



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 108348423 B

(45) 授权公告日 2021. 05. 11

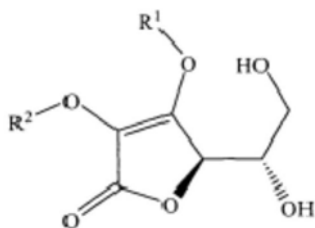
(21) 申请号 201680063950.6	(72) 发明人 保罗·詹姆斯·汤姆林森 马克·约翰逊 杰克·托马斯·希克斯
(22) 申请日 2016.10.25	
(65) 同一申请的已公布的文献号 申请公布号 CN 108348423 A	(74) 专利代理机构 北京天昊联合知识产权代理有限公司 11112
(43) 申请公布日 2018.07.31	代理人 高钊 李小山
(30) 优先权数据 1519184.4 2015.10.30 GB	(51) Int.Cl. A61K 8/365 (2006.01) A61K 8/67 (2006.01) A61Q 19/00 (2006.01)
(85) PCT国际申请进入国家阶段日 2018.05.02	
(86) PCT国际申请的申请数据 PCT/EP2016/025124 2016.10.25	(56) 对比文件 CN 103211718 A, 2013.07.24 philosophy.overnight age-resetting, anti-wrinkle moisturizer.《MINTEL》.2014,
(87) PCT国际申请的公布数据 W02017/071820 EN 2017.05.04	审查员 康旭亮
(73) 专利权人 博姿有限公司 地址 英国诺丁汉郡	权利要求书1页 说明书12页

(54) 发明名称
护肤组合物及其方法

(57) 摘要
本公开的技术涉及包含O-取代的抗坏血酸或其衍生物以及葡糖酸内酯的组合物,其中所述组合物包含占所述组合物的至多95重量%的水相。本公开的技术还涉及改善皮肤状况的应用和方法。

1. 一种化妆品组合物, 包含:

0.1重量%至2重量%的由下式表示的O-取代的抗坏血酸:



其中R¹为C1-4烷基且R²为H; 以及

0.5重量%至10重量%的葡糖酸δ-内酯,

其中所述化妆品组合物包含占所述化妆品组合物的至多95重量%的水相, 所述化妆品组合物不包含选自抗坏血酸磷酸钠、抗坏血酸葡糖苷、L-抗坏血酸、抗坏血酸棕榈酸酯、抗坏血酸视黄基酯、抗坏血酸四己基癸基酯和抗坏血酸磷酸镁的抗坏血酸衍生物, 并且所述化妆品组合物包含比O-取代的抗坏血酸更高浓度的葡糖酸δ-内酯。

2. 根据权利要求1所述的化妆品组合物, 其中所述化妆品组合物包含占所述化妆品组合物的至多90重量%的水相。

3. 根据权利要求2所述的化妆品组合物, 包含0.5重量%至2.5重量%的葡糖酸δ-内酯。

4. 根据权利要求3所述的化妆品组合物, 包含0.5重量%至2重量%的葡糖酸δ-内酯。

5. 根据前述任一项权利要求所述的化妆品组合物, 其中所述化妆品组合物为水包油乳液, 其包含30重量%至85重量%的水相和15重量%至70重量%的油相。

6. 根据权利要求5所述的化妆品组合物, 其中所述乳液包含60重量%至75重量%的水相和25重量%至40重量%的油相。

7. 根据权利要求1所述的化妆品组合物, 其中所述O-取代的抗坏血酸是3-乙基抗坏血酸。

8. 根据权利要求1所述的化妆品组合物, 其中所述化妆品组合物为凝胶、乳霜、洗液或精华液的形式。

9. 根据权利要求1所述的化妆品组合物的化妆品应用, 其中所述化妆品应用用于非治疗目的。

10. 根据权利要求9所述的化妆品应用, 其中所述化妆品组合物是护肤组合物。

11. 一种改善皮肤护理的方法, 包括向皮肤提供根据权利要求1至8中任一项所述的化妆品组合物, 其中所述改善皮肤护理的方法用于非治疗目的。

12. 根据权利要求11所述的方法, 其中改善皮肤护理包括改善(i) 表皮脱落, 或保湿, 或(ii) 减少或防止形成皱纹或细纹、皮肤下垂或色素沉着过度中的至少一者, 或(iii) 增加皮肤紧致度或皮肤松弛度。

13. 根据权利要求1-8中任一项所述化妆品组合物的用于改善皮肤状况的应用, 其中所述用于改善皮肤状况的应用用于非治疗目的。

护肤组合物及其方法

技术领域

[0001] 本公开的技术涉及包含O-取代的抗坏血酸或其衍生物以及葡糖酸内酯的组合物。本公开的技术还涉及改善皮肤状况的应用和方法。

背景技术

[0002] 维生素C和葡糖酸内酯(通常称为葡糖酸 δ -内酯)是已知用于化妆品的各种衍生物。

[0003] 认为葡糖酸内酯是对皮肤温和的酸性化合物,并为护肤组合物提供抗衰老的性能,例如减少皱纹或减少细纹。相较于护肤组合物中已知的许多 α -和/或 β -羟基羧酸(如乳酸、抗坏血酸或羟基乙酸),葡糖酸内酯具有更大的分子结构。据信葡糖酸内酯在较低pH条件下具有最佳效果。

[0004] 据信维生素C和基于抗坏血酸的各种衍生物可增强胶原蛋白合成,或作为抗氧化剂,并且已经将其用于抗衰老组合物(通过减少皱纹、细纹或改善皮肤紧致度),使皮肤更明亮/容光焕发。目前已提出含有维生素C或其衍生物的组合物可减少褐斑和其他类型阳光损伤的出现,并改善皮肤的自然愈合反应。据信局部用组合物中维生素C的不稳定性可能是由于其容易被氧气、光、碱性条件、某些金属以及升高的温度氧化。据信由于局部用组合物中维生素C的不稳定性,最佳制剂具有低pH。为了稳定维生素C,已经对在水性和非水性介质中的护肤组合物进行了如下总结的各种尝试。

