



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 105456046 A

(43) 申请公布日 2016. 04. 06

(21) 申请号 201510631423. 8

(22) 申请日 2015. 09. 29

(30) 优先权数据

14/499, 713 2014. 09. 29 US

(71) 申请人 强生消费者公司

地址 美国新泽西州

(72) 发明人 G · L · 安康尼

L · 德卡斯特罗蒙泰罗洛弗雷多

A · 帕塞罗 E · M · 舍居

(74) 专利代理机构 上海专利商标事务所有限公

司 31100

代理人 张静 沙永生

(51) Int. Cl.

A61K 8/46(2006. 01)

A61K 8/36(2006. 01)

A61Q 15/00(2006. 01)

权利要求书1页 说明书12页

(54) 发明名称

止汗剂组合物

(57) 摘要

本发明题为“止汗剂组合物”。本发明提供了一种止汗剂组合物,所述止汗剂组合物包含至少3.5重量%的酚磺酸锌或乳酸锌,其中所述组合物基本上不含铝盐。

1. 一种止汗剂组合物,所述止汗剂组合物包含至少 3.5 重量%的酚磺酸锌或乳酸锌,其中所述组合物基本上不含铝盐。
2. 根据权利要求 1 所述的组合物,所述组合物还包含吸水剂。
3. 根据权利要求 2 所述的组合物,其中所述吸水剂选自二氧化硅、棉粉、竹丝和沸石。

止汗剂组合物

技术领域

[0001] 本发明提供了一种止汗剂组合物,该止汗剂组合物包含至少 3.5 重量%的酚磺酸锌或乳酸锌,其中所述组合物基本上不含铝盐。

背景技术

[0002] 在世界各地,止汗剂和除臭剂组合物广泛用于控制局部出汗和气味。湿斑诸如腋下的那些被视为不雅观的。另外,身体气味可妨碍正常人际关系并且引起社会排斥。这些问题在以下区域中更显著具体地呈现,该区域往往趋于具有高湿度,例如,温暖气候。除腋下区域之外,包括足部的其它身体区域可从止汗剂和除臭剂的使用中获得益处。

[0003] 止汗剂通过减缓出汗过程而起作用。这可通过以下方法来实现:阻塞从其产生汗液的孔,封闭汗腺的乙酰胆碱受体,或者抑制汗液在腺体处的产生(阻止乙酰胆碱从交感神经的神经元释放)。另一方面,除臭剂通过使汗液停止而起到去除臭气味的作用。除臭剂通过以下方式而起作用:限制细菌增殖,封闭汗液扩散,吸收恶臭并且进行酶抑制。除臭剂、止汗剂或两者可作为商业产品在市场上出售。

[0004] 当前市场上出售的用于此类用途的产品可使用收敛金属盐,诸如铝盐或者铝/锆盐。此类盐不仅能够封闭孔以抑制和减少出汗,而且还能够杀微生物,并且该盐的有效部分通常保留在孔之间的皮肤表面上。通过利用此类盐控制出汗,使用者可有利地同时减少或消除局部产生的恶臭。因此,如果存在的不足的止汗剂活性物质能够使得该组合物能够用作有效止汗剂,则该活性物质通常提供除臭剂的有益效果。

[0005] 最近,铝可被吸收到血液内的问题已经增加。另外,含铝气溶胶止汗剂的使用允许吸入并且可使得铝从鼻腔深处吸收。

[0006] 有利地,申请人现已经公开不含铝盐的止汗剂可使用锌盐以一定量配制。锌盐在文献中已描述为除臭剂。然而,对于一些锌盐而言,当用作除臭剂时,所推荐的浓度仅可变化为至多约 2.0 重量%。

[0007] 已知铝盐通过使乳腺导管上皮细胞的蛋白质,诸如胶原、角蛋白、糖蛋白以及阻塞汗腺的其它物质沉淀而起作用。当根据本发明进行使用时,乳酸锌和酚磺酸锌还展示出与汗液控制相关的止汗剂效果。为了实现止汗剂效果,需要较高浓度的锌盐。预期乳酸锌和酚磺酸锌因有机链聚合的可能性而具有类似的特性。预期无机锌盐(诸如,氧化锌)因不存在碳链并且具有较小的聚合可能性而不具有此类特性。

