

發明專利說明書

200301136

(填寫本書件時請先行詳閱申請書後之申請須知，作※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 91135838 ※IPC 分類： A61K7/48

※ 申請日期： 91.12.11

壹、發明名稱

(中文) 維生素於矽油包水(W/O)乳化液中之安定化

(英文) STABILIZATION OF VITAMINS IN WATER-IN-SILICONE OIL
(W/O) EMULSIONS

貳、發明人 (共 2 人)

發明人 1 (如發明人超過一人，請填說明書發明人續頁)

姓名：(中文) 巴特雷 狄恩 馬可森

(英文) BARTLEY DEAN MAXON

住居所地址：(中文) 美國密西根州聖路易斯市吉町廣場路 226 號

(英文) 226 GIDDINGS PLACE, ST. LOUIS, MICHIGAN
48880, U.S.A.

國籍：(中文) 美國

(英文) U.S.A.

參、申請人 (共 1 人)

申請人 1 (如申請人超過一人，請填說明書申請人續頁)

姓名或名稱：(中文) 美商道康寧公司

(英文) DOW CORNING CORPORATION

住居所或營業所地址：(中文) 美國密西根州密蘭市西薩爾茲堡路 2200 號

(英文) 2200 WEST SALZBURG ROAD, MIDLAND,
MICHIGAN 48686-0994, U.S.A.

國籍：(中文) 美國

(英文) U.S.A.

代表人：(中文) 羅傑 哥布洛吉

(英文) ROGER GOBROGGE

發明人 2

姓名：(中文) 麥克 史帝芬 史塔吉

(英文) MICHAEL STEPHEN STARCH

住居所地址：(中文) 美國密西根州蜜德藍登市凱得里吉路 2769 號

(英文) 2769 CEDARIDGE DRIVE, MIDLAND,

MICHIGAN 48642-8896, U.S.A.

國籍：(中文) 美國

(英文) U.S.A.

捌、聲明事項

☐ 本案係符合專利法第二十條第一項☐第一款但書或☐第二款但書規定之期間，其日期為：_____

☒ 本案已向下列國家（地區）申請專利，申請日期及案號資料如下：

【格式請依：申請國家（地區）；申請日期；申請案號 順序註記】

1. 美國 2001 年 12 月 19 日 10/024,983
2. _____
3. _____

☒ 主張專利法第二十四條第一項優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；日期；案號 順序註記】

1. 美國 2001 年 12 月 19 日 10/024,983
2. _____
3. _____
4. _____
5. _____
6. _____
7. _____
8. _____
9. _____
10. _____

☐ 主張專利法第二十五條之一第一項優先權：

【格式請依：申請日；申請案號 順序註記】

1. _____
2. _____
3. _____

☐ 主張專利法第二十六條微生物：

☐ 國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

1. _____
2. _____
3. _____

☐ 國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

1. _____
2. _____
3. _____

☐ 熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

(1)

玖、發明說明

(發明說明應敘明：發明所屬之技術領域、先前技術、內容、實施方式及圖式簡單說明)

技術領域

本發明係關於組合物及將維生素(例如，維生素E)加入矽油包水乳化液(W/O)中並使其安定化之方法。更詳細地說，本發明係關於使用通常為線型矽酮聚醚作為該矽酮乳化劑，合併有機乳化劑使維生素於該W/O乳化液內安定化之用途。

先前技藝

已知維生素A及維生素C可加入矽油包水(W/O)組合物內供皮膚保養應用，且其在市場上大受歡迎。

然而，維生素E之活性型式(亦即，生育酚)在此種W/O系統內通常顯示降解現象。因此，在個人保養領域內有需要安定化維生素，特別為含安定化維生素E之矽油包水乳化液(W/O)。

雖然國際專利公告WO 00/72817 A1(2000年，12月7日)描述某些含維生素之W/O乳化液，但是用以製備W/O乳化液之該矽酮彈性體組份是一種可藉由使用交聯劑(其係為含矽原子之不飽和化合物，亦即，乙烯基末端性矽酮)得到之組合物。

然而，根據本發明，已意外發現可藉由使用交聯劑(其係為不含矽原子之不飽和化合物，亦即， α,ω -二烯交聯性矽酮彈性體)得到之矽酮彈性組合物取代上述矽酮彈性體組合物以製成新穎且改良之W/O乳化液。

