



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 113164340 B

(45) 授权公告日 2023. 12. 01

(21) 申请号 201980077137.8

(72) 发明人 张悦梅 王琰

(22) 申请日 2019.10.23

(74) 专利代理机构 中科专利商标代理有限责任  
公司 11021

(65) 同一申请的已公布的文献号  
申请公布号 CN 113164340 A

专利代理师 陈平

(43) 申请公布日 2021.07.23

(51) Int.Cl.

(30) 优先权数据

A61K 8/25 (2006.01)

62/749,813 2018.10.24 US

A61K 8/87 (2006.01)

A61Q 19/08 (2006.01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日  
2021.05.24

(56) 对比文件

US 2017189298 A1, 2017.07.06

(86) PCT国际申请的申请数据

US 2006210513 A1, 2006.09.21

PCT/US2019/057579 2019.10.23

US 2014227213 A1, 2014.08.14

(87) PCT国际申请的公布数据

US 2017189320 A1, 2017.07.06

W02020/086670 EN 2020.04.30

US 2015342845 A1, 2015.12.03

US 2017189288 A1, 2017.07.06

(73) 专利权人 科蒂公司

审查员 张祥瑞

地址 美国纽约

权利要求书3页 说明书13页 附图2页

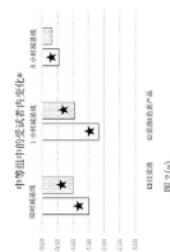
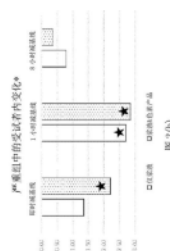
(54) 发明名称

化妆品提紧组合物

(57) 摘要

本申请涉及化妆品组合物,并且特别地,涉及皮肤紧致组合物和通过向皮肤提供皮肤紧致改善而改善皮肤外观的组合物,来处理例如眼袋、面部皱纹和其他皮肤瑕疵,所述化妆品组合物包含多价硅酸盐、至少一种成膜剂和羧酸,其中所述组合物的pH在6.0至11.2的范围内,其中所述组合物在施用于皮肤后提供紧致效果。本发明提供了一种组合物,其提供有效的紧致产品,仍具有良好的天然皮肤光泽而没有与已知的产品相关的白色残留物外观。

临床视觉评分 (皱纹)



★ 本发明产品显著

1. 一种化妆品组合物,所述化妆品组合物包含硅酸钠、热解法二氧化硅、成膜剂和pH调节剂,其中所述组合物的pH在6.5至8.6的范围内,其中所述组合物在施用于皮肤后提供皮肤紧致效果,其中所述成膜剂是聚氨酯,并且所述pH调节剂是20%柠檬酸溶液形式的柠檬酸,

所述硅酸钠包含悬浮在水溶液中的 $\text{Na}_2\text{O}$ 和 $\text{SiO}_2$ ,其中 $\text{SiO}_2:\text{Na}_2\text{O}$ 重量比为3.22,并且硅酸钠溶液在34-42%固体的范围内,并且占所述组合物的总重量的4-20重量%,

所述热解法二氧化硅以所述组合物的0.1-5重量%、以所述固体内容物的0.6%-32%的范围内的量存在,

所述成膜剂以在所述组合物的2-20重量%的范围内的量存在,并且

所述20%柠檬酸溶液以所述组合物的1-10%的范围内的量存在并以所述固体内容物的1.3-13%的范围内的量存在。

2. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述组合物的pH在6.5至8.5的范围内。

3. 根据权利要求1所述的化妆品组合物,其中所述组合物在施用于所述皮肤后提供紧致效果,在所述皮肤上基本上没有白色或灰样外观。

4. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述热解法二氧化硅以所述组合物的0.2-2重量%并以所述固体内容物的1.3-13%的范围内的量存在。

5. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述柠檬酸以所述组合物的0.2-2重量%、所述固体内容物的1.3-13%的范围内的量存在。

6. 根据前述权利要求中任一项所述的组合物,其中所述组合物还包含增塑剂。

7. 根据权利要求6所述的组合物,其中所述增塑剂选自甘油、丙二醇、丁二醇和丙二醇及其混合物。

8. 根据权利要求7所述的组合物,其中所述增塑剂以0.5-20重量%的量存在以促进所述皮肤的顺滑性和水分含量。

9. 根据权利要求7所述的组合物,其中所述增塑剂以0.5-6重量%的量存在以促进所述皮肤的顺滑性和水分含量。

10. 根据权利要求7所述的组合物,其中所述增塑剂包含甘油以促进所述皮肤的顺滑性和水分含量。

11. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述组合物还包含0-2%的黄原胶,以提供透明的组合物以允许通过显著增加所述组合物的粘度、防止其从施加其的皮肤区域流失来稳定所述膜。

12. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述组合物包含防腐剂。

13. 根据权利要求12所述的组合物,其中所述防腐剂为苯氧基乙醇。

14. 根据权利要求13所述的组合物,其中所述防腐剂以所述组合物的总重量的0-2重量%的量存在。

15. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述组合物包含抗微生物剂。

16. 根据权利要求15所述的组合物,其中所述抗微生物剂以在所述组合物的0-2重量%的范围内的量存在。

17. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述20%柠檬酸溶液以所述组合物的5-9重量%的量存在。

18. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述成膜剂是聚氨酯-35。

19. 根据权利要求1所述的组合物,所述组合物还包含去离子水。

20. 根据权利要求1所述的组合物,所述组合物以在所范围内的量包含以下成分,其中所有的量均为所述成分的重量对所述组合物的总重量的重量%:

热解法二氧化硅0.1-2%

38.6%硅酸钠水溶液4-20%

20%柠檬酸水溶液5-9%

41%聚氨酯水乳液2-20%;和任选地,以下中的任何一种或多种:

黄原胶0-2%

多元醇增塑剂0.5-20%,任选地,所述多元醇增塑剂含量在0.5-6%的范围内的1,3-丁二醇和量在0.5-6%的范围内的甘油,

苯氧基乙醇0-2%;和

1,2-己二醇和辛二醇0-2%。

21. 根据权利要求1所述的组合物,所述组合物以所示的量包含以下成分,其中所有的量均为所述成分的重量对所述组合物的总重量的重量%:

原材料	百分数重量%
34-42%%硅酸钠水溶液	6-12
热解法二氧化硅	0.1-2
聚氨酯聚合物	5-12
20%柠檬酸水溶液	5-9

22. 根据权利要求20所述的组合物,所述组合物以所示的量包含以下附加成分,其中所有的量均为所述成分的重量对所述组合物的总重量的重量%:

原材料	百分数重量%
去离子水	60-75

23. 根据权利要求21或22所述的组合物,所述组合物以所示的量包含以下一种或多种附加成分,其中所有的量均为所述成分的重量对所述组合物的总重量的重量%:

原材料	百分数重量%
黄原胶	0.3-0.8
1,3-丁二醇	1.0-15%
甘油	1.5-3.5
1,2-己二醇和辛二醇	0-2
苯氧基乙醇	0.0-2.0

24. 一种制备根据权利要求1所述的组合物的方法,所述方法包括以下步骤:

(a) 以预定的量混合硅酸钠与热解法二氧化硅;

(b) 向所述混合物中添加成膜剂;以及

(c) 在步骤(b)之后,添加pH调节剂以实现在6.5至8.6之间的范围内的pH。

25. 根据权利要求24所述的方法, 其中在步骤(c)处添加柠檬酸直至将pH调节到6.5-8.5的pH。

26. 根据权利要求25所述的方法, 其中所述成膜剂包含聚氨酯-35。

27. 根据权利要求26所述的方法, 其中所述聚氨酯-35以占所述组合物的5-12重量%的量包含。

## 化妆品提紧组合物

### 技术领域

[0001] 本申请涉及化妆品提紧组合物,特别地,涉及皮肤紧致组合物和改善皮肤外观的组合物。

### 背景技术

[0002] 衰老最明显的迹象之一是可见皱纹的形成和眼睛下方区域浮肿的增加。因此,已开发出多种多样的产品来隐藏或减少这些效应的可见效果。这样的产品包括用以掩盖皱纹和掩蔽浮肿的局部用化妆品和胭脂,以及涉及在皮肤下注入化合物如BOTOX™以紧致皮肤并防止浮肿和皱纹发生的更复杂程序。其他程序涉及使用局部处理来使皮肤水合和保湿皮肤,从而通过使皮肤更柔软和柔顺来减少可见皱纹的数量。其他产品含有活性成分如烟酰胺,其设计为随时间推移修复皮肤和恢复皮肤活力。这些产品和程序中的每一个都具有相关的缺点。

[0003] BOTOX™的应用是一项复杂的程序,需要反复拜访专家,并往往比更简单的局部处理具有更高的相关成本和风险。使用美容粉底层和爽肤水来掩饰或减少细纹、皱纹、浮肿及其他瑕疵的出现可具有短期效果,但一旦卸除妆容层,其下面的皮肤就与施加妆容之前相同。保湿剂和水合剂的使用可具有益处并随着时间的推移增加皮肤的健康,但这些改善要花相对长的时间并且所提供的益处是渐进的。

[0004] 因此,已尝试开发旨在减少细纹、皱纹和浮肿的出现的组合物。一种这样的产品依赖于向皮肤表面施加粘合剂膜。向皮肤施加粘合剂膜将导致皱纹被膜向上提拉,从而减少皱纹的数量。然而,与现有粘合剂成膜剂相关的问题包括由于皮肤收缩而对使用者造成的刺激和不适。此外,颜色通常为白色且与面部的基础肤色相区别的膜的高可见性是显著的缺点,另外与其他化妆品产品的相容性问题以及在数小时的过程中随着膜变干而发生的开裂也是显著的缺点。解决其中一些问题的尝试往往会加剧其他问题。

[0005] 硅酸钠常被用作粘合剂膜中的成膜剂。然而,由硅酸钠形成的膜往往非常硬且脆。添加增塑剂可能是对抗此问题的有效方式,然而,添加这样的化合物会导致膜的紧致性的降低。共价硅酸盐的添加会促进紧致性,但其往往会在皮肤上引起不期望的白色灰样外观。除了基本的成膜化合物外,最近的开发还包括例如掺入了其他添加剂如UV吸收剂、有色颜料和皮肤增亮剂的产品。

### 发明内容

[0006] 仍然需要用于产生皮肤紧致效果的改进的化妆品组合物,其具有低的视觉冲击和与皮肤更相容的较低pH。

[0007] 因此,该领域的主要技术挑战之一在于设计一种有效的皮肤紧致组合物,该组合物不会导致皮肤上出现白色外观并比现有技术具有较低的pH。

[0008] 本发明试图通过提供一种可耐受宽的pH范围、不会在皮肤上导致白色外观、同时仍保持良好的皮肤紧致行为的组合物来减轻已知的皮肤紧致组合物的缺点。

[0009] 本发明提供了如所附权利要求中所要求保护的组合物。

[0010] 相应地,本发明提供了一种化妆品组合物,其包含硅酸钠、热解法二氧化硅、至少一种成膜剂和pH调节剂,其中所述组合物的pH在约6.0至约11.2的范围内,其中所述组合物在施用于皮肤后提供皮肤紧致效果。本发明的组合物将形成膜并当在皮肤上形成时提供皮肤紧致效果。

