(19)中华人民共和国国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 111511340 A
(43)申请公布日 2020.08.07

(21)申请号 201880082393.1

(22)申请日 2018.12.17

(30)优先权数据
17208371.9 2017.12.19 EP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2020.06.19

(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2018/085143 2018.12.17

(87)PCT国际申请的公布数据
WO2019/121476 EN 2019.06.27

(71)申请人 帝斯曼知识产权资产管理有限公司
地址 荷兰海尔伦

(72)发明人 马蒂尔德·德劳恩
克里斯蒂娜·门得洛克-埃丁格

(74)专利代理机构 北京东方亿思知识产权代理有限责任公司 11258
代理人 张兵兵

(51)Int.Cl.
A61K 8/25(2006.01)
A61K 8/35(2006.01)
A61K 8/37(2006.01)
A61K 8/42(2006.01)
A61K 8/49(2006.01)
A61Q 17/04(2006.01)
A61K 8/92(2006.01)
A61K 8/97(2017.01)
A61K 8/06(2006.01)

权利要求书3页 说明书12页

(54)发明名称

局部组合物

(57)摘要

本发明涉及以特定比例包含泛醇、基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂和微粒化的紫外线滤光剂的局部组合物。

CN 111511340 A

1.一种局部组合物，所述局部组合物包含泛醇、微粒化的紫外线滤光剂和基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂，其特征在于与所述基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂的量和/或所述微粒化的紫外线滤光剂的量相比，所述局部组合物中泛醇的量至少相等(或更高)。

2.根据权利要求1所述的局部组合物，其中所述微粒化的紫外线滤光剂具有小于200nm的通过光散射确定的平均粒径分布D_v50。

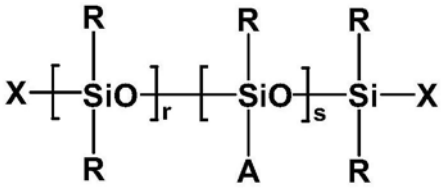
3.根据权利要求1或2所述的局部组合物，其中所述微粒化的紫外线滤光剂是微粒化的不溶性有机紫外线滤光剂。

4.根据权利要求1至3中任一项所述的局部组合物，其中所述微粒化的紫外线滤光剂用作包含微粒化的紫外线滤光剂的颗粒的水性分散体。

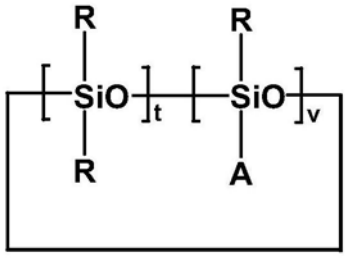
5.根据权利要求4所述的局部组合物，其中包含微粒化的紫外线滤光剂的所述水性分散体额外地包含C_{8-16}烷基多葡糖苷。

6.根据权利要求1至5中任一项所述的局部组合物，其中所述微粒化的紫外线滤光剂是亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚或三联苯三嗪。

7.根据权利要求1至6中任一项所述的局部组合物，其中所述基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂是根据式Ia或Ib的化合物：



Ia

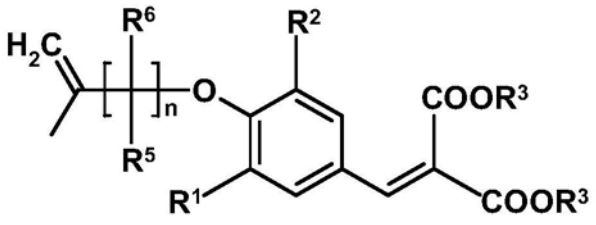


Ib

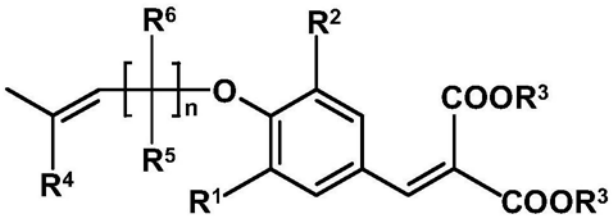
其中

X为R或A；

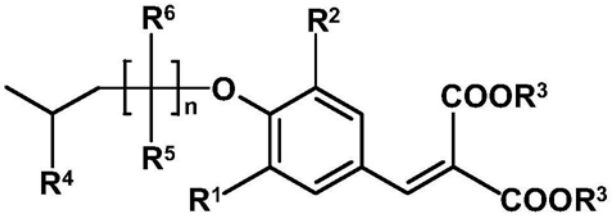
A选自式IIa、IIb或IIc：



IIa



IIb



IIc；

R为氢、C_{1-6}-烷基或苯基；

R^1和R^2各自独立地为氢、羟基、C_{1-6}-烷基或C_{1-6}-烷氧基；

R^3为C_{1-6}-烷基；

R^4为氢或C_{1-6}-烷基；

R^5和R^6各自独立地为氢或C_{1-6}-烷基；

r为0至250；

s为0至20；

r+s至少为3；

t为0至10；

v为0至10；

v+t至少为3；并且

n为1至6；

前提条件是当s为0时，至少一个X为A。

8.根据权利要求1至7中任一项所述的局部组合物，其中所述基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂是聚硅氧烷-15。

9.根据权利要求1至8中任一项所述的局部组合物，其中基于所述组合物的总重量，所述微粒化的紫外线滤光剂(基于活性物质)的量选自0.1重量％至9重量％的范围，优选0.5重量％至7重量％的范围，更优选1重量％至6重量％的范围，最优选1重量％至5重量％的范围。

10.根据权利要求1至9中任一项所述的局部组合物，其中基于所述组合物的总重量，泛醇以选自0.1重量％至10重量％的范围，优选0.5重量％至8重量％的范围，更优选1重量％至7重量％的范围，最优选2重量％至6重量％的范围的量存在于所述局部组合物中。

11.根据权利要求1至10中任一项所述的局部组合物，其中基于所述组合物的总重量，所述基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂以选自0.1重量％至9重量％的范围，优选0.5重量％至7