[0005] US 2,400,171 (Ruskin, 1946年5月14日公开)涉及将抗坏血酸转化成其钙盐或锌盐以保持稳定的水溶液。

[0006] US 6,146,664 (Siddiqui, 2000年11月14日公开)涉及在非水性或基本上无水的硅氧烷载体中含有抗坏血酸的组合物。

[0007] US 8,022,090 (Choi等, 2011年9月20日公开)涉及作为维生素C的初级稳定剂的阳离子材料和阴离子材料;以及作为维生素C的次级稳定剂的咖啡酸衍生物。

[0008] US2007196310 (Mary Kay, 2007年2月21日出版)涉及一种非水性组合物,其包含:(a)抗坏血酸;(b)含量低于全部组合物的50重量%的含有机硅的化合物;以及(c)精油,其中当所述组合物在室温下储存至少1个月时,所述组合物中抗坏血酸的初始量的至少50%保持稳定。

[0009] US 2014/0155633 (Lin-Chao等, 2014年6月5日公开)涉及通过限定烷基取代的抗坏血酸使抗坏血酸衍生物稳定的组合物。

[0010] US 7,741,496 (Wei-Chuan等, 2010年6月22日公开)和US2011/02811943 (Pei Miu等, 2011年11月17日公开)均涉及一种抗坏血酸衍生物,该衍生物使通过疏水间隔基连接的一个或两个亲水头基结合。

[0011] US 6,110,476 (Nguyen等, 2000年8月29日公开)涉及一种基于磷酸衍生物和焦亚硫酸盐以使抗坏血酸稳定的体系。US2008/0253982 (Shibayama, 2008年10月16日公开)公开了稳定的抗坏血酸磷酸酯。

[0012] US 6,162,419 (Perricone等,2000年12月19日公开)、US6,087,393 (Mathur,2000年7月7日公开)、US 8,053,469 (2011年11月8日公开)、US 5,736,567 (Cantin等,1998年4月7日公开)以及US 5,140,043 (Darr等,1992年8月18日公开)均涉及多种二醇化合物中的稳定的抗坏血酸体系。

[0013] US 6,010,706 (Candau等,2000年1月4日公开)涉及一种用于在亲水性载体中使抗坏血酸稳定的容器,所述容器独立包装但混合在一起使用。

[0014] 上述专利通过使用大量不同的化学方法、容器和水包油及油包水组合物,提供了相当多的选择以使抗坏血酸或各种衍生物稳定。

[0015] 然而,上述现有技术所考虑的稳定方法均没有公开将衍生物与葡糖酸内酯或其衍生物组合使用。US 6,063,963和US 2008/0287533描述了使用葡糖酸内酯和羟基酸或抗坏血酸衍生物制剂的尝试。

[0016] US6,036,963 (Weinkauff等,2000年3月14日公布)涉及化妆品用水包油化妆品护肤乳液组合物,其包含约3%至约12%的量的羟基酸、葡糖酸内酯或葡糖二酸内酯以及化妆品学可接受的载体。

[0017] US 2008/0287533 (Gupta,2008年11月20日公布)涉及抗坏血酸与天然糖内酯的酯,并且公开的糖内酯之一是葡糖酸内酯。因此,US 2008/0287533教导了将抗坏血酸和内酯组合以形成单个分子。

发明内容

[0018] 制备包含葡糖酸内酯和维生素C形式的组合物以改善皮肤护理状况(也可以称为皮肤状况)将是有利的。改善的皮肤护理可能包括减少或防止以下至少一项:改善表皮脱落、保湿、形成皱纹或细纹、皮肤下垂或色素沉着过度(如太阳斑纹)、或增加皮肤紧致度或皮肤松弛度。然而,由于上述据信的最佳功能性条件的差异,通过在包含葡糖酸内酯的组合物中的维生素C的形式稳定性增强而具有改善的稳定性的组合物将是有利的。

[0019] 本领域技术人员知道,水基体系中的葡糖酸内酯可以部分水解成葡糖酸,其中内酯形式和酸形式之间具有平衡性。这是一个众所周知的化学平衡。因此,本文中提及葡糖酸内酯意欲也包括葡糖酸内酯和包括葡糖酸的任何平衡产物。

[0020] 如本文所使用的,与“包括”,“含有”或“其特征在于”同义的过渡性术语“包含”是包含性的或开放性的,并且不排除另外的未列举的元素或方法步骤。然而,本文中的每个“包含”的叙述中,意图是该术语还包括作为替代实施方案,其中“由...组成”排除未指定的任何要素或步骤,并且“基本上由...组成”允许包含额外的未列举的元素或步骤,这些元素或步骤实质上不影响所考虑的组合物、方法或应用的基础的、基本的和新颖的特征。

[0021] 除非另外指出,否则相对于本文公开的全部组合物,处理率是基于重量的。

[0022] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及一种组合物,其包含:

[0023] O-取代的抗坏血酸或其衍生物;以及

[0024] 葡糖酸内酯或其衍生物(通常为葡萄糖酸内酯),

[0025] 其中所述组合物包含占所述组合物的至多95重量%,或至多90重量%的水相。

[0026] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及一种组合物,其包含:

[0027] O-取代的抗坏血酸或其衍生物;以及

- [0028] 葡糖酸内酯或其衍生物(通常为葡萄糖酸内酯),
- [0029] 其中所述组合物一种乳液,其包含油相以及占所述组合物至多90重量%的水相。
- [0030] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及一种组合物,其包含:
- [0031] 0-取代的抗坏血酸或其衍生物;以及
- [0032] 葡糖酸内酯或其衍生物(通常为葡萄糖酸内酯),
- [0033] 其中所述组合物是一种凝胶,并且水相占所述组合物的至多95重量%。
- [0034] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及一种组合物,其包含:0.001重量%至10重量%的0-取代的抗坏血酸或其衍生物,和0.01重量%至20重量%的葡糖酸内酯或其衍生物,其中所述组合物包含占所述组合物的至多95重量%,或至多90重量%的水相。
- [0035] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及一种组合物,其包含:0.001重量%至10重量%的0-取代的抗坏血酸或其衍生物,和0.01重量%至10重量%的葡糖酸内酯或其衍生物,其中所述组合物包含占所述组合物的至多95重量%,或至多90重量%的水相。
- [0036] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及一种组合物,其包含:0.001至5重量%的0-取代的抗坏血酸或其衍生物,和0.01至5重量%的葡糖酸内酯或其衍生物,其中所述组合物包含占所述组合物的至多95重量%,或至多90重量%的水相。
- [0037] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及一种组合物,其包含:0.01至3重量%的0-取代的抗坏血酸或其衍生物,和0.1至2.5重量%的葡糖酸内酯或其衍生物,其中所述组合物包含占所述组合物的至多95重量%,或至多90重量%的水相。
- [0038] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及一种组合物,其包含:0.1至2重量%的0-取代的抗坏血酸或其衍生物,和0.5至2重量%的葡糖酸内酯或其衍生物,其中所述组合物包含占所述组合物的至多95重量%,或至多90重量%的水相。
- [0039] 本文公开的葡糖酸内酯可以包括葡糖酸癸内酯或葡糖酸-1,5-内酯(通常为葡糖酸癸内酯)。
- [0040] 通常本公开的技术涉及葡糖酸内酯或其衍生物与0-取代的抗坏血酸或其衍生物的组合。
- [0041] 通常所述组合物包含比0-取代的抗坏血酸更高浓度的葡糖酸内酯。
- [0042] 所述组合物可以为凝胶、乳霜、洗液或精华液的形式,通常是乳霜、精华液、洗液。在一个实施方案中,组合物可以是精华液。
- [0043] 所述组合物可以是乳液或凝胶。
- [0044] 当组合物是乳液时,组合物可以是包含油相以及占组合物至多90重量%的水相的乳液。
- [0045] 当组合物是凝胶时,组合物还包含增稠剂。
- [0046] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及本文公开的组合物(通常为护肤组合物)的化妆品应用。
- [0047] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及改善皮肤护理的方法,其包括向皮肤提供本文公开的组合物。改善皮肤护理可能包括改善(i)表皮脱落或保湿,或(ii)减少或防止形成皱纹或细纹、皮肤下垂或色素沉着过度(例如太阳斑纹)的至少一种,或(iii)增加皮肤紧致度或皮肤松弛度。
- [0048] 在一个实施方案中,本公开的技术涉及使用本文公开的组合物来改善皮肤护理。

改善皮肤护理可能包括改善 (i) 表皮脱落或保湿, 或 (ii) 减少或防止形成皱纹或细纹、皮肤下垂或色素沉着过度 (例如太阳斑纹) 的至少一种, 或 (iii) 增加皮肤紧致度或皮肤松弛度。

[0049] 本文公开的应用和方法对于本领域技术人员是已知的, 并不包括治疗或医学治疗, 即所公开的应用或方法涉及非治疗应用或方法。

[0050] 通常皮肤是哺乳动物皮肤, 如人的皮肤。

[0051] 发明详述

[0052] 本公开的技术提供了如上所公开的组合物、方法和应用。

[0053] 0-取代的抗坏血酸

[0054] 0-取代的抗坏血酸或其衍生物可以是0-烷(烯)基抗坏血酸或其衍生物。

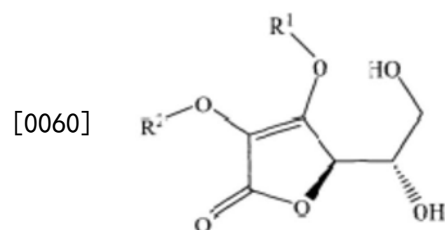
[0055] 如本文所用“烷(烯)基”旨在表示烷基或烯基(通常为烷基)。

[0056] 烷(烯)基可以是非环状的或环状的, 通常是非环状的。非环状基团可以是直链或支链的, 通常是直链的。

[0057] 通常0-取代的抗坏血酸或其衍生物可以是0-烷基抗坏血酸或其衍生物。

[0058] 0-取代的抗坏血酸或其衍生物在本领域中是已知的, 并且在EP专利申请EP2722043A1和US2014/0155633 (Lin等, 申请人Corum) 中有所描述。

[0059] 在一个实施方案中, 0-取代的抗坏血酸或其衍生物可以由下式表示:



[0061] 其中R¹和R²基团可以独立地为H、C1-20烷基、C3-20环烷基、C1-20烷氧基、C2-20酰基、C6-20芳基、C1-20杂环芳香族基团、C1-20杂环非芳族基团或C3-20环烯基。

[0062] 0-取代的抗坏血酸或其衍生物可以具有取代的基团, 其本质上可以是烃, 即由碳和氢组成。在一个实施方案中, R¹和R²基团可以独立地为H、C1-20烷基、C3-20环烷基、C6-20芳基或C3-20环烯基。

[0063] 在一个实施方案中, 0-取代的抗坏血酸可以是3-烷基抗坏血酸或其混合物。通常烷基可以是C1-20、或C1-10、或C2-8、或C2-4。

[0064] 通常0-取代的抗坏血酸可以是3-乙基抗坏血酸。

[0065] 0-取代的抗坏血酸可以占组合物的0.001至5重量%、或0.01至3重量%、或0.1至2重量%。

[0066] 其他成分

[0067] 本文公开的组合物可以任选地还包含其他成分。其他成分包括芙蓉属植物(Hibiscus)、肽、基质金属蛋白酶抑制剂、增白剂、皮肤调理剂、水杨酸化合物、防晒剂、防腐增稠剂、粘度调节剂、和/或胶凝螯合剂、蜡、稀释剂、载体、推进香料或pH调节剂。