發明內容

本發明係關於組合物，例如，具有非連續水性相分散在連續油相內之油包水(W/O)乳化液。該W/O乳化液之連續油相包含線型矽酮聚醚， α,ω -二烯交聯性矽酮彈性體，及非離子性有機乳化劑。該W/O乳化液不含使用含矽原子之不飽和化合物製成之矽酮彈性體。

該W/O乳化液之非連續水性相或該W/O乳化液之連續油相較佳分別含水(溶性活性成份或油溶性活性成份)。

該W/O乳化液之連續油相可包含一或多種溶劑，例如，八甲基環四矽氧烷，十甲基環五矽氧烷，十二甲基環六矽氧烷，六甲基二矽氧烷，八甲基三矽氧烷，十甲基二矽氧烷，八甲基三矽氧烷，十甲基四矽氧烷，十二甲基五矽氧烷，十四甲基六矽氧烷，十六甲基七矽氧烷。

自詳細說明文之考慮事項可瞭解本發明這些及其它特徵。

實施方法

線型(亦即，非交聯)矽酮聚醚

使用以製備根據本發明之組合物之該線型(亦即，非交聯)矽酮聚醚通常可分散在該油相中。其可具有耙型結構，其中該聚氧乙烯或聚氧乙烯-聚氧丙烯共聚單位可接枝在該矽氧烷主鏈上，或該SPE可具有ABA嵌段共聚結構，其中A表示該ABA結構之聚醚部份，而該B表示該矽氧烷部份。

文中適用之非交聯矽酮聚醚具該通式 $MD_{0.1,000}D'_{1-100}M$

，最佳為該通式 $MD_{0.500}D'_{1.50}M$ ，其中 M 表示單官能基單位 $R_3SiO_{1/2}$ ， D 表示二官能基單位 $R_2SiO_{2/2}$ ，而 D' 表示二官能基單位 $RR'SiO_{2/2}$ 。在這些通式中， R 是含 1-6 個碳原子之烷基，或芳基，且 R' 是含氧伸烷基部份。該 R' 基可以只含環氧乙烷 (EO) 單位；環氧乙烷 (EO) 及環氧丙烷 (PO) 單位之組合；或環氧乙烷 (EO) 單位，環氧丙烷 (PO) 單位，及環氧丁烷 (BO) 單位之組合。 R' 基較佳包括呈 $EO_{3-100}PO_{0-100}$ 大約比率 (最佳呈 $EO_{3-30}PO_{1-30}$ 之比率) 之氧伸烷基單位。

R' 部份通常包括可以連接該 R' 之氧伸烷基部份與該矽氧烷主鏈之二價基團，例如， $-C_mH_{2m}-$ ，其中 m 為 2-8。此種部份亦含該 R' 之氧伸烷基部份之端基，例如，氫，羥基，或烷基，芳基，烷氧基，或醋酸基。

文中使用之非交聯矽酮聚醚亦可以是一種具有該通式 $M'D_{10-1,000}D'_{0-100}M'$ (最佳為該通式 $M'D_{10-500}D'_{0-50}M'$) 之種類，其中 M' 表示單官能基單位 $R_2R'SiO_{1/2}$ ， D 表示二官能基單位 $R_SiO_{2/2}$ ，且 D' 表示二官能基單位 $RR'SiO_{2/2}$ 。在這些通式中， R 可以是含 1-6 個碳原子之烷基，或芳基，而且 R' 表示含氧伸烷基部份。如前述， R' 基通常只含環氧乙烷 (EO) 單位或環氧乙烷 (EO) 及環氧丙烷 (PO) 單位之組合。此種 R' 基團包括呈 $EO_{3-100}PO_{0-100}$ (最佳 $EO_{3-30}PO_{1-30}$) 比之這些氧伸烷基單位。

亦如上述， R' 部份通常包括用以連接 R' 之氧伸烷基部份與該矽氧烷主鏈之二價基團 $-C_mH_{2m}-$ ，其中 m 為 2-8。此

外，該 R' 部份包括 R' 氧伸烷基部份之端基，例如，氫，羥基，烷基，芳基，烷氧基，或醋酸基。

此外，文中使用之非交聯矽酮聚醚可具有該通式 $MD_{0-1,000}D'_{0-100}D''_{1-100}M$ ，其中 D'' 表示二官能基單位 $RR''SiO_{2/2}$ ，且 R'' 為含 1-40 個碳原子之烷基。M，D，D'，及 R 如同上文定義。