重量%的范围，更优选1重量%至6重量%的范围的量，最优选1重量%至5重量%的范围的量存在于所述局部组合物中。

12.根据权利要求1至11中任一项所述局部组合物，其中所述组合物是在水包油(O/W)乳化剂的存在下包含分散在水相中的油相的水包油O/W乳液的形式。

13.根据权利要求1至12中任一项所述的局部组合物，其中所述局部组合物还包含丁基甲氧基二苯甲酰甲烷、氰双苯丙烯酸辛酯和水杨酸乙基己酯。

14.泛醇、微粒化的紫外线滤光剂和基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂在局部组合物中用于减少所述局部组合物转移到玻璃或塑料表面的用途。

15.减少脂肪和/或油转移到表面、例如特别是玻璃或塑料表面的方法，所述方法包括向包含所述脂肪和油的局部组合物中加入泛醇、微粒化的紫外线滤光剂和基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂。

局部组合物

[0001] 本发明涉及以特定比例包含泛醇、基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂和微粒化的紫外线滤光剂的局部组合物。

[0002] 多年来,防晒产品已经有了很大的发展。早期的配制物旨在保护使用者免受UV-B辐射的伤害,因为曾经有人认为UV-B射线是导致皱纹,皮肤疾病和皮肤癌的最重要贡献者。但是,最近的研究表明,UV-A辐射在太阳损伤和皮肤疾病(例如红斑狼疮和黑色素瘤和非黑色素瘤皮肤癌)的发展中具有同等或者甚至更为重要的作用。因此,当前的关注是消除尽可能多的UVA(320-400nm)和/或UVB(280-320nm)光。因此,对具有高SPF(防晒系数)和高UVA防护同时光稳定的防晒产品的需求在不断增长。

[0003] 此外,现在的防晒产品需要皮肤友好型防腐剂或防腐增强剂,其可以是传统防腐剂的替代品。防晒产品的另一个需要是改善保湿性,以及防止或减少对皮肤的刺激。

[0004] 然而,防晒产品中通常含有大量的脂肪和油,这些脂肪和油在涂覆于皮肤上后、尤其是在手指上后通常会导致这些脂肪和油转移到表面上、尤其是例如玻璃表面(诸如触摸屏)上,从而使表面具有油污,这是最终消费者非常不想要的。

[0005] 因此,本发明的目的是弥补现有技术的缺点,并开发包含紫外线滤光剂和舒缓剂的防晒产品,该产品克服了现有技术的缺点。

[0006] 令人惊讶的是,已经发现包含大量泛醇结合基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂和微粒化的紫外线滤光剂的组合物显示出组合物到玻璃表面上的转移减少。

[0007] 因此,本发明在一个方面中涉及包含泛醇、基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂和微粒化的紫外线滤光剂,其特征在于,与组合物中存在的微粒化的紫外线滤光剂的量和/或基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂的量相比,局部组合物中泛醇的量(重量%)至少相等(或更高)。

[0008] 在一个优选的实施方式中,与组合物中存在的基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂的量相比,根据本发明的局部用组合物中泛醇的量至少相等(或更高)。

[0009] 在另一个优选的实施方式中,与组合物中存在的微粒化的紫外线滤光剂和基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂的量相比,根据本发明的局部组合物中泛醇的量至少相等(或更高)。

[0010] 术语“局部”在这里被理解为是指对角质物质的外部施用,角质物质特别是皮肤、头皮、睫毛、眉毛、指甲、粘膜和毛发,优选皮肤。

[0011] 泛醇(INCI)也称为D-泛醇、右旋泛醇、维他命原B5或(+)-(R)-2,4-二羟基-N-(3-羟丙基)-3,3-二甲基丁酰胺。泛醇改善水合作用,减少皮肤瘙痒和炎症,改善皮肤弹性,并加速表皮伤口愈合。例如,泛醇在DSM营养产品欧洲有限公司作为D-泛醇可商业购得。

[0012] 如本文中所用,术语“微粒化”通常是指小于200nm,优选约5nm至约200nm,更优选约15nm至约100nm的粒径D_v50(Beckmann Coulter)。

[0013] 微粒化的紫外线滤光剂的实例是微粒化的不溶性有机紫外线滤光剂或微粒化的无机紫外线滤光剂。微粒化的不溶性有机紫外线滤光剂的例子是亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚或三联苯三嗪。微粒化的无机紫外线滤光剂的实例是化妆品应用中常规使用的微粒化的二氧化钛、微粒化的氧化锌、微粒化的氧化铈或微粒化的铁氧化物(iron

oxide)。

[0014] 如本文中所用,术语“不溶性”是指显示出在室温下(即～22℃)在普通化妆品油(例如苯甲酸C_{12-15}烷基酯、丙二醇、矿物油)中的溶解性而且在水中的溶解性小于0.05重量%、优选小于0.3重量%、最优选小于0.01重量%的紫外线滤光剂。根据另一实施方式,微粒化的紫外线滤光剂是UVA滤光剂或UVB滤光剂或宽带(UVA和UVB)滤光剂。

[0015] 根据一个优选的实施方式,微粒化的紫外线滤光剂是微粒化的不溶性有机紫外线滤光剂。

[0016] 根据一个优选的实施方式,根据本发明的微粒化紫外线滤光剂是不溶性有机紫外线滤光剂,其具有小于200nm的通过光散射确定的平均粒径分布D_v50。

[0017] 更优选地,微粒化的不溶性有机紫外线滤光剂具有在30至150nm的范围内、最优选在35至125nm的范围内、例如特别是在40至110nm的范围内选择的通过光散射(即,通过光子相关光谱法(PCS))确定的平均粒径分布D_v50。在一个特别有利的实施方式中,微粒化的不溶性有机紫外线吸收剂表现出在50至80nm范围内的D_v10,在75至125nm范围内的D_v50和在140至180nm范围内的D_v90,甚至更优选在55至75nm的范围内的D_v10,在80至110nm的范围内的D_v50,在150至175nm的范围内D_v90。本文给出的粒径通常是使用Beckman Coulter Delsa Nano S在微粒化的不溶性有机紫外线吸收剂在水、例如超纯水(Mili-Q纯化)中的悬浮液中确定的,优选地浓度为3mg/ml。

