

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷



[12] 发明专利说明书

A61K 7/027

A61K 7/032

A61K 7/32

A61K 7/48

[21] ZL 专利号 00805101.1

[45] 授权公告日 2005 年 6 月 1 日

[11] 授权公告号 CN 1203832C

[22] 申请日 2000.2.10 [21] 申请号 00805101.1

[30] 优先权

[32] 1999.2.12 [33] US [31] 09/249,217

[86] 国际申请 PCT/US2000/003464 2000.2.10

[87] 国际公布 WO2000/047170 英 2000.8.17

[85] 进入国家阶段日期 2001.9.17

[71] 专利权人 宝洁公司

地址 美国俄亥俄

[72] 发明人 M·L·维特 D·E·塔兰蒂诺

N·M·施奈克

M·G·小阿姆斯特朗

审查员 雷耀龙

[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 李 瑛

权利要求书 1 页 说明书 39 页

[54] 发明名称 含有维生素 B₃ 的化妆品组合物

[57] 摘要

本发明涉及化妆品组合物，包括：a)0.01% - 50% (重量) 的维生素 B₃ 化合物；b)0% - 90% (重量) 的润肤组分，其中包含 0% - 100% (重量) 的在室温下呈液态的油；c)0.01% - 80% (重量) 的极性溶剂；d)0% - 30% (重量) 的表面活性剂；e)0% - 90% (重量) 的固化剂；和 f)0% - 90% 的色料，以无水组分计，其中将维生素 B₃ 化合物加入到组合物中使得维生素 B₃ 化合物的浓度超过维生素 B₃ 化合物在组合物中的饱和溶解度。

I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

1. 化妆品组合物，包括：

a) 0.01重量%—50重量%的维生素B₃化合物；

b) 0重量%—90重量%的润肤组分；

c) 0.01重量%—80重量%的极性溶剂；

d) 0重量%—30重量%的表面活性剂；

e) 0重量%—90重量%的固化剂，该固化剂的熔点为65℃-125℃；

和

f) 0%—90%的色料，以无水组分计，

其中将维生素B₃化合物加入到组合物中使得维生素B₃化合物的浓度超过维生素B₃化合物在20℃下在组合物中的饱和溶解度。

2. 根据权利要求1的化妆品组合物，其中维生素B₃化合物的浓度比维生素B₃化合物在20℃下在组合物中的饱和溶解度大至少150%。

3. 根据权利要求1的化妆品组合物，其中所说的维生素B₃化合物是烟酰胺。

4. 根据权利要求1的化妆品组合物，其中所说的维生素B₃化合物是基本上非复合的。

5. 根据权利要求1的化妆品组合物，其中所说的极性溶剂选自水、甘油、丙二醇、丁二醇、己二醇、乙醇、泛醇及其混合物。

6. 根据权利要求1的化妆品组合物，其中选择所说的润肤组分使得所用材料的类型中至少99%的溶解度参数的差别不多于0.1—0.8。

7. 根据权利要求1的化妆品组合物，其中所说的润肤组分是极性润肤剂，其中维生素B₃化合物在30℃下在极性润肤剂中的溶解度大于1.5%。

含有维生素B₃的化妆品组合物

发明领域

本发明涉及主要由作为连续相的亲脂性物质组成并含有维生素B₃类化合物的局部用化妆品组合物。

发明背景

烟碱酸，也称作维生素B₃，是烟酸的俗名。烟酸的生理活性形式为烟酰胺，它也是维生素B₃族化合物的一员。烟酸和烟酰胺(烟酸酰胺)在体内是作为两种酶的组成成分发挥功能：烟酰胺腺嘌呤二核苷酸(NAD)和烟酰胺腺嘌呤二核苷酸磷酸酯(NADP)。直到最近，这些维生素B₃类化合物仅用于治疗烟酸缺失和糙皮病。

然而，现今发现维生素B₃类化合物还适用于皮肤护理活性剂的领域。英国专利1,370,236描述了含有0.5%至10%烟酸的亮肤组合物。美国专利4,096,240公开了0.1%至10%烟酰胺在亮肤中的应用。还发现维生素B₃类化合物可以有效调节人体肌肤的纹理。参见Oblong等人的PCT申请WO 97/39733。

然而，当局部施用于皮肤时，仅有大约2—4%所施用的维生素B₃类化合物真正渗透到皮肤中。因此，对于含维生素B₃类化合物的化妆品组合物存在着需求，所需组合物应提供改进的维生素B₃类化合物的皮肤渗透性。本发明人发现，将维生素B₃类化合物掺入极性溶剂中以使维生素B₃类化合物超过极性溶剂的饱和溶解度的化妆品组合物可改善维生素B₃类化合物的总的皮肤渗透性。

所以，本发明的一个方面提供可提高局部施用的维生素B₃类化合物渗透过皮肤的量的化妆品组合物。

本发明的另一方面提供含有极性溶剂和作为未溶解的结晶的维生素B₃类化合物的化妆品组合物。

本发明的再一方面提供含有极性溶剂和作为未溶解的结晶的维生素B₃类化合物的唇膏组合物。

从下面的详细描述这些方面和其它方面将变得更加清楚。

发明概述

本发明涉及化妆品组合物，其含有：

- a) 0.01%—50%(重量)的维生素B₃化合物；
- b) 0%—90%(重量)的润肤组分，其中包含0%—100%(重量)的在室温下呈液态的油；
- c) 0.01%—80%(重量)的极性溶剂；
- d) 0%—30%(重量)的表面活性剂；
- e) 0%—90%(重量)的固化剂；和
- f) 0%—90%的色料，以无水组分计，

除非另有说明，所有百分比、份数和比例是以本发明化妆品组合物的总重量计。除非另有说明，所有此类有关所列组分的重量均以活性含量计，所以不包括载体或市售原料中可能包含的副产物。

发明详述

定义

在此所用的术语“含有”是指组合物含有其他组分，这些组分与该组合物相容并且优选那些大体上不破坏本发明的缔合结构的成分。该术语包含术语“由…组成”和“基本上由…组成”。

在此所用的术语“化妆品”包括彩妆、粉底和护肤产品。术语“彩妆”是指在面部着色的产品，包括粉底、黑色和褐色，即睫毛油、遮盖剂、眼线、眉用色料、眼影、胭脂、唇用色料等。护肤产品是那些用来处理或护理、湿润、改善或清洁皮肤的产品。短语“护肤品”所指的产品包括，但不限于胶粘剂、绷带、牙膏、无水隔离保湿剂、洗衣粉、织物柔软剂、隔离式药物释放贴剂、止汗剂、除臭剂、指甲抛光剂、散剂、织物、擦物、固体乳化体湿敷剂

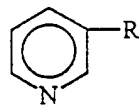
(compact)、无水发用调理剂等。术语“粉底”是指液体、膏霜、摩丝、水粉饼、遮盖剂或类似的在化妆上产生或重新平抚皮肤整体色泽的产品。制备粉底能够更好地对湿性和/或油性皮肤起作用。

必要组分

维生素B₃成分

本发明含有安全和有效量的天然或合成维生素B₃类化合物。本发明的组合物中优选约含0.01% - 约50%，更优选约含0.1% - 约30%，更优选约含0.5% - 约20%，首选约1% - 约10%的维生素B₃类化合物。

在此所用的“维生素B₃类化合物”是指如下式所示的化合物：



其中R是 $-\text{CONH}_2$ (即烟酰胺)、 $-\text{COOH}$ (即烟酸) 或 $-\text{CH}_2\text{OH}$ (即烟醇)；其衍生物；和上述任何物质的盐。

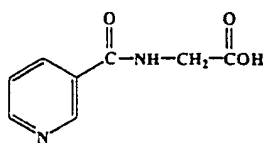
上述维生素B₃类化合物的衍生物实例包括：烟酸酯，包括烟酸的非血管舒张性酯，烟酰基氨基酸，羧酸的烟醇酯，烟酸N-氧化物和烟酰胺N-氧化物。

适用的烟酸酯包括： C_1 - C_{22} 、优选 C_1 - C_{16} 、更优选 C_1 - C_6 醇的烟酸酯。所述醇适宜为直链或支链、环状或开链、饱和或不饱和(包括芳族)的、取代或未取代的。所述酯类优选是非潮红性的。这里采用的“非潮红性的”是指在将组合物涂敷在对象的皮肤后这类酯不会造成明显的潮红反应(虽然这类化合物可以产生肉眼不可见的血管舒张作用，但总人数中的大多数人不会出现明显的潮红反应)。另外，在较高剂量为潮红性的烟酸物质可以以较低剂量使用以便减小潮红作用。烟酸的非潮红性酯包括烟酸生育酚酯和六烟酸肌醇酯；优选的是烟酸生育酚酯。

