

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.

A61K 8/85 (2006.01)

A61Q 5/00 (2006.01)



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 01816188. X

[45] 授权公告日 2008 年 10 月 1 日

[11] 授权公告号 CN 100421645C

[22] 申请日 2001.10.9 [21] 申请号 01816188. X

[30] 优先权

[32] 2000.10.10 [33] US [31] 09/685,850

[86] 国际申请 PCT/US2001/031542 2001.10.9

[87] 国际公布 WO2002/030367 英 2002.4.18

[85] 进入国家阶段日期 2003.3.24

[73] 专利权人 宝洁公司

地址 美国俄亥俄州

[72] 发明人 马乔里·M·佩弗利

安东尼·R·马凯塔

[56] 参考文献

DE2262375 A 1974.6.27

US5783202A 1998.7.21

EP 149175 A2 1985.7.24

JP 11 - 302133 A 1999.11.2

JP 61 - 238718 A 1986.10.24

US 5783202 A 1998.7.21

JP 3 - 141213 A 1991.6.17

ES 2052450 A 1994.7.1

DE 2262375 A 1974.6.27

JP3 - 141213A 1991.6.17

JP61 - 238718A 1986.10.24

ES2052450A 1994.7.1

EP0149175A2 1985.7.24

JP11 - 302133A 1999.11.2

审查员 任 怡

[74] 专利代理机构 北京市柳沈律师事务所

代理人 贾静环 宋 莉

权利要求书 1 页 说明书 18 页

[54] 发明名称

头皮美容组合物以及相应的提供头皮增湿和皮肤活性有益效果的方法

[57] 摘要

本发明公开了局部免洗型美容组合物，包括包装的免洗型组合物，该组合物直接应用在头皮上，其中含有 a) 约 40% 至约 99% 重量的挥发性液体，b) 约 0.005% 至约 20% 重量的皮肤活性物质，和 c) 约 0.1% 至约 20% 重量的增湿物质，优选液体湿润剂。该组合物是基本上不含清洁表面活性剂的免洗型制剂，并且直接应用于头皮上。本发明还公开了通过直接将局部组合物应用到头皮上来治疗头皮的方法。已经发现，本发明组合物和方法可以提供改善的头皮增湿作用和改善的去头屑或其它皮肤活性物质在皮肤上的沉积，而不过分影响美发。

1. 头皮美容组合物，该组合物含有：

- a)40%至 80%重量的挥发性液体，该挥发性液体在 25℃温度测得的蒸气压大于 23.7 毫米汞柱，和
- b)0.005%至 20%重量的含锌去头屑活性物质，
- c)0.1%至 20%重量的液体湿润剂，
- d)5%至 50%重量的水，
- e)0.001%至 10%重量的卡波姆，

其中该组合物是含低于 2% 重量的清洁表面活性剂的免洗型组合物，并且直接应用于头皮上，且该免洗型组合物的粘度为 1,000 至 20,000 厘沲。

2. 权利要求 1 的头皮美容组合物，其中含锌去头屑活性物质的含量为组合物重量的 0.005%至 2%。

3. 权利要求 2 的头皮美容组合物，其中含锌去头屑活性物质选自乳糖酸锌、吡啶硫酮锌，及其组合。

4. 权利要求 3 的头皮美容组合物，其中含锌去头屑活性物质是吡啶硫酮锌。

5. 权利要求 1 的头皮美容组合物，其中挥发性液体在 25℃温度测得的蒸气压为至少 25 毫米汞柱。

6. 权利要求 5 的头皮美容组合物，其中挥发性液体包括具有 2 至 8 个碳原子的一元醇，其中一元醇占该挥发性液体重量的 20%至 100%。

7. 权利要求 6 的头皮美容组合物，其中一元醇是乙醇。

8. 权利要求 1 的头皮美容组合物，其中液体湿润剂占组合物重量的 1%至 10% 重量。

9. 权利要求 8 的头皮美容组合物，其中液体湿润剂选自聚丙二醇、聚乙二醇、乙基己二醇、己二醇、甘油、丙二醇、山梨醇，及其组合。

10. 权利要求 1 的头皮美容组合物，其中该组合物还含有 0.01%至 2% 重量的清凉感觉剂。

头皮美容组合物以及相应的提供头皮增湿 和皮肤活性有益效果的方法

发明领域

本发明涉及增湿头皮化妆品和相应的该化妆品的应用方法，该组合物含有皮肤活性物质，直接应用到头皮上以提供改善的增湿和皮肤活性有益效果。

发明背景

去头屑产品是公知的，并且通常可以在消费者市场购得。许多这些产品呈香波或生发油形式面市，其中含有去头屑成分，例如吡啶硫酮锌、三氯生、三氯碳酰苯胺、甘草酸二钾盐、甘草酸一铵、尿囊素、含硫物质、异丙基甲基酚、水杨酸及类似的其它物质。

去头屑头发或头皮滋补剂尤其适用，消费者可以使用该去头屑滋补剂达到满意的去头屑效果，但另一方面也选择专门用于其头发类型的护理所需，而非只为了控制或治疗头皮屑所需的香波。最终结果是达到良好的美发效果和控制与头皮屑头发有关的剥落和瘙痒。这些去头屑滋养剂经常是含水液体，其中去头屑活性物质溶解或者分散在含水载体中，该载体含有水和最高达 80% 重量的小链醇载体液体。

然而，许多去头屑头发和头皮滋养剂会使头皮变得过分干燥，因此在一定程度上产生与滋养剂中去头屑活性物质的去头屑作用相反的作用。这些滋养剂经常含有高百分比的挥发性载体，例如乙醇，以在应用的过程中或者应用之后为头皮提供凉爽的感觉，但是也趋于使皮肤干燥，尤其是在反复使用后。这些滋养剂还有其它的在应用过程中与头发接触的问题，并且在某些情况下对美发具有负面影响。

