二十年）后仍能获得，但优选在受试

者整个一生中都长期持续应用。在上述延续期间，典型依照每天约一次的规律施用，然而，施用频率可以变化，并且包括约每周一次至约每天三次或更多次。

当局部施用时，可使用多种用量的本发明组合物，来提供角质组织外观和/或感觉有益效果。例如，以 mg 组合物/cm^2 角质组织为单位，每次施用本发明组合物的典型用量为约 0.1mg/cm^2 至约 20mg/cm^2。尤其有用的涂敷量为约 0.5mg/cm^2 至约 10mg/cm^2。

可通过，例如，施用皮肤露剂、清爽露剂、牛奶露剂、霜膏、凝胶、泡沫、油膏剂、糊剂、乳液、喷剂、调理剂、滋补剂、化妆品、唇膏、粉底、指甲油、须后水等形式的组合物，来实施皮肤组织状况的处理，所述组合物旨在留在皮肤或其它角质组织上以达到某些美学上的、预防上的、治疗上的或其它方面的有益效果（即“免洗型”组合物）。在角质组织（如皮肤）上施用组合物后，其留在皮肤上优选至少约 15 分钟，更优选至少约 30 分钟，甚至更优选至少约 1 小时，甚至更优选至少几小时，如最多约 12 小时。可以处理面部、毛发和/或指/趾甲的任何表面部位（例如，面部、嘴唇、眼下区域、眼皮、头皮、颈、躯干、臂、手、腿、脚、手指甲、脚趾甲、头皮毛发、睫毛、眉毛等）。通过使用手掌和/或手指，或通过使用装置或工具（如棉球、药签、衬垫、涂敷笔、喷雾涂敷器等），来施用本发明的组合物。

确保使角质组织与至少最小含量的组合物连续接触的另一个方法是，通过使用适用于例如脸部的贴剂来施用所述化合物。上述方法尤其可用于有问题的皮肤区域，所述皮肤区域需要更多的强化治疗（如面部鱼尾纹区域、眉心纹、眼下区域、上唇等）。所述贴剂可以是吸留的、半吸留的或不吸留的，并且可以是粘性的或非粘性的。组合物可被包含在贴剂内或在应用贴剂前涂敷于皮肤上。所述贴剂还可包含附加的活性物质，如用于放热反应的化学引发剂，如 PCT 申请 WO 9701313 以及授予 Wu 等人的美国专利 5,821,250、5,981,547 和 5,972,957 中所描述的那些。所述贴剂还可包含电能源（如电池），以例如增加所述组合物和活性剂的递送（如离子电渗疗法）。贴剂敷在角质组织上的保留时间优选至少约 5 分钟，更优选至少约 15 分钟，还更优选至少约 30 分钟，甚至更优选至少约 1 小时，甚至更优选晚上作为夜间处理的一种形式。

在另一个实施例中，使用个人护理方案来调节角质组织状况。“方案”是指使用口服组合物和局部用组合物的组合。在一个具体的实施例中，所述口服组合物和所述局部用组合物作为套盒被包装在一起。在另一个实施例中，所述口服组合物和所述局部用组合物没有作为套盒被包装在一起，但是所述方案的潜在使用者被告知（例如通过广告、产品标签），口服组合物和局部用组合物可彼此组合使用来调节角质组织状况。至少一种口服或局部用的组合物包含一种本发明 PPARG 拮抗剂。优选地，口服和局部用组合物包含一种本发明 PPARG 拮抗剂。

实例

以下是本发明组合物的非限制性实例。实例的给出仅是为了举例说明之目的，不应被解释为是对本发明的限制，因为在不背离本发明的精神和范围的情况下，其许多改变是可能的，这将被本领域的普通技术人员所认识到。

在实例中，除非另外指明，所有浓度均以重量百分比列出，并排除了次要物质，如稀释剂、填充剂等。因此，所列的制剂包括所列的组分以及与该组分有关的任何微量物质。对本领域普通的技术人员来说显而易见的是，这些次要组分的选定将根据选定的具体成分的物理和化学特性而不同，以制造本文所述的发明。