发明内容

[0008] 本发明提供了包含至少 3.5 重量%的酚磺酸锌或乳酸锌的止汗剂组合物,其中所述组合物基本上不含铝盐。

具体实施方式

[0009] 本发明涉及使用足以用作止汗剂的有效量的锌盐。

[0010] 止汗剂可包含其它成分,例如,吸水剂。

[0011] 通过组合有效量的锌盐与吸收剂,可获得有效的和美观的止汗剂制剂。

[0012] 如本文所用,术语“锌盐的有效量”意指足以封闭或阻塞汗腺以避免在皮肤表面产生汗液的量。当汗腺被封闭或阻塞时,皮肤保持较干燥。需要有效作为止汗剂的量大于通常用于除臭剂的量。

[0013] 具体地讲,该组合物包含至少 3.5 重量%的锌盐。锌盐的量显著高于先前已知用于除臭防护的量;此较高的量提供了止汗剂防护。

[0014] 优选地,对于乳酸锌而言,该组合物包含至少 3.5 重量%、更优选地至少 3.6 重量%的锌盐。

[0015] 优选地,对于酚磺酸锌而言,该组合物包含至少 5 重量%、更优选地至少 5.3 重量%的锌盐。

[0016] 在一个实施例中,锌盐为酚磺酸锌。

[0017] 在另一个实施例中,锌盐为乳酸锌。

[0018] 也可使用酚磺酸锌和乳酸锌两者的混合物。

[0019] 该组合物可包含一种或多种附加的止汗剂活性物质,例如,乳酸钠、乳酸钙、乳酸铵、乙酸钙、乙酸钠和乙酸镁。

[0020] 根据本发明的止汗剂组合物通常可包含至多 20 重量%、或至多约 13 重量%、或至多约 10 重量%的锌盐加任何附加的止汗剂活性物质。

[0021] 该组合物基本上不含水合氯化铝和/或其衍生物。该制剂可偶尔包含铝残余。在将原材料中的残余用作组合物的成分时,这涉及痕量或极低量的铝元素。这不是铝盐。

[0022] 该组合物可任选地包含吸水剂。此类吸水剂在化妆品应用中为已知的并且通常为多孔成分,该多孔成分具有微通道,从而获得高吸收能力和吸收各种不同材料的能力。此类化合物对亲水性或亲脂性分子可具有亲和力。在一些情况下,优选的是组合多种吸水剂,以使得吸收能力最大化。

[0023] 合适的吸水剂包括二氧化硅、棉粉、竹丝和沸石。

[0024] 在一个实施例中,组合物包含印度簕竹根茎粉 (Bambusa Arundinacea Stem Powder) (例如,购自 Polytechno Indústrias Químicas Ltda/Ion Química 的 BAMB00 SILK PW) 和二氧化硅 (例如,购自 Kobo 的 MSS 500/3H 和/或购自 Presperse 的 SPHERON L-1500)。

[0025] 该组合物可包含止汗剂、除臭剂、或化妆品领域中已知的其它成分。在大多数实施例中,止汗剂将包含对使用者的身体提供益处的其它功能成分。通常,此类材料对于个人护理组合物领域的普通技术人员而言为熟知的,并且可包含保湿剂、抗菌剂、除臭剂和香料。

[0026] 其它成分可包括成膜剂。例如,聚合物的水不溶性膜在腋窝皮肤上产生闭合作用,从而减少腋下湿度。此类膜为汗液通道的阻隔物。所用的聚合物应为闭合的、不溶于水的、并且粘度高,诸如,丙烯酸酯/辛基丙烯酰胺共聚物。

[0027] 该组合物还包含已知具有抗菌和除臭特性的成分。这些物质可包括,例如,1,6-二-(4-氯苯基双胍)己烷(氯己定)、3,4,4'-三氯碳酰苯胺、季铵化合物、丁香油、薄荷油、百里香油、三乙基柠檬酸盐、金合欢醇(3,7,11-三甲基-2,6,10-十二碳三烯-1-醇)、乙基己基甘油醚或聚甘油-3辛酸酯。具体地讲,具有亲酯性的聚甘油-3辛酸

酯 (TEGO[®] Cosmo P 813, 购自德固赛公司 / 赢创公司 (Degussa/Evonik))、植物源酯已用于以极低的浓度来减少在皮肤上引起气味的细菌。