已经发现，含有去头屑或其它皮肤活性物质的头发和头皮滋养剂，下文称作头皮美容组合物，可以配制并应用到头皮上，而不使头皮变得过分干燥，并且不会过分影响美发。这可以通过配制含有下列组分的免洗型组合物实现：约 0.1% 至约 20% 重量的增湿物质、优选液体湿润剂，约 0.005% 至

约 20%重量的去头屑或其它皮肤活性物质，和约 40%至约 99%重量的挥发性液体，其中该组合物基本上不含清洁表面活性剂，并直接应用到头皮上。

还发现，本发明的头皮美容组合物可以直接应用到头皮上，这样不仅改善了皮肤的湿润性，也改善了皮肤活性物质在头皮上的沉积。该组合物优选具有多个开口的敷料器或其它递送系统直接应用到头皮上，该组合物通过这些开口直接应用到头皮上。组合物直接应用到头皮上可以通过使用合适的敷料器或其它递送系统实现，而不会过分影响美发。

因此，本发明的目的是提供改善了皮肤活性物质对头皮递送、而不会过分影响美发的组合物和方法。本发明的另一个目的是在达到这样的皮肤活性物质递送的同时还提供改善的对头皮的增湿效果，特别是当皮肤活性物质是去头屑物质时。本发明的再一个目的是，通过直接应用含有挥发性液体、去头屑或其它皮肤活性物质以及液体湿润剂的免洗型制剂，而将所有这些组分递送到所需的头皮区域。

发明概述

本发明涉及免洗型头皮美容组合物以及相应的将该组合物直接应用到头皮上的方法，其中该组合物含有约 0.1%至约 20%重量的增湿物质、优选液体湿润剂，约 0.005%至约 20%重量的去头屑或其它皮肤活性物质和约 40%至约 99%重量的挥发性液体，并且其中该组合物基本上不含清洁表面活性剂，并直接应用到头皮上。该免洗型头皮美容组合物优选包含或者包装在具有多个开口的包装中，该免洗型头皮美容组合物通过这些开口直接应用到头皮上。

已经发现，本发明免洗型头皮美容组合物和相应的方法可以提供头皮增湿、去头屑或其它皮肤活性有益效果，以及改善的皮肤活性物质在头皮上的沉积，而不过分影响美发。

发明详述

本发明头皮美容组合物和相应的方法涉及下列基本的限制：

- 1)挥发性液体载体，
- 2)去头屑或其它皮肤活性物质，
- 3)增湿物质，优选液体湿润剂，和

4)该组合物直接应用到头皮上。在下文中将更详细地描述以上各条限制。

除非另有说明，本文所用术语“挥发性的”是指这样的物质，它们的环境条件下为液体，在 25℃ 温度测得的蒸气压大于 25℃ 温度时水的蒸气压，优选其蒸气压大于约 25 毫米汞柱、更优选的是其蒸气压大于约 35 毫米汞柱。相反，除非另有说明，本文所用术语“非挥发性的”是指固体或液体物质，它们在 25℃ 温度测得的蒸气压等于或小于 25℃ 温度时水的蒸气压，即其在 25℃ 温度的蒸气压等于或小于 23.7 毫米汞柱。

本文所用术语“免洗型”是指本发明组合物，并且是指该组合物应用到所需皮肤区域、而无需随后漂净或洗发，在应用后保留至少约 1 小时，更通常是应用后保留至少约 6 小时的方法。术语“免洗型”明确地排除了如下组合物，例如香波、皮肤清洁组合物和其它类似的组合物，这些组合物直接应用到所需身体区域，随后立即洗掉，或者在应用后几分钟内洗去。

除非另有说明，本文所用术语“环境条件”是指约 1 个大气压 (1atm)、约 50% 相对湿度和约 25℃ 温度的周围条件。除非另有说明，本文所述的所有值、量和量度均是在环境条件下获得的。

本发明的头皮美容组合物基本上不含清洁表面活性剂。在上下文中，术语“基本上不含”是指如下的头皮美容组合物，该组合物含有少于 5%、优选少于 2% 重量的清洁表面活性剂。然而，应该理解，该组合物可以含有少于 5% 重量的该表面活性剂，条件是该表面活性剂用于使制剂稳定或者另外改善该组合物的非清洁性能。

本发明头皮美容组合物直接应用在头皮上。在上下文中，“直接应用”是指该组合物主要直接施用在头皮上、而非头发上，优选通过具有多个开口的敷料器或其它包装体系应用，该组合物通过这些开口由敷料器或其它包装体系中直接应用到头皮上、而非头发上。该直接应用典型包括应用到头皮和最接近或邻近头皮的部分头发或发干上，但是优选并具体地是，不包括组合物常规的类似滋养剂或香波那样应用到头发或头皮上，这种常规方法是用手或其它软的基质将产品应用到头发和头皮上、然后将该组合物揉遍头发至所需的头皮区域。

本发明的头皮美容组合物和相应的方法可以包含、包括或本质上包括本文所述的该发明的必要成分和限制，以及任何附加的或任选的成分、组分或本文所述的限制或该应用的其它效果。

除非另有说明，本文所用的所有百分数、份数和比例均以头皮滋养组合物总重量计。除非另外指明，与所列成分有关的所有这些重量均以具体成分的含量为基础，因此不包含市售物质中可能包括的溶剂、载体、副产物、填充剂或其它微量组分。

皮肤活性物质

本发明的头皮美容组合物含有足以提供所需皮肤活性效果的去头屑或其它皮肤活性物质。任何去头屑或其它皮肤活性物质是已知的，或者在提供去头屑或其它皮肤活性效果方面的有效性适用于本发明组合物和方法。本发明组合物中的皮肤活性物质或试剂可以是增溶的或者是分散的液体形式，或者是增溶的或分散的固体形式。