实例 1 至 5：保湿水包油洗剂/霜膏

	1	2	3	4	5
水相:					
水	适量	适量	适量	适量	适量
甘油	3	5	7	10	15
乙二胺四乙酸二钠	0.1	0.1	0.05	0.1	0.1
对羟基苯甲酸甲酯	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
烟酰胺	2	0.5	---	---	5
三乙醇胺	-----	0.25	---	0.3	-----
D-泛醇	0.5	0.1	-----	0.5	1.5
脱氢乙酸钠	---	-----	---	0.5	---
苄醇	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
GLW75CAP-MP（75% 的 TiO2 含水分散体）[1]	-----	0.5	0.5	-----	-----

二羟乙基磺酸己氧苯醚	----	0.1	----	----	----
棕榈酰肽[2]	0.00055	0.00055	0.0001	0.0003	0.00055
N-乙酰氨基葡糖	2	1	2	2	1
大豆异黄酮	0.5	----	----	----	----
茶儿茶素	----	0.1	----	1	----
木槿提取物	0.2	----	1	----	0.5
红曲米	----	0.1	----	0.1	----
鞣酸	1	1	1	0.5	1
油相:					
水杨酸	----	----	1.5	----	----
异十六烷	3	3	3	4	3
PPG 15 硬脂基醚	----	----	8	----	10
异硬脂酸异丙酯	1	0.5	1.3	1.5	1.3
蔗糖聚酯	0.7	----	0.7	1	0.7
溶血磷脂酸	0.5	0.5	0.5	----	1
二棕榈酰羟脯氨酸	----	----	----	1.0	----
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	0.5	----	----	----
植物甾醇	----	----	0.5	----	1.0
鲸蜡醇	0.4	0.3	0.4	0.5	0.4
硬脂醇	0.5	0.35	0.5	0.6	0.5
二十二醇	0.4	0.3	0.4	0.5	0.4
PEG-100 硬脂酸酯	0.1	0.1	0.1	0.2	0.1
鲸蜡硬脂基葡糖苷	0.1	0.1	0.1	0.25	0.1
增稠剂:					
聚丙烯酰胺/C13-14 异链烷烃/月桂基聚氧乙烯醚-7	1.5	----	2	2.5	2
聚季铵盐-37	----	2	----	----	----
附加成分:					
聚二甲基硅氧烷/聚二甲基硅氧烷醇	----	1	2	0.5	2
聚甲基倍半硅氧烷	----	----	0.25	----	1
尼龙-12	----	0.5	----	----	----
Prestige 绢紫[3]	----	----	----	----	1
Timiron 亮红[4]	----	1.0	----	2	----

[1] 得自 Kobo 的产品

[2] 得自 Sederma

[3] 二氧化钛涂层云母紫色干涉颜料，得自 Eckart

[4] 二氧化硅和二氧化钛涂层云母红色干涉颜料，得自 Rona

在一个适宜的容器中，合并水相成分，并加热至 75℃。在另一个合适的容器中，将油相成分混合，并加热至 75℃。然后，将油相加入到水相中，并研磨所得乳液（如用 Tekmar T-25）。然后，将增稠剂加入乳液中，并在搅拌的同时将乳液冷却至 45℃。于 45℃ 加入剩余的成分。在搅拌下将产物冷却至 30℃，并倒入到适宜的容器中。