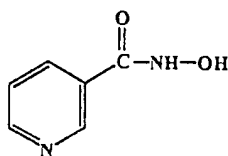
维生素B₃类化合物的其它衍生物是由一个或多个酰氨基氢的取

代获得的烟酰胺衍生物。本发明所用烟酰胺衍生物的非限定实例包括：烟酰基氨基酸，例如由活化烟酸化合物(如烟酰叠氮化物或烟酰氯)与氨基酸反应衍生的；和有机羧酸(如C1-C18)的烟醇酯。此类衍生物的具体实例包括烟尿酸和烟酰基异羟肟酸，其具有下列化学结构：

烟尿酸



烟酰基异羟肟酸：



烟醇酯的实例包括羧酸水杨酸、乙酸、乙醇酸、棕榈酸等的烟醇酯。在此适用的维生素B₃类化合物的其它非限定实例是2-氯烟酰胺、6-氨基烟酰胺、6-甲基烟酰胺、n-甲基烟酰胺、n,n-二乙基烟酰胺、n-(羟甲基)-烟酰胺、喹啉酰亚胺、烟酰苯胺、n-苄基烟酰胺、n-乙基烟酰胺、尼芬那宗、烟碱醛、异烟酸、甲基异烟酸、硫烟酰胺、烟胍酰胺、1-(3-吡啶基甲基)脲、2-巯基烟酸、烟酸环己醇酯和烟酰哌嗪。

上述维生素B₃类化合物的实例是本领域熟知的，并且可以从多个来源商购，例如，Sigma化学公司(St. Louis, MO)；ICN Biomedicals公司(Irvin, CA)和Aldrich化学公司(Milwaukee, WI)。

本发明可以采用一种或多种维生素B₃类化合物。优选的维生素B₃类化合物是烟酰胺和烟酸生育酚酯。更优选的是烟酰胺。

当使用时，优选的烟酰胺的盐、衍生物和盐的衍生物是在上述

调节皮肤状况的方法中具有基本上与烟酰胺相同功效的那些化合物。

维生素B₃类化合物的盐也适用于此。在此适用的维生素B₃类化合物的盐的非限定实例包括有机或无机盐，例如具有阴离子无机物质的无机盐(例如，氯化物、溴化物、碘化物、碳酸盐，优选氯化物)，和有机羧酸盐(包括一-、二-和三-C1-C18羧酸盐，如乙酸盐、水杨酸盐、羟乙酸盐、乳酸盐、苹果酸盐、柠檬酸盐，优选一元羧酸盐，例如乙酸盐)。所属领域技术人员可以很容易地制备维生素B₃类化合物的这些和其他盐，例如W. Wenner, "L-抗坏血酸和D-异抗坏血酸与烟酸及其酰胺的反应", J. Organic Chemistry, VOL. 14, 22-26 (1949)所述，该文献在此被引入作为参考。Wenner描述了烟酰胺的抗坏血酸盐的合成。

在一个优选实施方案中，维生素B₃类化合物的环氮实质上是化学游离的(例如未键合和/或未受阻)，或在传送给皮肤后大体上转变为化学游离的("化学游离"在下文中另外称作"未复合")。更优选地，维生素B₃类化合物基本上未复合。因此，如果组合物含有盐或其他复合形式的维生素B₃类化合物，当将该组合物传送到皮肤上时，所述复合物优选是大体上可逆的，更优选基本上是可逆的。例如，所述复合物应该在约5.0至约6.0的pH下实质上是可逆的。所属领域普通技术人员很容易测定上述的可逆性。

更优选的维生素B₃类化合物在释放至皮肤之前在组合物中大体上是未复合的。减少或防止不利复合物形成的途径的实例包括不使用那些与维生素B₃类化合物形成大体上不可逆或其它复合物的物质，pH调节，离子强度调节，表面活性剂的应用以及其中维生素B₃类化合物和与其复合的物质的配制是在不同的相中进行。上述途径是所属领域普通技术人员熟知的。

因此，在一个优选实施方式中，维生素B₃类化合物含有有限量的盐形式，并且更优选实质上不含有维生素B₃类化合物的盐。优选维生素B₃化合物含有少于约50%的所述盐，更优选基本上不含有盐

形式。pH为约4至约7的组合物中的维生素B₃类化合物通常含有小于约50%的盐形式。

含有的维生素B₃类化合物可以是实质上纯净的原料，或通过适当物理和/或化学分离方法由天然(例如植物)来源获得的提取物。优选的是维生素B₃类化合物实质上纯净，更优选的是基本上纯净。

本发明的化妆品组合物包含维生素B₃化合物和极性溶剂，其中维生素B₃化合物的浓度超过维生素B₃化合物在组合物中的饱和溶解度(在环境温度下；即，在大约20℃)。结果，一部分维生素B₃化合物以未溶解的形式存在。优选地，维生素B₃化合物的浓度比维生素B₃化合物在组合物中在环境温度下的饱和溶解度大至少50%，更优选至少大100%，最优选至少大150%或更大。

极性溶剂

适合用于本发明的溶剂包括能够溶解维生素B₃化合物的任何极性溶剂。

适用的极性溶剂包括：水；醇，例如乙醇、丙醇，异丙醇，己醇和苜醇；多元醇，例如丙二醇、聚乙二醇、丁二醇、己二醇、麦芽糖醇、山梨糖醇和甘油；溶解在甘油中的泛醇；矫味油，和它们的混合物。也可以采用这些溶剂的混合物。优选的极性溶剂是多羟基醇和水。优选溶剂的实例包括甘油、溶于甘油中的泛醇、二醇类化合物如丙二醇和丁二醇、聚乙二醇类化合物、水和它们的混合物。首选采用的极性溶剂是醇、甘油、泛醇、丙二醇、丁二醇和它们的混合物。

典型地，本发明的化妆品组合物应含有约0.1%至约80%、优选约0.5%至约60%、更优选约1%至约30%和首选约3%至约18%的极性溶剂。

任选组分

润肤剂组分

润肤剂组分也是本发明的组合物所必需的。润肤剂组分可包含脂肪、油、脂肪醇、脂肪酸和有助于涂敷和粘着、产生光泽并且首

要的是增强保湿作用的酯类。

适用的润肤剂是：异硬脂酸衍生物、棕榈酸异丙酯、羊毛脂油、二聚酸二异丙酯、马来酸化大豆油、棕榈酸辛酯、异硬脂酸异丙酯、乳酸鲸蜡酯、蓖麻油酸鲸蜡酯、醋酸生育酚、乙酰化羊毛脂醇、乙酸鲸蜡酯、苯基聚三甲基硅氧烷、油酸甘油酯、亚油酸生育酚、麦胚甘油酯类化合物、花生基(arachidyl)丙酸酯、乳酸肉豆蔻酯、油酸癸酯、蓖麻油酸丙二醇酯、异丙基羊毛酯(lanolate)、季戊四醇四硬脂酸酯、新戊二醇二辛酸酯/二癸酸酯、氯化椰油基甘油酯、异壬酸异壬酯、异壬酸异十三烷酯、肉豆蔻酸肉豆蔻酯、柠檬酸三异鲸蜡酯、鲸蜡醇、辛基十二烷醇、油醇、泛醇、羊毛脂醇、亚油酸、亚麻酸、脂肪酸的蔗糖酯、羟基硬脂酸辛酯及其混合物。其他适当润肤剂的实例可以参见Cosmetic Bench Reference, pp. 1.19-1.22 (1996)。

特别优选的润肤剂是极性润肤剂乳化剂如直链或支链聚甘油酯。此处所用的所谓“极性润肤剂”是指具有至少一个极性部分且其中维生素B₃类化合物在极性润肤剂中的溶解度(在30℃下)大于约1.5%，优选大于约2%，更优选大于约3%。适宜的极性润肤剂包括但不限于多元醇酯和多元醇醚如直链或支链聚甘油酯和聚甘油醚。这类润肤剂的非限制性实例包括PG3二异硬脂酸酯、聚甘油-2-倍半异硬脂酸酯、聚甘油-5-二硬脂酸酯、聚甘油-10-二硬脂酸酯、聚甘油-10-二异硬脂酸酯、乙酰化甘油单酸酯、甘油酯、三辛酸酯/癸酸甘油酯、蓖麻醇酸甘油酯、异硬脂酸甘油酯、肉豆蔻酸甘油酯、亚油酸甘油酯、聚亚烷基二醇如PEG600、甘油单酸酯、2-甘油单月桂酸酯、脱水山梨醇酯及其混合物。