本发明的头皮美容组合物和方法中的皮肤活性物质以不同浓度的组成进行配制，但是通常占头皮美容组合物重量的约 0.005%至约 20%、更典型约 0.01%至约 10%、甚至更典型约 0.05%至约 7%。浓度将根据如下因素改变：对于所选择的特定皮肤活性物质的确定的安全有效浓度、所需的皮肤活性有益效果的程度或类型等。适用于本发明的皮肤活性物质的非限制性实例包括去头屑活性物质、甾族抗炎剂(例如皮质甾醇)、非甾族抗炎剂、抗刺激活性物质、杀虫剂(例如用于控制虱、蚤类、蜱类或其它昆虫的物质)、植物基质的植物甾醇及其衍生物(例如 β -谷甾醇、菜油甾醇、豆甾醇)、凉爽或其它皮肤可感觉的物质、除去头屑活性物质之外的抗微生物剂、麻醉剂、抗组胺剂、收敛剂、酶、维生素、头发生长活性物质、防晒剂以及其它类似的已知物质或者其它效果的局部药物或非药物活性物质。

用作皮肤活性物质的杀虫剂的非限制性实例包括丁醇向日葵醛(peperonyl butoxide)、除虫菊提取物、imidacloprid 局部用溶液、林丹(六氯化苯)、有机磷酸酯(马拉硫磷)、天然除虫菊酯、合成除虫菊酯(例如扑灭司林)和任何其它已知或者其它效果的、用于控制或治疗皮肤、头发或毛皮以抵抗昆虫的物质，所述昆虫是蚤类、虱类和其它昆虫。

用于本发明的皮肤活性酶的非限制性实例包括氧化还原酶、转移酶、裂合酶、水解酶、异构酶、连接酶和类似的其它酶。

皮肤活性物质可以包括所选择的缓解抗炎剂，其浓度为占头皮美容组合物重量的约 0.01% 至约 5.0%、更优选约 0.05% 至约 3.0%。在本文中，缓解抗炎活性物质是指除甾族抗炎剂之外的、有助于缓解和减少皮肤刺激的任何物质。该活性物质的非限制性实例包括泛酸衍生物、泛酸醚、尿囊素或其组合，优选的是泛酸的醇衍生物，例如泛醇(包括 d-泛醇和 l-泛醇)，在 CTFA Cosmetic Ingredient Handbook (The Cosmetic, Toiletry and Fragrance Association, Inc. pp.272-273, 1992) 中描述了某些实例，这些描述结合在本文中作为参考。泛醇也可以用作湿润剂，并且当该组合物不含其它湿润剂时，泛醇应该被认为是用于定义本发明组合物的湿润剂。特别优选的是尿囊素、维生素 E 油，及其组合。

皮肤活性物质优选为去头屑活性物质，最典型的是抗微生物去头屑活性物质，其在组合物中的浓度为组合物重量的约 0.001% 至约 5%、更优选约 0.01% 至约 3%、甚至更优选约 0.05% 至约 1%。优选的抗微生物去头屑活性物质包括杀真菌活性物质，例如吡硫鎓盐、羟甲辛吡酮、酮康唑、苯咪丁酮、环吡司、特比奈芬、伊曲康唑和硫或含硫活性物质，例如硫化硒。最优选的是吡啶硫酮锌(ZPT)，其浓度为组合物重量的 0.005% 至 2%、更优选约 0.005% 至约 0.5%。

硫化硒是优选的用于本发明组合物的抗微生物去头屑活性物质，其有效浓度为头皮美容组合物重量的约 0.001% 至约 5.0%、优选约 0.01% 至约 2.5%、更优选约 0.05% 至约 1.0%。硫化硒通常被看作是具有一摩尔硒和两摩尔硫的化合物，尽管也可以是环结构的 Se_xS_y ，其中 $x+y=8$ 。硫化硒是个人护理领域公知的，并且描述在例如美国专利 2,694,668；美国专利 3,152,046；美国专利 4,089,945；和美国专利 4,885,107 中，这些描述结合在本发明中作为参考。

其它硫或含硫物质也可以用作头皮美容组合物中的抗微生物活性物质，其浓度为头皮美容组合物重量的约 0.001% 至约 5.0%、优选约 0.1% 至约 5.0%、更优选约 1.0% 至约 5.0%。

吡硫翁抗微生物活性物质，特别是 1-羟基-2-吡啶硫酮盐是高度优选的、用于头皮美容组合物的去头屑活性物质。优选的吡硫鎓盐是那些由重金属形成的盐，所述重金属是例如锌、锡、镉、镁、铝和镉这样的金属。锌盐是最优选的，特别是 1-羟基-2-吡硫鎓的锌盐(吡啶硫酮锌，ZPT)。其它阳离

子，例如钠也是适用的。特别优选的是板状颗粒形式的 1-羟基-2-吡硫鎓盐，其中颗粒的平均大小最高达约 20 微米、优选最高达约 8 微米、最优选最高达约 5 微米。吡硫鎓抗微生物活性物质是护发领域公知的，并且描述在例如美国专利 2,809,971；美国专利 3,236,733；美国专利 3,753,196；美国专利 3,761,418；美国专利 4,345,080；美国专利 4,323,683；美国专利 4,379,753；和美国专利 4,470,982 中，这些描述结合在本发明中作为参考。

用于本发明组合物和方法的含锌皮肤活性物质的其它具体实例包括吡啶硫酮锌、乙酸锌、乙酰基甲二磺酸锌、天冬氨酸锌、硼酸锌、碳酸锌、氯化锌、柠檬酸锌、DNA 锌、甲醛次硫酸锌、葡萄糖酸锌、谷氨酸锌、水解胶原锌、乳酸锌、月桂酸锌、肉豆蔻酸锌、新癸酸锌、棕榈酸锌、PCA 锌、十五烯三羧酸锌、蓖麻油酸锌、蓖麻油酸锌、松脂酸锌、硬脂酸锌、硫酸锌、十一碳烯酸锌、氧化锌、乳糖酸锌，及其组合。