[0068] 在一个实施方案中, 本文公开的组合物进一步包含芙蓉属植物、肽、基质金属蛋白酶抑制剂、增白剂中的一种或多种。

[0069] 芙蓉属植物可能是玫瑰茄(Hibiscus sabdariffa)、朱槿(Hibiscus rosa sinensis)或黄葵(Hibiscus Abelsonii)。已知所有三种芙蓉属植物形成化妆品组合物

用提取物。芙蓉属植物可能是一种提取物的形式。

[0070] 肽被定义为包括氨基酸的不间断序列的化合物。通常,肽是天然来源的。二肽包含两个氨基酸的不间断序列。如本文所用氨基酸包括并涵盖所有天然存在的氨基酸,为D或L构型。通常参照常規的三字母代码来指示氨基酸,并且从左至右读取序列。本公开的技术的组合物可以包含选自以下的二肽:乙酰基二肽1鲸蜡酯、乙酰基二肽3氨基己酸酯、壬二酰基双二肽10、香豆酰基二肽3、双鲸蜡二肽9、二肽二氨基丁酰基苜蓿基酰胺二乙酸酯、二肽1、二肽10、二肽11、二肽12、二肽15、二肽16、二肽17、二肽18、二肽19、二肽2、二肽20、二肽3、二肽4、二肽5、二肽6、二肽7、二肽8、二肽8HCL、二肽9、己酰基二肽3、正亮氨酸乙酸酯、甲基十一碳烯酰基二肽16、烟酰基二肽22、烟酰基二肽23、烟酰基二肽24、烟酰基二肽26、油酰基二肽15、棕榈酰二肽10、棕榈酰二肽13、棕榈酰二肽17、棕榈酰二肽5二氨基丁酰羟基苏氨酸、棕榈酰二肽5二氨基羟基丁酸酯、棕榈酰二肽7以及它们的混合物。

[0071] 在一个实施方案中,本公开的技术的组合物可以包含三肽或其混合物。三肽可以是天然存在的或合成来源的。合适的三肽化合物包括三肽1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、其衍生物以及它们的混合物。三肽包含一种或多种基于His的三肽。

[0072] 本公开的技术的组合物可以进一步包含四肽。四肽可以是一种或多种基于Rigin的四肽、一种或多种ALAMCAT-四肽或其混合物。四肽可以是天然存在的或合成来源的。用于本发明组合物的合适四肽包括选自以下的四肽:四肽1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、34、35、其衍生物以及它们的混合物。

[0073] 本公开的技术的基于Rigin的四肽可基于Gly-Gln-Pro-Arg (Rigin) 结构并包括其类似物及其衍生物。Rigin是一种典型的四肽。

[0074] 本公开的技术的组合物可进一步包含五肽、其衍生物以及它们的混合物。如本文所用“五肽”是指天然存在的五肽和合成的五肽。本文也可以使用天然存在的和市售的包含五肽的组合物。合适的五肽包括选自以下的五肽:五肽1、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、21、22、23、24、25、26、28、29、30、31、33、34、35、36、38、39、其衍生物以及它们的混合物。

[0075] 当肽存在于本文公开的组合物中时,肽可以占组合物的0或0.01%至20%、或0.05%至15%、或0.05至10重量%。

[0076] 基质金属蛋白酶抑制剂 (MMPi)

[0077] 术语“基质金属蛋白酶抑制剂”涉及对至少一种通过皮肤或在皮肤中表达、合成或激活的基质金属蛋白酶具有抑制活性的所有分子和/或植物或细菌提取物。基于它们在结构和底物特异性方面的相似性,基质金属蛋白酶家族由几个明确限定的基团形成 (Woessner J.F., Faseb Journal, vol.5, 1991, 2145)。

[0078] MMPi可以以组合物的0或0.01重量%至10重量%、或0.1重量%至5重量%、或0.25重量%至2.5重量%、或0.5重量%至1重量%的水平存在。

[0079] 增白剂

[0080] 在一个实施方案中,本文公开的组合物还包含增白剂/增亮剂。

[0081] 当所述组合物进一步包含增白剂/增亮剂时,它可以占组合物的0或0.001重量%至10重量%、或0.01重量%至5重量%、或0.1重量%至2重量%、或0.2重量%至1重量%。例如,增白剂/增亮剂可以占组合物的0或0.001重量%至3重量%、或0.01重量%至2重量%、或0.05重量%至1重量%、或0.1重量%至0.5重量%。

[0082] 增白剂/增亮剂可以包括以下成分中的至少一种:余甘子、桑叶提取物、倒捻子素、槐属、类黄酮、羟基苯氧基丙酸以及二甲基甲氧基色原烷醇。

[0083] 在一个实施方案中,增白剂/增亮剂可以是选自以下成分的混合物:

[0084] 余甘子 (*Emblica*), 以及

[0085] 选自桑叶提取物、倒捻子素、槐属 (*Sophora*)、类黄酮、羟基苯氧基丙酸以及色原烷的抗氧化剂。

[0086] 在一个实施方案中,增白剂/增亮剂可以是选自以下成分的混合物:余甘子和槐属,任选地存在桑叶提取物。通常可以存在桑叶提取物。

[0087] 余甘子可能是余甘果 (*Emblica officinalis*), 通常包含超过40重量% (通常50-80重量%) 的余甘子苷A、余甘子苷B, 赤芍素和石榴皮葡萄糖酸鞣质, 以及不超过约1重量% 的类黄酮。