[0028] 该组合物还可包含由 CTFA 分类的作为“乳化稳定”剂的直链醇、胺、醚醇、鲸蜡醇、硬脂醇和鲸蜡硬脂醇。

[0029] 在止汗剂组合物中可包含香料和芳香剂。香料产生呈香味形式的嗅觉响应, 并且此外可有助于遮蔽体臭。

[0030] 需要防腐剂以防止产品受到由细菌、酵母菌或霉菌引起的损坏, 并且保护产品免于消费者在使用期间不经意地污染。可用的防腐剂包括: 苯甲酸钠、乙基己基甘油和 1, 2- 辛二醇、苜醇、对羟基苯甲酸甲酯、对羟基苯甲酸丙酯、DMDM 乙内酰脲、甲基氯异噻唑啉酮、甲基异噻唑啉酮、咪唑烷基脲苯氧基乙醇、苯甲酸钠和苯甲酸。EDTA 及其盐通常用于进一步增强防腐。

[0031] 应当添加抗氧化剂, 以保护制剂避免氧化过程。可用的抗氧化剂包括抗坏血酸、生育酚乙酸酯和多元酚。在本发明中, 抗氧化剂诸如生育酚乙酸酯 (稳定的维生素 E) 可用作抗氧化剂。

[0032] 在该组合物中可包含润湿剂和保湿剂。合适的成分包括疏水剂、亲水剂以及它们的组合。保湿剂的示例为尿囊素、甘油、聚异丁烯酸甘油酯、泛醇、多元醇、神经酰胺、琉璃苣油 (亚油酸)、透明质酸、sodium peroxylinecarboxylic acid (PCA 钠)、小麦蛋白 (如, 月桂基二甲基羟丙基胺水解小麦蛋白)、毛发角蛋白氨基酸、泛醇; 月见草油; GLA 3 以及其它鱼油, 其可包括例如 ω -3 和 ω -6 油和 / 亚油酸; 和亚麻籽油, 以及它们的混合物。还可使用其它保湿剂。

[0033] 本发明的止汗剂组合物中可包含颜料和着色剂。

[0034] 对于在美学上更令人愉悦的产品而言, 可包含润肤剂, 诸如, 肉豆蔻酸异丙酯、矿物油和植物油, 该润肤剂通常产生呈增大的皮肤润滑性的触觉响应。该组合物可包含任何期望量的润肤剂, 从而实现期望的润肤效应。

[0035] 在本发明中, 非挥发性润肤剂为优选的。典型的非挥发性润肤剂包括非硅氧烷润肤剂和硅氧烷润肤剂。非挥发性、非硅氧烷润肤剂包括 C₁₂₋₁₅ 烷基苯甲酸盐。非挥发性硅氧烷材料可为聚醚硅氧烷、聚烷芳基硅氧烷或聚醚硅氧烷共聚物。本发明的例示性非挥发性硅氧烷材料为聚苯基三甲基硅氧烷。润肤剂的非限制性示例可见于美国专利 6, 007, 799。示例包括但不限于 PPG-14 丁醚、PPG-15 硬脂醚、PPG-3 肉豆蔻醚、硬脂醇、硬脂酸、单蓖麻油酸甘油酯、棕榈酸异丁酯、单硬脂酸甘油酯、异鲸蜡醇硬脂酸酯、硫酸牛酯、油醇、丙二醇、月桂酸异丙酯、貂油、脱水山梨醇硬脂酸酯、鲸蜡醇、氢化蓖麻油、硬脂酸十八烷基酯、氢化大豆甘油酯、异硬脂酸异丙酯、月桂酸己酯、十三烷二酸二甲酯、油酸癸酯、己二酸二异丙酯、n- 癸二酸二丁酯、癸二酸二异丙酯、棕榈酸 2- 乙基己酯、异壬酸异壬酯、异壬酸异癸酯、异壬酸异十三烷酯、棕榈酸 2- 乙基己酯、2- 乙基己基硬脂酸酯、二-(2- 乙基己基) 己二酸酯、二-(2- 乙基己基) 琥珀酸酯、肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、硬脂酸异丙酯、二十八烷醇、硬脂酸丁酯、单硬脂酸甘油酯、聚乙二醇、油酸、三甘醇、羊毛脂、蓖麻油、乙酰化羊毛脂醇、乙酰化羊毛脂、矿物、羊毛脂的异丙基酯、脂肪酸、矿物油、肉豆蔻酸丁酯、异硬脂酸、棕榈酸、PEG-23 油醇醚、油酸油醇酯、亚油酸异丙酯、乳酸鲸蜡酯、乳酸月桂酯、乳酸肉豆蔻酯、季铵化羟基烷、氨基葡萄糖酸酯、植物油、异油酸癸酯、异硬脂醇新戊酸酯、肉豆蔻酸肉豆