用于本发明组合物和方法的皮肤活性物质可以包括任何物质，这些物质加入组合物中可以提供毛发生长调节作用(在本文中称作“毛发生长活性物质”)。在上下文中，术语“毛发生长调节”包括刺激毛发生长；刺激头发增密；防止、减少、阻止和/或延迟掉头发；防止、减少、阻止和/或延迟头发变稀；增加毛发生长速度；诱导更多发丝形成；增大发丝直径；延长发丝；将毛囊由毫毛囊变为末端囊；诱导毫毛囊的形成；将囊由静止期转化为生长旺盛期(由此增加生长旺盛期囊与静止期囊的总体比例)；促进囊由较早的生长旺盛期发展为较晚的生长旺盛期；引起生长旺盛期向生长中期转化；治疗脱发；及其任意组合。

优选的毛发生长活性物质包括含锌的盐，例如本文所述的那些，特别是乳糖酸锌。适用于本发明组合物和方法的其它毛发生长活性物质包括在美国专利 6,124,362(Bradbury 等)中描述的那些物质，这些描述结合在本发明中作为参考。

挥发性液体

本发明的头皮美容组合物包含适于局部应用到人皮肤上的挥发性液体载体。这些液体载体包括任何在环境条件下为挥发性的液体，或者任何液体载体的组合，这些组合在环境条件下为挥发性的，另外它们适于局部应用到头皮或皮肤的其它区域。

在本发明头皮滋养组合物中，挥发性液体载体或载体组合的含量为头皮美容组合物重量的约 40%至约 99%、优选约 50%至约 80%、更优选约 55%至约 80%、甚至更优选约 60%至约 75%。

挥发性液体载体优选包括具有 2 至 8 个碳原子、更优选约 2 至 4 个碳原子的一元醇，优选的实例包括乙醇、异丙醇、丙醇、正丁醇、叔丁醇、异丁醇，及其组合。最优选的是乙醇。其它挥发性液体载体也可用于该组合物，优选不含聚硅氧烷的液体载体，它们可以单独使用，或者以各种组合方式使用，例如与本发明优选的一元醇组合使用。这些其它挥发性液体载体的非限制性实例包括挥发性烃液体、多元醇、一元醇或多元醇的酯或醚和聚硅氧烷等，条件是它们具有本文所述的必需的挥发性，并且不是下文所述的本发明组合物的液体湿润剂组分。

增湿物质

本发明头皮美容组合物含有一种或多种增湿物质，以使该组合物具有改善的增湿性和/或鳞片减少的有益效果。增湿物质可以是任何已知的或者在提供皮肤增湿方面有其它效果的物质，并且优选限制为如下的物质，它们使组合物具有如本文所述的头皮增湿或瞬时鳞片减少值。

用于本发明头皮美容组合物的增湿物质优选为液体湿润剂。适合的湿润剂包括任何液体吸湿物质，它们是已知的、或者在提供免洗型组合物皮肤增湿作用方面有效的物质。该物质的浓度将根据如下因素改变：所选择的制剂和制剂中的具体湿润剂，但是该浓度最典型为头皮美容组合物重量的约 0.1%至约 20%、更典型约 0.5%至约 15%、最优选约 1.0%至约 10%。

适用于本发明头皮美容组合物的液体湿润剂包括任何吸湿性、水溶性液体，它们在 25℃温度水中的溶解度至少为 50%重量。许多这些湿润剂具有一个或多个连接的羟基，其非限制性实例包括液体聚亚烷基二醇，例如聚丙二醇和二乙二醇或聚乙二醇(例如分子量为约 200 至约 600，例如 PEG-4、PEG-6、PEG-8、PEG-12)、乙基己二醇、己二醇、丁二醇、甘油、丙二醇、二丙二醇、三聚丙烯二醇、聚丙烯-5-月桂基醚-5、聚甘油椰酸酯、山梨醇、果糖、甘氨酸、肌醇、泛醇，及其组合。

合适湿润剂的具体非限制性实例包括 Lubrajel Oil[®] (甘油基聚甲基丙烯酸酯和丙二醇)、Glucquat[®] 125 (lauryl methyl gluceth-10 hydroxypropyldimonium chloride)、Glucam[®] E-10 (methyl gluceth-10)、Glucam[®]

E-20 (methyl gluceth-20)、Glucam[®] P-10 (PPG-10 甲基葡萄糖醚)、Glucam[®] P-20 (PPG-20 甲基葡萄糖醚)、乳酸钠、PCA 钠、Schercomid LME(乳酰胺 MEA)、Clearcol(溶解胶原)、Collasol M (溶解胶原)、Crolastin (水解弹性蛋白)、Cromoist CS(sodium chondroitin sulfate 和水解胶原)、Cromoist HYA (水解胶原和透明质酸)、CromoistWHYA(水解小麦蛋白和透明质酸)、CromoistO-25(水解燕麦)、CropeptideW(水解小麦蛋白和水解小麦淀粉)、Crosilk 10,000 (水解丝)、Crosilk Liquid (丝氨基酸)、Crosilkquat (Cocodimonium hydroxypropyl silk amino acids)、Crotein CAA/SF(胶原氨基酸)、Crotein HKP (毛发角蛋白(keatin)氨基酸和氯化钠)、Crotein HKP/SF (角蛋白氨基酸)、Crotein MCAA (胶原氨基酸)、Hydrolactin 2500 (水解乳蛋白)、Hydrosoy 2000 (水解大豆蛋白)、Hydrotriticum[®] 2000(水解小麦蛋白)、Hydrotriticum[®] WAA (小麦氨基酸)、Reticusol(水解网硬蛋白)、Tritisol[®](水解小麦蛋白)、Incromectant AMEA-100 (乙酰胺 MEA)、Incromectant AMEA-70(乙酰胺 MEA)、Incromectant LMEA (乙酰胺 MEA 和乳酰胺 MEA)、Incromectant AQ (乙酰氨基丙基三甲基氯化铵)、Incromectant LQ (乳酰氨基丙基三甲基氯化铵)、Gelatin NF、Lactil[®] (乳酸钠和 PCA 钠, 以及甘氨酸和果糖和尿素和烟酰胺和 inositol, 和苯甲酸钠以及乳酸)。