[0088] 余甘子可能是油柑 (*phyllanthus Emblica*)。

[0089] 槐属可能是小树及豌豆族豆科植物的灌木的提取物。

[0090] 苦参 (*Sophora Angustifolia*) 根提取物、苦参提取物、龙爪槐 (*Sophora japonica*) 提取物,

[0091] 在一个实施方案中,槐属源自苦参根提取物。

[0092] 通常余甘子可能是油柑, 并且槐属源自苦参根提取物。

[0093] 据信类黄酮物种具有抗氧化性能, 并成为一种抗氧化植物多酚剂。术语抗氧化植物多酚剂是指植物提取物或其衍生物, 包含类黄酮类, 包括黄酮、黄酮醇、黄烷酮、黄烷醇和花生黄素; 酚酸类; 芪类; 木脂素以及它们的混合物, 其提供抗氧化剂益处。使用本文所述的总抗氧化能力 (TAC) 试验来测定抗氧化剂益处。植物提供了丰富的多酚类物质来源, 因此是所述抗氧化剂的有效来源。类似的活性物质可以合成制备, 并且因此是所述植物多酚剂的类似物。

[0094] 抗氧化多酚剂可包括选自下述植物的提取物: 桑树 (例如, 桑树 (*morus alba*))、人参 (例如, 人参 (*Panax ginseng*))、覆盆子、牛至 (例如, 牛至 (*origanum vulgare*))、绿茶 (例如, 茶树 (*camellia sinensis*) 的绿色叶子)、白茶 (例如, 茶树 (*camellia sinensis*))、蓝莓提取物 (例如, 干越桔 (*vaccinium cyanococcus*))、法国海岸松树皮 (例如, 海岸松 (*pinus pinaster*), 以商品名 Pycnogenol 出售)、迷迭香 (例如, 迷迭香 (*rosmarinus officialis*))、葡萄 (包括葡萄籽) (例如, 酿酒葡萄 (*vitis vinifera*))、茴香 (例如, 小茴香 (*foeniculi fructus*))、锦鸡儿 (*Caragana sinica*)、马郁兰 (例如, 马郁兰 (*origanum majorana*))、番红花 (例如, 番红花 (*crocus sativus*))、苹果 (例如, 苹果 (*malus domestica*))、咖啡、绿咖啡、樱桃 (例如, 甜樱桃 (*prunus avium*))、雪藻 (例如, 极地雪藻 (*chlamydomonas nivalis*))、余甘子 (例如, 余甘子 (*Phyllanthus emblica*))、银杏 (例如, 银杏 (*Ginkgo biloba*))、辣木 (例如, 辣木 (*moringa oleifera*))、姜类 (例如, 姜 (*zingiberaceae*))、木兰 (例如, 木兰科金缕梅 (*magnolioidae virginiana*))、法国藏红花 (French saffron)、火绒草 (例如, 火绒草

(*leontopodium alpinum*))、白莲(例如,白莲(*nymphaea alba*))、姜黄根、药蜀葵(例如,药蜀葵(*althaea officianlis*))、牛蒡(例如,牛蒡(*arctium lappa*))、越橘(例如,黑果越桔(*vaccinium myrtillus*))、蔓越橘(例如,蔓越莓(*vaccinium oxycoccus*)))、石榴花蜜(Pomegranate nectar)(例如,石榴(*Punica granatum*))、鼠尾草(例如,鼠尾草(*salvia officinalis*))、百里香(例如,百里香(*thymus vulgaris*))、向日葵(例如,向日葵(*helianthus annuus*))、野胡萝卜(例如,野胡萝卜(*daucus carota*))、酒花(例如,啤酒花蛇麻草(*humulus lupulus*))、金缕梅(例如,金缕梅(*hamamelis*))、橡树(例如,栎属(*Quercus*))、山茶(例如,山茶(*theacea*))、红三叶草(例如,红三叶(*tritolium pretense*))、亚麻(例如,亚麻(*linium usitatissimum*))、柠檬(例如,柠檬(*citrus limon*))、桦木(例如,桦木(*betula*))、矢车菊(例如,矢车菊(*centaurea cyanus*))、天竺葵、蓼属植物、大豆(例如,大豆(*glycine max*))以及它们的混合物。

[0095] 在一个实施方案中,抗氧化剂多元醇试剂可以是选自以下植物的提取物:桑树、人参、葡萄、牛至、葡萄、鼠尾草、向日葵、海岸松树皮、迷迭香、马郁兰、番红花、法国藏红花、野胡萝卜、酒花、咖啡、绿咖啡、金缕梅、橡木、山茶、红三叶草、亚麻、姜、木兰、火绒草、牛蒡以及它们的混合物。

[0096] 来自上述植物列表的活性多酚物质包括选自以下的芹菜素、木犀草素、槲皮素、山奈酚、柚皮素、橙皮素、儿茶素、没食子儿茶素、矢车菊素、天竺葵素、大豆黄素、染料木素、咖啡酸、绿原酸、迷迭香酸、没食子酸、白藜芦醇、阿魏酸、表没食子儿茶素没食子酸酯、云杉鞣醇、开环异落叶松树脂酚、异紫杉树脂醇、宫边苔草酚C、木犀草素以及它们的混合物。

[0097] 如本领域技术人员所理解的,用于本发明的抗氧化植物多酚剂的量以提取物的干重表示。抗氧化植物多酚剂(植物提取物)可以以组合物的0.005重量%至10重量%、或0.01重量%至7重量%,或0.01重量%至5重量%存在。

[0098] 当色原烷存在时,其可以选自:甲基、二-、三-和四-C1-C6烷基、C1-C6烷氧基色原烷醇;五甲基色原烷醇、甲基、二、三和四C1-C6烷基、C1-C6烷氧基色原烷醇C14-C20酯以及它们的混合物。