蔻酯、油醇乙氧基肉豆蔻酸酯、二甘醇硬脂酸酯、乙二醇单硬脂酸酯、硬脂酸肉豆蔻酯、羊毛脂酸异丙酯、石蜡、甘草酸、氢化硬脂酸酰胺。

[0036] 在一个实施例中，润肤剂选自线性硅氧烷、环状硅氧烷、烃类、具有多于 3 个碳原子的多羟基醇、包含聚丙二醇 (PPG) 部分并且以烷基醚封端的液体或固体聚亚烷基二醇醚、以及它们的组合。在另一个实施例中，润肤剂为挥发性硅氧烷，诸如环甲基硅酮或三硅氧烷，该硅氧烷的闪点为 100℃ 或更小。在另一个实施例中，润肤剂为非挥发性硅氧烷，诸如聚二甲基硅氧烷醇或更长链的聚二甲基硅氧烷。

[0037] 表面活性剂和乳化剂可用于本发明的止汗剂组合物。典型的表面活性剂公开于 US2003/0007939A1 中。可用于该组合物的乳化剂包括非离子、阴离子、阳离子、两性或两性离子物质及其共混物。合适的乳化剂公开于美国专利 3,755,560 和美国专利 4,421,769 中。示例为聚乙二醇 20、单月桂酸脱水山梨糖醇酯（聚山梨酸酯 20）聚乙二醇 20 硬脂醚 (Brij 78, 硬脂基聚氧乙烯醚 20)、月桂醇的聚乙二醇醚（月桂基聚氧乙烯醚 23）、聚山梨酯 80（吐温 80），和卵磷脂。

[0038] 如本领域已知的，该组合物为固体或凝胶棒、霜膏、洗剂、喷雾剂、挤压产品等的形式。

[0039] 因此，锌盐和其它活性剂可包含在如本领域中已知的载体中。止汗剂载体的主要类型在最多情况下落在以下类别中：(a) 溶液；(b) 乳液，水包油和油包水两者；并且包括洗剂和霜膏；(c) 悬浮液；(d) 凝胶；和 (e) 固体和半固体包括棒状产品。在一些载体包括液体、凝胶、悬浮液和乳液中，可通过如本领域已知的滚涂式涂覆器来提供止汗剂产品用于施涂。

[0040] 在很多情况下用于个人护理组合物的溶剂的示例（除水之外）为聚丙二醇、聚乙二醇、乙醇、甘油、乙二醇、1,2,4-丁三醇、1,2,6-己三醇、乙醇、异丙醇、丁三醇、山梨醇酯、丁二醇、丁烯二醇、己二醇、甲基丙二醇、吡咯烷酮、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砷、二甲基砷和类似的溶剂以及它们的混合物。

[0041] 本发明的组合物可为挤压产品，包括水-醇挤压产品。

[0042] 止汗剂组合物可具有凝胶形式。根据本发明的“凝胶”为胶体，其中分散相已与连续相结合，以产生粘稠的、胶状产品。根据本发明的凝胶可为水性的或非水性的。凝胶将通常包含载体，该载体包含如上所述的胶凝剂。凝胶的载体还将包含溶剂。还可包含为实现稳定性所需要的硅氧烷表面活性剂。

[0043] 水包油型和油包水型的乳液，诸如洗剂和霜膏是化妆品领域所熟知的并且可用于本主题发明。也可使用三相乳液，例如，水包油包水型。可用于乳液类型又可用于溶剂型载体中的溶剂的油通常包括烃油和蜡（如，矿脂、矿物油、微晶体蜡、聚烯烃、石蜡、野樱素、地蜡、聚乙烯、鲨烷、聚 α 烯烃、氢化聚异丁烯以及它们的组合物）。优选的是脂肪酸衍生物、胆固醇、胆固醇衍生物、甘油二酯和甘油三酯（如，蓖麻油、大豆油、衍生的大豆油（诸如，马来酸大豆油）、红花油、棉籽油、玉米油、胡桃油、花生油、橄榄油、鱼肝油、杏仁油、鳄梨油、棕榈油、芝麻油、植物油和植物油衍生物、葵花籽油、椰子油和衍生的椰子油、棉籽油和衍生的棉籽油、荷荷巴油、可可酯以及它们的组合物，以及已局部氢化或完全氢化的上文提及的油中的任一种）、乙酰甘油酯（如，乙酰化单甘油酯）、烷基酯、烯基酯（如，肉豆蔻酸油醇酯、硬脂酸油醇酯、油酸油醇酯、以及它们的组合物）、羊毛脂及其衍生物（如，羊毛脂、羊毛脂