用于头皮美容组合物的湿润剂优选渗透头皮皮肤表层, 即角质层, 然后将水分吸入那些皮肤层中, 由此在应用后提供改善的头皮增湿作用。该湿润剂优选有助于提供具有如下文所定义的优选皮肤增湿量度的组合物。

产品形式

本发明的头皮美容组合物在环境条件下是可流动的液体, 并且具有约 20 厘沲($1\text{mm}^2/\text{s}=1$ 厘沲)至约 60,000 厘沲($1\text{mm}^2/\text{s}=1$ 厘沲)、优选约 100 至约 20,000 厘沲($1\text{mm}^2/\text{s}=1$ 厘沲)的粘度。这些可流动液体可以呈各种形式, 包括分散体、多相乳液或悬浮液, 或者单相溶液。

已经发现, 该头皮美容组合物在环境条件或者使用条件下, 应该具有本文所述的产品的粘度, 以便其在直接应用到头皮上、特别是由敷料器或由为直接头皮应用设计的其它包装直接应用到头皮上时, 提供可接受的涂布特性。还发现, 具有含锌去头屑活性物质的头皮美容组合物应该具有至少 1,000 厘沲($1\text{mm}^2/\text{s}=1$ 厘沲)、优选约 1,000 至约 20,000 厘沲($1\text{mm}^2/\text{s}=1$ 厘沲)。

施)的最小粘度,以在应用过程中提供所需的涂布特性,并使得含锌活性物质均匀地分布在所应用的头皮区域。

产品特性

本发明的头皮美容组合物和方法为头皮提供了以下有益效果,例如减轻瘙痒、减轻刺激、增湿、减少鳞片、减少头皮上的干燥时间,以及与所选择的具体皮肤活性物质有关的其它有益效果。根据所选择的活性物质,这些其它有益效果可以包括毛发生长(例如 ZPT 或其它毛发生长活性物质)、头皮屑控制或抑制、抗炎、杀真菌或其它抗微生物作用等。

本发明的头皮美容组合物优选提供一种或多种下列性能特征,包括如本文定义的鳞片减少和头皮增湿值,其特征是有助于提供上文所述的产品有益效果。按照下文所定义的方法确定这些性能特征。

1.初始鳞片减少

本发明的头皮美容组合物和方法提供了改善的头皮增湿和鳞片减少作用,特别是对于那些进行了头皮屑控制或消除的头皮应用区域。在提供由于头皮增湿所产生的短期鳞片减少、以及由连续应用产品和控制头皮状况(通过连续应用产生鳞片、例如头皮屑控制,并改善去头屑活性物质的沉积)所产生的长期鳞片减少两方面,该组合物均特别有效。

头皮美容组合物优选提供在应用后 5 分钟时测量的初始鳞片减少,以提供如本文所定义的初始鳞片减少值,该值优选至少约 40%、更优选至少约 50%鳞片减少。初始鳞片减少值实质上是指定区域可见鳞片减少百分数的度量,是该区域美容应用的结果。初始鳞片减少值是在应用或者治疗后不久,与组合物有效增加头皮湿度和减少可见鳞片剥落现象有关的度量。按照下列方法测定瞬时鳞片减少值。

按照瞬时鳞片减少的方法学,每个专门小组成员在开始分组之前的 3 天的正常洗浴期间洗腿;在洗净期间不在腿上使用任何类型的膏霜润湿剂。然后用 sharpie 牌标记笔在每条腿上标出几个 3x7 厘米的区域。将头皮美容组合物(用注射器加 0.1 毫升)局部施用到其中一个标记区域,并用带胶乳手套的手指均匀地涂在整个区域。每个专门小组成员的一个标记区域作为对照,其上不应用产品。应用 5 分钟后,用 D-Squame[®]盘(标准 22 毫米透明盘,购自 CUDerm, Corporation,Dallas,Texas, U.S.A)挤压治疗区域,然后立即移开,然后压入 Dsquame 存储卡。用对照(未接受治疗的)皮肤区域重复

该涉及 D-squame 盘的步骤。观察治疗和未治疗区域的 D-squame 盘上的鳞片，并测定瞬时鳞片减少值，作为相对于未治疗对照的盘上鳞片数量减少的百分率。

2. 头皮增湿作用

本发明头皮美容组合物包含增湿物质、优选如上文所述的湿润剂，其中该物质有助于提供具有可头皮增湿、以及有助于减少由干燥或受刺激皮肤导致的鳞片剥落和/或瘙痒的组合物。由头皮美容组合物提供的头皮增湿作用可以通过测量该组合物应用到头皮上后约 4.0 小时时的皮肤水分确定其特性。

用于确定本发明组合物和方法的特性的头皮增湿作用，可以通过将头皮美容组合物应用到腿上之后，测量皮肤增湿作用而间接测定。通过下列方法进行该皮肤增湿测量。下文所述的所有读数均是在 23℃ 温度和 50% 相对湿度下获得的。