非极性润肤剂也是优选的。此处所用的所谓“非极性润肤剂”是指具有非永久性电偶极矩的任何润肤剂乳化剂，并且其中维生素B₃类化合物在该非极性润肤剂中的溶解度(在30℃下)小于约1.5%，优选小于约1.0%，更优选小于约0.5%。适用的非极性润肤剂包括，但不限于，酯和直链或支链烃。这类润肤剂的非限制性实例

包括异壬酸异壬酯、异硬脂酸异丙酯、羟基硬脂酸辛酯、二聚酸二异丙酯、羊毛脂油、棕榈酸辛酯、棕榈酸异丙酯、链烷烃、异链烷烃、乙酰基羊毛脂、脂肪酸蔗糖酯、肉豆蔻酸异丙酯、硬脂酸异丙酯、矿物油、硅油、聚二甲基硅氧烷、尿囊素、异十六烷、异十二烷、凡士林，和它们的混合物。

维生素B₃类化合物在极性或非极性润肤剂中的溶解度的测定方法如下所述。

适用的油包括酯、甘油三酯、烃类化合物和聚硅氧烷类化合物。这些可以是单一物质或一种或多种物质的混合物。它们一般占润肤剂组分的0%至约100%，优选约5%至约90%，和首选约70%至约90%。

油可以起到润肤剂作用并且另外赋予所述化妆品组合物如唇膏以粘度、粘合性和阻力特性。适用的油的实例包括辛酸甘油三酯；癸酸甘油三酯；异硬脂酸甘油三酯；己二酸甘油三酯；肉豆蔻酸乙酸丙二醇酯；羊毛脂；羊毛脂油；聚丁烯；棕榈酸异丙酯；肉豆蔻酸异丙酯；异硬脂酸异丙酯；癸二酸二乙酯；己二酸二异丙酯；醋酸生育酚；亚油酸生育酚；硬脂酸十六烷基酯；乳酸乙酯；油酸鲸蜡酯；蓖麻油酸鲸蜡酯；油醇；十六烷基醇；羟基硬脂酸辛酯；辛基十二烷醇；麦胚油；氢化植物油；蓖麻油；矿脂；改性羊毛脂；支链烃；醇和酯；玉米油；棉籽油；橄榄油；棕榈仁油；菜籽油；红花油；霍霍巴油；月见草油；鳄梨油矿物油；牛油，棕榈酸辛酯，马来酸大豆油，甘油三辛酸酯，二聚酸二异丙酯，和挥发性和非挥发性硅油，包括苯基聚三甲基硅氧烷。

本发明优选的油是乙酰甘油酯；醇和多元醇的辛酸酯和癸酸酯，如二醇和甘油的这些酯；醇和多元醇的蓖麻油酸酯，如蓖麻油酸鲸蜡酯；PG-3二异硬脂酸酯，聚甘油醚，聚甘油酯，辛酸甘油三酯，癸酸甘油三酯，异硬脂酸甘油三酯，己二酸甘油三酯，苯基聚三甲基硅氧烷，羊毛脂油，聚丁烯，棕榈酸异丙酯，异硬脂酸异丙酯，蓖麻油酸鲸蜡酯，辛基十二烷醇，油醇，氢化植物，蓖麻油，

改性羊毛脂，棕榈酸辛酯，羊毛脂油，马来酸化大豆油，蓖麻油酸鲸蜡酯，甘油三辛酸酯，二聚酸二异丙酯，合成羊毛脂衍生物和支链醇，脂肪酸的蔗糖酯，羟基硬脂酸辛酯及其混合物。

有利地是，选择所用的油，以使多数(至少约75%，优选至少约80%和首选至少约99%)种类的油具有的溶解度参数的差别不超过约1至约0.1、优选约0.8至约0.1。

润肤剂组分占所述化妆品组合物的约1%至约90%，优选约10%至约80%，更优选约20%至约70%，最优选约40%至约60%。

表面活性剂

适用的表面活性剂是可以形成乳化或缔合结构的那些物质。表面活性剂乳化剂可以占配方的0%至约20%，优选0%至约15%，最优选约1%至约10%。适宜乳化剂的实例可参见美国专利5,085,856 (Dunphy等人)；日本专利特开昭61-83110；欧洲专利申请EP 522624 (E1-Nokaly等人)。其它适宜的乳化剂可参见Cosmetic Bench Reference, pp. 1.22, 1.24-1.26 (1996)，所有文献在此全文引入作为参考。

在此也可使用在环境温度下当与极性溶剂混合时能够形成缔合结构、优选层状液晶或反转六边形的表面活性剂。在此所用的环境温度/室温可以是约18℃至约27℃，优选约20℃至约25℃，这取决于多种可变因素，例如地理位置，即亚热带对温带地区。如果能够形成缔合结构，所属领域普通技术人员能够在环境温度下测定出来。适用的表面活性剂具有的克拉夫特点一般等于或低于约20℃的环境温度，或通常等于或低于约18℃至约27℃，优选等于或低于约20℃至约25℃。

所属领域熟知Krafft点的定义，并且所属领域的一名普通技术人员可以测量出表面活性剂的Krafft点。一般而言，Krafft点是表面活性剂的烃链的熔点。它也可以表示因超过临界胶束浓度并形成胶束所致的缔合胶体在水中的溶解度急速增高时的温度。参见Ekwall., P., "Composition, Properties and Structure of

Liquid Crystalline Phases in Systems of Amphiphilic Compounds”Advances in Liquid Crystals Vol. I, Chapter I, p. 81.

在为测定形成缔合结构的能力制备表面活性剂和极性溶剂的联合样本中，要求表面活性剂充分溶于极性溶剂中以使缔合结构可以在环境温度下形成。一名所属领域的普通技术人员能够测定相容性相互作用。

任何在环境温度下形成缔合结构并且适用于化妆品的表面活性剂适合于本发明。适用于化妆品的表面活性剂不存在皮肤病学或毒理学问题。阴离子表面活性剂、非离子表面活性剂、阳离子表面活性剂、两性表面活性剂及其混合物也适用。优选采用Krafft点等于或低于约环境温度的阴离子表面活性剂、非离子表面活性剂、阳离子表面活性剂、两性表面活性剂及其混合物。更优选Krafft点等于或低于约环境温度的非离子表面活性剂、阳离子表面活性剂、两性表面活性剂及其混合物。

适用于形成缔合结构的表面活性剂参见El-Nokaly的美国专利5,843,407，在此引入作为参考。

本发明的缔合结构也可以有效改善维生素B₃类化合物的皮肤渗透性。不受理论的限制，相信所述缔合结构通过在皮肤上形成连续或不连续双层或多层表面或者起隔离的作用或者在皮肤上充当截留基质。在此所用的术语“隔离”是指防止或阻隔某些事物，在此处的情况中，防止水分(通过蒸发)和维生素B₃类化合物(通过膜结合)由皮肤表面逸出。在此所用的术语“截留基质”是指能够与皮肤结合的单层、多层囊泡、圆柱形胶束、六边形液晶、层状液晶或立方相液晶。截留基质捕捉维生素B₃类化合物，因此维持皮肤与维生素B₃类化合物接触。此外，由于本发明的缔合结构是热力学稳定的，所以可以肯定截留或结合的极性溶剂随时间内缓慢释放。因此极性溶剂的缓慢释放有助于使维生素B₃类化合物保持为溶解形式，由此提高维生素B₃类化合物的皮肤渗透性。甚至可以通过加入上述蜡质或蜡

样(或凝胶样)固化剂来增强隔离效应。

表面活性剂可以以约4%至约97%、优选约5%至约95%、更优选约20%至约90%和首选约30%至约70%的缔合结构的水平应用。

固化剂

本发明的化妆品组合物还可以含有一种或多种可以有效固化该化妆品组合物中所用的特定液体基质材料的物质，在此单独或总称为“固化剂”。(在此所用的术语“固化”是指液体基质在环境温度下成为固体或半固体的物理和/或化学转变，即形成具有稳定物理结构并在正常使用条件下沉积在皮肤上的最终组合物)。所属技术领域技术人员懂得，化妆品组合物采用的特定固化剂的选择应取决于预期组合物的具体类型，即凝胶或蜡基，所要求的流变学，使用的液体基质物质和组合物中采用的其它物质。固化剂优选以约0.1%至约90%、更优选约1%至约50%、甚至更优选约5%至约40%、最优选约3%至约20%的浓度存在。

