



(12) 发明专利



(10) 授权公告号 CN 110149795 B

(45) 授权公告日 2023. 10. 03

(21) 申请号 201680091143.5
(22) 申请日 2016.12.02
(65) 同一申请的已公布的文献号
 申请公布号 CN 110149795 A
(43) 申请公布日 2019.08.20
(85) PCT国际申请进入国家阶段日
 2019.05.27
(86) PCT国际申请的申请数据
 PCT/EP2016/079591 2016.12.02
(87) PCT国际申请的公布数据
 W02018/099570 EN 2018.06.07
(73) 专利权人 西姆莱斯股份公司
 地址 德国霍尔茨明登
(72) 发明人 C·巴普蒂斯脱 A·特恩特
 G·菲尔哈伯 S·兰格
 D·斯托尔曼 B·茹安 O·科赫
(74) 专利代理机构 北京世峰知识产权代理有限公司 11713
 专利代理师 康健 王思琪
(51) Int.Cl.
 A61K 8/34 (2006.01)
 A61K 8/42 (2006.01)
 A61Q 11/00 (2006.01)
 A61Q 17/04 (2006.01)
 A61Q 19/00 (2006.01)
 A61K 31/047 (2006.01)
 A61K 31/08 (2006.01)
 A61P 17/00 (2006.01)

(56) 对比文件
 CN 104661633 A, 2015.05.27
 CN 101970008 A, 2011.02.09
 CN 1057564 A, 1992.01.08
 EP 1938785 A2, 2008.07.02
 US 2013068304 A1, 2013.03.21
 WO 2011117384 A1, 2011.09.29
 DE 102006060439 A1, 2008.06.26
 CN 103025311 A, 2013.04.03
 CN 105853278 A, 2016.08.17
 US 2013210921 A1, 2013.08.15
 CN 101346072 A, 2009.01.14
 US 2009269290 A1, 2009.10.29
 US 2014113971 A1, 2014.04.24
 KR 20130088665 A, 2013.08.08
 US 2009054520 A1, 2009.02.26
 US 2006269500 A1, 2006.11.30
 US 2016206523 A1, 2016.07.21
 US 6780443 B1, 2004.08.24
 CN 101111608 A, 2008.01.23
 CN 1620248 A, 2005.05.25
 WO 2009087578 A2, 2009.07.16
 JP 2004300143 A, 2004.10.28
 JP 2012153675 A, 2012.08.16
 JP 2014070063 A, 2014.04.21
 Tetesept. "Neck & Shoulder Muscle Relax Balm". 《GNPD》. 2015, 第1-3页.
 Crown Craft Commercial. "Soya Blackhead Heating Mask". 《GNPD》. 2014, 第1-5页.

审查员 赵凯飞

权利要求书3页 说明书53页 附图2页

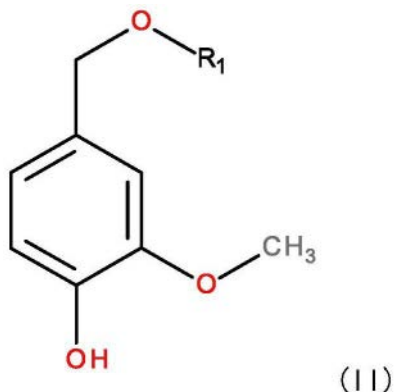
(54) 发明名称
 化妆品混合物
(57) 摘要
 提出一种化妆混合物, 含有或由以下成分组成 (a) 至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂和 (b1) 至少一种含有5至12个碳原子的1,2-烷二醇和/

或 (b2) 至少一种含有3至12个碳原子和3至6个羟基的多元醇。

1. 一种化妆用混合物, 含有以下成分

(a) 至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂, 和

(b1) 至少一种1,2-烷二醇, 所述1,2-烷二醇选自1,2-十二烷二醇、1,2-癸二醇、1,2-辛二醇、1,2-己二醇或其混合物, 其中所述TRPV1和/或TRPV3调节剂由根据式(II)的香草醚表示:



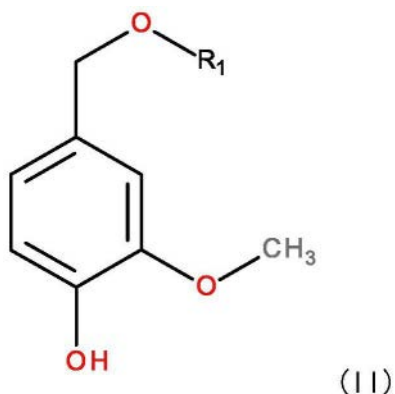
其中R₁代表氢或C1-C7烷基, 和

所述成分(a)和(b1)以10:90至90:10的重量比存在。

2. 一种化妆用混合物, 由以下成分组成

(a) 至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂, 和

(b1) 至少一种1,2-烷二醇, 所述1,2-烷二醇选自1,2-十二烷二醇、1,2-癸二醇、1,2-辛二醇、1,2-己二醇或其混合物, 其中所述TRPV1和/或TRPV3调节剂由根据式(II)的香草醚表示:



其中R₁代表氢或C1-C7烷基。

3. 根据权利要求1或2所述的混合物, 其中所述TRPV1和/或TRPV3调节剂选自式(II)的香草醚并且所述1,2-烷二醇选自1,2-己二醇, 1,2-辛二醇及其混合物。

4. 根据权利要求3所述的混合物, 其中所述TRPV1和/或TRPV3调节剂是香草醇丁醚并且所述1,2-烷二醇选自1,2-己二醇, 1,2-辛二醇及其混合物。

5. 根据权利要求2所述的混合物, 其中所述成分(a)和(b1)以10:90至90:10的重量比存在。

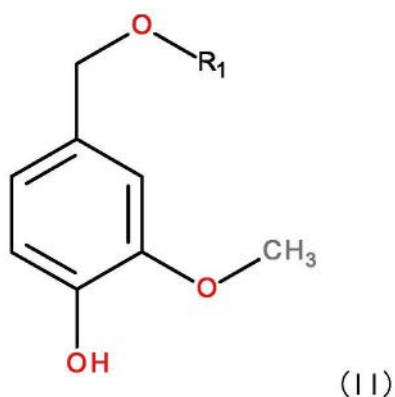
6. 根据权利要求1或5所述的混合物, 其中所述成分(a)和(b1)以40:60至60:40的重量比存在。