按照本文增湿测量的方法学，每个专门小组成员首先在开始分组之前的 3 天的正常洗浴期间洗腿；在洗净期间不在腿上使用任何类型的润湿剂或膏霜。用 sharpie 牌标记笔在每条腿上标出几个 3x7 厘米的区域。在用任何产品处理之前，在标记区域的五个不同的点读取 Skicon 读数(Skicon-200, 购自 I.B.S. Co. Ltd. (Shizuoka-ken, Japan)。通过用多点探头测量电导率(微欧姆或 $\mu\sigma$)以避免毛发、并确保与角质层接触，使用 Skicon 评价皮肤表面的水合作用。将产品处理之前的五个 Skicon 读数平均，作为基线，并将接受治疗皮肤的 Skicon 读数与之比较。

在获得基线读数后，将 0.1 毫升产品应用到获得基线读数的区域，并用带胶乳手套的手指均匀地涂在整个区域。将其中一个标记区域作为对照，在试验过程中，其上不应用产品。应用 4 小时后，在应用和标记区域再取五个 Skicon 读数。将这 4 个读数平均。然后从由相同应用区域得到的 4 小时读数平均值中减去平均基线读数，得到增加的增湿作用，该增湿作用是由于在该区域应用该产品所致。然后将该增湿作用的增加与同样经过 4 小时的未治疗对照测得的增湿作用的增加进行比较。在腿上，接受治疗皮肤与未治疗皮肤增湿作用的增加与预期类似产品在头皮上应用的皮肤增湿作用的增加相关。该治疗对未治疗皮肤的增湿作用的相对增加在本文中以头皮增湿值描述其特性，该值是治疗对未治疗皮肤的增湿作用增加的比率。

本发明的头皮美容组合物和方法优选提供至少约 2.5、更优选至少约 4.0、甚至更优选至少约 6.0、最典型为约 2.5 至约 10.0 的头皮增湿值。

应用系统

本发明的头皮美容组合物直接应用到头皮上，以减少与头发的最初接触，并改善皮肤活性物质在头皮上的沉积。将产品直接应用到头皮上的任何已知或其它有效的方法或应用系统均适用于本发明组合物和方法。

将本发明的头皮美容组合物直接应用到头皮上。在上下文中，“直接应用”是指该组合物主要直接施用在头皮上、而非头发上，优选通过具有多个开口的敷料器或其它包装体系应用，该组合物通过这些开口由敷料器或其它包装体系中直接应用到头皮上、而非头发上。该直接应用典型包括应用到头皮和最接近或邻近头皮的部分头发或发干上，但是优选并且具体地是，不包括组合物常规的类似滋养剂或香波那样应用到头发或头皮上，这种常规方法是用手或其它软的基质将产品应用到头发和头皮上、然后将该组合物揉遍头发至所需的头皮区域。

头皮美容组合物可以不使用敷料器或其它包装系统而直接应用到头皮上，条件是，该应用是如本文所定义的直接应用。例如，通过将头皮美容组合物小心地涂在指尖上，然后转头或者低头，使头发从头皮上悬垂下来，之后将产品小心并直接地从指尖涂到暴露的头皮区域，可以实现这种直接应用。

头皮美容组合物优选使用包括敷料器或其它包装系统的应用系统直接应用到头皮上，其中该应用通过多个开口直接完成，即直接越过头发并直接涂在头皮上或接近头皮的部位，这样，该组合物就直接应用到头皮上，尽管一些产品还是会与一些靠近头皮表面的发干接触。

用于本发明组合物和方法的应用系统的实例包括，含有储器和多个开口或附加齿或其它与储器相连部件的任何包装系统，在储器中含有该组合物或者组合物穿过该储器，组合物通过多个开口或附加齿或其它与储器相连部件由储器中透出，并直接应用到头皮表面。该包装系统优选含有至少约 3 个这样的开口或齿、更典型有约 3 至约 300 个齿，当然，开口和齿的数量将根据例如所需的敷料器大小、设计等因素改变。优选的开口位于齿内并在齿的末端，即储器的末端并靠近使用部位。

其它适宜的应用系统包括可以包含或不包含组合物储器的包装或应用系统，但是该包装或应用系统包含梳子或头皮刷子，例如将梳子或刷子的部分蘸上头皮美容组合物，并将其用在头皮上。

任选成分

本发明的头皮美容组合物还可以包含一种或多种已知用于护发或个人护理产品的任选组分，条件是这些任选成分在物理上和化学上与本文所述必要成分相容，或者不过分影响产品的性能。该任选组分的浓度最通常并单独为头皮美容组合物重量的约 0.001% 至约 10%。

用于头皮美容组合物的任选组分的非限制性实例包括染料、乳化剂和表面活性剂、pH 调节剂、香味化学品和香料、防腐剂、蛋白质、防晒剂、维生素(例如维生素 E 油)、粘度调节剂、着色剂、悬浮剂或增稠剂(例如聚丙烯酸酯增稠剂)等。

其它任选成分包括皮肤可感觉的物质，优选凉爽的皮肤可感觉的物质，其某些非限制性实例描述于美国专利 4,230,688(Rowsell 等)和美国专利 4,136,163(Watson 等)中，这些描述结合在本发明中作为参考。任选可感觉的物质的非限制性实例包括薄荷醇、薄荷酮甘油乙缩醛、甲基二异丙基丙酰胺、乳酸薄荷酯、薄荷氧基-1,2-丙二醇、乙基甲酰胺、三甲基丁酰胺、乳酸薄荷酯、丁二酸一薄荷基酯、香兰基丁基醚、1-异蒲勒醇、桉树脑、甲基水杨酸酯、桉树油、香芹酮、迷迭香油、姜油、丁香油、乙基薄荷烷甲酰胺、樟脑、eucolytol、薄荷油及其组合，其浓度优选为组合物重量的约 0.01% 至约 2.0%、更优选约 0.01% 至约 1.0%。