实例 6 至 11：保湿水包硅氧烷浆液/洗剂：

	6	7	8	9	10	11
水相：						
水	适量	适量	适量	适量	适量	适量
甘油	3	5	7	10	15	10
乙二胺四乙酸二钠	0.1	0.1	0.05	0.1	0.1	0.1
烟酰胺	2	---	0.5	---	5	3
脱氢乙酸钠	---	---	-----	0.5	---	---
D-泛醇	0.5	0.1	---	0.5	1.5	0.5
GLW75CAP-MP（75%的 TiO2 含水分散体）[1]	-----	0.4	-----	-----	-----	0.4
抗坏血酸基葡糖苷	-----	-----	-----	-----	-----	1
棕榈酰肽[2]	0.00055	0.00055	0.0003	0.0003	0.00055	0.00055
BHT	-----	0.5	-----	-----	-----	-----
大豆异黄酮	-----	1	-----	-----	-----	-----
N-乙酰氨基葡糖	2	-----	2	-----	5	-----
茶儿茶素	-----	0.1	-----	1	-----	-----
三乙醇胺	---	---	0.8	0.3	0.6	---
木槿提取物	0.2	-----	1	-----	0.5	-----
红曲米	-----	0.1	-----	0.1	-----	-----
鞣酸	1	1	1	0.5	1	1
硅氧烷/油相：						
环状聚甲基硅氧烷(Cyclomethicone)D5	10	5	5	10	7.5	10
Dow Corning 9040 硅氧烷弹性体[3]	-----	10	5	5	7.5	5
KSG-15AP 硅氧烷弹性体[4]	5	-----	5	5	7.5	5
聚二甲基硅氧烷/聚二甲基硅氧烷醇	-----	2	2	1	2	1
聚二甲基硅氧烷50厘池	1	-----	-----	-----	-----	-----

水杨酸	----	0.5	---	----	----	----
溶血磷脂酸	0.5	0.5	0.5	----	0.1	----
植物甾醇	----	----	----	0.2	----	0.1
PPG-15 硬脂基醚	----	2	2	2	1	1
脱氢乙酸	----	0.1	---	----	----	----
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	----	0.2	----	----	----
维生素 E 乙酸酯	----	0.5	0.1	0.1	----	0.1
增稠剂:						
聚丙烯酰胺/C13-14 异链烷烃/月桂基聚氧乙烯醚-7	2.5	2.5	----	----	----	3
丙烯酸酯/C10-30 丙烯酸烷基酯交联聚合物	----	----	0.6	----	0.5	----
十一碳烯酰基苯基丙氨酸预混物						
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	----	----	----	1	----
水	----	----	----	----	24	----
三乙醇胺	----	----	----	----	0.4	----
二棕榈酰羟脯氨酸预混物:						
水	----	----	----	----	----	4.4
三乙醇胺	----	----	----	----	----	0.2
二棕榈酰羟脯氨酸	----	----	----	----	----	1.0
附加成分:						
聚甲基倍半硅氧烷	0.5	0.5	1.0	1	1	0.5
聚乙烯	----	0.5	0.5	1.0	----	----
Flamenco Summit 绿 G30D[5]	----	----	1.0	----	----	----
Silca	----	----	1	0.5	----	----
Prestige 绢红[6]	----	----	----	1.0	1.0	1.0

[1] GLW75CAP-MP，75% 的二氧化钛含水分散体，得自 Kobo

[2] 得自 Sederma

[3] 硅氧烷弹性体分散体，得自 Dow Corning Corp.

[4] 硅氧烷弹性体分散体，得自 Shin Etsu

[5] 二氧化钛和二氧化锡涂层云母绿色干涉颜料，得自 Engelhard

[6] 二氧化钛涂层云母红色干涉颜料，得自 Eckart

在一个合适的容器中，混合水相成分，并搅拌直至均匀。在另一个合适的容器中，混合硅氧烷/油相成分，并搅拌直至均匀。通过在一个适宜的容器中混合预混物成分，在搅拌的同时加热至约 70℃，然后在搅拌的同时冷却至室温，分别制备二棕榈酰羟脯氨酸预混物和/或十一碳烯酰基苯基丙氨酸预混物。加入一半增稠剂，然后将硅氧烷/油相加入到水相中，并研磨所得乳液（如用 Tekmar T-25）。在搅拌的同时，将剩余的增稠剂、二棕榈酰羟脯氨酸预混物和/或十一碳烯酰基苯基丙氨酸预混物加入到乳液中，随后加入剩余的成份。一旦该组合物均匀，则将产品倒入到适宜容器中。