7. 根据权利要求4所述的混合物, 其中1,2-烷二醇为1:1比例的1,2-己二醇和1,2-辛二醇混合物。

8. 一种化妆品组合物, 含有基于最终组合物计的从0.01至5%重量的根据权利要求1或2所述的混合物。

9. 以下成分 (a) 和 (b) 用于制备用于改善TRPV1和/或TRPV3调节剂温暖感受和减小灼烧感的制剂中的用途:

(a) 至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂, 其中所述TRPV1和/或TRPV3调节剂由式 (II) 的香草醚表示:



其中R₁代表氢或C1-C7烷基; 和

(b) 至少一种1,2烷二醇, 其中所述1,2烷二醇选自1,2-十二烷二醇、1,2-癸二醇、1,2-辛二醇、1,2-己二醇或其混合物,

其中所述TRPV1和/或TRPV3调节剂和1,2烷二醇以10:90至90:10的重量比存在。

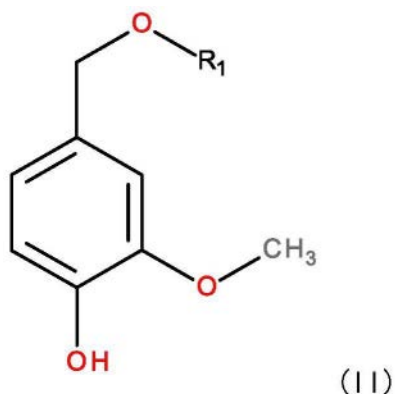
10. 根据权利要求9所述的用途, 其中所述香草醚是香草丁基醚。

11. 根据权利要求9所述的用途, 其中所述1,2-烷二醇选自1,2-己二醇、1,2-辛二醇及其混合物。

12. 根据权利要求11所述的用途, 其中所述1,2-烷二醇是1:1比例的1,2-己二醇和1,2-辛二醇混合物。

13. 一种含有或由以下成分

(a) 至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂, 其中所述TRPV1和/或TRPV3调节剂由式 (II) 的香草醚表示:



其中R₁代表氢或C1-C7烷基; 和

(b) 至少一种1,2烷二醇, 其中所述1,2烷二醇选自1,2-十二烷二醇、1,2-癸二醇、1,2-

辛二醇、1,2-己二醇或其混合物,其中所述TRPV1和/或TRPV3调节剂和1,2-丙二醇以10:90至90:10的重量比存在,

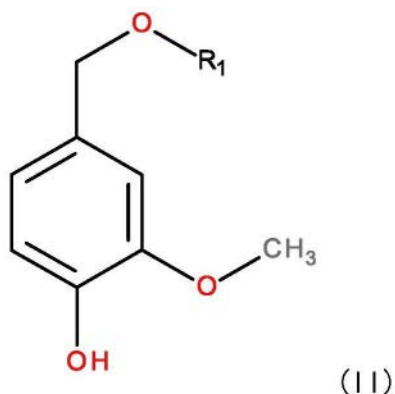
构成的组合物用于制备改善在人类皮肤上的温暖感受和减小灼烧感的制剂中的用途。

14. 根据权利要求13所述的用途,其中所述香草醚是香草丁基醚。

15. 根据权利要求13所述的用途,其中所述1,2-丙二醇选自1,2-己二醇、1,2-辛二醇及其混合物。

16. 根据权利要求15所述的用途,其中所述1,2-丙二醇是1:1比例的1,2-己二醇和1,2-辛二醇混合物。

17. 选自1,2-十二烷二醇、1,2-癸二醇、1,2-辛二醇、1,2-己二醇或其混合物的1,2-丙二醇用于制备同时改善TRPV1和/或TRPV3调节剂被施用至人类皮肤上时的温暖感受和减小灼烧感的制剂中的用途,所述TRPV1和/或TRPV3调节剂是根据式(II)的香草醚



其中R₁代表氢或C1-C7烷基。

18. 根据权利要求17所述的用途,其中所述香草醚是香草丁基醚。

19. 根据权利要求17所述的用途,其中所述1,2-丙二醇选自1,2-己二醇、1,2-辛二醇及其混合物。

20. 根据权利要求19所述的用途,其中所述1,2-丙二醇是1:1比例的1,2-己二醇和1,2-辛二醇混合物。

化妆品混合物

发明领域

[0001] 本发明属于化妆品领域并且涉及一种新的混合物,其含有不良副作用减小的暖化剂,含有所述混合物的组合物,一种用于改善在人类皮肤或粘膜上温暖感受的方法,以及特定羟基化合物作为暖化剂性能增强剂的用途。

现有技术

[0002] 瞬态受体电位阳离子通道子类V成员1 (TRPV1)或成员3 (TRPV3),也已知为辣椒素受体和香草素受体1或3,是人类体内由TRPV1或TRPV3基因编码的蛋白质。TRPV1是瞬时受体电位香草素受体蛋白中第一个分离的成员,其又是瞬时受体电位蛋白组的一个子类。TRPV1的功能是检测和调节身体温度。此外,TRPV1参与感知烫伤热和疼痛(痛觉)。

[0003] TRPV1/3是非选择阳离子通道,可以被各种外源性和内源性的物理和化学刺激激活。最熟知的TRPV1激活剂是:

[0004] • 高于43°C的温度;

[0005] • 酸性条件;

[0006] • 辣椒素(辣椒中的刺激化合物),和

[0007] • 异硫代氰酸烯丙酯(芥末和山葵中的辛辣化合物)

[0008] 除了TRPV1,TRPV3导致疼痛灼烧的感受。其内源性激活剂包括:低pH值(酸性条件)、内源性大麻素anandamide、N-油酰-多巴胺、和N-花生四烯酰多巴胺。TRPV1/3受体主要见于外周神经系统的伤害感受神经元,但是也存在于许多其他组织中,包括中枢神经系统和皮肤。TRPV1/3参与疼痛的传输和调节(痛觉),以及不同疼痛刺激的整合。

[0009] 激动剂如辣椒素和树脂毒素(resiniferatoxin)激活TRPV1/3,并在延长的使用下,引起TRPV1活性降低(脱敏),通过随后减少TRPV1/3介导的暴露于有害刺激后促炎分子的释放缓解疼痛。激动剂可以各种形式局部施用于疼痛区域,通常作为贴膏或膏剂。市面上有许多含有辣椒素的霜剂,含有低浓度的辣椒素(0.025-0.075%)。有争议的是这些制剂是否真的导致TRPV1/3脱敏;它们可能通过反刺激起作用。