[0018] 根据另一个实施方式,局部组合物包含作为水性分散体的微粒化的紫外线滤光剂,该水性分散体包含微粒化的紫外线滤光剂的微粒化的颗粒。

[0019] 优选地,微粒化的紫外线滤光剂在水性分散体中的浓度在基于分散体的总重量的10至90重量%、20至80重量%、30至70重量%的范围内,更优选在40至60重量%的范围内,例如在45至55重量%的范围内。

[0020] 根据另一个实施方式,包含微粒化的紫外线滤光剂的水性分散体额外地包含C_{8-16}烷基多葡糖苷。

[0021] 术语“烷基多葡糖苷(APG)”是指具有通式$C_nH_{2+n}O(C_6H_{10}O_5)_xH$的一类非离子表面活性剂,其中n是选自2至22的整数,x是葡糖苷部分的平均聚合水平(单葡糖苷、二葡糖苷、三葡糖苷、寡葡糖苷和多葡糖苷)。这些APG广泛用于家庭和工业应用。它们通常来源于可再生原料,例如源自玉米的葡萄糖和源自植物的脂肪醇。这些烷基多葡糖苷通常表现出1至1.7、优选1.2至1.6、例如1.4至1.6的葡糖苷部分的平均聚合水平。

[0022] 在根据本发明的所有实施方式中,特别有利的是使用基本上由辛基(C_8)和癸基(C_{10})多葡糖苷组成的C_{8-10}烷基多葡糖苷。优选地,这样的辛基(C_8)和癸基(C_{10})多葡糖苷还表现出在3:1至1:3的范围内,优选在约2:1至1:2的范围内,最优选在1.5:1至1:1.5的范围内辛基(C_8)单葡糖苷与癸基(C_{10})单葡糖苷的比率(%/%,其中所有%都是通过HPLC-MS测定的面积%)。另外,此类C_{8-10}烷基多葡糖苷优选地包含不超过3重量%,更优选不超过2重量%,最优选不超过1.5重量%的C_{12}烷基单葡糖苷(如通过HPLC-MS测定)。可以理解的是,这样的烷基多葡糖苷基本上不含任何更高级的(即,C_{14-16})烷基多葡糖苷。

[0023] 根据本发明的特别有利的C_{8-10}烷基多葡糖苷由衍生自玉米的葡萄糖和衍生自椰子油和棕榈仁油的C_8和C10脂肪醇制成,其例如是由上海精细化工有限公司在商品名Green APG 0810下作为水性分散体出售的。

[0024] 优选地，基于水性分散体的总重量，这种C_{8-16}烷基多葡糖苷或其混合物以2至15重量％，优选5至10重量％的浓度存在。优选地，这种C_{8-16}烷基多葡糖苷是C_{8-10}烷基多葡糖苷。

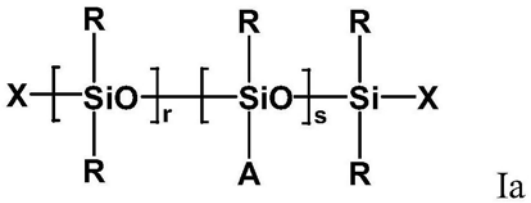
[0025] 优选地，在本发明的所有实施方式中，微粒化的紫外线滤光剂是亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚或三联苯三嗪。在本发明的所有实施方式中最优选的是，紫外线滤光剂是微粒化的亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚。

[0026] 亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚(INCI)也被称为MBBT、2,2'-亚甲基双-(6-(2H-苯并三唑-2-基)-4-(1,1,3,3-四甲基丁基)-苯酚，是由DSM Nutritional Products Ltd(PARSOL® MAX)和BASF SE(Tinosorb® M)作为包含MBBT和烷基多葡糖苷的水性分散体出售的。MBBT是可过滤UVA和UVB光的一种广谱紫外线滤光剂。

[0027] 三联苯三嗪也称为2,4,6-三([1,1'-联苯]-4-基)-1,3,5-三嗪，是由BASF SE作为Tinosorb® A2B出售的一种紫外线滤光剂。

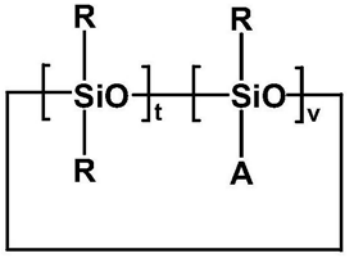
[0028] 优选地，在本发明的所有实施方式中，局部组合物中的基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂具有苯亚甲基丙二酸酯型发色团残基。

[0029] 甚至更优选地，根据本发明的基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂是根据式Ia或Ib的化合物：



Ia

[0030]



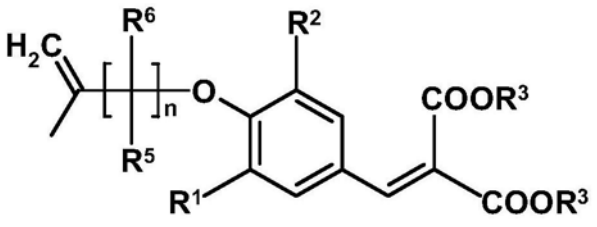
Ib

[0031] 其中

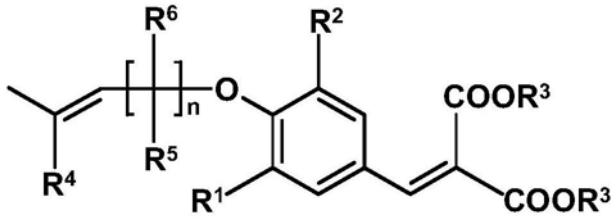
[0032] X为R或A；

[0033] A选自式IIa、IIb或IIc：

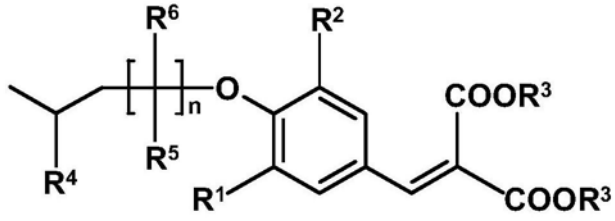
[0034]