[0011] 在一些实施方案中,组合物的pH在约6.0至约10的范围内,如在6.5至8.5的范围内。这具有显著的优点,即本发明的组合物的pH接近于中性并接近于其所施用于的皮肤的pH。这意味着所述组合物是皮肤友好的。

[0012] 在一些实施方案中,pH调节剂包含羧酸,如选自柠檬酸和乳酸的那些。

[0013] 本发明的组合物具有在施用于皮肤后提供皮肤紧致效果而基本上不在皮肤上产生白色或灰样外观的优点。这样的白色或灰样外观是与现有技术的皮肤紧致产品相关的不希望有的特征。

[0014] 因此,已惊奇地发现,包含热解法二氧化硅(也称火成二氧化硅)、碱性硅酸盐如硅酸钠、成膜剂(增塑剂)如聚氨酯-35和羧酸如柠檬酸的组合物提供了显著的皮肤紧致效果而没有与本领域已知的皮肤紧致产品相关的在皮肤上出现的白色外观。在本发明的一个实施方案中,羧酸如柠檬酸或乳酸的使用允许使用较低的量火成二氧化硅,并且还起到降低pH的作用。

[0015] 本发明提供了一种组合物,其提供有效的紧致产品而不会在皮肤上导致白色外观。其还可缓解眼睛下方区域的明显浮肿。

[0016] 相应地,本发明提供了如附随的权利要求书中所记载的化妆品提紧组合物。从属权利要求中记载了若干方面。

[0017] 本发明的组合物不包含多价硅酸盐。

[0018] 本发明的组合物具有有效地紧致松弛的皮肤、减少皱纹和眼睛下的浮肿的显著优点,从而获得与年轻人相关的较光滑的皮肤。

[0019] 本发明的发明人已发现,面部的不同区域对相同制剂的反应不同。一方面,这是由于面部的不同区域经历的皮肤保湿水平不同;另一方面,这是由于人类每天做的许多面部表情导致皮肤的不同区域的拉伸/收缩。

[0020] 因此,产生白化效应的一些原因可归因于一天中面部肌肉的运动,这导致干膜开裂/变得更明显。本发明提供了一种将产生显著的皮肤紧致效果的组合物,该效果也被证实是持久的。

[0021] 本发明人已发现,当施用于眼睛下方的区域时,本发明的组合物是特别有用的。它不仅显示出有效的抗皱活性,而且还减少面部皮肤的眼下区域的浮肿。本发明的组合物提供了直到目前为止尚未在任何现有技术中公开的效果的组合。除了技术效果外,该优点还在于,由于本发明与现有技术的组合物相比较高的灵活性,故将大大降低膜干燥的白化效应,尤其是对于眼下区域。

[0022] 眼下区域特别受关注,因为它是高度保湿的并且因为它通常被压缩而不是拉伸,故将改善膜的耐久性。膜的拉伸与白化的更高和更快发展有关。

[0023] 附图中提供了使用本发明的组合物的测试结果的实例。在存在/不存在爽肤水(粉底)的情况下使用本发明的混合物进行了临床测试。这是本发明相对于现有技术特别有利

的另一方面,因为大多数已知产品通常与其他化妆品产品不相容。然而,虽然确实会在皮肤紧致和减少浮肿方面失去一些功效,但本发明可用在粉底和爽肤水/遮瑕产品之上。

[0024] 所用的测试方案基于视觉评分量表,其中皱纹/浮肿的严重性为从1(轻度)到10(严重)。独立地评价右眼下和左眼下区域的浮肿和皱纹(在施用产品之前和之后)。

[0025] 临床评分者使用以下所示的10-分量表独立地评估每个眼下区域的视觉浮肿。

[0026]	无	轻度			中等			严重		
	0	1	2	3	4	5	6	7	8	9

[0027] 临床评分者使用以下所示的10-分量表独立地评估每个眼下区域的视觉皱纹。

[0028]	无	轻度			中等			严重		
	0	1	2	3	4	5	6	7	8	9

[0029] 当与粉底一起使用时,本发明显示出从6到4的降低,有效性效果在8小时的过程中减小。当单独使用该制剂时,观察到从6到1的降低,同样在数小时内效果变弱。研究的样本量为18个人。

[0030] 硅酸钠本身是成膜剂,但为了使制剂成为有效的化妆品产品,需要在制剂中引入若干类型的添加剂以使皮肤保持湿润和舒适并保持配方稳定。然而,这些添加剂会降低硅酸钠的皮肤紧致性的有效性。在现有技术中,已使用多价二氧化硅来恢复一定程度的皮肤紧致效果。令人惊奇的是,本发明人已发现向硅酸钠中添加相对少量的热解法二氧化硅(比率为8:1的硅酸钠:热解法二氧化硅)(硅酸钠:热解法二氧化硅的重量比范围为40:1至1:1)实现了皮肤紧致和特别是在眼下区域减少浮肿的显著效果。

[0031] 所述组合物还包含羧酸,如柠檬酸或乳酸。已发现柠檬酸可有效降低组合物的pH,由于碱性硅酸钠和热解法二氧化硅,故组合物的pH原本在约pH 11下。这导致制剂变得稠厚和发粘,并且具有看起来像白色颗粒的单独的相,这一技术问题通过在形成组合物时在添加柠檬酸之前先添加包括黄原胶、甘油、丁二醇和聚氨酯-35在内的添加剂得到解决。相应地,本发明还提供了一种形成上述组合物的方法,所附方法的步骤在附随的权利要求书中阐述,包括步骤:

[0032] (a) 以预定的量混合硅酸钠与热解法二氧化硅;

[0033] (b) 向混合物中添加聚氨酯-35;和

[0034] (c) 在步骤(b)之后,然后以预定的量添加柠檬酸。采用特定的成分组合和添加顺序,形成pH在6.5至9的范围内的均匀且稳定的组合物。通过向组合物中添加更多的柠檬酸来降低pH。

[0035] 定义

[0036] 在整个本说明书中,使用了以下术语并应理解为具有以下含义:

[0037] 硅酸钠-是具有化学式 $\text{Na}_{2x}\text{SiO}_{2+x}$ 或 $(\text{Na}_2\text{O})_x \cdot \text{SiO}_2$ 的化学化合物如偏硅酸钠 $\text{Na}_2\text{SiO}_3$ 、原硅酸钠 $\text{Na}_4\text{SiO}_4$ 和焦硅酸钠 $\text{Na}_6\text{Si}_2\text{O}_7$ 的统称。阴离子通常是聚合型的。这些化合物一般是无色透明固体或白色粉末,并可以各种量溶于水中。硅酸钠也是这样的化合物的混合物的技术名称和通称,主要是偏硅酸盐,也称水玻璃或液体玻璃。在工业中,各种等级的硅酸钠以其 $\text{SiO}_2:\text{Na}_2\text{O}$ 重量比(其可通过乘1.032而换算为摩尔比)为特征。该比率可在2:1至3.75:1之间变化。比率低于2.85:1的等级称为碱性的。本发明的组合物中使用的硅酸钠具

有3.22的重量比,该硅酸钠是碱性的。

[0038] 热解法/火成二氧化硅-;

[0039] CAS号112945-52-5,在火焰中产生,由无定形二氧化硅的微滴组成,这些微滴熔合成带分支的链状三维二次颗粒,所述二次颗粒随后团聚成三次颗粒。所得粉末具有极低的堆积密度和高的表面积。

### 附图说明

[0040] 现在结合附图描述本申请,在附图中:

[0041] 图1a针对i) 仅浆液和ii) 浆液&色素产品示出了中等组中受试者内变化的临床视觉评分(浮肿)结果;

[0042] 图1b针对i) 仅浆液和ii) 浆液&色素产品示出了严重组中受试者内变化的临床视觉评分(浮肿)结果;

[0043] 图2a针对i) 仅浆液和ii) 浆液&色素产品示出了中等组中受试者内变化的临床视觉评分(皱纹)结果;和

[0044] 图2b针对i) 仅浆液和ii) 浆液&色素产品示出了严重组中受试者内变化的临床视觉评分(皱纹)结果。

### 具体实施方式

[0045] 从历史上看,抗皱化妆品产品在很大程度上依赖于二氧化硅和多价硅酸盐成膜剂以产生其宣称的皮肤紧致效果来减少皱纹和浮肿。这些现有技术组合物通常具有约10-12的pH范围,因为二氧化硅本身是强碱性的,并且根据现有技术中的教导,较低的pH会导致在皮肤上形成较脆且较不柔软的膜,这又会导致开裂、白化和其他明显的视觉缺陷。然而,即使在较高的pH下,许多当前的市场产品仍然会导致施用了组合物的皮肤区域的白化效应。

[0046] 本发明提供了一种皮肤紧致组合物,其以基于固体水平计约1:5的热解法二氧化硅:硅酸钠固体重量比包含硅酸钠和热解法火成二氧化硅,因为硅酸钠的固体水平在34-42%、优选地35-40%、最优选36-39%、最优选38-39%之间的范围内。本发明的组合物的技术优点在于实现了增强的皮肤紧致效果,已发现其在长达8小时的时间段内抚平面部皱纹,同时减少浮肿。已发现热解法火成二氧化硅和硅酸钠的组合令人惊奇地有效。尽管组合的机理未知,但认为皮肤紧致效果的产生可归因于以下事实:与现有技术所公开的先前组合物不同,当前的组合物不是化学交联的而是物理交联的。这将产生更柔顺且柔软的膜,其允许皮肤下面的面部肌肉运动而不会导致膜开裂和白化。协同效应在下表1中示出的实施例中示出。在不存在热解法火成二氧化硅的情况下,未能取得有效的皮肤紧致效果,而即使少量的热解法火成二氧化硅也有助于显著提高皮肤紧致性。

[0047] 所有的量均为重量/重量%(成分的重量/组合物的总重量)。

原材料	原材料	CB8-5B1	CB8-5C1	CB8-5D1	CB8-5E1
商品名	INCI 名				
DI 水	DI 水	65.0	60.0	70.0	75.0
O 硅酸钠	硅酸钠, 水	6.0	12.0	10.0	8.0
Baycusan C 1004/1	聚氨酯 35, 水	12.0	12.0	8.0	5.0
甘油 99.7% usp	甘油	1.5	3.5	1.6	3.3
1,3-丁二醇	1,3- 丁 二 醇	3.5	3.5	1.5	3.1
Wacker HDK N20	二氧化硅	2.0	0.9	0.5	0.1
[0048] Keltrol CG-T	黄原胶	0.8	0.8	0.8	0.3
柠檬酸 (20% 水溶液)	柠檬酸, 水	9.0	6.5	7.0	5.0
苯氧基乙醇	苯氧基乙 醇	0.2	0.8	0.6	0.2
总计		100.0	100.0	100.0	100.0
	紧致感觉	显著	中等	中等	轻微
	皱纹抚平 效果	显著	中等	中等	轻微
	外观	保湿的天 然皮肤	保湿的天 然皮肤	保湿的天 然皮肤	保湿的天 然皮肤
	pH	7.2	7.47	7.66	8.37