实例 12 至 17：保湿硅氧烷包水霜膏/洗剂：

组分	12	13	14	15	16	17
A 相						
水	适量	适量	适量	适量	适量	适量
尿囊素	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
乙二胺四乙酸二钠	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
对羟基苯甲酸乙酯	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
对羟基苯甲酸丙酯	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
咖啡因	----	1	----	----	----	1
BHT	----	0.1	----	0.015	----	----
右旋泛醇	1	0.5	1	1	1	1
甘油	7.5	10	15	7.5	5	15
去氧苯比妥羟乙基磺酸盐	----	----	0.1	0.2	----	----
1,2-己二醇	---	---	3	6	---	---
烟酰胺	---	----	----	2	3.5	5
棕榈酰肽[1]	0.00055	0.00055	0.00055	0.0003	0.0003	0.00055
苯基苯并咪唑磺酸	----	----	----	----	1	----
脱氢乙酸钠	0.5	----	----	---	---	---
苄醇	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
三乙醇胺	0.3	----	0.1	0.1	0.6	----
绿茶提取物	1	1	1	1	1	1
大豆异黄酮	----	0.5	----	----	----	----
N-乙酰氨基葡糖	5	----	2	5	2	----
偏亚硫酸氢钠	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
茶儿茶素	----	0.1	----	1	----	----
木槿提取物	0.2	----	1	----	0.5	----
红曲米	----	0.1	----	0.1	----	----
鞣酸	1	1	1	0.5	1	1

B 相						
环戊硅氧烷	15	15	18	15	15	18
二氧化钛	0.5	0.5	0.75	0.5	0.5	0.75
C 相						
C12-C15 烷基苯甲酸酯	3	----	----	---	---	----
溶血磷脂酸	0.1	0.5	0.5	----	1	----
维生素 E 乙酸酯	0.5	----	1	0.5	0.5	1
丙酸视黄酯	0.2	----	----	---	---	----
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	----	0.2	----	----	----
二棕榈酰羟脯氨酸	----	---	----	0.5	---	----
水杨酸	----	0.5	---	----	----	----
PPG-15 硬脂基醚	---	2	1	2	2	----
脱氢乙酸	----	0.5	0.1	----	----	----
植物甾醇	---	---	----	---	0.2	----
D 相						
KSG-21 硅氧烷弹性体[2]	4	4	5	4	4	5
Dow Corning 9040 硅氧烷弹性体[3]	15	15	12	15	15	12
Abil EM-97 聚二甲基硅氧烷共聚多元醇[4]	0.5	----	----	0.5	0.5	----
聚甲基倍半硅氧烷	2.5	2.5	2	2.5	2.5	2
十一碳烯酰基苯基丙氨酸预混物						
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	----	----	----	1	----
水	----	----	----	----	24	----
三乙醇胺	----	----	----	----	0.4	----
E 相						
水	---	----	----	----	----	8.85
三乙醇胺	---	----	----	----	----	0.25
二棕榈酰羟脯氨酸	---	----	----	----	----	1

[1] 得自 Sederma

[2] KSG-21 是乳化的硅氧烷弹性体，得自 Shin Etsu

[3] 硅氧烷弹性体分散体，得自 Dow Corning Corp.