本发明的蜡质化妆棒的实施方式适宜含有约5%至约50%(重量)的蜡质固化剂。在此所用的术语“蜡质固化剂”是指具有蜡样特征的固化物质。所述蜡质物质也可以用作润肤剂。在蜡质物质中适用于本发明的是高熔点蜡，即具有约65℃至约125℃的熔点，例如蜂蜡、鲸蜡、巴西棕榈蜡、月桂子蜡、小烛树蜡、褐煤蜡、地蜡、纯地蜡、石蜡、合成蜡如Fisher-Tropsch蜡、微晶蜡和它们的混合物。纯地蜡、地蜡、白蜂蜡、合成蜡及其混合物属于在此优选的高熔点蜡。含有在此所述的蜡的组合物公开在U.S. 专利4,049,792(Elsnau, 1977. 9. 20授权，该文献在此全文引入作为参考)。具有约37℃至约75℃熔点的低熔点蜡适用于本发明的蜡棒实施方案。本发明的含有挥发性硅油作为液体基质物质的蜡棒实施方式优选含有约10%至约35%，更优选约10%至约20%(重量)的低熔点蜡。此类物质包括具有含约8至30个碳原子的脂肪链的脂肪酸、脂肪醇、脂肪酸酯和脂肪酸酰胺，和它们的混合物。优选的蜡样物质包括鲸蜡醇、棕榈酸、硬脂醇、山嵛酸酰胺、动物脂肪酸的蔗糖

酯、聚乙二醇的一和二-脂肪酸酯，和它们的混合物。特别优选硬脂醇、鲸蜡醇及其混合物。适用于本发明的脂肪酸、脂肪醇和其他蜡样物质还公开在下列文献中，这些文献全部在此引入作为参考：美国专利 4,151,272 Geary 等，1979.4.24 发布；美国专利 4,229,432, Geria, 1980.8.21 发布；和美国专利 4,280,994, Turney, 1981.7.28 发布；“The Chemistry and Technology of Waxes”, A. H. Warth, 2nd Edition, reprinted in 1960, Reinhold Publishing Corporation, pp 391-393 和 421；“The Petroleum Chemicals Industry”, R. F. Goldstein and A. L. Waddeam, 3rd Edition (1967), E & F. N. Span Ltd., pp 33-40；“The Chemistry and Manufacture of Cosmetics”, M. G. DeNavarre, 2nd edition (1970), Van Nostrand & Company, pp 354-376；和在“Encyclopedia of Chemical Technology”, Vol. 24, Kirk-Othmer, 3rd Edition (1979) pp 466-481。在本发明蜡棒中用作固化剂的优选蜡样物质公开在美国专利 4,126,679, Davy 等，1978.11.21 中，该文献在此全文引入作为参考。优选的蜡样物质的混合物包括含有约 14 至约 18 碳原子的碳链的脂肪醇，和链长等于或长于 20 个碳原子的醇，其中最终的混合物含有约 1% 至约 3% (重量) 的长链脂肪醇。含有这些脂肪醇混合物的组合物描述在欧洲专利说明书 No. 117,070, May, 1984.8.29 公开 (在此引入作为参考)。

本发明也可以采用生物聚合体，例如公开在 Dunphy 等的欧洲专利申请 No. 522624 中的那些生物聚合体，其在此全文引入作为参考。

本发明的凝胶棒实施方式适宜含有约 3% 至约 30%，优选约 3% 至约 10% (重量) 的固化剂。固化剂的具体用量应取决于特定固化剂和所用的液体基质物质，和凝胶棒的预期物理特性。本发明凝胶棒实施方式中所用的固化剂一般是表面活性化合物，其形成网状结构使液体基质物质固定或固化成为凝胶。此类固化剂包括：皂类，例如高级脂肪酸的钠和钾盐，即具有 12 至 22 个碳原子的酸；高级脂肪酸

的酰胺；醇胺的高级脂肪酸酰胺；二苯甲醛-山梨糖醇缩醛；碱金属和碱土金属的乙酸盐、丙酸盐和乳酸盐；蜡，如小烛树蜡和巴西棕榈蜡；和它们的混合物。在那些固化剂中本发明的凝胶棒实施方式优选使用硬脂酸钠、棕榈酸钠、硬脂酸铝、羟基硬脂酸镁铝，和它们的混合物。含有在此所述的固化剂的凝胶棒组合物公开在下列专利文献中，它们在此全文引入作为参考：美国专利2,900,306, Slater, 1959.8.18发布；美国专利3,255,082, Barton, 1966.6.7发布；美国专利4,137,306, Rubino等, 1979.1.30发布；美国专利4,154,816, Roehl等, 1979.5.15发布；美国专利4,226,889, Yuhas, 1980.10.7授权；美国专利4,346,079, Roehl, 1982.8.24授权；美国专利4,383,988, Teng等, 1983.5.17授权；欧洲专利说明书No. 107,330, Luebbe等, 1984.5.2公开；和美国专利申请序列No. 630,790, DiPietro, 1984.7.13提交。适用于本发明凝胶棒实施方案的优选固化剂在欧洲专利说明书No. 24,365中有描述, Sampson等, 1981.5.4公开, 在此全文引入作为参考。

在此也可以用作固化剂的是常规增稠剂。适用增稠剂的实例包括但不限于天然聚合物，例如槐树豆胶、藻酸钠、酪蛋白酸钠、蛋白蛋白、明胶琼脂、角叉菜胶藻酸钠、黄原胶、冥护子(quince seed)提取物、黄芪胶、淀粉、化学改性淀粉和类似物、半合成聚合性物质如纤维素醚(例如羟乙基纤维素、甲基纤维素、羧甲基纤维素、羟丙基甲基纤维素)、聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯醇、瓜尔胶、羟丙基瓜耳胶、可溶性淀粉、阳离子纤维素、阳离子瓜耳胶和类似物；和合成聚合物，例如羧乙烯基聚合物、聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯醇聚丙烯酸聚合物、聚甲基丙烯酸聚合物、聚乙烯基乙酸酯聚合物、聚乙烯基氯聚合物、聚偏二氯乙烯聚合物和类似物。也可采用无机增稠剂，例如硅酸铝类化合物，如皂土，或聚乙二醇和聚丙二醇硬脂酸酯或二硬脂酸酯的混合物。天然聚合物和生物聚合体及其应用进一步公开在Dunphy等的欧洲专利申请No. 522624。天然聚合物或生物聚合体的其它实例可以参见Cosmetic Bench

Reference, pp. 1.40-1.42, 其在此引入作为参考。

在此也可以使用亲水性胶凝剂, 例如B. F. Goodrich公司以Carbopol注册TM树脂的商标出售的丙烯酸/丙烯酸乙酯共聚物和羧乙烯基聚合物聚合物。这些树脂基本上由胶态水溶性的丙烯酸与0.75%至2.00%的交联剂如聚烯丙基蔗糖或聚烯丙基季戊四醇交联的聚烯基聚醚交联聚合物组成。实例包括Carbopol 934、Carbopol 940、Carbopol 950、Carbopol 980、Carbopol 951和Carbopol 981。Carbopol 934是丙烯酸与约1%的每个蔗糖分子平均具有约5.8个烯丙基的蔗糖的聚烯丙基醚交联的水溶性聚合物。适用于此的还有以商品名“Carbopol Ultrez 10、Carbopol ETD2020、Carbopol 1382、Carbopol 1342和Pemulen TR-1 (CTFA命名: 丙烯酸酯/10-30无机丙烯酸酯交联聚合物)出售的丙烯酸聚合物(carbomer)。上述聚合物的联合形式也适用于此。其他适用于此的胶凝剂包括油凝胶, 如三羟基硬脂精。

疏水性改性纤维素也适合在此用作固化剂。这些纤维素还公开在美国专利4,228,277和5,104,646, 这两篇在此全文引入作为参考。

适用胶凝剂或胶化剂可以参见Cosmetic Bench Reference, p. 1.27, 其在此引入作为参考。

不受理论限制, 与润肤剂联合的固化剂通过在皮肤上形成连续或不连续双层或多层薄膜在皮肤上起隔离作用。在此所用的术语“隔离”是指防止或阻隔某些事物, 在此处的情况中, 是防止水分(通过蒸发)和维生素B₃类化合物(通过膜结合)由皮肤表面逸出。