除了上文所述的挥发性载体液体之外，本发明头皮美容组合物任选含有非挥发性载体液体。非挥发性载体可以是任何液体载体，它们是已知的或者适于应用在头皮上，其中所选浓度的任选非挥发性载体不过分影响产品的性能。任选的非挥发性载体液体可以是含水或非水的、含聚硅氧烷或不含聚硅氧烷的，但是如果存在，则优选含水载体，它使得组合物具有最高达头皮美容组合物重量约 50%、更优选约 5% 至约 50%、甚至更优选约 10% 至约 40% 的水浓度。任选用于本发明的非挥发性液体的非限制性实例描述在美国专利 6,074,655(Fowler 等)中，这些描述引入本发明作为参考。

应用方法

本发明的头皮美容组合物可以直接应用到头皮上，这样大多数组合物一开始就直接应用到皮肤上、而非头发上。该应用优选通过将组合物由上文所述的包装系统或递送系统应用而实现，并且该系统含有多个开口，组合物通过这些开口直接越过头发并直接应用到头皮上。该组合物以有效提供所需增湿和/或皮肤活性有益效果的量直接应用到头皮上。用量将根据例如使用者的需要和所选择的制剂等因素改变，但是最典型的用量是每次应用约 0.1 克至约 10 克、更典型每次应用约 0.5 克至约 5 克，并且可以每天一次或多次应用到湿的或干的头皮上。

当根据如本发明所述进行配制和应用时，本发明的头皮美容组合物和方法尤其适用，只不过该组合物是应用到动物、例如家畜(如马、牛)和家养宠物(如猫和狗)的任何或者所有皮肤或毛皮区域，其中向动物的皮肤上应用该皮肤活性物质将使这些区域受益。

本发明方法优选直接应用本文所述组合物，其中该应用是直接应用到头皮或皮肤的其它区域上，并且使用本文所述包装或递送系统完成。特别优选的是应用实施方案的那些方法，这些实施方案是使用本文所述的敷料器系统，将毛发生长剂或去头屑活性物质直接应用到头皮上，特别是由该敷料器应用含锌的毛发生长活性物质和含锌的去头屑活性物质，其中该优选的应用实施方案的方法包括，如上文所述使用所有组合物以及任何改变的组合物，其中不含任何湿润剂或其它类似的增湿物质。

制备方法

本发明头皮美容组合物可以通过任何已知的或其它有效的技术制备，这些技术适于将该组合物的必要成分和任何所选的任选成分结合，以形成物理稳定、适于皮肤应用的液体组合物。

例如，本发明的头皮美容组合物可以配制成水包油乳液，其中涉及一种水包油乳液和用氨甲基丙醇(AMP)中和的 Carbopol 增稠产品的配制。

1. 将 Carbopol Ultrez-10(聚丙烯酸酯聚合物，得自 B.F. Goodrich)与去离子水在中等水平搅拌下混合至完全水合粉末。继续混合直至 Carbopol 看上去完全润湿、而不附聚，并且外观略微模糊。

2. 然后先将其它成分加入批料中，再用碱增稠，优选加入任何水溶液物质，例如湿润剂、泛醇。此时还加入尿囊素。

3.然后用乙醇或乙醇和水制备一种 ZPT 预混物(或者其它类似的皮肤活性物质预混物)。向水、湿润剂、carbopol 混合物中加入该种 ZPT, 然后加入油相或增稠 carbopol(含水相)。

4.在另一预混物中, 将油性物质(包括醋酸维生素 E、乳酸薄荷酯、薄荷醇、香料)、乙醇、乙二醇和乳化剂结合, 形成油-乙醇相。

5.在剧烈搅拌下, 将油-乙醇相加入水相中, 形成一种白色、乳状外观的乳液。

6.按 0.85AMP 比 1 单位 Carbopol 的比例, 用氨甲基丙醇(AMP-调节剂)中和乳状外观乳液。通常, 将 AMP 与部分乙醇预混合, 以更好地混合并且加快中和速度。一旦加入中和剂, 继续混合 30 分钟, 以确保提供本发明头皮美容实施方案的均匀的批料。

实施例

下面的非限制性实施例说明了本发明具体的头皮美容实施方案和方法。每个列举的组合物均按照制剂领域制备水醇液体的公知方法制备。除非另有说明, 所有列举的量均是以头皮美容组合物总重量计的重量百分比。

然后将每个列举的组合物包装在适宜的敷料器中, 并直接应用到头皮或其它适宜的皮肤区域。该组合物在应用后至少 1 至 6 小时不漂洗或者不从皮肤上除去。每个列举的组合物提供了具有改善的皮肤活性物质的沉积、改善了皮肤或头皮增湿作用、而没有过分影响美发的头皮应用区域。

每个列举的组合物还使用除去头屑活性物质之外的皮肤活性物质进行配制, 包括甾族抗炎剂(例如皮质甾醇)、非甾族抗炎剂、杀虫剂、除去头屑活性物质之外的抗微生物剂、麻醉剂、抗组胺剂、收敛剂、酶、维生素除 ZPT 之外的毛发生长活性物质和防晒剂。在直接应用后, 每个这些再配制的组合物提供了改善的皮肤或头皮的增湿作用, 以及改善的皮肤活性物质在皮肤上的沉积。