[4] Abil EM-97，得自 Goldschmidt Chemical Corporation

在一个合适的容器中，用适当的搅拌器（如 Tekmar 型号 RW20DZM）将 A 相组分共混在一起，并搅拌直至所有组分溶解。接着，在合适的容器中，将 B 相组分共混在一起，并用合适的研磨机（如 Tekmar RW-20）研

磨约 5 分钟。搅拌着将 C 相组分加入到 B 相混合物中。接着，将 D 相组分加入到 B 和 C 相的混合物中，然后用合适的搅拌器（如 Tekmar RW-20）将所得的 B、C 和 D 相组分的组合搅拌约 1 小时。如果适用，通过混合所有成分，搅拌着将这些成分加热至 70℃，然后搅拌着冷却回室温，制备十一碳烯酰基苯基丙氨酸预混物和/或 E 相。在搅拌的同时将十一碳烯酰基苯基丙氨酸预混物和/或 E 相加入 A 相。接着，搅拌着将 A 相缓慢加入到 B、C 和 D 相的混合物中。持续搅拌所得混合物直至产物均匀。用适当的研磨机（如 Tekmar T-25）研磨所得产物约 5 分钟。

实例 18 至 22：水包油摩丝

	18	19	20	21	22
水相：					
水	适量	适量	适量	适量	适量
甘油	3	5	7	10	15
乙二胺四乙酸二钠	0.1	0.1	0.05	0.1	0.1
对羟基苯甲酸甲酯	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
烟酰胺	2	---	----	3	5
三乙醇胺	0.4	0.45	----	0.4	----
D-泛醇	0.5	0.1	----	0.5	1.5
脱氢乙酸钠	--	0.5	---	---	---
苄醇	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
GLW75CAP-MP（75% 的 TiO2 含水分散体）[1]	----	0.5	0.5	----	----
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	1	----	---	0.5	----
二羟乙基磺酸己氧苯醚	----	0.1	----	----	----
棕榈酰肽[2]	0.00055	0.00055	0.0001	0.00055	0.00055
N-乙酰氨基葡糖	2	1	2	2	1
大豆异黄酮	0.5	----	----	----	----
茶儿茶素	----	0.1	----	1	----
木槿提取物	0.2	----	1	----	----
红曲米	----	0.1	----	0.1	----
鞣酸	1	1	1	0.5	1
油相：					
水杨酸	----	----	1.5	----	----
异十六烷	3	3	3	4	3
PPG 15 硬脂基醚	----	3	4	----	8
异硬脂酸异丙酯	1	0.5	1.3	1.5	1.3

溶血磷脂酸	0.5	0.5	0.5	----	----
蔗糖聚酯	0.7	----	0.7	1	0.7
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	0.5	----	----	----
二棕榈酰羟脯氨酸	----	----	----	1.0	----
植物甾醇	----	----	0.5	----	1.0
鲸蜡醇	0.4	0.3	0.4	0.5	0.4
硬脂醇	0.5	0.35	0.5	0.6	0.5
二十二醇	0.4	0.3	0.4	0.5	0.4
PEG-100 硬脂酸酯	0.1	0.1	0.1	0.2	0.1
鲸蜡硬脂基葡糖苷	0.1	0.1	0.1	0.25	0.1
增稠剂:					
聚丙烯酰胺/C13-14 异链烷烃/月桂基聚氧乙烯醚-7	1.5	----	2	2.5	2
聚季铵盐-37	----	2	----	----	----
附加成分:					
聚二甲基硅氧烷/聚二甲基硅氧烷醇	----	1	2	0.5	2
聚甲基倍半硅氧烷	----	----	0.25	----	1
尼龙-12	----	0.5	----	----	----
Prestige 绢紫[3]	----	----	----	----	1
Timiron 亮红[4]	----	1.0	----	2	----
推进剂相					
152 A HFC 推进剂	3	4	2	3	2
A-70 推进剂	3	2	4	3	4