表 1 表示與這些通式相符之部份代表性線型(亦即，非交聯)矽酮聚醚，其可以使用以製備根據本發明之乳化液。

表 1

線型矽酮聚醚	線型(亦即，非交聯)矽酮聚醚之公稱結構
A	$MD_{8.6}D'_{3.6}M$ 其中 R 為 $-CH_3$ 且 R' 為 $-(CH_2)_3(EO)_{12}OH$
B	$MD_{108}D'_{10}M$ 其中 R 為 $-CH_3$ 且 R' 為 $-(CH_2)_3(EO)_{10}(PO)_4OH$
C	$M'D'_{75}M'$ 其中 R 為 $-CH_3$ 且 R' 為 $-(CH_2)_3(EO)_{18}(PO)_{18}OAc$
D	$M'D'_{50}M'$ 其中 R 為 $-CH_3$ 且 R' 為 $-(CH_2)_3(EO)_{18}(PO)_{18}OH$
E	$M'D'_{13}M'$ 其中 R 為 $-CH_3$ 且 R' 為 $-(CH_2)_3(EO)_{12}OH$
F	$MD_{22}D'_2M$ 其中 R 為 $-CH_3$ 且 R' 為 $-(CH_2)_3(EO)_{12}(PO)_{12}OH$
G	$MD_{396}D'_4M$ 其中 R 為 $-CH_3$ 且 R' 為 $-(CH_2)_3(EO)_{18}(PO)_{18}OH$

揮發性矽酮，亦即該溶劑

文中使用之溶劑為揮發性矽酮，通常為低分子量矽酮

(5)

油，且最佳為該通式 $(R'''_2SiO)_d$ 環狀烷基矽氧烷或該通式 $R'''_3SiO(R'''_2SiO)_eSiR'''_3$ 線型烷基矽氧烷，其中 R''' 為含 1-6 個碳原子之烷基， d 為 3-6，且 e 為 0-5。然而，最佳為該通式 $\{(CH_3)_2SiO\}_d$ 揮發性環狀甲基矽氧烷及該通式 $(CH_3)_3SiO\{(CH_3)_2SiO\}_eSi(CH_3)_3$ ，且其中 d 為 3-6 而 e 為 0-5。該揮發性甲基矽氧烷之沸點較佳小於 $250^\circ C$ ，黏度為 0.65-5.0 厘斯 (毫米²/秒)。

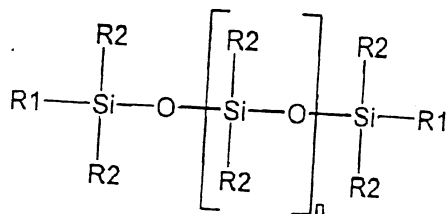
線型揮發性甲基矽氧烷之部份實例為通式 $Me_3SiOSiMe_3$ 六甲基二矽氧烷 (MM)，其沸點為 $100^\circ C$ ，黏度為 0.65 毫米²/秒；通式 $Me_3SiOMe_2SiOSiMe_3$ 八甲基三矽氧烷 (MDM)，其沸點為 $152^\circ C$ ，黏度為 1.04 毫米²/秒；通式為 $Me_3SiO(Me_2SiO)_2SiMe_3$ 十甲基四矽氧烷 (MD_2M)，其沸點為 $194^\circ C$ ，黏度為 1.53 毫米²/秒；通式 $Me_3SiO(Me_2SiO)_3SiMe_3$ 十二甲基五矽氧烷 (MD_3M)，其沸點為 $229^\circ C$ ，黏度為 2.06 毫米²/秒，及通式 $Me_3SiO(Me_2SiO)_4SiMe_3$ 十四甲基六矽氧烷 (MD_4M)，其沸點為 $245^\circ C$ ，黏度為 2.63 毫米²/秒，及通式 $Me_3SiO(Me_2SiO)_5SiMe_3$ 十六甲基七矽氧烷 (MD_5M)，其沸點為 $270^\circ C$ ，黏度為 3.24 毫米²/秒。在這些及以下通式中之 Me 表示該甲基 CH_3 。