[0049] 组合物的pH在6.0至11.2的范围内

[0050] 表1

[0051] 材料的范围如下所示,总计为100重量/重量%

原材料	百分数重量/重量%
去离子水	60-75
[0052] 硅酸钠 (38.6%水溶液)	6-12
火成二氧化硅	0.1-2
聚氨酯聚合物 (41%乳液)	5-12
黄原胶	0.3-0.8

[0053]	柠檬酸 (20%水溶液)	5-9
	1,3-丁二醇	1.5-3.5
	甘油	1.5-3.5
	1,2-己二醇和辛二醇	0-2
	苯氧基乙醇	0.0-2.0
	总计	100.00

[0054] 表2

[0055] 表1和2中的实施例使用手指在手背上施加2mg/cm的剂量来进行测试。在4\*4cm<sup>2</sup>区域中施加32mg样品,并在手平放的同时让其干燥3分钟,通过握拳进行拉伸测试,握拳将拉伸皮肤上已由本发明的组合物的施加所形成的膜。结果以视觉测试来观察,无需任何仪器测量。

[0056] 参见表1,可以看出,随着热解法二氧化硅的量的增加,组合物的紧致感和皱纹抚平效果提高。

[0057] 从上表1可见,提供包含硅酸钠、热解法二氧化硅、柠檬酸和聚氨酯的组合物在所得组合物的功效中起着至关重要的作用。如果不使用热解法火成二氧化硅和柠檬酸,则发现紧致效果会降低。由本发明的包含热解法二氧化硅、硅酸钠、柠檬酸和聚氨酯的组合物提供的皮肤紧致效果具有商业重要性和价值,因为在施用于皮肤时,其在皮肤上的可见性远低于替代的市场产品;这很可能是由于聚氨酯润湿干颗粒如二氧化硅的表面而防止了产品完全干燥后的白垩色外观,并且另外,聚氨酯还提供对皮肤的强粘附性和改善的柔韧性而最大限度地减少由于皮肤运动所致的开裂。当在皮肤上使用现有技术组合物时已知会发生的白化效应的缺乏或减弱是本发明的显著优点。

[0058] 除了本发明实现的皮肤紧致益处外,该新型组合物还具有减少眼睛下浮肿的额外技术效果,眼睛下浮肿是衰老和皱纹形成的常见附带效应。这种效果的组合在任何现有技术中均未见公开,并且据我们所知,没有哪种单一制剂可通过单一的局部处理来同时减轻皱纹和浮肿。

[0059] 另外,皮肤紧致产品对其他化妆品组合物的耐受性向来不高,并且实际上,作为这方面的证据,不鼓励将其他化妆品产品如爽肤水和粉底与现有技术中公开的组合物结合使用。然而,在当前的组合物中,化妆品如爽肤水、粉底的使用尽管降低了皮肤紧致和减少浮肿的效果,但并不阻止本发明实现其所描述的技术目的。

[0060] 在本发明的皮肤紧致组合物之前,大多数现有技术皮肤紧致产品的pH范围为10-12,这接近于分类为对皮肤“腐蚀性”的pH。通常,不推荐较低的pH值,因为在酸性介质中使用硅酸钠会导致制剂的较高粘度和胶凝。在本发明中,公开了一个实施方案,其中在组合物中引入了柠檬酸以及自乳化聚合物如聚氨酯-35(可商购获得,如以商品名BAYCUSAN C1004,其为来自Covestro AG(前Bayer Material Science AG)(勒沃库森)的市售产品)。该聚氨酯产品占本发明的组合物的2-20重量%,如在组合物的5-12重量%的范围内。

[0061] 在另一个方面,本发明还涉及一种制备皮肤紧致组合物的方法,其中所述方法包括在增稠剂和自乳化聚氨酯-35的存在下添加柠檬酸以维持配方的稳定性的步骤。柠檬酸将溶液的pH降低到6-10的范围,如在6.5-8.5的范围内。相对于现有技术的这种改进导致与

已知的美容护肤产品相比与皮肤更相容且侵袭性更低的较低碱性组合物。

[0062] 在一些实施方案中,二氧化硅以组合物的0.1-5重量/重量%、固体内容物的0.6%-32%的范围内的量存在,如组合物的0.2-2重量/重量%和固体内容物的1.3-13%。

[0063] 对于柠檬酸,在一些实施方案中,20%柠檬酸溶液以组合物的1-10%的范围内的量存在并以固体内容物的1.3-13%的范围内的量存在,如以5-9%的范围存在并以固体内容物的6.5-11.7%的范围存在。

[0064] 在一些实施方案中,硅酸钠溶液包含悬浮在34-42%水溶液中的 $\text{Na}_2\text{O}$ 和 $\text{SiO}_2$ ,其中 $\text{SiO}_2:\text{Na}_2\text{O}$ 重量比为3.22。例如,硅酸钠溶液占组合物的总重量的4-20%,如6-12%。

[0065] 除了热解法火成二氧化硅和硅酸钠外,也可在本发明的制剂中引入其他添加剂以形成有效的皮肤紧致产品。

[0066] 组合物还可含有0-2%的黄原胶,如Keltrol CG-T,以提供透明的组合物。黄原胶允许通过显著增加组合物的粘度、防止其从施加其的皮肤区域流失来稳定所得的膜。