[1] 得自 Kobo 的产品

[2] 得自 Sederma

[3] 二氧化钛涂层云母紫色干涉颜料，得自 Eckart

[4] 二氧化硅和二氧化钛涂层云母红色干涉颜料，得自 Rona

在一个适宜的容器中，合并水相成分，并加热至 75℃。在另一个合适的容器中，将油相成分混合，并加热至 75℃。然后，将油相加入到水相中，并研磨所得乳液（如用 Tekmar T-25）。将增稠剂加入到乳液中，并在搅拌的同时将乳液冷却至 45℃。于 45℃ 加入剩余的成分。在搅拌下将产物冷却至 30℃，并倒入到适宜的容器中。将推进剂和产品加入到适宜的气溶胶容器中，并将容器密封。

实例 23 至 28：水包硅氧烷摩丝

	23	24	25	26	27	28
水相：						
水	适量	适量	适量	适量	适量	适量
甘油	3	5	7	10	15	10
乙二胺四乙酸二钠	0.1	0.1	0.05	0.1	0.1	0.1
烟酰胺	2	---	----	3	5	3
脱氢乙酸钠	---	0.5	----	---	---	---
D-泛醇	0.5	0.1	----	0.5	1.5	0.5
GLW75CAP-MP（75% 的 TiO2 含水分散体）[1]	----	0.4	----	----	----	0.4
抗坏血酸基葡糖苷	----	----	----	----	----	1
棕榈酰肽[2]	0.0003	0.0003	0.00055	0.00055	0.00055	0.00055
大豆异黄酮	----	1	----	----	----	----
N-乙酰氨基葡糖	2	----	2	----	5	----
溶血磷脂酸	0.5	0.5	0.5	----	1	----
茶儿茶素	----	0.1	----	1	----	----
木槿提取物	0.2	----	1	----	0.5	----
BHT	----	0.5	----	----	----	----
红曲米	----	0.1	----	0.1	----	----
鞣酸	1	1	1	0.5	1	1
硅氧烷/油相：						
环状聚甲基硅氧烷(Cyclomethicone)D5	10	5	5	10	7.5	10
Dow Corning 9040 硅氧烷弹性体[3]	----	10	5	5	7.5	5
KSG-15AP 硅氧烷弹性体[4]	5	----	5	5	7.5	5
聚二甲基硅氧烷/聚二甲基硅氧烷醇	----	2	2	1	2	1
聚二甲基硅氧烷 50 厘池	1	----	----	----	----	----
水杨酸	----	----	0.5	----	----	----
植物甾醇	----	----	----	0.2	----	0.1
PPG-15 硬脂基醚	----	----	2	3	----	2
脱氢乙酸	----	----	0.5	----	----	----
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	----	---	0.2	----	----
维生素 E 乙酸酯	----	0.5	0.1	0.1	----	0.1
增稠剂：						
聚丙烯酰胺/C13-14 异链烷烃/月桂基聚氧乙烯醚-7	2.5	2.5	----	----	----	3

丙烯酸酯/C10-30 丙烯酸烷基酯交联聚合物	----	----	0.6	----	0.5	----
十一碳烯酰基苯基丙氨酸/二棕榈酰羟脯氨酸预混物						
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	----	----	----	1	----
水	----	----	----	----	24	9
三乙醇胺	----	----	----	----	0.4	0.2
二棕榈酰羟脯氨酸	----	----	----	----	----	1.0
附加成分:						
三乙醇胺	----	0.3	-0.7	----	0.6	----
聚甲基倍半硅氧烷	0.5	0.5	1.0	1	1	0.5
聚乙烯	----	0.5	0.5	1.0	----	----
Flamenco Summit 绿 G30D[5]	----	----	1.0	----	----	----
二氧化硅	----	----	1	0.5	----	----
Prestige 绢红[6]	----	----	----	1.0	1.0	1.0
推进剂相						
152A HFC 推进剂	3	2	4	1	5	3
A-70 推进剂	3	4	2	5	1	3

[1] GLW75CAP-MP，75% 的二氧化钛含水分散体，得自 Kobo

[2] 得自 Sederma

[3] 硅氧烷弹性体分散体，得自 Dow Corning Corp.