環狀揮發性甲基矽氧烷之部份實例為通式 $(Me_2SiO)_3$ 六甲基環三矽氧烷 (D_3)，其於室溫下為固體，且沸點為 $134^\circ C$ ；通式 $(Me_2SiO)_4$ 八甲基環四矽氧烷 (D_4)，其沸點為 $176^\circ C$ ，黏度為 2.3 毫米²/秒；通式 $(Me_2SiO)_5$ 十甲基環五矽氧烷 (D_5)

，其沸點為 210°C ，黏度為 3.87 毫米²/秒；及通式 $(\text{Me}_2\text{SiO})_6$ 十二甲基環六矽氧烷 (D_6)，其沸點為 245°C ，黏度為 6.62 毫米²/秒。

矽酮樹膠

該矽酮樹膠最佳為高分子量矽烷醇官能性聚合物，但是亦包括聚二甲基矽氧烷樹膠。此種樹膠為本技藝所知，且很容易購自賣方，例如，The Dow Corning Corporation, Midland, Michigan。此種材質之結構通常如下式：



其中 n 為 $5,000$ 至 $50,000$ 整數，較佳為 $10,000$ - $50,000$ 。R1 表示 $-\text{OH}$ ；具有 1 - 6 個碳原子之烷基，例如，甲基，乙基，或丙基；芳基，例如，苯基或聯苯基；烷芳基，例如，甲苯基或二甲苯基；或芳烷基，例如，苄基，苯基乙基，或 2 -苯基丙基。R2 表示具有 1 - 6 個碳原子之烷基，例如，甲基，乙基，或丙基；芳基，例如，苯基或聯苯基；烷芳基，例如，甲苯基或二甲苯基；或芳烷基，例如，苄基，苯基乙基，或 2 -苯基丙基。亦可使用其中 R1 為烯基 (例如，乙烯基) 之矽酮樹膠。然而，最佳為其中 R1 為 $-\text{OH}$ 而 R2 為甲基之矽酮樹膠；及其中 R1 及 R2 皆為甲基之矽酮樹膠。

α, ω -二烯交聯矽酮彈性體

如文中使用，該名辭 α, ω -二烯交聯矽酮彈性體意指其結構內不含氧伸烷基單位之 α, ω -二烯交聯矽酮彈性體。其通常在本技藝中被稱為非乳化性矽酮彈性體，其意指不含聚氧伸烷基。另一方面，根據本發明適用之該 α, ω -二烯交聯矽酮彈性體為美國專利第5,654,362號(1997年8月5日)所述之組合物。

如該美國專利第5,654,362號所詳述，該 α, ω -二烯交聯矽酮彈性體之製法為使(A)該通式 $R_3SiO(R'_2SiO)_a(R''HSiO)_bSiR_3$ 含 $\equiv Si-H$ 之聚矽氧烷或視需要選用之通式 $HR_2SiO(R'_2SiO)_cSiR_2H$ 或通式 $HR_2SiO(R'_2SiO)_a(R''HSiO)_bSiR_2H$ 含 $\equiv Si-H$ 之聚矽氧烷(其中R, R', R''為具1-6個碳原子之烷基，a為0-250，b為1-250，c為0-250)與(B)通式 $CH_2=CH(CH_2)_xCH=CH_2$ (其中x為1-20) ω -二烯進行反應。該反應係於鉑觸媒及(C)低分子量矽酮油或其它溶劑存在下進行。與過去使用以製備矽酮橡膠粉末比較，該反應系統具非水性。

矽酮橡膠粉末

如文中使用，該名辭矽酮橡膠粉末意指通常根據美國專利第4,742,142號(1988年5月3日)所述之方法製成之組合物。

矽酮橡膠粉末(有時候稱為E-粉末)是具平均顆粒大小分佈約0.1-200微米之硫化矽酮橡膠，亦即，交聯聚二甲基矽氧烷(PDMS)。使用水性乳化方法以製備該矽酮橡膠

粉末，因為此種方法可產生球形之該顆粒，並得到該所要顆粒大小分佈。本質上，該乳化法由以下步驟組成：在水中使用一或多種表面活化劑乳化可固化，液態矽酮彈性體組合物，繼而進行固化步驟，最後移除水。該乳化法之特性為可以產生球形之該顆粒及在某範圍內可以相當良好地控制顆粒大小分佈。