表 1: 免洗型头皮美容组合物

	I	II	III	IV	V	VI	VII
成分	重量%						
水, DRO	适量	适量	适量	适量	适量	适量	适量
卡波姆(1)	0.3	0.3	0.4			-	0.1
卡波姆(2)				0.5		-	
聚丙烯酰胺(和)C13-14 异链 烷烃(an)月桂基醚-7(3)				-	4.0	2.5	
氨基甲基丙醇(4)	0.26	0.285	0.34	-	-	-	0.13
四羟基丙基乙二胺(5)	-	-	-	0.5	-		-
乙醇(6)	55.0	50.0	55.0	55.0	55.0	60.0	45.0
吡啶硫酮锌(7)	0.1	0.1	0.09	0.01	0.01	0.2	0.1
硫酸锌(8)	-	-		0.01	0.1	-	-
乳酸锌(9)	-	-	-	-	-	0.2	-
乳酸薄荷酯(10)	0.35	0.1	0.25		0.5	-	0.5
薄荷醇(11)	0.15	0.1	0.25	0.25	0.25	0.25	0.5
薄荷酮甘油乙缩醛(12)				0.5			
泛醇(13)	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	2.0	1
醋酸生育酚(14)	0.5	1.0	1.0	1.0	1.0	2.0	-
PEG-60 氢化蓖麻油(15)	1.0		1.0	1.0		2.0	
PEG-25 甘油三油酸酯(16)	-	-	-	-	1.0	-	-
己二醇(17)	-	1.0	-	-	-	-	-
甘油(18)	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	4.0	3.0
尿囊素(19)	0.05	0.05	0.08	0.08	0.1	0.10	-
Isoceteth-20(70%act.)(20)	0.71		-	0.1	0.1	2.0	-
Cetearth-20(21)			0.5			-	
香料(22)	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30
氧化锌(23)	-	-	.001	-	.01	-	-

1	Carbopol Ultrez 10, 供应商: B.F.	1	D 泛醇, 供应商: Hoffmann LaRoche
2	Carbopol ETD 2020; 供应商: B.F.	1	醋酸维生素 E, 供应商: BASF
3	Sepigel 305, 供应商: Seppic	1	Cremophor RH 60, 供应商: BASF
4	AMP 调节剂, 供应商: Angus	1	Tagat TO, 供应商: Goldsmidt
5	Neutrol TE, 供应商: BASF	1	己二醇, 供应商: Van Waters & Rodgers
6	200 proof, SDA 40-2	1	Superol USP, 供应商: Procter & Gamble
7	小片 ZPT (2.5m), 供应商: Arch	1	微粉化尿囊素, 供应商: ICI
8	Whitco Zinc Stearate D. USP, 供	2	Arlasolve 200L, 供应商: ICI
9	Puramex ZN, 供应商: Purac	2	Cremaphor A20, 供应商: BASF
10	Frescolate ML, 供应商: Haarman	2	香料, 供应商: Haarman & Reimer
11	USP 薄荷醇, 供应商: Haarman &	2	Z-cote HP1, 供应商: BASF
12	Frescolat MGA, 供应商: Haarman		

表 2：免洗型头皮美容组合物

	VIII	IX	X	XI	XII	XIII	XIV	XV
水, DRO	适量	适量	适量	适量	适量	适量	适量	适量
卡波姆(1)	0.3	-	0.4			-		0.1
卡波姆(2)		.5		0.5		-		
聚丙烯酰胺(和)C13-14 异链烷 烃(an)月桂基醚-7(3)				-	0.5	1.0		
氨基甲基丙醇(4)	0.26	-	0.34	-	-	-		0.13
四羟基丙基乙二胺(5)	-	.5	-	0.5	-			-
乙醇(6)	55.0	50.0	55.0	55.0	55.0	60.0		45.0
硫化硒(7)	0.05							
酮康唑(8)		0.1						
苯咪丁酮(9)	-	-	.05	-		-		-
水杨酸(10)	-	-	-	3.0	-	0.2		-
除虫菊酯(11)					0.1			
蛋白酶, 脂肪酶混合物(12)								
皮质甾醇(13)						1.0		
杆菌肽锌(14)							0.1	
托萘酯(15)								1.0
乳酸薄荷酯(16)	0.25	0.1	0.25	0.25	0.25	0.50	0.1	0.5
泛醇(17)	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	2.0	0.5	1.0
醋酸生育酚(18)	0.5	1.0	1.0	1.0	1.0	2.0	-	-
PEG-60 氢化蓖麻油(19)	0.5	1.0	1.0	1.0	1.0	2.0	-	-
甘油(20)	5.0	-		3.0	5.0	10.0	1.0	3.0
山梨醇(21)		4.0	-	-	1.0	-		-
聚甲基丙烯酸甘油基酯和丙二 醇(22)			5.0		-	-	3.0	-
甲基 Glyceth-20(23)				1.0		-		-
Isoceteth-20(70%act.)(24)	0.71	0.7	0.7	0.1	0.1	2.0	-	-
香料(25)	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30		0.30

-
- | | | | |
|----|--------------------------|----|------------------------------------|
| 1 | Carbopol Ultrez 10, 供应商: | 14 | 杀菌剂 |
| 2 | Carbopol ETD 2020; 供应商: | 15 | 杀真菌剂 |
| 3 | Sepigel 305, 供应商: Seppic | 16 | Frescolate ML, 供应商: Haarman & |
| 4 | AMP 调节剂, 供应商: Angus | 17 | D 泛醇, 供应商: Hoffmann LaRoche |
| 5 | Neutrol TE, 供应商: BASF | 18 | 醋酸维生素 E, 供应商: BASF |
| 6 | 200 proof, SDA 40-2 | 19 | Cremophor RH 60, 供应商: BASF |
| 7 | 硫化硒, USP, 供应商: Abbot | 20 | Superol USP, 供应商: Procter & Gamble |
| 8 | 去头屑活性物质 | 21 | Sorbo 70% 山梨醇溶液, 供应商: ICI |
| 9 | 苯咪丁醇, 供应商: Bayer AG | 22 | Lubrajel Oil, 供应商: ISP |
| 10 | Unichem SALAC, 供应商: UPI | 23 | Glucam E-20, 供应商: Amerchol |
| 11 | 抗虱杀虫剂 | 24 | Arlasolve 200L, 供应商: ICI |
| 12 | 处理虱类的酶混合物 | 25 | 香料, 供应商: Haarman & Reimer |
| 13 | 甾族化合物 - 抗痒剂, 抗炎剂 | | |