IIa



IIb



IIc

[0035] R为氢、C_{1-6}-烷基或苯基；

[0036] R^1和R^2各自独立地为氢、羟基、C_{1-6}-烷基或C_{1-6}-烷氧基；

[0037] R^3为C_{1-6}-烷基；

[0038] R^4为氢或C_{1-6}-烷基；

[0039] R^5和R^6各自独立地为氢或C_{1-6}-烷基；

[0040] r为0至250；

[0041] s为0至20；

[0042] r+s至少为3；

[0043] t为0至10；

[0044] v为0至10；

[0045] v+t至少为3；并且

[0046] n为1至6；

[0047] 前提条件是当s为0时，至少一个X为A。

[0048] 术语“C_{1-6}-烷基”是指例如甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、仲丁基、异丁基、戊基和新戊基的基团。术语“C_{1-6}-烷氧基”是指相应的烷氧基基团。

[0049] 在本发明的所有实施方式中，R优选是甲基。

[0050] 残基R^1和R^2优选为氢、甲氧基或乙氧基，更优选氢，或者R^1和R^2中的一者为氢，另一者为甲基、甲氧基或乙氧基。

[0051] 残基R^3优选为甲基或乙基，更优选乙基。

[0052] 优选地，R^4为氢或甲基，R^5和R^6为氢，且n为1。

[0053] 具有通式IIa和IIb的组别A的聚硅氧烷化合物和它们的制备描述于欧洲专利申请EP-A0538431中。这些聚硅氧烷化合物是最优选的。

[0054] 具有通式IIc的组别A的聚硅氧烷化合物和它们的制备描述于欧洲专利申请EP-A0358584中。

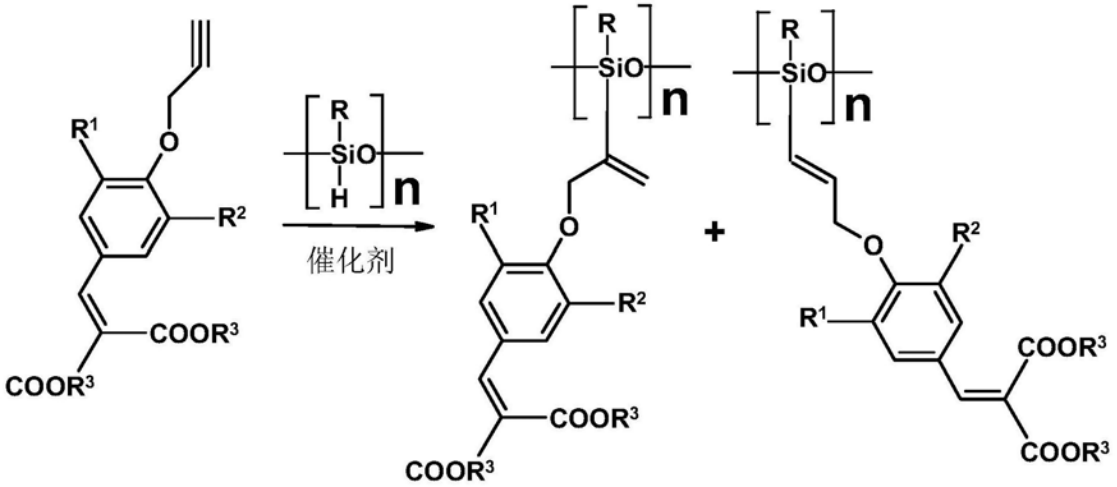
[0055] 在根据式Ia的线性聚硅氧烷化合物中，携带发色团的残基A可以与聚硅氧烷的端基连接(X＝A)，或者可以在聚合物上统计分布。

[0056] 携带发色团的残基A统计分布的线性聚硅氧烷化合物是优选的。所述优选的聚硅氧烷化合物具有至少一个携带发色团残基的单元(s＝1)，优选地，s具有约2至约10的值，更优选约4的统计平均值。聚硅氧烷化合物中存在的其它硅氧烷单元的数目r优选为约5至约150，更优选约60的统计平均值。

[0057] 就化妆品性能而言，优选的是这样的聚硅氧烷化合物，其中20％或更少，优选小于10％的全部硅氧烷单元是携带发色团残基的单元。

[0058] 具有式IIa的发色团残基A的聚硅氧烷单元与具有式IIb的发色团残基A的聚硅氧烷单元的比率并不重要。所述比率可以为约1:1至约19:1，优选为约2:1至约9:1，更优选为约4:1。

[0059] 其中A为式IIa或IIb的残基的聚硅氧烷化合物Ia或Ib可以如EP-B0538431所述，根据以下反应方案，通过相应的苯亚甲基丙二酸酯的硅烷化反应来制备：

[0060] 

[0061] 其中，R^1、R^2和R^3如上面所定义。

[0062] 4-(2-丙炔基氧基)苯基亚甲基二乙基酯的硅烷化可以采用已知的用于将与氢原子键合的硅加成到含有脂肪族不饱和的基团的程序来进行。这种反应通常由铂族金属或铂族金属的络合物催化。可以使用的催化剂的示例是碳负载铂、氯铂酸、乙酰丙酮铂、铂化合物与不饱和化合物(例如烯烃和二乙烯基二硅氧烷)的络合物、无机底物上负载的铂化合物的络合物以及铑和钯化合物的络合物。加成反应可以在减压、常压或高压下进行。在反应混合物中可以使用溶剂，例如甲苯或二甲苯，尽管溶剂的存在不是必需的。也优选的是较高的反应温度下进行反应，例如约50℃至约150℃。

[0063] 特别优选的是通式Ia的化合物，其中

[0064] X表示甲基，

[0065] A表示式IIa或IIb的基团，

[0066] R表示甲基，

[0067] R^1和R^2表示氢、甲氧基或乙氧基，或者R^1和R^2中的一者为氢，另一者为甲基、甲氧基或乙氧基，

[0068] R^3表示甲基或乙基，

[0069] R^4表示氢或甲基，

[0070] R^5和R^6表示氢，

[0071] r为约5至150，

[0072] s为约2至约10，并且

[0073] n的值为1。

[0074] 最优选的是通式Ia的线性聚硅氧烷，其中

[0075] X表示甲基，

[0076] A表示式IIa或IIb的基团，

[0077] R表示甲基，

[0078] R^1和R^2表示氢，

[0079] R^3表示乙基，

[0080] R^4表示氢，

[0081] R^5和R^6表示氢，

[0082] r为约60的统计平均值，

[0083] s为约4的统计平均值，并且，

[0084] n的值为1。

[0085] 在本发明的所有实施方式中，这些最优选的基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂是聚硅氧烷-15(INCI)，其在DSM营养品有限公司以商品名PARSOL® SLX市售。