[0010] TRPV1调节剂或激动剂已经记载于例如WO 2007 054480 A1 (MERCK),其教导了2-(苯并咪唑-1-基)-乙酰胺衍生物在治疗TRPV1相关疾病中的效果。

[0011] WO 2008 079683 A1 (ABBVIE)教导了环己基和苯基共轭双环系统的化合物用于抑制TRPV1受体。

[0012] EP 01939173 A1 (SERENTRIX)公开了O-取代的-二苄基脲-或硫脲衍生物作为TRPV1受体拮抗剂。

[0013] WO 2008 076752 A1 (JANSSEN)教导了苯并咪唑类化合物作为有效的TRPV1调节剂。

[0014] EP 01908753 A1 (MOCHIDA)涉及TRPV1调节剂,其为杂环亚基乙酰胺衍生物。

[0015] 最后,EP 2700431 A1 (ANALYTICON)涉及用于相同目的的特定植物提取物。

[0016] 能够调节TRPV1/3活性的制剂(也被称为TRPV激动剂)如辣椒素或某些香草素化合

物通常用于化妆品和口服组合物中,因为当被施用至人类皮肤或粘膜,它们提供特定的温暖感受。不幸的是,温暖感受通常伴随不想要的副作用,例如刺激、发炎、灼烧感、瘙痒、变红、疼痛等。这些效果限制了可以向化妆制剂加入的TRPV1/3调节剂的浓度,并当然限制了想要的温暖效果。

[0017] 因此,本发明解决的问题是改善(提高)TRPV1/3调节剂在人类皮肤或粘膜提供的温暖感受,并同时减少不良副作用。

发明内容

[0018] 本发明的主题是化妆用混合物,含有或由以下成分组成

[0019] (a) 至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂和

[0020] (b1) 至少一种含有5至12个碳原子的1,2-烷二醇和/或

[0021] (b2) 至少一种含有3至12个碳原子和3至6个羟基的多元醇。

[0022] 令人惊讶地是,已经观察到向所述的TRPV1和/或TRPV3调节剂,特别是香草醚,加入所述的特定羟基化合物,特别是1,2-烷二醇,提高了在人类皮肤或粘膜上的温暖感受,同时显著减小了调节剂不想要的副作用,即各种皮肤刺激(例如灼烧感、瘙痒、发红、刺痛、疼痛)。这特别令人惊讶,因为烷二醇导致的简单的渗透增强效果本会提高副作用。

[0023] 因此,本发明提供了一种如何在混合物或配方中使用较少量的TRPV1和/或TRPV3调节剂,同时改善调节剂的皮肤病学相容性。也可以通过向给定浓度的TRPV1和/或TRPV3调节剂加入羟基化合物提高温暖感受,同时减少在皮肤上的不良副作用。

[0024] TRPV1/TRPV3调节剂

[0025] 应当注意的是,涉及影响TRPV1和TRPV3活性的物质的术语“调节剂”和“激动剂”以相同的方式使用。根据本发明,TRPV1和/或TRPV3调节剂选自组包括:

[0026] • 香草素衍生物,优选香草醚,

[0027] • 辣椒素,

[0028] • 异硫代氰酸烯丙酯,

[0029] • 姜辣醇,

[0030] • 4-(I-薄荷氧基甲基)-2-苯基-1,3-二氧戊环,

[0031] • 4-(I-薄荷氧基甲基)-2-(3',4'-二羟基苯基)-1,3-二氧戊环,

[0032] • 4-(I-薄荷氧基甲基)-2-(2'-羟基-3'-甲氧基苯基)-3-二氧戊环,

[0033] • 4-(I-薄荷氧基甲基)-2-(4'-甲氧基苯基)-3-二氧戊环,

[0034] • 4-(I-薄荷氧基甲基)-2-(3',4'-亚甲基二氧苯基)-3-二氧戊环,

[0035] • 4-(I-薄荷氧基甲基)-2-(3'-甲氧基-4'-羟基苯基)-3-二氧戊环,

[0036] • 红辣椒油,

[0037] • 红辣椒油树脂,

[0038] • 姜油树脂,

[0039] • 壬酸香草酰胺,

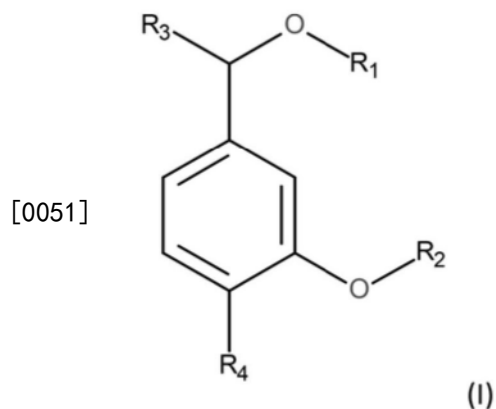
[0040] • 千日菊油树脂,

[0041] • 川椒(*Zanthoxylum piperitum*)提取物,

[0042] • 山椒素I,

- [0043] • 山椒素II，
[0044] • 山椒酰胺，
[0045] • 黑胡椒提取物，
[0046] • 胡椒脂碱，
[0047] • 胡椒碱，
[0048] • 千日菊素，和
[0049] • US 6,780,443中公开的调节剂或暖化剂(只要涉及调节剂的性质，该文件通过引用的方式引入)及其混合物。