[0067] 在一些实施方案中,组合物还包含0.5-6%、0.5-20%的1,3-丁二醇,类似于黄原胶,其充当抗冻剂以稳定膜的形成。

[0068] 组合物还可包含0.5-6%的甘油,其在皮肤护理中使用以促进皮肤的顺滑性和水分含量。该水合还可通过使皮肤更柔顺而有助于长期降低皱纹可见性。

[0069] 防腐剂和稳定剂占制剂的总重量的0-2%并用作防腐剂和稳定剂。制剂中可使用防腐剂如苯氧基乙醇、氯苯甘醚、对羟基苯甲酸酯。

[0070] 另外的添加剂可包括成膜剂,如高分子量聚氨酯。优选的聚氨酯为聚氨酯-35如以商品名BAYCUSAN C1004/1商购获得,其为来自Covestro AG(前Bayer Material Science AG)(勒沃库森)的市售产品。聚氨酯成膜剂占制剂的2-20重量%,如在5-12%的范围内。

[0071] 水基PU通常对于干颜料/颗粒表现出良好的亲和力,因此水基PU有助于润湿/分散干颗粒而最大限度地减少哑光/干颗粒外观。然而,如果使用许多PU,则它会促进光泽外观,这是不期望的。对于本申请,必须控制所用PU的比率,因为过多PU可能导致对硅酸钠聚合物结构的干扰,从而削弱皮肤紧致效果。当然,应理解,其他聚合物如聚酯等也可润湿干颜料或颗粒。然而,对于本发明的组合物,由于其在皮肤上的强粘附性和弹性形状恢复能力,故PU可以是增塑剂,这也是有助于皮肤紧致效果的持久性的有益性质。

[0072] 剩余的重量百分数由去离子水(DI)构成。

[0073] 本领域技术人员应理解,上述添加剂中的一些对于实现所需技术的皮肤紧致效果不是必需的。促进皮肤健康和/或表现出抗微生物活性的化合物对于皮肤紧致不是必需的,但确实与皮肤紧致化合物协作而改善皮肤的整体外观和健康。

[0074] 然后应根据常规方式将所得组合物以规则且均匀的层施用于皮肤。在一些实施方案中,可将组合物施用于无过量的油的干净、干燥皮肤层。应以单层施加并让其干燥。

[0075] 实施例

[0076] 本发明的皮肤紧致组合物的制备方法

[0077] 实施例1

[0078] 现在结合下表3描述本发明的制备方法。

[0079] 最初,以下表3中所示的量和比率合并去离子(DI)水、硅酸钠和火成二氧化硅并以中等速度如约800至约1500rpm混合各成分5-10分钟直至获得均一/均匀的混合物。使用顶

置式混合器和螺旋桨叶片,在此特定的实施例中,使用具有螺旋桨叶片的IKA® RW 20来搅拌直至均匀。当然,这仅仅是可使用的一种方法和设备。

[0080] 在该混合阶段之后,加入聚氨酯,以中等速度如约800至约1500rpm连续混合组合物直至均匀。

[0081] 同时,在单独的容器中混合经预湿的黄原胶、甘油和1,3-丁二醇,然后添加到主组合物中。这导致组合物粘度的显著增加。以较高的速率混合组合物直至不再发生粘度的增加。

[0082] 最后,根据粘度变化在高速如约1000rpm至约2000rpm下加入在水中的20%柠檬酸以及防腐剂如苯氧基乙醇以确保组合物被均匀地乳化。

[0083] 然后在高速如约1500至约3000rpm的速度下混合最终组合物10-20分钟以确保得到均匀的乳液。该乳液为水包油乳液,其中内部油相为在外部水相中的聚氨酯。

[0084] 发现当向具有水、火成二氧化硅、硅酸钠和聚氨酯-35 (Baycusan C1004/1)的体系中添加柠檬酸时,体系将胶凝并出现不溶的沙粒尺寸小颗粒。这些颗粒不能在后续步骤中分解。这不仅表明体系不均匀/不稳定,而且在施用过程中很难将沙粒样颗粒弄碎,故产品会失去一些视觉吸引力。对于配方87B3P,在柠檬酸之后才添加Baycusan C1004/1并观察到类似的现象。这证明沙粒样颗粒不是由于Baycusan C1004(聚氨酯)引起的。因此,本发明人认为这是由于碱性硅酸钠与柠檬酸之间的反应。

[0085] 以下是实施例1中使用的配方,其中阐述了方法步骤以使成品体系的最终组合物具有均匀/稳定的相。

添加顺序	原材料商品名	原材料INCI名	97B2-suC
A相: 称取 A1、A2 和 A3 并依次加到容器中, 同时混合			
A1	DI 水	DI 水	67.7
A2	O 硅酸钠	硅酸钠	8
A3	(热解法二氧化硅 - 火成二氧化硅) Wacker HDK N20	火成二氧化硅	1.2
在中等速度如 800 至 1500rpm 下混合 5-10 分钟, 直至均匀			
B相: 称取 B 并加到体系中, 同时混合,			
B1	Baycusan C 1004	聚氨酯 35	10
在中等速度如 800 至 1500rpm 下混合 5-10 分钟, 直至均匀			
称取 C 并在单独的容器中预混合以让液体预润湿黄原胶			
将 C 混合物添加到体系中, 同时混合, 系统粘度将增加, 相应地增加速度			
C1	Keltrol CG-T	黄原胶	0.5
C2	甘油 99.7% usp	甘油	2.4
C3	1,3-丁二醇	1,3-丁二醇	2.3
取决于粘度的增加, 于 (中等速度) 如约 1000 至约 1500rpm 下混合 10 分钟或直至黄原胶被完全活化, 并且粘度不再进一步急剧增加。			
在高速如约 1500 至约 2000rpm 下添加 D。			
D1	苯氧基乙醇	苯氧基乙醇	0.9
D2	柠檬酸 (20% 水溶液)	柠檬酸, 水	7
在高速如约 1500 至约 3000rpm 下混合 10-20 分钟; 系统看起来像是均匀的浆液。			
总计			100