色料

本发明的某些实施方案, 优选唇膏或纯彩, 含有0%至约90%, 优选约1%至约35%、更优选约1%至约20%和首选约5%至约15%的色料, 以无水颜料的重量计。这些通常是铝、钡或钙盐或色淀。优选存在约0.1%至约4%的染料和0%至约20%的珠光剂。

当混合在唇用组合物中时, 颜料一般分散在润肤剂中形成良好

的颜料分散体，由此提供均匀的颜色分布。利用缔合结构、优选层状液晶可以获得颜料的优异分散体，其可以作为色料/颜料混合在本发明化妆品组合物内的方式。一种优选的干燥颜料的混合方法包括步骤：

(a) 制备基本组成如下的混合物:

(1) 极性溶剂; 和

(2) 表面活性剂, 选自Krafft点等于或低于环境温度的两性、阳离子、阴离子和非离子表面活性剂及其混合物;
和

(b) 搅拌该混合物直至形成缔合结构;

(c) 加入并混合干燥颜料直至获得均匀混合物;

(d) 研磨该混合物直至获得均匀粒度; 和

(e) 相剩余成分中加入并混合(c)的混合物直至得到均匀混合物。

如果化妆品组合物的成分被处理为使缔合结构就地形成, 优选的干燥颜料混合方法是将它们在一种或多种液体润肤剂组分中制浆。

适用于此的色料/颜料是所有适用于唇膏组合物的无机或有机色料/颜料。

色淀或是用固体稀释剂延展或缩小的颜料, 或者是通过水溶性染料沉淀在吸附性表面上制备的有机颜料, 通常是氢氧化铝。在某些情况中对于可溶性染料是否沉淀在氢氧化铝的表面生成染色无机颜料或是否仅仅在底物存在下沉淀存在不确定性。由酸性或碱性染料形成的不溶性盐也可以生成色淀。在此还可以采用钙和钡色淀。

适用于本发明的色淀包括红色3铝色淀、红色21铝色淀、红色27铝色淀、红色28铝色淀、红色33铝色淀、黄色5铝色淀、黄色6铝色淀、黄色10铝色淀、橙色5铝色淀和蓝色1铝色淀, 红色6钡色淀、红色7钙色淀。

其它色料和颜料也可以含在唇膏中, 例如染料和珠光剂, 氧化钛, 红色6、红色21、褐色、红褐色和黄褐色染料, 白垩、滑石、氧化铁和钛酸盐云母。

优选地, 色料成分是平均初级粒度直径小于约5微米、优选的是2微米、更优选的是1微米的水溶性微粒固体。

不受理论的限定，确信此类固体微粒本身位于分散液滴的界面(即不连续相)和连续相作为屏障，防止的聚集，并且由此改进稳定化。这种现象的更详细解释参见S. E. Friberg和Kare Larsson在Food Emulsions, pp. 36-41, Marcel Dekker, Inc. (1997)中的描述，其在此全文引入作为参考。分散剂也可以与本发明的色料和颜料合用。适用分散剂的实例包括但不限于U. S. 专利5,688,493中描述的那些，其在此全文引入作为参考。

皮肤学上可接受的化妆品载体

本发明的组合物可与化妆用或皮肤学上可接受的化妆载体结合。这样的载体是与皮肤、指甲、粘膜、组织和毛发相容性的并且包括符合这些要求的任何常用的化妆用或皮肤用载体。这种载体也是与维生素B₃类化合物相容的，即该载体应该不与维生素B₃类化合物相互作用。适宜的载体包括，但不限于，溶液、皂类、浴液、乳液、软膏、唇膏、粉底、睫毛油、脂粉、悬浮液、乳膏、洗液、凝胶、泡沫、摩丝等等。这些载体有利于局部涂敷并且在某些情况下提供附加的治疗效果，例如，通过受影响的皮肤区域的保湿。本领域的普通技术人员能很容易地选择皮肤学上可接受的化妆用载体。

其它添加剂

可以存在于本发明化妆品组合物中的其它任选成分包括上述的矫味油；脂肪可溶性维生素，例如维生素A和E，维生素A(例如乙酸酯、丙酸酯或棕榈酸酯)和维生素E(例如乙酸酯或山梨酸酯)的酯；防晒剂，例如甲氧基肉桂酸辛酯，丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷，二氧化钛和氧化锌；杀菌剂，例如三氯生；抗炎剂，例如氢化可的松；脂质物，例如神经酰胺和脂质体和护肤活性剂。化妆品组合物可以含有化妆品组合物如睫毛油、粉底或护唇产品中常用的成分。这包括护肤活性成分，例如药学活性成分。

护肤活性成分可以以水溶性和非水溶性形式加入本发明的化妆品组合物。这些包括但不限于维生素C及其衍生物(例如棕榈酸抗坏血酸、磷酸抗坏血酸及其盐，如镁或钠盐)、维生素D、泛醇、视黄

酸、氧化锌、 β -甘草酸(glycyerhetic acid); 春黄菊油; 银杏提取物; 焦谷氨酸、盐或酯; 透明质酸钠; 2-羟基辛酸; 硫; 水杨酸; 羧甲基胱氨酸和它们的混合物。

这些脂溶性和水溶性的添加剂一般是以小于约10%(重量)的量存在, 和更常为约0.01%至约5%(重量), 优选约0.01%至约3%(重量), 首选约0.1%至约1%(重量)。

矫味油如薄荷油、橙油、柑橘油、冬青油可以于醇或甘油合用。矫味油常常混合在溶剂如乙醇中以稀释矫味剂。在此适用的矫味油可以衍生自天然来源或合成制得。常用的矫味油是酮、醇、脂肪酸、酯和萜烯的混合物。术语“矫味油”在所属领域中一般被认为是由植物来源(即叶、树皮、水果或植物的皮)衍生的液体, 并且它们通常不溶于水。所用矫味油的水平可以是0%至约5%, 优选0%至约1%。

保湿剂也可以含在本发明组合物中。优选的保湿剂包括吡咯烷酮羧酸、乳酸钠或乳酸、尿素、瓜、甘油酸及其盐(例如钙盐)、矿脂、胶原、 α -羟丙基甘油基醚、 α -羟基酸(例如乙基乙醇酸、亮氨酸、苦杏仁酸、乙醇酸)、葡糖胺和弹性蛋白纤维, D-泛醇、尿囊素、透明质酸和硫酸软骨素。适用保湿剂的实例可以参见Cosmetic Bench Reference, p. 1.30-1.32 (1996), 其在此引入作为参考。

优选的任选组分是乙基纤维素(Ethocel)。乙基纤维素一般适合在约5%和更优选1%的水平使用。

另一优选任选组分是二氧化硅。二氧化硅一般优选以约1%至约5%的水平使用。

低变应性组合物可以由在此所述的液晶、蜡、油和色料制成。这些唇膏应该不含有香料、矫味油、羊毛脂、防晒剂, 特别是PABA, 或其它敏化剂或潜在敏化剂和刺激物。

本发明的组合物也可以制备为长效或非转移性化妆品组合物。此类唇膏的详细探讨参见日本专利公开Hei No. 6-199630和欧洲专

利申请748622, 它们在此全文引入作为参考。

另外的可以混合在本发明组合物中的任选物质可以参见Oblong等的PCT申请W0 97/39733。

使用的方法

本发明的化妆品组合物理想地适于处理皮肤和唇部, 尤其是以唇膏或唇用香脂的形式涂敷给唇部提供长效或半长效颜色, 具有理想的光彩或光泽修饰。化妆品组合物也可以用护肤剂处理皮肤和/或唇部, 保护它们不暴露在恶劣气候下, 包括刮风和雨天, 干燥和/或炎热环境, 环境污染物(例如臭氧、烟尘等), 或保护不和过度剂量的阳光接触。组合物也适宜为头发和皮肤提供防晒、保湿和/或调理作用, 改善肤感, 调节皮肤纹理, 减少细纹和皱纹, 降低头发或皮肤上的油性光亮, 亮肤和减少皮肤或头发异味。

所以, 所述化妆品组合物可以以传统方式、用或不用常规夹持器或涂敷器涂敷在皮肤和/或唇部为其提供装饰性和/或保护性薄膜。

维生素B₃类化合物在润肤剂中的溶解度测定方法

维生素B₃类化合物在本发明的多种非极性润肤剂中的溶解度可以测定如下:

I. 分析样本的制备:

1) 将润肤剂置于预先称重的瓶内, 随后用维生素B₃类化合物饱和;