[0099] 通常可以选择下述色原烷:二甲基甲氧基色原烷醇、四甲基甲氧基色原烷醇、五甲基色原烷醇、二甲基甲氧基色原烷基棕榈酸酯、二烷基甲氧基色原烷基肉豆蔻酯、二甲基甲氧基色原烷基硬脂酸酯、二甲基甲氧基色原烷基油酸酯、二甲基甲氧基色原烷基亚油酸酯以及它们的混合物。

[0100] 在一个实施方案中,色原烷可以是二甲基甲氧基色原烷醇(由Lipotec以商品名Lipochroman 6市售)。

[0101] 皮肤调理剂

[0102] 本发明的组合物可以任选地包含皮肤调理剂。该皮肤调理剂可以选自润湿剂、软化剂、保湿剂或其混合物。当存在皮肤调理剂时,其可以占组合物的0或0.01重量%至20重量%、或0.1重量%至10重量%、或0.5重量%至7重量%。

[0103] 皮肤调理剂可选自胍、尿素、羟基乙酸和羟基乙酸盐、水杨酸、乳酸和乳酸盐、芦荟、乳木果油、多羟基醇(例如山梨糖醇、甘露糖醇、木糖醇、赤藓糖醇、甘油、己三醇、丁三醇、(二)丙二醇、丁二醇、己二醇、聚乙二醇)、糖(例如果糖、葡萄糖、木糖、蜂蜜、甘露糖、木糖)、葡萄糖酸内酯和淀粉及其衍生物、吡咯烷酮、羧酸、透明质酸及其盐、乳酰胺单乙醇胺、

乙酰胺单乙醇胺、泛醇、尿囊素以及它们的混合物。

[0104] 通常皮肤调理剂选自甘油、阿拉伯半乳聚糖、丁二醇、透明质酸、乳木果油、丙二醇、乙基己基甘油、透明质酸盐以及它们的混合物。

[0105] 水杨酸化合物

[0106] 本文公开的组合物可以任选地包含水杨酸化合物、其酯、其盐或其组合。在本文公开的组合物中的一个实施方案中，水杨酸化合物包含占组合物的0或0.0001重量%至25重量%、或0.001重量%至15重量%、或0.01重量%至10重量%、或0.1重量%至5重量%和/或0.01重量%至2重量%的水杨酸。在一个实施方案中，水杨酸化合物是水杨酸。

[0107] 防晒剂

[0108] 本发明的组合物可以任选地包含防晒剂组分。防晒剂可包含有机或无机防晒剂或两者的组合。合适的无机防晒剂包括选自微细二氧化钛和微细氧化锌的那些，以及它们的混合物。

[0109] 合适的有机防晒剂包括选自以下的那些：a) 对氨基苯甲酸、其酯和衍生物（例如，对-二甲基氨基苯甲酸2-乙基己酯）；b) 甲氧基肉桂酸酯（例如，对甲氧基肉桂酸2-乙基己酯、对甲氧基肉桂酸2-乙氧基乙酯或对-二-（对甲氧基肉桂酰）-a'-（2-乙基己酰））；c) 二苯甲酮（例如，羟苯甲酮）；d) 二苯甲酰甲烷，如4-（叔丁基）-4'-甲氧基二苯甲酰甲烷，e) 2-苯基苯并咪唑-5-磺酸及其盐；f) 烷基-β,β-二苯基丙烯酸酯，例如烷基α-氰基-β,β-二苯基丙烯酸酯如奥克利林；g) 三嗪，例如2,4,6-三苯胺基-（对-碳-2-乙基-己基-1-氧）-1,3,5-三嗪；h) 樟脑衍生物如甲基亚苄基樟脑和i) 它们的混合物。其他防晒成分包括选自水杨酸三甲环己酯，水杨酸乙基己酯、二乙基己基丁酰氨基三嗪酮、双乙基己氧基苯酚甲氧基苯基三嗪、二乙基氨基羟基苯甲酰基苯甲酸己酯、丁基甲氧基二苯甲酰甲烷、亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚、聚硅氧烷-15以及它们的混合物。防晒剂可以占组合物的0至10重量%或0.1重量%至10重量%。

[0110] 其他可选的成分

[0111] 可将防腐剂添加到组合物中，如苯甲酸、苯甲酸钠、山梨酸、山梨酸钾、2-溴-2-硝基丙烷-1,3-二醇（溴硝丙二醇，商品名为Myacide®）、苄醇、双咪唑烷基脲、咪唑烷基脲、对羟基苯甲酸甲酯、苯氧基乙醇、对羟基苯甲酸丙酯、对羟基苯甲酸甲酯钠、脱氢乙酸钠、聚六亚甲基双胍盐酸盐、异噻唑酮和对羟基苯甲酸丙酯钠以及它们的混合物，适宜的量组合物的0.01重量%至10重量%。

[0112] 可以向组合物中添加螯合剂，如乙二胺四乙酸及其盐，其量通常为组合物的0或0.005重量%至0.5重量%。

[0113] 所述组合物可以包含适当量的蜡如可可脂，其量为组合物的0.1至10重量%。

[0114] 该组合物还可以包含合适的化妆品学上可接受的稀释剂、载体和/或推进剂，例如二甲醚。该组合物还可以包含珠光剂，例如硬脂酸单乙醇酰胺和/或云母，适宜的量组合物的0或0.01重量%至10重量%。

[0115] 香料可以适宜地以组合物的0或0.01重量%至2重量%的量加入，与水溶性染料如酒石黄一样，适宜的量微量，例如组合物重量的0或 1×10^{-5} 重量%至0.1重量%。

[0116] 该组合物还可以包含pH调节剂，例如氢氧化钠、氨基甲基丙醇、三乙醇胺，其适宜的量组合物的0或0.01重量%至10重量%。可以通过本领域熟知的方法对组合物进行缓