[0086] 在本发明的所有实施方式中，基于组合物的总重量，在根据本发明的局部组合物中存在的泛醇的量有利地选自0.1重量％至10重量％的范围，优选0.5重量％至8重量％的范围，更优选1重量％至7重量％的范围，最优选2重量％至6重量％的范围。基于组合物的总重量，进一步优选的范围是1重量％至6重量％或2重量％至6重量％的泛醇。

[0087] 在本发明的所有实施方式中，基于组合物的总重量，在根据本发明的局部组合物中存在的微粒化的紫外线滤光剂(基于活性物质)、优选地亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚或三联苯三嗪、最优选地亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚的量有利地在0.1至9重量％的范围内选择，优选地在0.5至7重量％的范围内、更优选地在1至6重量％的范围内、最具体地在1至5重量％的范围内选择。基于组合物的总重量，进一步优选的范围是0.5至6重量％、1至5重量％和1至3重量％。

[0088] 在本发明的所有实施方式中，基于组合物的总重量，基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂、优选地具有苯亚甲基丙二酸酯型发色团残基的基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂(例如，最优选聚硅氧烷-15)在根据本发明的局部组合物中的量有利地选自0.1重量％至9重量％的范围，优选地0.5重量％至7重量％的范围，更优选1重量％至6重量％的范围，最优选1重量％至5重量％的范围。进一步合适的范围将是1重量％至7重量％或2重量％至4重量％。

[0089] 根据本发明的尤其有利的局部组合物包含2至6重量％的泛醇，1至3重量％的亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚(基于活性物质)和2至4重量％的聚硅氧烷-15(所有量均基于组合物的总重量)。

[0090] 本发明的一个实施方式涉及在本发明的局部组合物中使用本文中所描述和定义的微粒化的紫外线滤光剂的方法，用于减少局部组合物转移到玻璃或塑料表面。

[0091] 在本发明的一个具体的实施方式中，涉及使用本文中所描述和定义的泛醇、微粒

化的紫外线滤光剂和基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂在根据本发明的局部组合物中的方法，用于减少局部组合物转移到玻璃或塑料表面。在一个尤其有利的实施方式中，与微粒化的紫外线滤光剂的量和/或基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂的量相比，泛醇在所述局部组合物中的量至少相等(或更高)。

[0092] 在一个尤其优选的实施方式中，本发明涉及在局部组合物中使用2至6重量％的泛醇、使用1至3重量％的亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚(基于活性物质)和使用2至4重量％的聚硅氧烷-15的方法，用于减少局部组合物转移到玻璃或塑料表面，前提条件是与聚硅氧烷-15的量和/或亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚的量相比，泛醇在所述局部组合物中的量至少相等(或更高)。

[0093] 在另一个实施方式中，本发明涉及本文中所描述和定义的泛醇、微粒化的紫外线滤光剂和基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂用于减少局部组合物中包含的脂肪和油转移到表面(例如尤其是玻璃或塑料表面，诸如触摸屏)的用途。在一个尤其有利的实施方式中，与微粒化的紫外线滤光剂的量和/或基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂的量相比，泛醇在所述局部组合物中的量至少相等(或更高)。

[0094] 在一个尤其优选的实施方式中，本发明涉及2至6重量％的泛醇的用途、1至3重量％的亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚(基于活性物质)的用途以及2至4重量％的聚硅氧烷-15的用途，用于减少局部组合物中包含的脂肪和油转移到表面、例如尤其是玻璃或塑料表面(诸如触摸屏)，前提条件是与聚硅氧烷-15的量和/或亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚的量相比，泛醇在所述局部组合物中的量至少相等(或更高)。

[0095] 在一个附加的实施方式中，本发明涉及减少脂肪和/或油转移到表面(特别是玻璃或塑料表面，例如触摸屏)的方法，所述方法包括向包含这种脂肪和油的根据本发明的局部组合物中加入本文中所描述和定义的泛醇、微粒化的紫外线滤光剂和基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂。在一个尤其有利的实施方式中，与微粒化的紫外线滤光剂的量和/或基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂的量相比，泛醇在所述局部组合物中的量至少相等(或更高)。

[0096] 在另一个特别有利的实施方式中，本发明涉及减少脂肪和/或油转移到表面(例如尤其是玻璃或塑料表面，例如触摸屏)的方法，所述方法包括向包含这种脂肪和油的局部组合物中添加2至6重量％的泛醇、添加1至3重量％的亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚(基于活性物质)以及添加2至4重量％的聚硅氧烷-15，前提条件是与聚硅氧烷-15的量和/或亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚的量相比，泛醇在所述局部组合物中的量至少相等(或更高)。

[0097] 在本发明的所有实施方式中，优选的局部组合物是含有油相和水相的乳液，例如尤其是O/W、W/O、Si/W、W/Si、O/W/O、W/O/W多重乳液或皮克林乳液。基于组合物的总重量，存在于这种乳液中的油相(即包含所有油和脂肪的相)的量优选为至少10重量％，例如在10至60重量％的范围内，优选在15-50重量％的范围内，最优选15-40重量％的范围内。

[0098] 在另一个实施方式中，本发明涉及用作防晒剂的根据本文描述的实施方式的局部组合物，还涉及根据本文描述的实施方式的局部组合物作为防晒剂的用途。

[0099] 除微粒化的紫外线滤光剂、尤其是微粒化的亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚或三联苯三嗪和基于聚硅氧烷基的紫外线滤光剂外，在根据本发明的局部组合物中还可以存在其他的紫外线滤光剂。这些紫外线滤光剂都是市售的紫外线滤光剂物质，例如具体