[0050] 在一个优选实施方案中，所述TRPV1和/或TRPV3调节剂为式(I)的香草醚，



[0052] 其中

[0053] R1代表氢或C1-C7烷基；

[0054] R2代表C1-C3烷基；

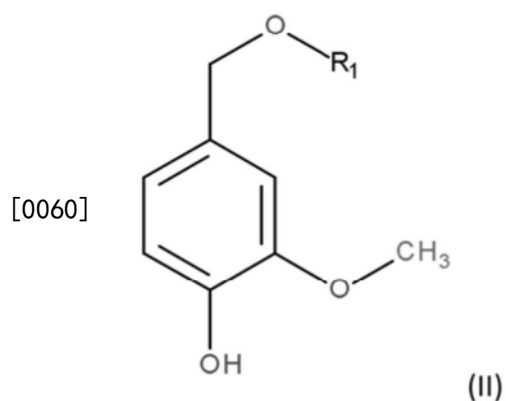
[0055] R3代表氢或C3-C9烷氧基；

[0056] R4代表羟基或OC(O)CH3基团，并且

[0057] 其中R2和R3可以共价键合形成环状缩醛；

[0058] 所述缩醛任选被C2-C8烷基取代。

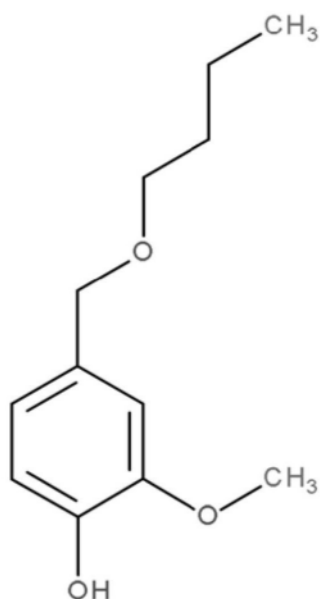
[0059] 在一个特别优选实施方案中，所述TRPV1和/或TRPV3调节剂是式(II)的香草醚



[0061] 其中R1代表氢或C1-C7烷基。

[0062] 最优选的所述TRPV1和/或TRPV3调节剂是式(III)的香草醚

[0063]



(III = 香草醇丁醚 VEB)

[0064] 羟基化合物

[0065] 构成组 (b1) 并用作 TRPV1/TRPV3 调节剂的促进剂的第一组物质包括 1,2-烷二醇, 优选自组包括 1,2-戊二醇、1,2-己二醇、1,2-庚二醇、1,2-辛二醇、1,2-壬二醇、1,2-癸二醇、1,2-十一烷二醇、1,2-十二烷二醇及其混合物。

[0066] 优选地, 所述 1,2-烷二醇选自 1,2-戊二醇、1,2-己二醇、1,2-庚二醇、1,2-辛二醇以及 1,2-己二醇和 1,2-辛二醇的混合物。

[0067] 构成组 (b2) 的另一组适当促进剂包括多元醇, 选自组包括:

[0068] • 甘油; 由 1,2-环氧- ω -羟基烷烃与水的反应产物得到的 1,2, ω -C4-C12-烷三醇

[0069] • 自缩合度为 1.5 至 10 的技术低聚甘油混合物, 如二甘油含量为 40 至 50 重量%的技术二甘油混合物;

[0070] • 羟甲基化合物, 特别是如三羟甲基乙烷、三羟甲基丙烷、三羟甲基丁烷、季戊四醇和二季戊四醇;

[0071] • 低级烷基葡萄糖苷, 特别是烷基中含有 1 至 8 个碳原子, 例如甲基和丁基葡萄糖苷;

[0072] • 含有 5 至 12 个碳原子的糖醇, 例如山梨糖醇或甘露醇,

[0073] 或其混合物。

[0074] 混合物

[0075] 在一个优选实施方案中, 所述 TRPV1 和/或 TRPV3 调节剂选自式 (II) 的香草醚, 并且所述 1,2-烷二醇选自 1,2-己二醇、1,2-辛二醇及其混合物, 并且特别地所述 TRPV1 和/或 TRPV3 调节剂是香草醇丁醚并且所述 1,2-烷二醇选自 1,2-己二醇、1,2-辛二醇及其混合物。

[0076] 根据本发明的混合物可以含有重量比为约 10:90 至约 90:10, 优选约 20:80 至约 80:20, 甚至更优选约 30:70 至约 60:40 的成分 (a) 和 (b)。总体优选范围为约 40:60。混合物可以结合少量稳定剂如含量为约 0.05 至 0.5 重量%, 优选 0.1 至约 0.2 重量%的抗坏血酸棕榈酸酯。

[0077] 化妆品组合物或皮肤病组合物

[0078] 本发明的另一个主题涉及含有上述TRPV1/TRPV3调节剂和烷二醇的混合物的化妆品或皮肤病组合物,优选以影响人类皮肤或粘膜上温暖感受的含量,如0.01至约5重量%,优选0.1至2重量%并且更优选约0.2至约1重量%,基于最终组合物计。

[0079] 优选的化妆品或皮肤病组合物是皮肤护理或防晒组合物。

[0080] 根据本发明的制剂可以含有研磨剂、抗痤疮剂、抗皮肤老化剂、抗蜂窝组织炎剂、去头屑剂、抗炎剂、防刺激剂、抑制刺激剂、抗氧化剂、收敛剂、抑汗剂、杀菌剂、抗静电剂、粘合剂、缓冲剂、载体、螯合剂、细胞刺激剂、清洗剂、护理剂、脱毛剂、表面活性物质、除臭剂、止汗剂、软化剂、乳化剂、酶、精油、纤维、成膜剂、固色剂、泡沫形成剂、泡沫稳定剂、消泡剂、泡沫促进剂、胶凝剂、凝胶形成剂、头发护理剂、毛发定型剂、头发拉直剂、增湿剂、润湿剂、保湿剂、漂白剂、加强剂、驱污剂、光学增亮剂、浸渍剂、驱污剂、减摩剂、润滑剂、保湿霜、软膏、遮光剂、增塑剂、覆盖剂、上光剂、光泽剂、聚合物、粉末、蛋白质、加脂剂(re-oiling agents)、磨蚀剂、硅酮、皮肤舒缓剂、皮肤清洁剂、护肤剂、皮肤愈合剂、皮肤光亮剂、皮肤保护剂、皮肤软化剂、育发剂、冷却剂、皮肤冷却剂、加温剂、皮肤升温剂、稳定剂、紫外线吸收剂、UV滤光剂、洗涤剂、织物柔顺剂、助悬剂、皮肤美黑剂、增稠剂、维生素、油、蜡、脂肪、磷脂、饱和脂肪酸、单或多不饱和脂肪酸、 α -羟基酸、多羟基脂肪酸、液化剂、染料、颜色保护剂、颜料、防蚀剂、芳香物质、调味物质、芳香物质、多元醇、表面活性剂、电解质、有机溶剂或硅酮衍生物等作为额外助剂和添加剂。