2) 振动瓶子并且静置在30℃的外浴中1小时。用小搅拌棒搅动瓶子的内容物。如果瓶中不出现沉淀, 随后可加入更多的烟酰胺。反复操作脂质出现沉淀。令样本在外浴中继续放置48小时以确保饱和;

3) 将饱和乳化体抽入注射器;

4) 将0.45微米滤膜(Gelman Acrodisc)装配在该注射器的顶端并且润肤剂通过过滤进入另外的预先称重的分析瓶中;

5) 利用HPLC分析润肤剂, 测定其中烟酰胺的含量。

II. 分析:

将约0.25g的样本称量(样本重量)到15mL塑料螺纹盖离心管内。样本和约3mL的50/50 v/v甲醇/氯仿混合并且通过涡流混合均化。随后加入约7mL的水由甲醇/氯仿相提取维生素B₃类化合物。各样本以往复运动振荡50次使甲醇/氯仿中的烟酰胺转移到水相中。这种混合在两相的界面产生一种乳化体。通过令样本静置数小时或在高速下短暂离心(15秒)可以消散该乳化体。一旦两相彻底分开,小心地用移液管转移水相置于另外的预先称重的瓶子中。记录该水相的重量(水相重量)。把水相的等份试样转移到分析容器中,利用HPLC (Waters 2690分离模块, 偶联Waters 996 PDA检测器, Waters Corporations提供)分析烟酰胺。

III. 计算:

维生素B₃类化合物的百分比利用HPLC测定的维生素B₃类化合物浓度并且乘以稀释因子。稀释因子是将水相重量除以样本重量。

实施例

实施例I - XI中所述的化妆品制剂举例说明本发明化妆品组合物的具体实施方式, 但不对本发明构成限定。所属领域技术人员在不脱离本发明的实质和范围下可以完成其它改进。本发明这些举例的化妆品组合物的实施方案提供改善的维生素B₃类化合物的皮肤渗透性并且改进了化妆品组合物的稳定性。

所有举例的组合物可以通过常规制剂和混合技术制备。这样的制剂和混合技术详述于Harry's Cosmeticology, pp. 119-141和314-354 (J. B. Wilkinson and R.J. Moore 7th ed 1982) 和Cosmetics: Science and Technology, pp. 1-104 and 307-422 (M.S. Balsam and E. Sagarin 2nd ed 1972), 这两篇文献在此全文引入作为参考。组分用重量百分比给出, 并且不包括次要物质如稀释剂、填充剂等。因此, 所列制剂含有列出的成分和与这些成分有关的次要物质。

实施例 I

本发明的唇膏组合物如下制备：

<u>组分</u>	<u>用量 (重量百分比)</u>
蓖麻油	13.5
棕榈酸异丙酯	11.6
辛酸/癸酸/异硬脂酸/己二酸	7.0
甘油三酯	
羊毛脂	7.0
红色21铝色淀	7.0
小烛树蜡	6.6
丙二醇肉豆蔻基醚乙酸酯	6.0
辛酸/癸酸甘油三酯	5.8
甘油	5.0
水	5.0
烟酰胺	6.0
二氧化钛	4.7
蜂蜡	4.1
甘油一酯	3.5
羊毛脂油	2.5
地蜡	2.5
磷脂(大豆卵磷脂)	1.0
聚丁烯	0.8
巴西棕榈蜡	0.4

将上述组分加入安装加热源的不锈钢容器中。将组分加热至约85℃并且混合直至均匀。把该混合物倾入模具中并且冷却至室温。

将唇膏涂敷在唇部可以提供着色、保湿和改善的唇感。

实施例II

本发明的唇膏组合物如下制备:

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
巴西棕榈蜡	1.50
地蜡	6.00
小烛树蜡	4.00
氢化植物油	5.00
乙酰化羊毛脂	4.00
异硬脂酸异丙酯	11.90
硬脂酸	10.00
对羟基苯甲酸丙酯	0.10
蓖麻油酸鲸蜡酯	10.00
棕榈酸生育酚	1.00
硅石L-700	1.00
聚丁烯	2.00
矿脂	5.50
<u>缔合结构相</u>	
蔗糖一油酸酯 ¹	14.00
烟酰胺	2.00
甘油	12.00
颜料	9.00

¹ Ryoto糖酯0-1690, Mitsubishi-Kagaku食品公司

除了颜料之外, 将缔合结构相的组分混合直至形成缔合结构。一旦形成缔合结构, 加热颜料并且在三辊磨上研磨。随后该混合物于其它组分混合, 并且混合直至得到均匀混合物。(或者加入上述成分并且同时混合在一起)。加热该混合物至85℃, 然后真空脱气

并倾入合适的模具中。将混合物冷却至环境温度并装入合适的包装中。

将唇膏涂敷在唇部可以提供着色、保湿和改善的唇感。

实施例III

基本上不含蓖麻油的本发明的唇膏组合物如下制备：

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
巴西棕榈蜡	1.50
地蜡	6.00
小烛树蜡	4.00
氢化植物油	9.00
棕榈酸异丙酯	9.40
异硬脂酸	7.50
乙酰化羊毛脂	4.00
对羟基苯甲酸丙酯	0.10
蓖麻油酸鲸蜡酯	10.00
棕榈酸生育酚	1.00
硅石L-700	1.00
聚丁烯	2.00
矿脂	5.50
<u>缔合结构相</u>	
蔗糖一油酸酯 ¹	12.00
烟酰胺	10.00
甘油	12.00
颜料	9.00

¹ Ryoto糖酯O-1690, Mitsubishi-Kagaku食品公司

组合物按照实施例II制备。

实施例IV

基本上不含蓖麻油的本发明的唇膏组合物如下制备:

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
巴西棕榈蜡	1.50
地蜡	5.50
小烛树蜡	4.00
氢化植物油	8.50
乙酰化羊毛脂	4.00
对羟基苯甲酸丙酯	0.10
蓖麻油酸鲸蜡酯	10.00
棕榈酸生育酚	1.00
聚丁烯	2.00
聚硅氧烷共聚物 ¹	5.97
矿脂	5.97
无水羊毛脂	5.97

缔合结构相

卵磷脂	22.95
烟酰胺	2.50
泛醇	5.04
甘油	12.00
颜料	9.00

¹ # 1154-141-1, 由GE Silicones供应。

实施例V

本发明的止汗剂凝胶棒如下制备:

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
-----------	------------------

N-月桂基-L-谷氨酸-二-	4
正丁基酰胺 ¹	
12-羟基硬脂酸	2
丙二醇	0.1
生育酚烟酸酯	2
轻质矿物油 ²	23
癸二酸二异丙酯 ³	43
铝锆	25
滑石	3

¹GP-1, Ajinomoto, Inc. 供应

²Benol白色矿物油, Witco Chemical Corp. 供应

³Schercenol IS, Scher Cherfficals Inc. 供应

将胶凝剂和液体基质物质混合在安装有加热源的容器内。在约80℃至约130℃之间加热该混合物同时搅拌，直至混合物形成均匀、熔融溶液。优选地，使该均匀、熔融溶液冷却至混合温度；通常约65℃至120℃。（另外，混合物可以直接加热至混合温度直至该混合物形成均匀、熔融溶液。然而，这种替代方法通常需要长时间在高温下加热且随后冷却）。把烟酰胺混合物、止汗剂活性剂和其它组分如香料和色料加入上述容器中的均匀、熔融溶液内同时搅拌。使该混合物冷却至开始变稠，随后将混合物倾入容器内使它们冷却至环境温度。（虽然不优选，止汗剂活性成分也可以与胶凝剂和液体基质物质一起在第一步中加入）。

将含有上述成分的止汗剂组合物涂敷在人体对象的腋下区域，在涂敷区域可以减少出汗并且改善该区域的异味。

实施例VI

本发明的固体止汗剂棒如下制备：

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
-----------	------------------

硬脂醇	10.0
烟酰胺	5
丁二醇	0.2
氢化蓖麻油-mp 86℃	4.0
氯氢氧化铝	40.0
Isopar“V” ¹	45
香料	1.0
	100.0

(Isopar“V”平均分子量197 沸点范围255-301℃)

将异链烷烃、非水溶性液体润肤剂、表面活性剂和非水溶性蜡充分加热生成这些物质的溶液，随后加入收敛止汗剂盐并且轻轻搅动。加入烟酰胺混合物和盐之后，加入其它选择性组分如滑石，混合这种形成均匀混悬液。使该混悬液冷却至高于固化点的温度，随后倾入适当容器内。