地(INCI名称)苯基苯并咪唑磺酸、3-苯亚甲基樟脑、氰双苯丙烯酸辛酯(octocrylene)、甲氧基肉桂酸乙基己酯、水杨酸乙基己酯、胡莫柳酯、乙基己基三嗪酮、氧化锌、双-乙基己氧基酚甲氧苯基三嗪、二乙基己基丁酰胺基三嗪酮、二苯甲酮-3、二氧化钛、丁基甲氧基二苯甲酰甲烷、苯基二苯并咪唑四磺酸二钠和二乙氨基羟苯甲酰基苯甲酸己酯,不过并不限于这些物质。优选地,根据本发明的局部用组合物至少包含氰双苯丙烯酸辛酯、水杨酸乙基己酯和丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷作为其他紫外线滤光剂。

[0100] 由于根据本发明的局部组合物意图用于局部施用,因此它们包含生理学上可接受的介质,即与角质物质(例如皮肤、粘膜和角质纤维)相容的介质。特别是,生理学上可接受的介质是美容上可接受的载体。

[0101] 术语美容上可接受的载体是指化妆品组合物中常规使用的所有载体和/或赋形剂和/或稀释剂。

[0102] 根据本发明的优选的局部组合物是皮肤护理制剂、修饰用制剂和功能制剂。

[0103] 皮肤护理制剂的示例特别是,光防护制剂、抗衰老制剂、用于治疗光衰老的制剂、身体油、身体乳、身体凝胶、护理霜、护肤软膏、皮肤粉剂、保湿凝胶、保湿喷雾、面部和/或身体保湿剂、皮肤美黑制剂(即用于人类皮肤的人工/无阳光的美黑和/或致黑的组合物),例如仿晒(self-tanning)乳膏剂和亮肤制剂。

[0104] 修饰用制剂的示例特别是口红、眼影、睫毛膏、干湿化妆配制物、胭脂和/或脂粉。

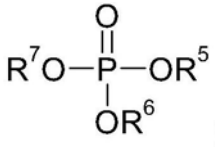
[0105] 功能制剂的示例是包含活性成分的化妆品或药物组合物,例如激素制剂、维生素制剂、植物提取物制剂、抗衰老制剂和/或抗微生物(抗细菌或抗真菌)制剂,但不限于此。

[0106] 在一个具体的实施方式中,根据本发明的局部组合物是光防护制剂(防晒产品),例如防晒乳、防晒露、防晒霜、防晒油、紫外线阻挡物或具有SPF(防晒系数)的日间护理霜。特别感兴趣的是防晒霜、防晒露、防晒乳和防晒制剂。

[0107] 根据本发明的局部组合物可以是在溶剂或脂肪物质中的悬浮液或分散体的形式,或者作为选择可以是乳液或微乳液的形式(特别是水包油(O/W-)型或油包水(W/O-)型、水包硅氧烷(Si/W-)型或硅氧烷包水(W/Si-)型、PIT乳液、多重乳液(例如油包水包油(O/W/O-)型或水包油包水(W/O/W-)型)、皮克林乳液、水凝胶、醇凝胶、脂质凝胶、一相或多相溶液或囊状分散体或其他常见形式,它们也可以通过笔应用、作为面膜应用或作为喷雾剂应用。

[0108] 根据本发明的局部组合物有利地以在水包油(O/W)乳化剂的存在下包含分散在水相中的油相的O/W乳液的形式存在。这种O/W乳液的制备对于本领域的技术人员是公知的并在实施例中加以说明。

[0109] 在一个有利的实施方式中,根据本发明的O/W乳化剂是磷酸酯乳化剂。术语磷酸酯乳化剂是指式(II)的磷酸酯乳化剂

[0110] 

式(II)

[0111] 其中R^5、R^6和R^7可以为氢,具有1至22个碳、优选12至18个碳的烷基;或具有1至22个碳、优选12至18个碳,并具有1摩尔或更多、优选2至25摩尔、最优选2至12摩尔环氧乙烷的烷氧基化烷基,前体条件是R^5、R^6和R^7中的至少一者为如前所定义的烷基或烷氧基化烷基,但

在所述烷基或烷氧基化烷基基团中具有至少6个烷基碳。

[0112] 优选的是这样的单酯，其中R^5和R^6为氢，R^7选自10至18个碳的烷基基团和10至18个碳且2至12摩尔环氧乙烷的烷氧基化脂肪醇。尤其优选的磷酸酯乳化剂为C_{8-10}烷基乙基磷酸酯、C_{9-15}烷基磷酸酯、鲸蜡硬脂醇聚醚-2磷酸酯、鲸蜡硬脂醇聚醚-5磷酸酯、鲸蜡醇聚醚-8磷酸酯、鲸蜡醇聚醚-10磷酸酯、鲸蜡基磷酸酯、C6-10链烷醇聚醚-4磷酸酯、C_{12-15}链烷醇聚醚-2磷酸酯、C_{12-15}链烷醇聚醚-3磷酸酯、DEA-鲸蜡硬脂醇聚醚-2磷酸酯、DEA-鲸蜡基磷酸酯、DEA-油醇聚醚-3磷酸酯、鲸蜡醇磷酸酯钾、癸醇聚醚-4磷酸酯、癸醇聚醚-6磷酸酯和三月桂醇聚醚-4磷酸酯。根据本发明的一个具体的磷酸酯乳化剂是鲸蜡醇磷酸酯钾，例如DSM营养产品有限公司Kaiseraugst以Amphisol®K商品化的。