[0081] 表面活性剂

[0082] 优选的助剂和添加剂是阴离子和/或两性或两性离子表面活性剂。阴离子表面活性剂的典型实例是肥皂、烷基苯磺酸盐、烷基磺酸盐、烯基磺酸盐、烷基醚磺酸盐、甘油醚磺酸盐、甲酯磺酸盐、磺基脂肪酸、烷基硫酸盐、脂肪族醇醚硫酸盐、甘油醚硫酸盐、脂肪酸醚硫酸盐、羟基混合醚硫酸盐、单甘油酯(醚)硫酸盐、脂肪酸酰胺(醚)硫酸盐、单-和二烷基磺基丁二酸盐、单-和二烷基磺基琥珀酰胺酸盐、磺基甘油三酯、酰胺皂、醚羧酸及其盐、脂肪酸羟乙磺酸盐、脂肪酸肌氨酸盐、脂肪酸牛磺酸盐、N-酰氨酸如,例如酰基乳酸盐、酰基酒石酸盐、酰基谷氨酸盐和酰基天冬氨酸盐、烷基低聚葡萄糖苷硫酸盐、蛋白质脂肪酸缩合物(特别是小麦基植物产品)和烷基(醚)磷酸盐。如果阴离子表面活性剂含有聚乙二醇醚链,则它们可具有常规的,但优选窄的同系物分布。两性或两性离子表面活性剂的典型实例为烷基甜菜碱、烷基酰胺基甜菜碱、氨基丙酸盐、氨基甘氨酸盐、咪唑啉甜菜碱和磺基甜菜碱。所述表面活性剂均为已知化合物。其结构和制备信息可见于相关概要著作,例如J.Falbe(ed.),“Surfactants in Consumer Products”,Springer Verlag,Berlin,1987,pages 54 to 124 or J.Falbe(ed.),“Katalysatoren,Tenside und Mineralöladditive (Catalysts, Surfactants and矿物油Additives)”,Thieme Verlag,Stuttgart,1978,pages 123-217。表面活性剂在制剂中的百分比含量为0.1至10重量%,并且优选0.5至5重量%,基于制剂计。

[0083] 油体

[0084] 适当的油体,其为O/W乳液的成分,是例如基于含有6至18个,优选8至10个碳原子的Guerbet醇,直链 C_6-C_{22} -脂肪酸与直链或支链 C_6-C_{22} -脂肪族醇的酯或支链 C_6-C_{13} -羧酸与直链或支链 C_6-C_{22} -脂肪族醇的酯,如例如肉豆蔻酸十四烷酯、棕榈酸十四烷酯、硬脂酸十四烷酯、异硬脂酸十四烷酯、油酸十四烷酯、山嵛酸十四烷酯、芥酸十四烷酯、肉豆蔻酸十六烷

酯、棕榈酸十六烷酯、硬脂酸十六烷酯、异硬脂酸十六烷酯、油酸十六烷酯、山嵛酸十六烷酯、芥酸十六烷酯、肉豆蔻酸十八烷酯、棕榈酸十八烷酯、硬脂酸十八烷酯、异硬脂酸十八烷酯、油酸十八烷酯、山嵛酸十八烷酯、芥酸十八烷酯、肉豆蔻酸异十八烷酯、棕榈酸异十八烷酯、硬脂酸异十八烷酯、异硬脂酸异十八烷酯、油酸异十八烷酯、山嵛酸异十八烷酯、油酸异十八烷酯、油醇肉豆蔻酸酯、棕榈酸油醇酯、油醇硬脂酸酯、油醇异硬脂酸酯、油酸油醇酯、山嵛酸油醇酯、芥酸油醇酯、肉豆蔻酸二十二烷酯、棕榈酸二十二烷酯、硬脂酸二十二烷酯、异硬脂酸二十二烷酯、油酸二十二烷酯、山嵛酸二十二烷酯、芥酸二十二烷酯、肉豆蔻酸芥醇酯、棕榈酸芥醇酯、硬脂酸芥醇酯、异硬脂酸芥醇酯、油酸芥醇酯、山嵛酸芥醇酯和芥酸芥醇酯。此外适当的是直链 C_6-C_{22} -脂肪酸与支链醇，特别是2-乙基己醇的酯、 $C_{18}-C_{38}$ -烷基羧酸与直链或支链 C_6-C_{22} -脂肪族醇的酯，特别是苹果酸二辛酯、直链和/或支链脂肪酸与多元醇(如例如丙二醇、二聚二元醇(Dimerdiol)或三聚三元醇(Trimertriol))和/或Guerbet醇的酯、基于 C_6-C_{10} -脂肪酸的甘油三酯、基于 C_6-C_{18} -脂肪酸的液态单-/二-/三酸甘油酯混合物、 C_6-C_{22} -脂肪族醇和/或Guerbet醇与芳族羧酸，特别是苯甲酸的酯、 C_2-C_{12} -二羧酸与具有1至22个碳原子的直链或支链醇或者具有2至10个碳原子和2至6个羟基的多元醇的酯、植物油、支链伯醇、取代环己烷、直链和支链 C_6-C_{22} -脂肪族醇的碳酸酯，如例如碳酸二辛酯(Cetiol®CC)、基于具有6至18个优选8至10个碳原子的脂肪族醇的Guerbet碳酸酯、苯甲酸与直链和/或支链 C_6-C_{22} -醇的酯(例如Finsolv®TN)、每个烷基具有6至22个碳原子的直链或支链、对称或非对称的二烷基醚，如例如二辛酰基醚(Getiel®OE)、环氧化脂肪酸酯与多元醇的开环产物、硅油(环聚二甲基硅氧烷、硅酮甲基硅油等级等)和/或脂肪烃或环烷烃，如例如角鲨烷、角鲨烯或二烷基环己烷。

[0085] 乳化剂

[0086] 也可以将其他表面活性剂加入制剂作为乳化剂，包括例如

[0087] • 2至30摩尔环氧乙烷和/或0至5摩尔环氧丙烷与直链 C_{8-22} 脂肪族醇、与 C_{12-22} 脂肪酸、与烷基中具有8-15个碳原子的烷基苯酚的加成产物；