通常採用兩種交聯矽氧烷聚合物之固化之反應，其中一種為於鉑觸媒存在下添加氫化矽($\equiv\text{SiH}$)至乙烯基官能性矽氧烷內，亦即氫甲矽烷化反應，而另一種方法為使用反應性矽使矽烷醇官能性矽氧烷進行縮合反應。根據該交聯步驟使用那一種方法(縮合反應或氫甲矽烷化反應)，用以製造矽酮橡膠粉末之聚合物為OH或乙烯基官能性聚合物。這些聚合物通常具適當低分子量(MW)，因為其同時具備的低黏度可以使其容易經由習用方法乳化。就製備矽酮橡膠粉末而言，較佳為黏度低於約1000 cP(厘泊)之聚合物。

交聯劑實際上可以是可溶於該聚合物內之任何多官能性反應性矽氧烷或矽烷。較佳交聯劑為氫化矽($\equiv\text{SiH}$)官能性矽氧烷，因為其具高反應性及不會產生副產物。這些矽氧烷可以是線型聚甲基氫矽氧烷，或聚二甲基矽氧烷與聚甲基氫矽氧烷之共聚物。該氫甲矽烷化反應(添加 $\equiv\text{SiH}$ 至乙烯基官能性矽氧烷內)之優點為不會形成副產物。反之，該縮合反應($\equiv\text{SiH}$ 與 $\equiv\text{SiOH}$ 之反應)會釋放大量 H_2 。

可使用標準乳化高剪切設備(例如，均質器或膠體磨機)

(9)

進行該乳化程序。所使用表面活化劑可以具離子性或非離子性，或兩者之組合，但是較佳為非離子表面活化劑。較佳非離子表面活化劑為乙氧化烷酯。表面活化劑之含量佔該矽酮聚合物重量之約0.5-5%。應該瞭解一旦移除水時，該表面活化劑仍然留在該矽酮橡膠粉末內。

必需已形成該顆粒後，才進行矽酮橡膠粉末內之交聯作用。然而，一旦合併這三種基本成份(亦即，(i)該官能性聚合物，(ii)該交聯劑，及(iii)該觸媒)時，即可進行交聯反應。因此，必需使用某些方法以確保該重要的交聯反應開始之前，形成顆粒。可以使用觸媒抑制劑或乳化後添加該觸媒以完成上述步驟。在某些情況下，必需使該乳化液經加熱以增加該交聯反應之速率。一旦完成交聯反應時，可藉由移除水以採集該顆粒。可藉由使用例如，真空蒸餾法或噴霧乾燥法完成該水移除步驟。在真空蒸餾法中，必需於真空下使用混合機，提供熱及攪拌。然而較佳方法為噴霧乾燥法，因為其具高效率，且可以連續操作。

部份交聯矽酮聚醚

使用在本申請案之各該實例中之以二級矽為主之乳化劑為如通常在美國專利第4,853,474號(1989年8月1日)及第5,136,068號(1992年，8月4日，所述之矽酮組合物，這兩種專利其各教示製造此種部份交聯組合物之方法。這些組合物亦很容易以商業基礎購自賣方，例如，the Dow Corning Corporation, Midland, Michigan。

有機乳化劑(群)

如文中使用，該各辭有機乳化劑有意排除含矽原子之乳化劑。另一方面，該有機乳化劑為非離子表面活性劑。一些適合的非離子表面活性劑種類為羧基化醇乙氧化物，羧基化烷基酚乙氧化物，乙氧化醇，乙氧化脂肪酸，乙氧化脂肪酸，乙氧化脂肪油，甘油酯，聚甘油脂肪酯，乙氧化甘油酯，山梨糖醇酐衍生物，蔗糖酯及衍生物，葡萄糖酯及衍生物。最能代表本發明之有機乳化劑實例為乙氧化脂肪酸，例如，EMULSYNT 1055，及山梨糖醇酐衍生物，例如，TWEEN 20。更詳細地說，EMULSYNT 1055為聚甘油脂肪酯(亦即，聚甘油-4油酸酯)及乙氧化脂肪酯(亦即，PEG-8丙二醇可可酯)之混合物。另一方面，TWEEN 20為聚氧乙烯(20)山梨糖醇酐單月桂酸酯。