把含有上述成分的止汗剂组合物涂敷在人体对象的腋下区域，在涂敷区域可以减少出汗并且改善该区域的异味。

实施例VII

本发明的固体止汗剂棒如下制备：

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
硬脂酸	10.0
氢化蓖麻油-mp86℃	4.0
氯氢氧化锆	25.0
滑石	10.0
Isopar “M” ¹	45.0
丙二醇	0.5
烟酰胺	2.0
己二酸二异丙酯	5.0
香料	1.0

100.0

¹ (Isopar “M”, 平均分子量191 沸点范围207-260℃) 组合物按照实施例VI制备和使用。

实施例VIII

本发明的止汗剂膏霜如下制备:

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
环甲基硅氧烷(D5)	43.5
聚二甲基硅氧烷(350cs)	4.0
Cab-0-Sil HS-5 ¹	4.0
Microthene FN 510 ²	6.0
烟酰胺	0.5
生育酚烟酸酯	0.5
甘油	0.1
Natrosol ³	2.0
异二十烷 ⁴	13.0
Reach AZ ⁵	26.7
香料	0.8

¹胶体硅石增稠物质, 由Cabot Corporation出售

²低密度聚乙烯粉末, U. S. I. Chemicals出售

³羟乙基纤维素, Hercules, Inc出售

⁴2, 2, 4, 4, 6, 6, 8, 8-二甲基-10-甲基十一胺, 得自Permethlyl Corporation, Frazier, PA.

⁵锆-铝-甘氨酸羟基氯化物复合物, 特殊止汗活性物质, Reheis Chemical Company出售。

将环甲基硅氧烷、聚二甲基硅氧烷、异二十烷和香料加入不锈钢混合容器中。随后加入Cab-0-Sil, 再加入Microthene和Natrosol, 最后加入任何剩余的成分。加入各具体物质后彻底搅拌

该组合物。

随后用 Black & Decker Die (Model 4420, 4型) 磨床在约 6,000rpm 下研磨该组合物 5 分钟, 该磨床带有直径 6.35cm 的风扇分散叶片。研磨组合物的渗透力值在 25℃ 和 50% 相对湿度下约为 300grams。

把含有上述成分的止汗剂霜剂涂敷在人体对象的腋下区域, 在涂敷区域可以减少出汗并且改善该区域的异味。

实施例 IX

本发明的防水睫毛油如下制备:

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
石油馏出物 (IBP 345)	51.570
浮油松香甘油酯	10.000
有机皂土 38CG 或型号	5.890 (胶凝剂)
色料 (黑色 34-3068 或型号)	5.000
烷基化 PVP (220 型)	5.000
三羟基硬脂精 (R 型)	5.000 (胶凝剂)
碳酸镁 309	5.000 (填充剂)
高岭土 2747	2.000
巴西棕榈蜡, NF	2.000
碳酸异丙烯酯	1.940
聚乙烯 AC-617A	1.000
丙二醇	1.000
烟酰胺	2.000
苯氧基乙醇	0.800
色料 (黄色 34-3170 或型号)	1.600
羟苯甲酸丙酯, NF	0.100
Tenox BHA	0.100
总量	100.000

将除着色剂、烟酰胺和胶凝剂/填充剂外的上述成分加到安装有加热源的不锈钢混合容器中。将这些成分加热至大约90℃并利用螺旋桨叶混合。一旦温度达到约90℃，便将这些成分在约3500rpm下利用分散器叶片混合。然后在用分散器混合期间缓慢加入颜料。同样，在混合的同时加入烟酰胺和胶凝剂/填充剂。用分散器继续混合直到混合物为均相的。然后使混合物冷却，同时用分散器在3500rpm下混合。在约40℃下，中止混合并将混合物转移到合适的贮存容器中。

将该睫毛油组合物涂敷在睫毛和/或眉毛上提供软化、保湿和调理的作用。

实施例X

本发明的睫毛油如下制备：

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
石油馏出物 (IBP 345)	49.570
浮油松香甘油酯	10.000
有机皂土38CG或型号	5.890 (胶凝剂)
碳酸镁309	5.000 (填充剂)
烷基化PVP (220型)	5.000
三羟基硬脂精 (R型)	5.000 (胶凝剂)
滑石2755	4.790 (填充剂)
高岭土2747	2.000 (填充剂)
巴西棕榈蜡, NF	2.000
碳酸异丙酯	1.940
丙二醇	1.000
生育酚烟酸酯	4.000
聚乙烯AC-617A	1.000
苯氧基乙醇	0.800
羟苯甲酸丙酯, NF	0.100

Tenox BHA	0.100
色料 (蓝色3403516或型号)	1.810
总量	100.000

按照实施例IX制备和使用该组合物。

实施例XI

本发明的睫毛膏如下制备:

<u>组分</u>	<u>用量(重量百分比)</u>
石油馏出物 (IBP 345)	51.670
浮油松香甘油酯	13.000
有机皂土38CG或型号	5.890 (胶凝剂)
碳酸镁309	5.000 (填充剂)
三羟基硬脂精 (R型)	5.000 (胶凝剂)
巴西棕榈蜡, NF	2.000
高岭土2747	2.000 (填充剂)
碳酸异丙烯酯	1.940
甘油	1.000
烟酰胺	5.000
聚乙烯AC-617A	1.000
苯氧基乙醇	0.800
色料	5.500
Tenox BHA	0.100
羟苯甲酸丙酯	0.100
总量	100.000

按照实施例IX制备和使用该组合物。

实施例XII

本发明的唇膏如下制备:

<u>组分</u>	<u>重量%.</u>
聚丁烯	4.536
羊毛脂油	18.342
辛氧基甘油基山嵛酸酯	18.342
庚酸硬脂基酯	8.856
西蒙得木油	8.856
蓖麻油	20.78
丁基羟基甲苯	0.054
丁基羟基苯甲醚	0.054
微晶蜡	6.84
聚乙烯500	6.84
<u>缔合结构相</u>	
卵磷脂	0.475
甘油	1
烟酰胺	4.5
胆甾醇	0.475
磷酸二鲸蜡酯	0.05

在适当容器中, 将蓖麻油、聚丁烯、羊毛脂油、辛氧基甘油基山嵛酸酯、庚酸硬脂基酯、西蒙得木油、丁基羟基甲苯、丁基羟基苯甲醚、微晶蜡、聚乙烯500加入带有加热源的容器中并且在约100-110℃下加热形成熔化物。混合该熔化物直至均匀。将烟酰胺、卵磷脂、甘油、胆甾醇和磷酸二鲸蜡酯单独混合形成缔合结构。然后将该缔合结构混合物加入含蓖麻油的混合物中, 混合直至均匀。真空下使该混合物脱气, 倾入适当模具中。将该混合物冷却至环境温度并且装入适当包装中。

将唇膏涂敷在唇部提供色彩、保湿和改善的唇感。

实施例XIII

¹利用如下所述的常规混和和配制技术由下列成分制备适合用作液体化妆粉底的油包水型局部用组合物。

<u>组分</u>	<u>wt. %</u>
A部分	
环甲基硅氧烷 ¹	15.15
辛酸十六烷基酯	2.00
聚二甲基硅氧烷共聚多元醇 (DC5225C) ²	20.00
B部分	
滑石	3.38
颜料	10.51
Spheron L-1500 ³	0.50
C部分	
合成蜡Durachem PT-0602 ⁴	1.00
山萘酸十二烷基酯	0.50
D部分	
环甲基硅氧烷 ⁵	1.00
三羟基硬脂精	0.30
E部分	
月桂基醚-7	0.50
羟苯甲酸丙酯	0.25
G部分	
水	17.44
羟苯甲酸甲酯	0.12
丙二醇	2.00
烟酰胺	20.00
甘油	3.00
氯化钠	2.00

脱氢乙酸钠 0.30

香料 0.05

¹ Dow Corning提供的DC245流体

² Dow Corning提供的聚二甲基硅氧烷共聚多元醇(10%)和DC245流体(90%)

³ Presperse提供的球形硅石

⁴ Astor Wax Corp.提供的合成蜡

⁵ Dow Corning提供的DC245流体

在适当容器中，合并A和B部分的组分。用带有1"管形组件和正方形孔筛的Silverson L4R混合器在9000rpm下混合30分钟（可将容器盖上以避免任何挥发物或其它物质丧失）。将生成的混合物加热至85 - 90℃。加入组分C并且用带有2"头部和解磨筛的Silverson L4R混合器在2100rpm下混合5分钟。容器应当加盖以使环甲基硅氧烷和其它挥发性或非挥发性物质的蒸发减到最少。将生成的混合物冷却至45 - 55℃。