[4] 硅氧烷弹性体分散体，得自 Shin Etsu

[5] 二氧化钛和二氧化锡涂层云母绿色干涉颜料，得自 Engelhard

[6] 二氧化钛涂层云母红色干涉颜料，得自 Eckart

在一个合适的容器中，混合水相成分，并搅拌直至均匀。在另一个合适的容器中，混合硅氧烷/油相成分，并搅拌直至均匀。通过在一个适宜的容器中混合预混物成分，在搅拌的同时加热至约 70℃，然后在搅拌的同时冷却至室温，分别制备十一碳烯酰基苯基丙氨酸预混物和/或二棕榈酰羟脯氨酸预混物。加入一半增稠剂，然后将硅氧烷/油相加入到水相中，并研磨所得乳液（如用 Tekmar T-25）。在搅拌的同时，将剩余的增稠剂、十一碳烯酰基苯基丙氨酸预混物和/或二棕榈酰羟脯氨酸预混物加入到乳液中，随后加入剩余的成份。一旦该组合物均匀，则将产品倒入到适宜容器中。将产品和推进剂加入到气溶胶容器中。密封气溶胶容器。

实例 29 至 34：水基棒状制剂

	29	30	31	32	33	34
水相：						
水	适量	适量	适量	适量	适量	适量
棕榈酰肽[1]	0.00055	0.00055	0.00055	0.00055	0.00055	0.00055
丙二醇	15	25	20	15	25	20
双丙甘醇	50	40	45	50	40	45
硬脂酸钠	6	6	6	6	6	6
三乙醇胺	0.2	0.5	-----	0.6	0.2	----
N-乙酰基-D-葡糖胺	----	2.0	0.5	----	----	2.0
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	0.5	----	1	----	----
烟酰胺	2	---	3.5	5	2	3.5
脱氢乙酸钠	---	0.5	---	---	---	---
二棕榈酰羟脯氨酸	1	----	----	1	0.5	----
茶儿茶素	----	0.1	----	1	----	----
木槿提取物	0.2	----	1	----	0.5	----
红曲米	----	0.1	----	0.1	----	----
鞣酸	1	1	1	0.5	1	1

[1] 得自 Sederma

在一个适宜大小的容器中，混合所有成分，加热到 85℃，冷却，并在约 65℃ 下将其倒入到棒状容器中。

实例 35 至 40：无水的棒状制剂

	35	36	37	38	39	40
油相：						
异硬脂酸异丙酯	3	4	3	5	4	3
PPG-15 硬脂基醚	10	---	2	4	2	10
棕榈酰肽[1]	0.00055	0.00055	0.00055	0.00055	0.00055	0.00055
氰双苯丙烯酸辛酯	5	2	2	5	2	2
阿伏苯宗	1	2	1	3	---	---
环状聚甲基硅氧烷	适量	适量	适量	适量	适量	适量
苯基三甲基硅氧烷	5	5	5	5	5	5
硬脂醇	15	17	15	15	17	15
二十二醇	1	1	1	1	1	1
十一碳烯酰基苯基丙氨酸	----	0.5	----	---	1	---
脱氢乙酸	---	---	0.1	0.5	---	1.0
二棕榈酰羟脯氨酸	1	----	1.0	----	0.5	----
Genistien	0.1	---	0.2	---	0.1	---
植物甾醇	1	0.5	----	----	0.5	1
水杨酸	----	----	0.5	1.5	----	1.0
溶血磷脂酸	0.5	0.5	0.5	----	1	----

[1] 得自 Sederma

将所有成分加入一个适当大小的容器中，在搅拌的同时加热至 75℃，随后冷却，直至混合物达到约 45℃。将所述混合物倒入到棒状容器中。

尽管已用具体实施例来说明和描述了本发明，但对于本领域的技术人员显而易见的是，在不背离本发明的精神和保护范围的情况下可作出许多其他的变化和修改。因此，有意识地在附加的权利要求书中包括属于本发明范围内的所有这些变化和修改。