冲,例如通过使用包含琥珀酸、柠檬酸、乳酸及其可接受的盐、磷酸、磷酸一钠或磷酸二钠和碳酸钠的缓冲体系。合适地,组合物可以具有3至10、4至8或4.5至6.5的pH。

[0117] 在一个实施方案中,本公开的技术的组合物不包含选自抗坏血酸磷酸钠、抗坏血酸葡萄糖苷、L-抗坏血酸、抗坏血酸棕榈酸酯、抗坏血酸视黄基酯、抗坏血酸四己基癸基酯或抗坏血酸磷酸镁的抗坏血酸衍生物。

[0118] 在一个实施方案中,本公开的技术的组合物不包含MMP化合物,所述MMP化合物包含一种羟基芳基或多羟基芳基化合物或基于包含吡喃、内酰胺或哌啶组分的化合物的具有环状基团的环状化合物。

[0119] 可以向组合物中添加增稠剂,粘度调节剂和/或胶凝剂,例如丙烯酸聚合物,如商品名市售的丙烯酸聚合物Carbopol®或Ultrez®(均属于Lubrizol);或牛磺酸酯共聚物,如丙烯酰基甲基牛磺酸酯-乙烯基吡咯烷酮共聚物或丙烯酸羟乙酯/丙烯酰基二甲基牛磺酸钠共聚物;或改性纤维素,如以商品名(Hercules)市售的羟乙基纤维素或羟丙基甲基纤维素、氧化胺、环氧乙烷和环氧丙烷的嵌段聚合物(例如BASF Wyandotte的商品名为“Pluronic”®得自那些)、PVM、MA或癸二烯交联聚合物(以商品名Stabilez®60市售)、乙氧基化脂肪醇、盐(氯化镁、氯化钠)、Aristoflex®AVC(Clariant)、邻苯二甲酸酰胺、黄原胶、淀粉或改性淀粉(例如淀粉的金属盐,如1-辛烯基琥珀酸酐与淀粉的反应产物的铝盐)、聚丙烯酸钠、聚乙烯醇、脂肪醇和购自Hercules的商品名为N-Hance®的烷基半乳甘露聚糖。

[0120] 凝胶

[0121] 当本文公开的组合物为凝胶形式时,其可以含有0.1重量%至10重量%、或0.5重量%至5重量%、或0.5重量%至3重量%的增稠剂,例如粘度调节剂和/或胶凝剂,并且通常可以为聚合增稠剂。

[0122] 该凝胶可以包含:

[0123] 50重量%至95重量%的水和0.1重量%至10重量%的增稠剂,或

[0124] 60重量%至95重量%的水和0.5重量%至5重量%的增稠剂,或70重量%至90重量%的水和0.5重量%至3重量%的增稠剂。

[0125] 乳液

[0126] 本文公开的乳液可以是油包水、水包油或硅氧烷包水组合物,通常为水包油组合物。

[0127] 乳液可以是水包油乳液,或硅油包水乳液,通常为水包油乳液。

[0128] 乳液可以包含油相并且水相含量为组合物的30重量%至85重量%、或50重量%至80重量%、或60重量%至75重量%。

[0129] 水相可以含有占组合物的40重量%至80重量%、或50重量%至75重量%、或60重量%至75重量%的水。

[0130] 乳液可以包含油相,其含量为组合物的15重量%至70重量%、或30重量%至50重量%、或25重量%至40重量%。

[0131] 乳液可以为水包油组合物,其包含15重量%至70重量%的油相;以及30重量%至85重量%的水相。

[0132] 乳液可以为水包油组合物,其包含25重量%至40重量%的油相;以及60重量%至

75重量%的水相。

[0133] 乳液可以为硅氧烷包水乳液的形式,并且水相(water phase)可以占水相(aqueous phase)的30重量%至85重量%;并且硅氧烷占硅氧烷相的15重量%至70重量%。

[0134] 乳液可以为硅氧烷包水乳液的形式,并且水相可以占水相的60重量%至75重量%;并且硅氧烷占硅氧烷相的25重量%至40重量%。

[0135] 如果本文公开的组合物为硅氧烷包水组合物的形式,油相可以通过任何合适的硅酸盐、二甲基硅氧烷醇、硅氧烷弹性体以及它们的混合物(通常为硅氧烷弹性体)提供。

[0136] 通常硅氧烷油相可以由有机聚硅氧烷形成。有机聚硅氧烷可选自聚烷基硅氧烷、烷基取代的二甲聚硅氧烷、环聚二甲基硅氧烷、三甲基甲硅烷氧基硅酸酯、聚二甲基硅氧烷醇、聚烷基芳基硅氧烷以及它们的混合物中的一种或多种。聚烷基硅氧烷可以为(例如)环聚二甲基硅氧烷或二甲聚硅氧烷,通常为二甲聚硅氧烷。

[0137] 本文公开的硅氧烷包水组合物可包含乳化交联的有机聚硅氧烷弹性体,非乳化交联的有机聚硅氧烷弹性体或其混合物。如本文所用术语“非乳化”限定了不含聚氧化烯单元的交联有机聚硅氧烷弹性体。该弹性体可以为通过位于分子呈球状的MQ树脂上的Si-H位点而交联的二甲基聚硅氧烷。乳化交联的有机聚硅氧烷弹性体包括交联美国专利5,412,004; 5,837,793;以及5,811,487中所描述交联聚合物。由聚二甲基硅氧烷共聚醇交联聚合物(和)二甲基聚硅氧烷组成的乳化弹性体可以以商品名KSG-21从Shin Etsu商购获得。