[0086] 表3

[0087] 以下描述阐述了进行的其中发生相分离的其他实验, 这些实验包括在此以供比较和参考。

[0088] 从配方87B2P发现, 当向具有水、火成二氧化硅、硅酸钠和Baycusan C1004的体系中添加柠檬酸时, 系统将胶凝并出现不相容的沙粒尺寸颗粒, 并且该颗粒不能在后续步骤中分解。这不仅表明体系不均匀/不稳定, 而且在施用过程中很难将沙粒样颗粒弄碎, 故产

品不具有吸引人的外观。对于配方87B3P,在添加柠檬酸之前组合物中不包含Baycusan C1004/1,并观察到类似的相分离现象。这证明沙粒样颗粒不是由于Baycusan C1004/聚氨酯引起的。因此,本发明人认为这是由于碱性硅酸钠与柠檬酸之间的反应。

[0091] 实施例2

[0092] 现在结合下表4描述本发明的制备方法。如上面实施例1中所阐述,遵循如实施例1中所阐述的方法步骤。

[0093] 最初,以下表4中所示的量和比率合并去离子(DI)水、硅酸钠和火成二氧化硅并以中等速度如约800至约1500rpm混合各成分5-10分钟直至获得均一/均匀的混合物。

[0094] 在该混合阶段之后,加入聚氨酯-35,以中等速度如约800至约1500rpm连续混合组合物直至均匀。

[0095] 方法:按表的顶部到底部列出的顺序添加原材料。在每次添加之间将组合物混合约10分钟。

原材料	原材料	87B2 p	观察到的	87B 3p	观察到 的
商品名	INCI 名				
[0096] DI 水	DI 水	66.9		67	
(热解法二氧化硅 - 火成二氧化硅) Wacker HDK N20	火成二氧化硅	1.2		1.2	

	O 硅酸钠	硅酸钠	8.0		8.0	
	Baycusan C 1004	Baycusan C 1004	10.7			
	柠檬酸 (20%水溶液)	柠檬酸 (20%水溶液)	7	PH~8 胶凝, 出现沙粒样颗粒 (相分离)	7	PH~8 胶凝, 出现沙粒样颗粒 (相分离, 该批次在这里停止)
	Baycusan C 1004	聚氨酯 35			10.7	
[0097]	Keltrol CG-T	黄原胶	0.5	粘度增加		
	苯氧基乙醇	苯氧基乙醇	1	粘度增加	1	
	甘油 99.7% usp	甘油	2.4	粘度降低	2.4	
	1,3-丁二醇	1,3-丁二醇	2.4	粘度降低	2.4	
	Keltrol CG-T	黄原胶		粘度增加	0.4	
	柠檬酸 (20%水溶液)	柠檬酸 (20%水溶液)				
	总计		100	PH~8 胶凝, 具有沙粒样颗粒	100	

[0098] 表4

[0099] pH研究

[0100] 为了研究pH如何影响本发明的功效,将所描述的组合物两种变型中和至两个不同的pH水平——8.6和6,如下表5中所示。两种配方都保持了期望的粘度、稠度和紧致效果。体内试验表明,pH为6的制剂更易于变干和开裂,这导致施用了该组合物的皮肤区域更明显的白化。由于柠檬酸是白色粉末,故推定过多的酸性添加剂会导致组合物更快地变干,从而导致上述白化效应。因此,使用具有8.6的pH的制剂进行了进一步的测试,但具有较低pH的组合物有着研究潜在益处的潜力。

[0101] 应理解,最佳pH在6至8.6之间的pH下,如在6.5-8.5下。

原材料	原材料	93B	94A
商品名	INCI 名		
DI 水	DI 水	67.0	66.1
(热解法二氧化硅 - 火成二氧化硅) Wacker HDK N20	火成二氧化硅	1.2	1.2
O 硅酸钠	硅酸钠	8.0	7.9
[0102] Keltrol CG-T	黄原胶	0.4	0.4
苯氧基乙醇	苯氧基乙醇	1.0	1.0
甘油 99.7% usp	甘油	2.4	2.3
1,3-丁二醇	1,3-丁二醇	2.4	2.3
Baycusan C 1004/1	聚氨酯 35	10.7	10.6
柠檬酸 (20%水溶液)	柠檬酸, 水	7.0	8.2
		100.0	100.0
	pH	8.6	6