油、羊毛脂蜡、羊毛脂醇、羊毛脂脂肪酸、羊毛脂酸异丙酯、乙酰化羊毛脂、乙酰化羊毛脂醇、羊毛脂醇亚油酸酯、羊毛脂醇蓖麻油酸酯、羟基化羊毛脂、氢化羊毛脂以及它们的组合物)、蜡酯(如,蜂蜡和蜂蜡衍生物、鲸蜡、肉豆蔻酸肉豆蔻酯、硬脂酸十八醇酯以及它们的组合物)、甾醇和磷脂,以及它们的组合。烷基酯的示例包括脂肪酸的异丙酯和长链脂肪酸的长链酯,如,SEFA(脂肪酸的蔗糖酯)、季戊四醇酯、芳族单酯、芳族二酯或芳族三酯、蓖麻油酸鲸蜡酯、棕榈酸异丙酯、肉豆蔻酸异丙酯、蓖麻油酸鲸蜡酯和蓖麻油酸硬脂酰酯。其它示例包括月桂酸己酯、月桂酸异己酯、棕榈酸异己酯、油酸癸酯、油酸异癸酯、硬脂酸十六烷酯、硬脂酸癸酯、异硬脂酸异丙酯、己二酸二异丙酯、己二酸二异己酯、己二酸二己基癸酯、癸二酸二异丙酯、乳酸酰基异壬酸月桂酯、乳酸肉豆蔻酯、乳酸鲸蜡酯、以及它们的组合。另外,其它合适的油包括乳三甘油酯(如,氢化乳脂甘油酯)和多元醇脂肪酸聚酯。还为可用的是,植物蜡,诸如,巴西棕榈蜡和小烛树蜡;甾醇,诸如,胆固醇、胆固醇脂肪酸酯;和磷脂,诸如,卵磷脂和衍生物、鞘脂、神经酰胺、糖鞘脂、以及它们的组合。

[0044] 基于滚涂式的水通常为水包油乳液而非油包水体系,因为后者的功效较弱。水包油形乳液的活性成分存在于外相中的可易于触及的溶液形式中。由于该活性成分在溶解状态下失去活性,因此配制人员可使用液体或固体止汗剂活性物质。

[0045] 本发明的组合物还可为透明的滚涂式油包水。这些组合物在市场上为相对新型的。它们展示出优异的美学并且在施用之后不会在皮肤上留下残余或沉积物。仅按照指定的添加次序在室温下就可实现清晰度。

[0046] 另选地,该组合物可为气溶胶。喷剂或气溶胶具有在施用时不用与手直接接触的优点。气体推进剂可为例如烃碳氢化合物(丙烷、异丁烯)、氯氟烃、二氧化碳或一氧化二氮。

[0047] 本发明的组合物可为悬浮液。

[0048] 在一个实施例中,该组合物为洗剂或霜膏。

[0049] 在另一个实施例中,该组合物为固体或半固体或棒,并且包含有效量的至少一种活性个人护理成分和固化剂,其中该组合物在室温下(如,25℃及以下)为固体或半固体的形式。因此,该组合物可包含例如蜡和油以及水性溶液的混合物,例如由硬酯酸钠固化的丙二醇和/或乙醇混合物。优选地,固化剂选自蜡和硬脂酸钠。

[0050] 本发明的固体个人护理产品还可细分并且以粉末形式使用。

[0051] 几乎所有止汗剂固体使用硬脂醇作为胶凝剂。通常添加润肤剂以赋予柔和的触觉并且添加润滑能力。大多数固体还包含滑石和/或二氧化硅。二氧化硅为有效的悬浮剂,该悬浮剂有助于保持活性成分均匀地悬浮在整个棒中。杂项成分通常包括着色剂、二氧化钛(遮光剂)和尿囊素(抚慰剂)。

[0052] 棒和固体实际上为络合化学体系,该络合化学体系需要以下成分的平衡,该成分被设计来制备若干执行因素的大多数,该执行因素包括支出(payout)、滑动或润滑、化学稳定性、软化温度和当然的功效。

[0053] 本发明的组合物还可为泡沫。因此,上述液体载体可包含气体在液相中的分散体。气体小球可具有从胶态到宏观的任何尺寸,如在肥皂泡中。典型的液体泡沫为用于剃刮膏等的那些。