[0138] 非乳化弹性体可以包含聚二甲基硅氧烷交联聚合物。这种聚二甲基硅氧烷交联聚合物可由多个供应商提供,包括Dow Corning (EL9240)。其他聚二甲基硅氧烷交联聚合物可得自General Electric (SFE 839)、Shin Etsu (KSG-15,16,18[二甲基聚硅氧烷/苯基乙烯基二甲基聚硅氧烷交联聚合物])、以及Grant Industries (GRANSIL™系列弹性体)。在本发明中使用的交联的有机聚硅氧烷弹性体及其制备方法将进一步在美国专利4,970,252;5,760,116;以及5,654,362中有所描述。这里通常使用的市售弹性体是Dow Corning的9040硅氧烷弹性体共混物,Shin Etsu的KSG-21以及它们的混合物。

[0139] 水包油或油包水乳液可以包含有机油。有机油可以是挥发性的或非挥发性的。有机油可以包含稀释剂、溶剂、聚烯烃聚合物或酯油。

[0140] 术语“酯油”是指在室温(25℃)下为液体的包含至少一个酯官能团的油。本文中使用的酯油(例如)选自单酯。

[0141] 酯油可以(例如)选自式 R_1COOR_2 的单酯,其中 R_1 可以选自包含4至30、或6至24、或7至20个碳原子的直链和支链烷基链,并且 R_2 可以选自包含3至40个碳原子(例如10至30个碳原子和进一步(例如)16至26个碳原子)的支链烷基链。

[0142] 可提及的酯油的实例包括新戊酸异癸酯;辛酸异鲸蜡酯;异壬酸异壬酯、异壬酸异癸酯、异壬酸十三烷基酯;月桂酸己酯、月桂酸2-己基癸酯;肉豆蔻酸异丙酯、肉豆蔻酸异十六烷基酯、肉豆蔻酸异十三烷基酯、肉豆蔻酸2-辛基十二烷基酯;棕榈酸异丙酯、棕榈酸2-乙基己酯、棕榈酸异辛酯、棕榈酸异十六烷基酯、棕榈酸异癸酯、棕榈酸异硬脂醇酯、棕榈酸2-辛基癸酯;异硬脂酸异丙酯、硬脂酸2-辛基十二烷基酯、异硬脂酸异硬脂醇酯以及芥酸2-辛基十二烷基酯。

[0143] 本公开的乳液中酯油的量可以占组合物的0至20重量%、或0.1重量%至15重量%、或1重量%至10重量%。

[0144] 例子

[0145] 使用以下一般程序制备一系列组合物。将一定百分比的水添加到容器中,并添加一定百分比的葡糖酸内酯以形成混合物。然后将该混合物搅拌约30分钟。将一定百分比的维生素C或其衍生物添加到容器中并搅拌至溶解。使用50w/w的氢氧化钾或柠檬酸粉末溶液将pH调节至 4.6 ± 0.1 。所制备的组合物为:

[0146] 比较例1 (CE1):含有0.5重量%的维生素C(抗坏血酸)和1.5重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0147] 比较例2 (CE2):含有0.5重量%的抗坏血酸磷酸钠和1.5重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0148] 比较例3 (CE3):含有0.5重量%的抗坏血酸葡糖苷和1.5重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0149] 发明例1 (IE1):含有0.5重量%的3-乙基抗坏血酸和1.5重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0150] 比较例4 (CE4):含有1重量%的维生素C(抗坏血酸)和1.5重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0151] 比较例5 (CE5):含有1重量%的抗坏血酸磷酸钠和1.5重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0152] 比较例6 (CE6):含有1重量%的抗坏血酸葡糖苷和1.5重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0153] 发明例2 (IE2):含有1重量%的3-乙基抗坏血酸和1.5重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0154] 比较例7 (CE7):含有0.5重量%的维生素C(抗坏血酸)和7重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0155] 比较例8 (CE8):含有0.5重量%的抗坏血酸磷酸钠和7重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0156] 比较例9 (CE9):含有0.5重量%的抗坏血酸葡糖苷和7重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0157] 发明例3 (IE3):含有0.5重量%的3-乙基抗坏血酸和7重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0158] 比较例10 (CE10):含有1重量%的维生素C(抗坏血酸)和7重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0159] 比较例11 (CE11):含有1重量%的抗坏血酸磷酸钠和7重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0160] 比较例12 (CE12):含有1重量%的抗坏血酸葡糖苷和7重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0161] 发明例4 (IE4):含有1重量%的3-乙基抗坏血酸和7重量%的葡糖酸内酯的组合物。

[0162] 测试

[0163] 使用X Rite Color™ i7台式分光光度计,并用液体测定用透射试剂盒

(transmission kit)以通过分析随时间变化的颜色,评价各例子的稳定性。对于每种新样品,测试程序都包含以下步骤:(1)校准透射测定用分光光度计,(2)用测试溶液填充比色皿,(3)将比色皿插入仪器,(4)测量各样品的初始(标准) $L^*a^*b^*$ 值,(5)清洁并干燥溶液以进行下一次测量。

[0164] 初始测量后,将各样品放置在40℃的潮湿箱中。在各样品在40℃的箱中储存1、7和14天后,测量各样品的颜色变化。在测量颜色变化之前,将各样品冷却至23℃。然后通过上述步骤1至5对各样品进行评价。

[0165] 将分光光度计在初始测量后的DE2000等级归一化为0。下表显示了各样品在14天后获得的结果。通常对于DE2000评分较低的样品(DE2000测量的颜色变化为无色)可以获得更好的结果。DE2000的增加表明样品随着时间变得越来越不稳定。

[0166]	例子	DE2000	例子	DE2000
	CE1	4.7	CE7	22.0
	CE2	0.28	CE8	0.61
	CE3	0.22	CE9	0.39
[0167]	IE1	0.05	IE3	0.07
	CE4	9.46	CE10	7.27
	CE5	2.32	CE11	2.71
	CE6	0.77	CE12	1.88
	IE2	0.15	IE4	0.09

[0168] 所获得的结果表明,与含有维生素C或抗坏血酸磷酸钠或抗坏血酸葡萄糖苷的比较例相比,本公开的技术的组合物具有改善的稳定性。