活性成份

可以加入根據本發明組合物內之一些活性成份實例為水溶性維生素及水溶性藥物，其包括維生素B₁，維生素B₂，維生素B₆，維生素B₁₂，菸鹼酸，葉酸，生物素，及泛酸。

此外，該組合物亦可含有油溶性活性成份，例如，維生物及藥物，其包括維生素E，生育酚，維生素E酯， α -生育酚， β -生育酚， γ -生育酚， Δ -生育酚，Tocophersolan，生育酚醋酸酯，生育酚棕櫚酸酯，生育酚亞油酸酯，生育酚菸鹼酸酯，生育酚琥珀酸酯，及其混合物。

鹽組份

如文中使用，該名辭"鹽"意指無機鹽或有機鹽，其包括通稱為電解質之化合物。

一些適合的無機鹽實例包括氯化鈣，硫酸鎂，氯化鎂，硫酸鈉，硫代硫酸鈉，氯化鈉，磷酸鈉，氯化銨，碳酸銨，硫酸鐵，硫酸鋁，氯化鋁，鋁氯水合物，鋁倍半氯水合物，鋁二氯水合物，鋁銨四氯水合甘胺酸，鋁銨三氯水合物，鋁銨四氯水合物，鋁銨五氯水合物，及鋁銨八氯水合物。

一些適合的有機鹽實例包括乳酸鋁鈉，醋酸鈉，去氫醋酸鈉，丁氧基乙氧基醋酸鈉，辛酸鈉，檸檬酸鈉，乳酸鈉，二羥基甘胺酸鈉，葡萄糖酸鈉，麩胺酸鈉，羥基甲基磺酸鈉，草酸鈉，苯酚鈉，丙酸鈉，糖精鈉，柳酸鈉，肌胺酸鈉，甲苯磺酸鈉，天冬胺酸鎂，丙酸鈣，糖精鈣，d-羥基蔗糖鈣，巰基醋酸鈣，辛酸鋁，檸檬酸鎂，二醋酸鋁，甘胺酸鋁，乳酸鋁，甲二磺酸鋁，苯酚磺酸鋁，天冬胺酸鉀，雙酞酸鉀，雙酒石酸鉀，糖硫酸鉀，山梨酸鉀，巰基醋酸鉀，甲苯磺酸鉀，及乳酸鎂。

選用組份

由於乳化液很容易被微生物污染所以需要使用防腐劑作為本發明該組合物之選用組份，且可以使用之一些化合物實例包括甲醛，柳酸，苯氧基乙醇，DMDM乙內醯脲(1,3-二羥甲基-5,5-二甲基乙內醯脲)，5-溴-5-硝基-1,3-二噁烷，對羥基苯甲酸甲酯，對羥基苯甲酸丙酯，山梨酸，咪唑烷基(其係以品名 GERMALL® II 購自 Sutton

Laboratories, Chatham, New Jersey), 苯甲酸鈉, 5-氯-2-甲基-4-異噻唑啉-3-酮(以品名 KATHON CG購自 Rohm & Haas Company, Philadelphia, Pennsylvania, 丁基胺基甲酸碘丙炔酯(以品名 GLYCACIL® L購自 Lonza Incorporated, Fair Lawn, New Jersey)。

該組合物可包含凍結/解凍安定劑作為選用組份, 其包括下述化合物, 例如, 乙二醇, 1,2-丙二醇, 甘油, 1,3-丙二醇。

該乳化液可包含之另一種選用組份為腐蝕抑制劑, 例如烷醇胺; 無機磷酸鹽, 例如, 二硫磷酸鋅; 無機磷酸鹽; 無機亞硝酸鹽, 例如, 亞硝酸鈉; 矽酸鹽; 煙基矽酸鹽; 烷基磷酸胺; 琥珀酸酐, 例如, 十二烯基琥珀酸酐, 琥珀酸胺; 或鹼土磺酸鹽, 例如, 磺酸鈉或磺酸鈣。

亦可包含螯合劑, 例如, 乙二胺四醋酸(EDTA)及氮三醋酸(NTA)。

可藉由合併該油相 A 及水相 B 中各該下述代表量(其係以重量%表示)之組份, 形成根據本發明之組合物。

(i)以 100%該乳化劑為基準計(不包括任何溶劑), 0.2-3.0%該矽酮乳化劑(群);

(ii)20-80%該揮發性矽酮;

(iii)以 100%該樹膠為基準計(不包括任何溶劑), 0-8%該矽酮樹膠;

(iv)以 100%該彈性體為基準計(不包括任何溶劑), 0.2-10%該矽酮彈性體;