[0054] 实例

[0055] 实例 1

[0056] 使用下述方法来比较若干化合物的体外止汗剂活性,该化合物包括酚磺酸锌、医药级乳酸锌和食品级乳酸锌、以及水合倍半氯化铝。

[0057] 方法 1:通过在碱性 pH 下的凝胶聚合而引起浊度测量。

[0058] 在该测试中,使用 Hach model 2100 实验室浊度计。制备包含氢氧化钠的一种溶液 (pH 为 8.5) 并且在混合之后在 10% 浓度下测试每种化合物。使用比浊法技术来测量通过碱性溶液中的凝胶聚合而引起的浊度。凝胶聚合作用指示止汗剂活性。所形成的不溶性凝胶应充当汗腺口处的栓塞,从而减少汗液从腋窝的流出。

[0059] 结果示于表 1 中。

[0060] 表 1:在溶液中添加 10% 的化合物之后的浊度的平均值

[0061]

样品	浊度 pH8.5 (NTU)	物理观察
水合倍半氯化铝	593.0	凝胶聚合
乳酸锌 (医药级)	538.0	凝胶聚合
乳酸锌 (食品级)	525.5	凝胶聚合
酚磺酸锌	1.8	液体
乳酸钠	0.5	液体
七水硫酸镁	1.5	液体
一水硫酸镁	0.9	液体
硫酸铵	1.1	液体

[0062]

五水硫酸镁	1.5	液体
硫酸钠	1.8	液体
乳酸钙	0.9	液体
硫酸镁 Andros	0.5	液体
乳酸铵	1.2	液体
乙酸钠	0.9	液体
乙酸钙	20.0	液体
氯化镁	0.4	液体
缓冲液 (对照)	0.0	液体

[0063] 示于表 1 中的结果表明食品级和医药级乳酸锌在碱性环境中具有凝胶聚合的高可能性,并且具有类似于铝盐的作用。

[0064] 方法 2:评估活性 - 蛋白质相互作用的体外研究

[0065] 使用布拉德福方法 (Bradford, M. M., “使用蛋白染色粘合原理对微量蛋白质进行快速和灵敏的定量” (A rapid and sensitive for the quantitation of microgram quantities of protein utilizing the principle of protein-dye binding.),《分析生物化学》(Analytical Biochemistry 72:248-254. 1976) 来测量由包括乳酸锌和酚磺酸锌的各种化合物产生的沉淀的蛋白质的量。使用牛血清白蛋白 (BSA) 作为基准蛋白质来生成校准曲线。测定蛋白质的线性浓度范围,其为 0.1-1.5mg/mL。BSA 颗粒、BSA 标准溶液和布拉德福试剂全部可购自西格玛奥德里奇公司 (Sigma-Aldrich) (批号: A7906, P0834, B6916)。

通过以下方式来制备缓冲溶液：将 875mL 的 0.1 摩尔的氢氧化钠 (SpecSol) 添加到 125mL 的 0.1 摩尔的磷酸二氢钾 (Merck) 中，并且将其 pH 调节到 BSA 的等电点 (pH 4.9)。

[0066] 首先测试不同化合物（浓度为 10% (m/v)）的溶液，之后测试范围为 1% 至 15% (m/v) 的浓度，以建立剂量响应曲线。

[0067] 过程：

[0068] 1. 通过以下方式制备缓冲液：将 875mL 的 0.1 摩尔的氢氧化钠添加到 125mL 的 0.1 摩尔的磷酸二氢钾中，将 pH 调节至 4.9。这是用于制备活性样品溶液、剂量响应曲线和蛋白质溶液的缓冲溶液。

[0069] 2. 将 5g 的活性材料添加到 50mL 的缓冲溶液中，以制备活性样品溶液以用于初始筛选。将 0.5、2.5、5.0 和 7.5g (1%、5%、10% 和 15% w/v 的溶液) 添加到 50mL 的缓冲溶液中，以建立剂量响应曲线。

[0070] 3. 将得自牛血清 (BSA) 的 4g 白蛋白（购自西格玛奥德里奇公司 (Sigma-Aldrich)）添加到 2000mL 的缓冲溶液中，以制备蛋白质溶液。

[0071] 4. 将 10mL 的样品溶液（步骤 2）添加到 50mL 的蛋白质溶液中，以制备反应溶液。

[0072] 5. 将 0.1mL 的反应溶液（步骤 4）添加到 3mL 的布拉德福试剂中，之后通过 0.45 μ m 的滤膜过滤，以制备分析溶液。在 595nm 下测量并且记录吸光度。通过比较标准曲线来测定蛋白质浓度。

[0073] 结果在表 2 和标 3 中示出。

[0074] 表 2：通过筛选测试获得的结果（10% 活性物质的溶液）

[0075]