[0088] • 1至30摩尔环氧乙烷在甘油上的加成产物的 $C_{12/18}$ 脂肪酸单酯和二酯；

[0089] • 含有6至22个碳原子的饱和和不饱和脂肪酸甘油单酯和二酯和脱水山梨糖醇单酯和二酯和它们的环氧乙烷加成产物；

[0090] • 15至60摩尔环氧乙烷与蓖麻油和/或氢化蓖麻油的加成产物；

[0091] • 多元醇酯，尤其是聚甘油酯例如，聚甘油聚蓖麻醇酸酯、聚甘油聚-12-羟基硬脂酸酯或聚甘油二聚合油异硬脂酸酯。同样适用的是多个这类化合物的混合物；

[0092] • 2至15摩尔环氧乙烷与蓖麻油和/或氢化蓖麻油的加成产物；

[0093] • 基于直链、支链、不饱和或饱和 $C_{6/22}$ 脂肪酸、蓖麻油酸以及12-羟基硬脂酸和甘油、聚甘油、季戊四醇、二季戊四醇、糖醇(例如山梨糖醇)、烷基葡萄糖苷(例如：甲基葡萄糖苷、丁基葡萄糖苷、月桂基葡萄糖苷)以及多葡萄糖苷(例如纤维素)的偏酯；

[0094] • 磷酸单-、二-和三烷酯类以及磷酸单-、二-和/或三-PEG烷酯类及其盐；

[0095] • 羊毛蜡醇类；

[0096] • 聚硅氧烷/聚烷基聚醚共聚物及相应衍生物；

[0097] • 季戊四醇、脂肪酸、柠檬酸和脂肪族醇的混合脂和/或 C_{6-22} 脂肪酸、甲基葡萄糖和多元醇，优选丙三醇或聚甘油的混合脂；

[0098] • 聚二醇类以及

[0099] • 碳酸甘油酯。

[0100] 环氧乙烷和/或环氧丙烷与脂肪族醇、脂肪酸和烷基酚的加成产物,脂肪酸或蓖麻油的甘油单酯和二酯和脱水山梨糖醇单酯和二酯是市场上可以买到的产品。在这里是指同系混合物,其平均烷氧基化度相当于进行加成反应的环氧乙烷和/或环氧丙烷和基质的用量比例。环氧乙烷与甘油加成产物的 $C_{12/18}$ 脂肪酸单酯和二酯已知用作化妆制剂的富脂剂。优选的乳化剂在下文详细列出:

[0101] 偏甘油酯。适当的偏甘油酯的典型实例是羟基硬脂酸单甘油酯、羟基硬脂酸二甘油酯、异硬脂酸单甘油酯、异硬脂酸二甘油酯、油酸单甘油酯、油酸二甘油酯、蓖麻酸单甘油酯、蓖麻酸二甘油酯、亚油酸单甘油酯、亚油酸二甘油酯、亚油酸单甘油酯、亚油酸二甘油酯、芥酸单甘油酯、芥酸二甘油酯、酒石酸单甘油酯、酒石酸二甘油酯、柠檬酸单甘油酯、柠檬酸二甘油酯、苹果酸单甘油酯、苹果酸二甘油酯及其仍含有少量源自生产过程的甘油三酯的技术混合物。1至30且优选5至10摩尔环氧乙烷与上述偏甘油酯的加成产物同样适当。

[0102] 脱水山梨醇酯。适当的脱水山梨醇酯是脱水山梨醇单异硬脂酸酯、脱水山梨醇倍半异硬脂酸酯、脱水山梨醇二异硬脂酸酯、脱水山梨醇三异硬脂酸酯、脱水山梨醇单油酸酯、脱水山梨醇倍半油酸酯、脱水山梨醇二油酸酯、脱水山梨醇三油酸酯、脱水山梨醇单芥酸酯、脱水山梨醇倍半芥酸酯、脱水山梨醇二芥酸酯、脱水山梨醇三芥酸酯、脱水山梨醇单蓖麻酸酯、脱水山梨醇倍半蓖麻酸酯、脱水山梨醇二蓖麻酸酯、脱水山梨醇三蓖麻酸酯、脱水山梨醇单羟基硬脂酸酯、脱水山梨醇倍半羟基硬脂酸酯、脱水山梨醇二羟基硬脂酸酯、脱水山梨醇三羟基硬脂酸酯、脱水山梨醇单酒石酸酯、脱水山梨醇倍半酒石酸酯、脱水山梨醇二酒石酸酯、脱水山梨醇三酒石酸酯、脱水山梨醇单柠檬酸酯、脱水山梨醇倍半柠檬酸酯、脱水山梨醇二柠檬酸酯、脱水山梨醇三柠檬酸酯、脱水山梨醇单马来酸酯、脱水山梨醇倍半马来酸酯、脱水山梨醇二马来酸酯、脱水山梨醇三马来酸酯及其技术混合物。1至30且优选5至10摩尔环氧乙烷与上述脱水山梨醇酯的加成产物同样适当。

[0103] 聚甘油酯。适当的聚甘油酯的典型实例是聚甘油-2二聚羟基硬脂酸酯(Dehymuls® PGPH)、聚甘油-3-二异硬脂酸酯(Lameform®TGI)、聚甘油-4异硬脂酸酯(Isolan®GI 34)、聚甘油-3油酸酯、聚甘油-3二异硬脂酸酯(Isolan®PDI)、聚甘油-3甲基葡萄糖二硬脂酸酯(Tego Care®450)、聚甘油-3蜂蜡(CeraBellina®)、聚甘油-4癸酸酯(聚甘油癸酸酯T2010/90)、聚甘油-3鲸蜡基醚(Chimexane®NL)、聚甘油-3二硬脂酸酯(Cremophor®GS 32)和聚甘油聚蓖麻酸酯(Admul®WOL 1403)、聚甘油二异硬脂酸(polyglyceryl dimerate isostearate)酯及其混合物。其它适当的多元醇酯的实例是任选与1至30摩尔环氧乙烷反应的月桂酸、椰油酸、牛油酸、棕榈酸、硬脂酸、油酸、山萘酸等与三羟甲基丙烷或季戊四醇的单酯、二酯和三酯。

[0104] 阴离子乳化剂。典型的阴离子乳化剂是 C_{12-22} 脂肪酸,如例如棕榈酸、硬脂酸或山萘酸,以及 C_{12-22} 二羧酸,如例如壬二酸或癸二酸。

[0105] 两性乳化剂。其他适当的乳化剂是两性或两性离子表面活性剂。两性离子表面活性剂是分子中含有至少一个季铵基团和至少一个羧酸酯基团和一个磺酸酯基团的表面活性化合物。特别适当的两性离子表面活性剂为所谓的甜菜碱,如N-烷基-N,N-二甲基甘氨酸铵,例如椰油烷基二甲基甘氨酸铵、N-酰胺基丙基-N,N-二甲基甘氨酸铵,例如椰油酰胺基