合并D部分的组分并混合直到形成均匀的浆液。分开地，合并E部分的组分并混合直到形成均匀的浆液。将生成的浆液加到A、B和C的混合物（45 - 55℃）中，用带有2"头部和解磨筛的Silverson L4RT在2100rpm下混合5分钟。将生成的混合物冷却至30℃，然后加入香料组分。用带有2"头部和解磨筛的Silverson L4RT在2100rpm下混合5分钟。

在适当容器中合并G部分的组分并混合。将生成的溶液缓慢加到A - G的混合物中。用带有2"头部和解磨筛的Silverson L4RT混合器在2100 - 5100rpm下乳化此混合物（rpm随着混合物变稠而增加），当加入全部G混合物后继续混合5分钟。

将该组合物涂敷于人的面部，每天一次，用量为1 - 2mg组合物/cm²皮肤，持续4周，观察面部油的减少，油透过减少，粉底的磨耗延长，并且随着时间的流逝覆盖更加均匀。

其它适合用作粉底剂的局部用组合物可按上述方法用吡哆素、泛醇或泛酸代替烟酰胺来制备并且如上所述将其涂敷于面部。

将该粉底涂敷在皮肤上以减少皮肤的细纹和纹理并且减少油性光泽。

实施XIV

本发明的唇膏如下制备：

<u>组分</u>	<u>wt. %</u>
棕榈酸辛酯	11.24
棕榈酸异丙酯	4.80
有机皂土38 ¹	1.00
碳酸丙烯酯	0.33
蓖麻油酸十六烷基酯	1.00
二聚酸异丙酯	6.12
羊毛脂油	11.60
地蜡	6.75
小烛树蜡	5.25
Be Square 175 ²	2.00
粒化卵磷脂	2.00
二异硬脂酸酯	0.83
维生素“E”乙酸酯	0.05
对羟基苯甲酸丙酯	0.15
对羟基苯甲酸甲酯	0.15
苯甲酸	0.10
甘油	6.00
云母cf ³	7.00
烟酰胺	5.00

悬浮于二聚酸二异丙酯中的颜料(35%)	25.31
染色剂	2.92
¹ Quaternium-18 hectorite, 提供	
² 微晶蜡, Petrolite提供	
³ 未处理过的云母, Mearlmica MMCF, 提供	

在一个安装有热源的适当容器中, 加入蓖麻油酸十六烷基酯、二聚酸二异丙酯、羊毛脂油、地蜡、小烛树蜡、Be Square 175、粒化卵磷脂PG-3二异硬脂酸酯、维生素E乙酸酯、对羟基苯甲酸丙酯、对羟基苯甲酸甲酯、苯甲酸、甘油、云母cf、烟酰胺并将其加热至约80-90℃形成熔化物。将熔化物混合直至均匀。

在另一容器中, 将棕榈酸异丙酯、有机皂土38和碳酸丙烯酯混合形成凝胶。将凝胶、颜料浆和染色剂加到烟酰胺熔化物中并混合直至均匀。将混合物通过真空脱气并倾入适当模具中。将混合物冷却至环境温度并装入适当包装中。

将该唇膏涂敷到唇部以提供色彩、保温作用和改善的唇感。

实施例 XV

本发明的唇膏如下制备:

<u>组分</u>	<u>wt. %</u>
异硬脂酸异丙酯	12.58
棕榈酸辛酯	8.55
棕榈酸异丙酯	5.27
地蜡	5.00
小烛树蜡	3.00
石蜡	3.00
巴西棕榈蜡	2.00
十六烷醇	2.00
乳酸十六烷基酯	2.00

棕榈酸抗坏血酸酯	0.50
对羟基苯甲酸丙酯	0.10
维生素E乙酸酯	0.05
甲氧基肉桂酸辛酯	7.25
在蓖麻油中的微粒TiO ₂ (25%浆液)	8.00
在蓖麻油中的烟酰胺	5.00
甘油	0.10
云母SVA ¹	10.00
悬浮于二聚酸二异丙酯中的颜料(35%)	25.60

¹月桂酰赖氨酸处理过的云母SVA, 提供

将在蓖麻油中化的TiO₂用球磨研磨至所需的粒度。同样, 将在二异丙酯中的颜料用球磨研磨至所需的粒度。接下来, 在一个安装有热源的容器中将TiO₂和颜料与剩余的组分混合。将混合物加热至约85-90℃形成熔化物。将熔化物混合直至均匀。将混合物通过真空脱气并倾入适当模具中。将混合物冷却至环境温度并装入适当包装中。

将该唇膏涂敷到唇部以提供色彩、保温作用和改善的唇感。

实施例XVI

本发明的唇膏如下制备:

<u>组分</u>	<u>wt. %</u>
异硬脂酸异丙酯	12.58
棕榈酸辛酯	8.55
棕榈酸异丙酯	5.27
地蜡	5.00
小烛树蜡	3.00
石蜡	3.00
巴西棕榈蜡	2.00

十六烷醇	2.00
乳酸十六烷基酯	2.00
棕榈酸抗坏血酸酯	0.50
对羟基苯甲酸丙酯	0.10
维生素E乙酸酯	0.05
甲氧基肉桂酸辛酯	7.25
在蓖麻油中的微粒TiO ₂ (25%浆液)	8.00
在蓖麻油中的烟酰胺	5.00
甘油	0.10
云母SVA ¹	10.00
悬浮于二聚酸二异丙酯中的颜料 (35%)	25.60

卵磷脂 0.05

¹月桂酰赖氨酸处理过的云母SVA, 提供

将在蓖麻油中化的TiO₂用球磨研磨至所需的粒度。同样, 将在二异丙酯中的颜料用球磨研磨至所需的粒度。接下来, 在一个安装有热源的容器中将TiO₂和颜料与除卵磷脂之外的剩余组分合并。将混合物加热至约85-90℃形成熔化物。将熔化物混合直至均匀。然后在混合下加入卵磷脂直至均匀。将混合物通过真空脱气并倾入适当模具中。将混合物冷却至环境温度并装入适当包装中。

将该唇膏涂敷到唇部以提供色彩、保温作用和改善的唇感。

实施例XVII

下列步骤描述长效化妆乳液组合物的制备。

A. 通过在适当容器中合并下列组分制备一种混合物 (A部分):

组分	wt. %
MQ树脂 ¹	43.7
PM99A ²	56.3

¹三甲基硅氧烷硅酸盐, 购自GE。

²异十二烷，购自Presperse.

¹ 利用常规混合技术混合该混合物直至MQ树脂溶解。

处理：

B. 通过在适当容器中合并下列组分制备一种混合物（B部分）：

<u>组分</u>	<u>wt. %</u>
SE30聚硅氧烷树脂 ¹	50.0
PM99A	50.0

¹购自GE.

利用常规混合技术混合该混合物直至SE30聚硅氧烷树脂溶解。

C. 通过合并下列组分制备含有A部分和B部分的化妆乳液组合物：

<u>组分</u>	<u>wt. 克数</u>
A部分	38.67
B部分	20.78
颜料	10.00
PM99A	1.41
对羟基苯甲酸丙酯	0.20
有机皂土ISD	15.00
水	6.00
烟酰胺	7.00
合成锂皂石XLS ¹	0.94

¹可购自Southern Clay Products的水合硅酸钠锂镁

在适当容器中，合并A部分和颜料、对羟基苯甲酸丙酯和PM99A的混合物并且利用Ultra Turrax T25均化器在约8,000rpms下混合约10分钟或直至该化妆品混合物均匀（小心不要引燃PM99A）。向化妆品组合物中加有机皂土ISD同时在约8,000rpms下混合直至该混合物均匀。在另一容器中将合成锂皂石XLS、水和烟酰胺混合在一起并且随后加入到该化妆品组合物中同时用Ross均化器在约3,500rpms下混合直至均匀。向该化妆品混合物中加入B部分的混合

物，并且利用IKA混合器开始在高剪切、优选1600rpm下混合以便分散。一旦获得足够的分散作用，降低混合器速度，优选降至约1,000rpms，并且混合该化妆品混合物直至均匀。随后将化妆品混合物倾入适当容器内并且盖紧保存，优选在室温下保存。

涂敷该化妆乳液组合物使皮肤着色，改善皮肤纹理和肤感。