(v) 0-5% 非根據本發明之組合物之該矽酮橡膠粉末；

(vi) 0.1-4% 該有機乳化劑(群)，其包括該油相及水相使用之乳化劑；

(vii) 15-75% 水；

(viii) 0.1-3% 該電解質，亦即，氯化鈉；

(ix) 0.1-3% 該螯合劑，亦即，EDTA，或其它選用組份；及

(x) 0.1-8% 該活性成份(群)，亦即，維生素。

可以使用機械方法製備根據本發明之組合物，且該方法簡單地包括將該油相及水相混合在一起，然後使用實驗室均質械或其它可應用激烈攪拌之裝置使該相混合物均質化。

實例

陳述以下實例以更詳細說明本發明

實例 I-III

如表 2 所示，製成了種維生素 E W/O 組合物。使用以製備該組合物之各該成份含量係以重量%表示。比較實例 I 及 II 顯示在約 2 天內發生幾乎立即的分離現象，或顯示顏色變化；然而，如實例 III 之 W/O 組合物(其係為根據本發明之組合物)於 50°C 下經過一些時間(約 7 週)仍呈安定狀態，且於室溫下貯存時，其安定性可維持 5 個月之久。

表 2

相A	說明-油相	I-比較實例	II-比較實例	III-本發明
第一級矽酮 乳化劑	10%線型(亦即, 非交聯) 矽酮聚醚及90% D ₅	8.5	10.0	8.5
揮發性矽酮	十甲基環五矽氧烷(D ₅)	16.25	20.0	18.0
矽酮樹膠及 揮發性矽酮	15% OH末端嵌段聚矽氧 烷及85%D ₅	1.0	1.0	2.0
矽酮彈性體	12% α,ω -二烯交聯矽酮彈 性體及88% D ₅	3.0	5.0	3.0
矽酮粉末	矽酮橡膠粉末	2.5	0.5	無
第一級有機 乳化劑	非離子表面活性劑 Emulsynt 1055, 聚甘油-4 油酸酯及PEG-8丙二醇可 可酸酯	無	無	2.0
第二級矽酮 乳化劑	部份交聯矽酮聚醚	無	1.0	無
相B	說明-水相	I-比較實例	II-比較實例	III-本發明
H ₂ O	水	66.5	60.7	64.7
第二級有機 乳化劑	聚氧乙烯(20)山梨糖醇酐 單月桂酸酯-TWEEN 20	0.5	0.5	0.5

電解質	氯化鈉	1.0	1.0	1.0
螯合劑	乙二胺四醋酸，EDTA	0.1	0.1	0.1
維生素E	生育酚	0.7	0.7	0.7

在比較實例I中，已發現當添加生育酚時，該黏性會降低，且會產生幾乎立即的分離現象。在比較實例II中，可發現黏性只稍為降低。需注意，比較實例II所使用之該矽酮橡膠粉末係以後添加方式進行。然而，比較實例II中之該W/O組合物之安定性僅能維持數天。在實例III(其係為根據本發明該組合物)中，於製備該組合物之整個過程從頭至尾，該W/O組合物之黏性仍可維持安定。於室溫下在塑膠容器內該W/O組合物之貯存安定性可維持5個月。

使用100克份量以製備表2所示這3種W/O組合物。這些W/O組合物之製法為合併使用以形成部份該組合物之油相A之該矽酮乳化劑，該揮發性矽酮，該矽酮樹膠，該矽酮彈性體；及/或該矽酮橡膠粉末，該第一級有機乳化劑。使用以形成水性相B之各該組份分散在各別的容器內。緩慢添加水性相B至油相B中，並於紊流條件下混合。B相添加至油相內需費時約15-20分鐘。然後再使已合併之A相及B相一起混合15-20分鐘，形成該最終W/O組合物。

應該注意的是比較實例 I 及 II 各表示 W/O 乳化液，其中該矽酮組份（亦即，該矽酮橡膠粉末）是一種藉由使用交聯劑（其係為含矽原子之不飽和化合物，亦即，乙烯基端基矽酮）得到之組合物。反之，實例 III（其係為根據本發明該實例）可不含該矽酮橡膠粉末，且可以使用 α, ω 二烯交聯矽酮彈性體取代。