丙基二甲基甘氨酸铵、和烷基或酰基中具有8-18个碳原子的2-烷基-3-羧甲基-3-羟乙基咪唑啉和椰油酰胺基乙基羟乙基羧甲基甘氨酸盐。特别优选已知CTFA名为椰油酰胺丙基甜菜碱的脂肪酸酰胺衍生物。同样适当的乳化剂为两性表面活性剂。两性表面活性剂是除了C_{8/18}烷基或酰基外,分子中还含有至少一个游离氨基和至少一个-COOH或-SO₃H基团且能形成内盐的表面活性化合物。适当的两性表面活性剂的实例为烷基中具有约8-18个碳原子的N-烷基甘氨酸、N-烷基丙酸、N-烷基氨基丁酸、N-烷基亚氨基二丙酸、N-羟乙基-N-烷基酰胺基丙基甘氨酸、N-烷基牛磺酸、N-烷基肌氨酸、2-烷基氨基丙酸和烷基氨基乙酸。特别优选的两性表面活性剂为N-椰油烷基氨基丙酸酯、椰油酰胺基乙基氨基丙酸酯和C_{12/18}酰基肌氨酸。

[0106] 富脂剂和稠度因子

[0107] 富脂剂可以选自物质如,例如羊毛脂和卵磷脂以及聚乙氧基化或酰基化羊毛脂和卵磷脂衍生物、多元醇脂肪酸酯、单甘油酯和脂肪酸烷醇酰胺,其中脂肪酸烷醇酰胺也可用作泡沫稳定剂。

[0108] 使用的主要稠度因子是含有12至22个并且优选16至18个碳原子的脂肪族醇或羟基脂肪族醇以及偏甘油酯、脂肪酸或羟基脂肪酸。优选使用这些物质与烷基寡葡萄糖苷和/或相同链长的脂肪酸N-甲基葡萄糖酰胺和/或聚甘油聚-12-羟基硬脂酸酯的结合物。

[0109] 增稠剂和流变添加剂

[0110] 适当的增稠剂是聚合物增稠剂,如Aerosil®类(亲水性二氧化硅)、多糖,更特别是黄原胶、瓜尔胶、琼脂、藻酸盐和纤基乙酸钠(tyloses)、羧甲基纤维素和羟乙基和羟丙基纤维素、以及脂肪酸的相对高分子量聚乙二醇单酯和二酯、聚丙烯酸酯(例如Carbopols® [Goodrich]或Synthalens® [Sigma])、聚丙烯酰胺、聚乙烯醇和聚乙烯吡咯烷酮、表面活性剂如,例如乙氧基化脂肪酸甘油酯、脂肪酸与多元醇,如季戊四醇或三羟甲基丙烷的酯、窄同系物分布的脂肪族醇乙氧基化物和电解质,如氯化钠和氯化铵。

[0111] 聚合物

[0112] 适当的阳离子聚合物是例如阳离子纤维素衍生物,例如由Amerchol得到商品名为Polymer JR 400®的季铵化羟乙基纤维素、阳离子淀粉、二烯丙基铵盐和丙烯酰胺的共聚物、季铵化乙烯基吡咯烷酮/乙烯基咪唑聚合物如,例如Luviquat® (BASF)、聚乙二醇类和胺类的缩合产物、季铵化胶原多肽如,例如月桂基二甲基铵羟丙基水解胶原(Lamequat® L, Grünau)、季铵化小麦多肽、聚乙烯亚胺、阳离子硅氧烷聚合物,例如氨基二甲聚硅氧烷(氨基封端聚二甲硅氧烷)、己二酸和二甲基氨基羟丙基二亚乙基三胺的共聚物(Cartaretine®, Sandoz)、丙烯酸与二甲基二烯丙基氯化铵的共聚物(Merquat® 550, Chemviron)、聚氨基聚酰胺及其交联水溶性聚合物、阳离子角质素衍生物例如任选以微晶分布的季铵化壳聚糖、二卤代烷基如二溴丁烷与双二烷基胺的缩合产物,例如双-二甲基氨基-1,3-丙烷、阳离子瓜尔胶,例如Celanese的Jaguar® CBS、Jaguar® C-17、Jaguar® C-16、季铵盐聚合物如,例如Miranol的Mirapol® A-15、Mirapol® AD-1、Mirapol® AZ-1以及各种聚季铵盐类(例如6、7、32或37),其以商品名Rheocare® CC或Ultrage® 300市售。

[0113] 适当的阴离子、两性离子、两性和非离子聚合物是例如,乙酸乙烯酯/巴豆酸共聚物、乙烯基吡咯烷酮/丙烯酸乙烯酯共聚物、乙酸乙烯酯/马来酸丁酯/丙烯酸异冰片酯共聚

物、甲基乙烯基醚/马来酸酐共聚物及其酯、未交联的和与多元醇交联的聚丙烯酸、丙烯酸胺基丙基三甲基氯化铵/丙烯酸酯共聚物、辛基丙烯酸酰胺/甲基丙烯酸甲酯/甲基丙烯酸叔丁基氨基乙酯/甲基丙烯酸2-羟丙酯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮、乙烯基吡咯烷酮/乙酸乙烯酯共聚物、乙烯基吡咯烷酮/甲基丙烯酸二甲基氨基乙酯/乙烯基己内酰胺三元共聚物和任选衍生的纤维素醚和硅氧烷。

[0114] 珠光蜡

[0115] 适当的珠光蜡是例如，烷二醇酯，尤其是乙二醇二硬脂酸酯；脂肪酸烷醇酰胺，尤其是椰油脂肪酸二乙醇酰胺；偏甘油酯，尤其是硬脂酸单甘油酯；多元、任选羟基取代的羧酸与具有6-22个碳原子的脂肪族醇的酯，尤其是酒石酸的长链酯；具有总计至少24个碳原子的脂肪物质，如例如脂肪族醇、脂肪酮、脂肪醛、脂肪醚和脂肪碳酸酯，尤其是月桂酮和二硬脂醚；脂肪酸如硬脂酸、羟基硬脂酸或山嵛酸、具有12-22个碳原子的环氧烯烃与具有12-22个碳原子的脂肪族醇和/或具有2-15个碳原子和2-10个羟基的多元醇的开环产物、及其混合物。