[0113] 根据本发明的其他合适的O/W乳化剂包括PEG-30二聚羟基硬脂酸酯、PEG-4二月桂酸酯、PEG-8二油酸酯、PEG-40脱水山梨糖醇全油酸酯、PEG-7甘油椰油酸酯、PEG-20杏仁油甘油酯、PEG-25氢化蓖麻油、硬脂酸甘油酯(和)PEG-100硬脂酸酯、PEG-7橄榄油酸酯、PEG-8油酸酯、PEG-8月桂酸酯、PEG-60杏仁油甘油酯、PEG-20甲基葡萄糖倍半硬脂酸酯、PEG-40硬脂酸酯、PEG-100硬脂酸酯、PEG-80山梨醇月桂酸酯、硬脂醇聚醚-2、硬脂醇聚醚-12、油醇聚醚-2、鲸蜡醇聚醚-2、月桂醇聚醚-4、油醇聚醚-10、油醇聚醚-10/聚乙二醇10油醚、鲸蜡醇聚醚-10、异鲸蜡醇聚醚-20、鲸蜡硬脂醇聚醚-20、油醇聚醚-20、硬脂醇聚醚-20、硬脂醇聚醚-21、鲸蜡醇聚醚-20、异鲸蜡醇聚醚-20、月桂醇聚醚-23、硬脂醇聚醚-100、甘油基硬脂酸柠檬酸酯、硬脂酸甘油酯(自乳化)、硬脂酸、硬脂酸盐、聚甘油-3-甲基葡糖二硬脂酸酯。其他合适的乳化剂是脱水山梨糖醇油酸酯、脱水山梨糖醇倍半油酸酯、脱水山梨糖醇异硬脂酸酯、脱水山梨糖醇三油酸酯、月桂基葡糖苷、癸基葡糖苷、硬脂酰谷氨酸钠、蔗糖多硬脂酸酯和水合聚异丁烯。此外，一种或多种合成聚合物可用作乳化剂。例如，PVP二十碳烯共聚物、丙烯酸酯/C_{10-30}烷基丙烯酸酯交联聚合物、丙烯酸酯/硬脂醇聚醚-20甲基丙烯酸酯共聚物、PEG-22/十二烷基乙二醇共聚物、PEG-45/十二烷甘醇共聚物，以及它们的混合物。

[0114] 另一类特别合适的O/W乳化剂是非离子自乳化体系，其来源于橄榄油，例如以OLIVEM 1000商品名出售的(INCI名称)橄榄油鲸蜡醇酯和脱水山梨糖醇橄榄油酸酯(化学成分：橄榄油脂肪酸的脱水山梨糖醇酯和鲸蜡硬脂醇酯)。

[0115] 其他合适的是商购可得的聚合物乳化剂，例如疏水改性的聚丙烯酸如丙烯酸酯/C10-30烷基丙烯酸酯交联聚合物，它们以商品名Pemulen® TR-1和TR-2由Noveon商购可得。

[0116] 另一类特别合适的乳化剂是脂肪酸的聚甘油酯或二酯，也称为聚甘油酯/二酯(即一种或多种脂肪酸通过酯化作用与聚甘油结合的聚合物)，例如在Evonik以Isolan GPS[INCI名称：聚甘油-4-二异硬脂酸酯/聚羟基硬脂酸酯/癸二酸酯(即异硬脂酸、聚羟基硬脂酸和癸二酸与聚甘油-4混合物的二酯)]商购可得或在Cognis以Dehymuls PGPH可得(INCI聚甘油-2-二聚羟基硬脂酸酯)。

[0117] 此外合适的是聚亚烷基二醇醚，例如Brij 72(聚氧乙烯(2)硬酯醇醚)或Brij 721(聚氧乙烯(21)硬酯醇醚)，例如，可在Croda获得。

[0118] 基于组合物的总重量，至少一者O/W乳化剂或Si/W乳化剂分别优选以0.5重量％至10重量％，例如特别是0.5重量％至5重量％的范围，例如最特别是0.5重量％至4重量％的

范围内的量使用。

[0119] 合适的W/O乳化剂或W/Si乳化剂是聚甘油-2-二聚羟基硬脂酸酯、PEG-30二聚羟基硬脂酸酯、鲸蜡基聚二甲基硅氧烷共聚醇、油酸/异硬脂酸的聚甘油-3二异硬脂酸酯聚甘油酯、聚甘油-6-六蓖麻醇酸酯(polyglyceryl-6hexaricinolate)、聚甘油-4-油酸酯、聚甘油-4-油酸酯/PEG-8丙二醇椰油酸酯、硬脂酸镁、硬脂酸钠、月桂酸钾、蓖麻酸钾、椰油酸钠、牛脂酸钠、蓖麻油酸钾、油酸钠,以及它们的混合物。其他合适的W/Si乳化剂是月桂基聚甘油-3聚二甲基硅氧乙基二甲聚硅氧烷和/或PEG-9聚二甲基硅氧乙基二甲聚硅氧烷和/或鲸蜡基PEG/PPG-10/1二甲聚硅氧烷和/或PEG-12二甲聚硅氧烷交联聚合物和/或PEG/PPG-18/18二甲聚硅氧烷。基于组合物的总重量,该至少一种W/O乳化剂优选以约0.001重量%至10重量%的量,更优选0.2重量%至7重量%的量使用。

[0120] 根据本发明的局部组合物还有利地包含至少一种助表面活性剂,例如,选自单甘油酯和二甘油酯和/或脂肪醇的组。基于组合物的总重量,助表面活性剂通常以选自0.1重量%至10重量%的范围,例如特别是0.5重量%至7重量%的范围,例如最特别是1重量%至5重量%的范围的量使用。特别合适的助表面活性剂选自烷基醇,例如鲸蜡醇(Lorol C16,Lanette 16)、鲸蜡硬脂醇(Lanette O)、硬酯醇(Lanette 18)、山嵛醇(Lanette 22)、硬脂酸甘油酯、肉豆蔻酸甘油酯(Estol 3650)、氢化椰子酸甘油酯(Lipocire Na10)以及它们的混合物的列表。

[0121] 根据本发明的O/W乳液形式的组合物例如可以以用于O/W乳液的所有配制物形式制备,例如,以乳清、乳液或乳霜的形式,并且根据通常的方法制备。作为本发明主题的组合物旨在局部施用,并且特别可以构成皮肤学组合物或化妆品组合物,例如旨在保护人类皮肤免受紫外线辐射的不利影响(抗皱、抗衰老、保湿、防晒等)。

[0122] 根据本发明的一个有利的实施方式,组合物构成化妆品组合物,并意图用于皮肤的局部施用。

[0123] 最后,本发明的主题是一种对角质物质(例如特别是皮肤)进行美容处理的方法,其中如上所定义的组合物应用于所述角质物质(例如特别是皮肤)。该方法特别适用于保护皮肤免受紫外线辐射的不利影响,例如特别是晒伤和/或光老化。