样品	沉淀(BSA)
水合倍半氯化铝	100%
乳酸锌（医药级）	31%
酚磺酸锌	18%
乳酸钠	13%
七水硫酸镁	12%
一水硫酸镁	11%
硫酸铵	10%
五水硫酸镁	10%
硫酸钠	9%
乳酸钙	8%
硫酸镁 Andros	8%
乳酸铵	10%
乙酸钠	5%
乙酸钙	5%
乳酸锌（食品级）	5%
氯化镁	4%
缓冲液+BSA（对照）	0%

[0076] 表 3：通过剂量反应测定获得的结果

[0077]

样品名称	BSA 沉淀%
酚磺酸锌(1%)	5%

[0078]

酚磺酸锌(5%)	-1%
酚磺酸锌(10%)	21%
酚磺酸锌(15%)	31%
乳酸锌-医药级(1%)	9%
乳酸锌-医药级(5%)	7%
乳酸锌-医药级(10%)	13%
乳酸锌-医药级(15%)	18%
水合氯化铝(1%)	24%
水合氯化铝(5%)	56%
水合氯化铝(10%)	79%
水合氯化铝(15%)	95%
缓冲液 pH4.9 + BSA (对照)	0%

[0079] 表 2 和 3 所示的结果表明,增大锌盐(乳酸锌和酚磺酸锌)的量表现出剂量响应关系,从该剂量响应关系得出沉淀随着浓度增大而增多。根据上述结果,医药级乳酸锌和酚磺酸锌展示出成为阻塞剂的可能性。

[0080] 方法 3 :扫描电镜 (SEM) 和猪耳皮肤 (体外)

[0081] 使用扫描电镜 (SEM) 作为互补测定以使用猪耳皮肤来研究汗腺的栓塞。制备在利用不同的测试组合物处理之前和之后获取的猪耳皮肤样品的 SEM 图片并且随后进行比较。

[0082] 猪皮肤样品仅从耳部下方获得。将未经处理的皮肤样品(阴性对照)与用表 4(阳性对照)所示的水合氯化铝配方(阳性对照)或表 5 所示的乳酸锌配方处理的皮肤样品进行比较。在处理之前,通过顺序使用 70%乙醇、96%乙醇和 100%异丙醇洗涤来使皮肤样品脱水。将皮肤样品在干燥器中保持 3 天。在处理之前,皮肤样品涂覆有 15nm 的铂。

[0083] 表 4

[0084]

成分	功能	重量%
A :水	溶剂	Qsp
B :硬脂基聚氧乙烯醚 -2	表面活性剂	1.00-5.00
C :硬脂基聚氧乙烯醚 -21	表面活性剂	1.00-5.00
D :PPG-15 硬脂醚	润肤剂	1.00-10.00
E :水合氯化铝溶液 (50%)	止汗剂	12.00-40.00
F :淀粉辛烯基琥珀酸铝	吸收剂	0.1-3.0
G :二氧化硅	吸收剂	0.1-2.0

H : 乙基己基甘油 ; 1, 2- 辛二醇	皮肤调理试剂	0. 5-2. 0
I : 聚甘油 -3 辛酸酯	乳化剂	0. 1-1. 0

[0085]

J : 生育酚乙酸酯	皮肤调理剂	0. 01-1. 0
K : 苯甲酸钠	防腐剂	0. 1-0. 6

[0086] 表 5

[0087]

成分	功能	重量 %
A : 水	溶剂	Qsp
B : 硬脂基聚氧乙烯醚 -2	表面活性剂	1. 00-5. 00
C : 硬脂基聚氧乙烯醚 -21	表面活性剂	1. 00-5. 00
D : PPG-15 硬脂醚	润肤剂	1. 00-10. 00
E : 乳酸锌 (医药级)	止汗剂	5. 00-20. 00
F : 二氧化硅	吸收剂	0. 1-2. 0
G : 乙基己基甘油 ; 1, 2- 辛二醇	皮肤调理试剂	0. 5-2. 0
H : 聚甘油 -3 辛酸酯	乳化剂	0. 1-1. 0
I : 生育酚乙酸酯	皮肤调理剂	0. 01-1. 0
J : 苯甲酸钠	防腐剂	0. 1-0. 6

[0088] SEM 图片表明,用水合氯化铝制剂和乳酸锌配方的处理导致阻塞顶浆分泌管和毛发鞘,从而表明这两个配方将有效地用于减少出汗。

[0089] 实例 2

[0090] 以下物质为根据本发明的止汗剂组合物。

[0091] 滚涂式乳液配方示于表 6a 和 6b 中,该配方表现出优异的物理稳定性和施用特性。

[0092] 表 6a

[0093]