[0103] 表5

[0104] 实施例3和4

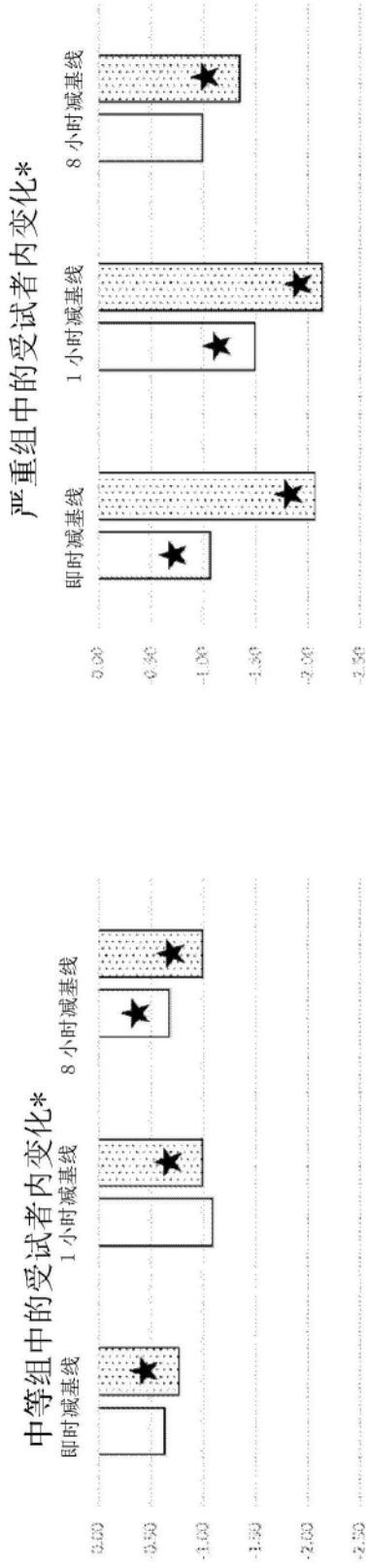
[0105] 在一些实施方案中,火成二氧化硅为Wacker HDK N20;聚氨酯聚合物为Baycusan C 1004;黄原胶为Keltrol CG-T,并且1,2-己二醇和辛二醇以Symdiol 68提供。还可包括其他酸性添加剂。

原材料	原材料	93B	96A
商品名	INCI 名		
DI 水	DI 水	67.0	70.1
(热解法二氧化硅 - 火成二氧化硅) Wacker HDK N20	火成二氧化硅	1.2	1.2
[0106] O 硅酸钠	硅酸钠	8.0	8.4
Keltrol CG-T	黄原胶	0.4	0.4
苯氧基乙醇	苯氧基乙醇	1.0	1.0
甘油 99.7% usp	甘油	2.4	2.5
1,3-丁二醇	1,3-丁二醇	2.4	2.5
Baycusan C 1004/1	聚氨酯 35	10.7	11.2

[0107]	柠檬酸 (20% 水溶液)	柠檬酸, 水	7.0	
	乳酸	乳酸		2.7
	总计		100	100

[0108] 通过向体系96A中直接添加而不在水中稀释来测试液体酸乳酸。与样品93B相比, 样品96A更粘, 仍很好地紧致, 该组合物非常稳定, 没有水分离。对于一些批次, 样品93B显示出一定的水分离, 本发明人认为这可能是由于在最后一步中随柠檬酸溶液一道添加的水并且没有足够的剪切 (sheer) 来将水带入到体系中。当在最后一步不用水的情况下使用乳酸时, 所得到的稳定体系确认了在一些情况下关于水分离的原因的此推定。因此, 在制备包含柠檬酸的标准配方的最后一步中提供了更长的剪切时间/混合时间。

# 临床视觉评分 (浮肿)



★ P 值 < 0.05 时显著

# 临床视觉评分 (皱纹)

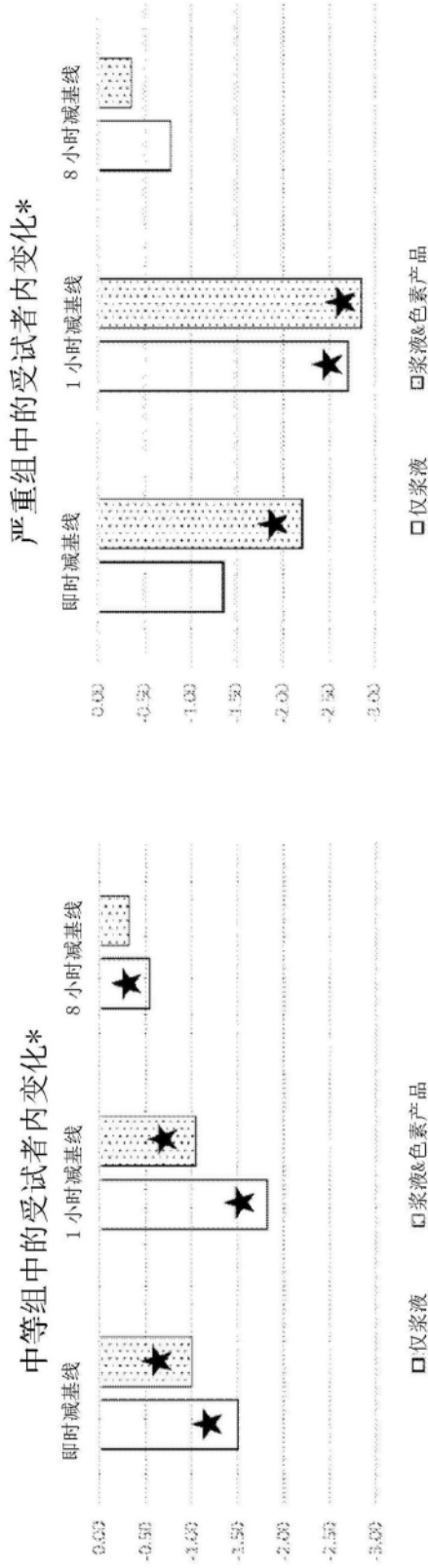


图 2 (a)

图 2 (b)

★ P 值 < 0.05 时显著