根據本發明製成之組合物可用於各種在店面裡買賣（OTC）的個人保護產品內。因此，其可使用在下述產品中：抑汗劑，除臭劑，皮膚乳膏，皮膚保養水，保濕劑，臉部處理劑（例如，粉刺或皺紋去除劑），個人及臉部清潔劑，沐浴油，香水，古龍水，香粉，防曬劑，刮鬍前及刮鬍後之洗劑，液態皂，刮鬍皂，刮鬍泡沫，洗髮精，護髮劑，噴髮劑，泡沫乳膠，持久劑，脫毛劑，角質層護膜劑，化粧品，色粧品，粉底，腮紅，口紅，唇膏，眼線筆，睫毛膏，除油劑，色粧去除劑，散劑。該組合物亦可作為藥劑，殺生物劑，除草劑之載劑，該載劑可以將各種水溶性物質及油溶性物質加入親水性及疏水性系統內。

只要不違背本發明之基本特徵，文中所述之化合物，組合物，及方法可以有各種變異。明確地說。文中所說明之各該具體實例僅為例證用，並無意限制該附加申請專利範圍以外之本發明範圍。

肆、中文發明摘要

本發明係關於一種具非連續水性相分散在連續油相中之油包水(W/O)乳化液，該連續油相具有線型矽酮聚醚， α,ω -二烯交聯矽酮彈性體，及非離子有機乳化劑。另一方面，使用含矽原子之不飽和化合物製成之該W/O乳化液不含矽酮彈性體。該W/O乳化液之非連續水性相或該W/O乳化液之連續油相含水溶性或油溶性活性成份，例如，維生素。

伍、英文發明摘要

A water-in-oil (W/O) emulsion with a discontinuous aqueous phase dispersed in a continuous oil phase has in the continuous oil phase a linear silicone polyether, an α,ω -diene crosslinked silicone elastomer, and a nonionic organic emulsifier. The W/O emulsion is otherwise free of silicone elastomers prepared using unsaturated compounds containing silicon atoms. Either the discontinuous aqueous phase of the W/O emulsion or the continuous oil phase of the W/O emulsion contains a water soluble or oil soluble active ingredient such as a vitamin.

拾、申請專利範圍

1. 一種含油包水(W/O)乳化液之組合物，該乳化液具有非連續水性相分散在連續油相中，該W/O乳化液之連續油相含線型矽酮聚醚， α,ω -二烯交聯矽酮彈性體，及非離子有機乳化劑，使用含矽原子之不飽和化合物所製成之該W/O乳化液不含矽酮彈性體。
2. 根據申請專利範圍第1項之組合物，其中該W/O乳化液之非連續水性相或該W/O乳化液之連續油相之一分別含水溶性活性成份或油溶性活性成份。
3. 根據申請專利範圍第2項之組合物，其中該活性成份係選自以下所組成之群組：維生素B₁，維生素B₂，維生素B₆，維生素B₁₂，菸鹼酸，葉酸，生物素，泛酸，維生素E，生育酚， α -生育酚， β -生育酚， γ -生育酚， Δ -生育酚，Tocophersolan，生育酚醋酸酯，生育酚棕櫚酸酯，生育酚亞油酸酯，生育酚菸鹼酸酯，生育酚琥珀酸酯，及其混合物。
4. 根據申請專利範圍第1項之組合物，該W/O乳化液之連續油相含0.2-3.0重量%該線型矽酮聚醚，0.2-10重量%該 α,ω -二烯交聯矽酮彈性體，及0.1-4.0重量%該非離子有機乳化劑，該W/O乳化液之其餘成份包含溶劑及水。
5. 根據申請專利範圍第4項之組合物，其中該溶劑為通式 $(R''''_2SiO)_d$ 揮發性環狀烷基矽氧烷，或通式 $(R''''_3SiO(R''''_2SiO)_eSiR''''_3)$ 揮發性線型烷基矽氧烷，其

中 R''' 為含 1-6 個碳原子之烷基，d 為 3-6，而 e 為 0-5。

6. 根據申請專利範圍第 5 項之組合物，其中該溶劑係選自以下所組成之群組：六甲基環三矽氧烷，八甲基環四矽氧烷，十甲基環五矽氧烷，十二甲基環六矽氧烷，六甲基二矽氧烷，八甲基三矽氧烷，十甲基四矽氧烷，十二甲基五矽氧烷，十四甲基六矽氧烷，及十六甲基七矽氧烷。

陸、(一)、本案指定代表圖為：第_____圖

(二)、本代表圖之元件代表符號簡單說明：

柒、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：