成分	功能	重量 %
A : 乳酸锌	止汗剂	3. 50
B : 硬脂基聚氧乙烯醚 -21	表面活性剂	2. 00

C :硬脂基聚氧乙烯醚-2	表面活性剂	2.00
D :硬脂基聚氧乙烯醚-5 硬脂酸酯	皮肤调理	1.00
E :环甲基硅酮 (和) PPG-15 硬脂醚	皮肤调理	5.00
F :去离子水	溶剂	75.5
G :吸收剂	吸收剂	6.00
H :芳香剂	香料	适量

[0094] 表 6b

[0095]

成分	功能	重量 %
A :酚磺酸锌	止汗剂	5.00
B :硬脂基聚氧乙烯醚-21	表面活性剂	2.00
C :硬脂基聚氧乙烯醚-2	表面活性剂	2.00
D :硬脂基聚氧乙烯醚-5 硬脂酸酯	皮肤调理	1.00
E :环甲基硅酮 (和) PPG-15 硬脂醚	皮肤调理	5.00
F :去离子水	溶剂	75.5
G :吸收剂	吸收剂	6.00
H :芳香剂	香料	适量

[0096] 步骤

[0097] 1. 组合 B、C、D 和 E 并且加热到 700C

[0098] 2. 在 700C 下,单独地加热 A、和 F

[0099] 3. 在搅拌下将 B/C/D/E 添加到 F

[0100] 4. 匀化混合物 1-3 分钟

[0101] 5. 在连续搅拌下冷却至 35℃

[0102] 6. 在搅拌下将 G 缓慢添加到乳液中

[0103] 7. 再次匀化混合物 1-3 分钟

[0104] 8. 添加 I

[0105] 9. 填充到合适的容器中

[0106] 本发明的组合物还可为透明的滚涂式油包水,该组合物展示出优异的美学,并且在施用之后在皮肤上不留下残余或沉积物。仅按照指定的添加次序在室温下实现清晰度。根据本发明的此类组合物的实例示于表 7a 和 7b 中。

[0107] 表 7a

[0108]

成分	功能	重量%
A :乳酸锌	止汗剂	3.50
B :去离子水	溶剂	8.75
C :双丙二醇	溶剂	3.00
D :PEG-7 椰油酸甘油酯	皮肤调理	18.20
E :环甲基硅酮 (和) 聚二甲基硅氧烷共聚多元醇	皮肤调理	45.50
F :鲸蜡硬脂酸辛酸酯	表面活性剂	3.20
G :聚山梨酸酯 20	表面活性剂	1.00

[0109]

H :去离子水	溶剂	4.10
I :肉豆蔻酸异丙酯	皮肤调理	1.00
J :吸收剂	吸收剂	6.00
K :芳香剂	香料	0.75

[0110] 表 7b

[0111]

成分	功能	重量%
A :酚磺酸锌	止汗剂	5.00
B :去离子水	溶剂	8.75
C :双丙二醇	溶剂	3.00
D :PEG-7 椰油酸甘油酯	皮肤调理	18.20
E :环甲基硅酮 (和) 聚二甲基硅氧烷共聚多元醇	皮肤调理	45.50
F :鲸蜡硬脂酸辛酸酯	表面活性剂	3.20
G :聚山梨酸酯 20	表面活性剂	1.00
H :去离子水	溶剂	4.10

I :肉豆蔻酸异丙酯	皮肤调理	1. 00
J :吸收剂	吸收剂	6. 00
K :芳香剂	香料	0. 75

[0112] 步骤

[0113] 1. 组合 A、B、C 并且伴有上置式搅拌（介质搅拌）

[0114] 2. 缓慢添加 D, 搅拌均匀

[0115] 3. 缓慢添加 E, 搅拌均匀

[0116] 4. 缓慢添加 F, 搅拌均匀

[0117] 5. 预混合 G 和 H, 缓慢添加到主批料中

[0118] 6. 缓慢添加 J, 搅拌均匀

[0119] 7. 预混合 I 和 K, 缓慢添加到主批料中搅拌直到澄清

[0120] 8. 倾注到合适的容器内

[0121] 本发明的组合物也可为泡沫。因此, 上述液体载体可包含气体在液相中的分散体。气体小球可具有从胶态到宏观的任何尺寸, 如在肥皂泡中。典型的液体泡沫为用于剃刮膏等的那些。