[0124] 按照本发明,根据本发明的组合物可以包含其他成分,例如,用于亮肤、晒黑预防的成分;治疗色素沉着的成分;预防或减少粉刺、皱纹、皱褶、萎缩和/或炎症的成分;螯合剂和/或隔离剂;抗脂肪和减肥(如植烷酸)、紧致、保湿和活肤、仿晒、舒缓的成分,以及用于改善弹性和皮肤屏障的药剂和/或局部组合物中常规使用的其他紫外线滤光剂物质和载体和/或赋形剂或稀释剂。如果没有其它说明,则下文提到的赋形剂、添加剂、稀释剂等适用于根据本发明的局部组合物。化妆品佐剂和添加剂和皮肤学佐剂和添加剂的必要量可以由技术人员根据所需的产品容易地确定。可以视情况将附加的成分加入油相中、水相中或单独加入。本领域的技术人员可以容易地调整添加的方式。

[0125] 在一些情况下,本文中有用的美容活性成分可提供一种以上的益处或通过一种以上的作用方式起作用。

[0126] 根据本发明的局部组合物也可以包含有用的化妆品佐剂和添加剂,例如,防腐剂/抗氧化剂、脂肪物质/油、水、有机溶剂、硅氧烷、增稠剂、软化剂、乳化剂、防晒剂、消泡剂、保湿剂、美容成分例如香料、表面活性剂、填料、隔离剂、阴离子、阳离子、非离子或两性聚合物

或其混合物、推进剂、酸化剂或碱化剂、染料、色素/着色剂、研磨剂、吸收剂、精油、皮肤感受剂、收敛剂、消泡剂、颜料或纳米颜料，例如适合通过物理阻挡紫外辐射提供光防护效果的那些，或通常配制在化妆品组合物中的任何其他成分。适用于本发明的组合物的在护肤行业中常用的这些化妆品成分例如描述于个人护理产品委员会(http://www.personalcarecouncil.org)的《国际化妆品成分词典和手册》(International Cosmetic Ingredient Dictionary&Handbook)中，可通过在线INFO BASE(http://online.personalcarecouncil.org/jsp/Home.jsp)访问，但不限于此。

[0127] 基于所需产品，化妆品佐剂和添加剂和皮肤学佐剂和添加剂的必要量可以由本领域技术人员很容易地选择，并将在实施例中加以说明，但不限于此。

[0128] 当然，本领域技术人员将小心选择上述可选的一种或多种附加的化合物和/或其量，以使得与按照本发明的组合本质上相关的有利性质未受到或基本上未受到由于预期的一种或多种添加导致的不利影响。

[0129] 根据本发明的局部组合物通常具有3至10的范围内的pH，优选4至8的范围内的pH，并最优选pH在4至7的范围内的pH。根据本领域的标准方法，可根据需要使用合适的酸(例如柠檬酸)或碱(例如NaOH)容易地调节pH。

[0130] 根据本发明的局部组合物还可包含一种或多种舒缓和软化皮肤的润肤剂。作为一个示例，润肤剂可以是二辛酰基碳酸酯或C_{12-15}烷基苯甲酸酯。其他的润肤剂是硅氧烷(二甲聚硅氧烷、环状聚甲基硅氧烷)、植物油(葡萄籽、芝麻籽、荷荷巴油等)、黄油(可可脂、乳木果油)、醇(硬脂醇、鲸蜡醇)和凡士林衍生物(凡士林油、矿物油)。

[0131] 根据本发明的化妆品组合物有利地包含防腐剂或防腐增强剂。优选地，附加的防腐剂和防腐增强剂分别选自由苯氧乙醇、乙基己基甘油、羟基苯乙酮、辛酸甘油酯、辛酸乙二醇、1,2-己二醇、丙烷二醇、丙二醇以及它们的混合物组成的组。存在时，基于组合物的总重量，防腐剂他防腐增强剂分别优选以0.01重量％至2重量％的量，更优选0.05重量％至1.5重量％的量，最优选0.1重量％至1.0重量％的量使用。特别优选的是，根据本发明的化妆品组合物不包含任何另外的/其他防腐剂，例如，对羟基苯甲酸酯类和/或甲基异噻唑啉酮。

[0132] 提供以下实施例以进一步说明本发明的组合物和效果。这些实施例仅是说明性的，并不打算以任何方式限制本发明的范围。

[0133] 实验部分

[0134] 如表1所述的配制物(O/W乳液)已根据本领域的标准方法制备。

[0135] 然后按如下所述用海绵测试来测试抗转移性(transfer resistance)：

[0136] -将一块海绵布切成7.5cm x 2.5cm的小块；

[0137] -去皮校准(tare)海绵样品的重量；

[0138] -涂覆400mg乳霜(cream)，并使其均匀分布在所有的7.5x 2.5厘米的海绵表面上；

[0139] -称重带涂覆的样品的海绵；

[0140] -去皮校准显微镜载玻片(玻璃板)；

[0141] -将显微镜载玻片(玻璃板)以500g的压力放在海绵顶部上10秒；

[0142] -称重量转移到玻璃板上的乳霜的量

[0143] -对每种配制物重复测试10次以获取每种配制物的平均值。

[0144] 结果列在表1中。

[0145] 表1

INCI	参考 1	发明 1	发明 2
	重量%		
丁基甲氧基二苯甲酰甲烷	4.00	4.00	4.00
氰双苯丙烯酸辛酯	8.00	8.00	8.00
水杨酸乙基己酯	5.00	5.00	5.00
鲸蜡醇磷酸酯钾	1.50	1.50	1.50
鲸蜡醇	3.00	3.00	3.00
二辛酰基碳酸酯	8.00	8.00	8.00
C12-15 烷基苯甲酸酯	8.00	8.00	8.00
水(Aqua)	补足至 100	补足至 100	补足至 100
甘油	3.00	3.00	3.00
黄原胶	0.30	0.30	0.30
羟基苯乙酮	0.50	0.50	0.50
苯氧乙醇，乙基己基甘油	1.00	1.00	1.00
泛醇		3.00	5.00
聚硅氧烷-15		3.00	3.00
亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚(50%活性物质)，水，癸基葡糖苷，丙二醇，黄原胶		4.00	4.00
乳霜的转移	1.7	1.2	0.9
与参考 1 相比减少%		-29%	-47%

[0146]

[0147] 由表2可以得出，向包含基于聚硅氧烷的紫外线滤光剂(聚硅氧烷-15)和亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚的组合物中加入相对大量的D-泛醇显著减少了转移至玻璃表面的乳霜的量。