[0116] 硅氧烷化合物

[0117] 适当的硅氧烷化合物是例如，二甲基聚硅氧烷、甲基苯基聚硅氧烷、环硅氧烷以及氨基、脂肪酸、醇、聚醚、环氧、氟、糖苷和/或烷基改性的硅氧烷化合物，在室温下它们可以是液态以及呈树脂态。其它适当的硅氧烷化合物是有机硅树脂，其为平均链长为200至300个二甲基硅氧烷单元的二甲基硅油与氢化硅酸盐的混合物。适当的挥发硅氧烷化合物的详细介绍见于Todd et al. in *Cosm. Toil.* 91, 27 (1976)。

[0118] 蜡和稳定剂

[0119] 除了使用的天然油，制剂中还可以含有蜡，尤其是天然蜡例如，小烛树蜡、巴西棕榈蜡、日本蜡、芦华草蜡(espartograss wax)、软木蜡、小冠椰子蜡(guaruma wax)、米糠油蜡、糖甘蔗蜡、小冠巴西棕蜡(ouricury wax)、褐煤蜡、蜂蜡、紫胶蜡(shellac wax)、鲸蜡、羊毛脂(wool wax)、尾脂脂肪(uropygial fat)、(纯)地蜡、地蜡(石蜡)、凡士林、石油蜡和微蜡；化学改性的蜡类(硬蜡类)如例如，褐煤酯蜡(montan ester waxes)、沙索蜡(sasol waxes)、氢化霍霍巴蜡(jojoba waxes)以及合成蜡类如例如聚亚烷基蜡类和聚乙二醇蜡类。

[0120] 作为稳定剂可以使用脂肪酸的金属盐，如例如硬脂酸或蓖麻酸镁、铝和/或锌盐。

[0121] 主要防晒剂

[0122] 在本发明中主要防晒剂是，例如在室温下是液态或结晶的有机物质(光过滤物质)，其能够吸收紫外辐射并又以长波辐射的形式释放吸收的能量，例如热量。

[0123] 根据本发明的制剂有利地含有至少一种UV-A过滤物质和/或至少一种UV-B过滤物质和/或宽带过滤物质和/或至少一种无机染料。根据本发明的制剂优选含有至少一种UV-B过滤物质或一种宽带过滤物质，更特别是至少一种UV-A过滤物质和至少一种UV-B过滤物。

[0124] 优选的化妆品组合物，优选根据本发明的局部制剂含有一种、两种、三种或多种防晒剂，选自组包括4-氨基苯甲酸及衍生物，水杨酸衍生物、二苯酮衍生物、二苯酰甲烷衍生物、丙烯酸二苯酯、3-咪唑基-4-基丙烯酸及其酯、苯并呋喃衍生物、丙二酸亚苄酯衍生物、含有一个或多个有机硅自由基的聚合UV吸收剂、肉桂酸衍生物、樟脑衍生物、三苯胺基-s-三嗪衍生物、2-羟基苯基苯并三唑衍生物、苯基苯并咪唑磺酸衍生物及其盐、邻氨基苯甲酸

薄荷酯、苯并三唑衍生物和吡啶衍生物。

[0125] 此外,有利地将式(I)的化合物与活性成分结合,所述活性成分渗透进入皮肤并由内保护细胞免受阳光导致的损害并降低皮肤基质金属蛋白酶水平。WO 2007/128723记载了被称为芳香烃受体拮抗剂的各个优选成分,并在此引用。优选的是2-亚苄基-5,6-二甲氧基-3,3-二甲基茛满-1-酮。

[0126] 下文引用的可在本发明中使用的UV过滤物质是优选的,但不限于这些物质。

[0127] 优选使用的UV过滤物质选自组包括:

[0128] • 对氨基苯甲酸

[0129] • 乙氧基化(25mol)对氨基苯甲酸乙酯(INCI名称:PEG-25 PABA)

[0130] • 对二甲基氨基苯甲酸-2-乙基己酯

[0131] • N-丙氧基化(2mol)对氨基苯甲酸乙酯

[0132] • 对氨基苯甲酸甘油酯

[0133] • 水杨酸高薄荷醇酯(胡莫柳酯)(NeoHeliopan®HMS)

[0134] • 水杨酸-2-乙基己酯(NeoHeliopan®OS)、

[0135] • 三乙醇胺水杨酸酯

[0136] • 水杨酸4-异丙基苄酯

[0137] • 邻氨基苯甲酸薄荷醇酯(NeoHeliopan®MA)

[0138] • 二异丙基肉桂酸乙酯

[0139] • 对甲氧基肉桂酸2-乙基己酯(NeoHeliopan®AV)

[0140] • 二异丙基肉桂酸甲酯

[0141] • 对甲氧基肉桂酸异戊酯(NeoHeliopan®E 1000)

[0142] • 对甲氧基肉桂酸二乙醇胺盐

[0143] • 对甲氧基肉桂酸异丙酯

[0144] • 2-苯基苯并咪唑磺酸和盐(NeoHeliopan®Hydro)

[0145] • 3-(4'-三甲基铵)-亚苄基-苄基-2-酮硫酸甲酯

[0146] • β-咪唑-4(5)-丙烯酸(尿刊酸)

[0147] • 3-(4'-磺基)亚苄基-苄基-2-酮和盐

[0148] • 3-(4'-甲基亚苄基)-D,L-樟脑(NeoHeliopan®MBC)

[0149] • 3-亚苄基-D,L-樟脑

[0150] • N-[(2和4)-[2-(氧代亚冰片-3-基)甲基]苄基]-丙烯酰胺聚合物

[0151] • 4,4'-[(6-[4-(1,1-二甲基)-氨基羰基]苯基氨基]-1,3,5-三嗪-2,4-二基)二亚氨基]-二-(苯甲酸-2-乙基己酯)(Uvasorb®HEB)

[0152] • 亚苄基丙二酸酯-聚硅氧烷(Parsol®SLX)

[0153] • 甘油基乙基己酸二甲氧基肉桂酸酯

[0154] • 双丙二醇水杨酸酯

[0155] • 4,4',4''-(1,3,5-三嗪-2,4,6-三基三亚氨基)-三-苯甲酸三(2-乙基己酯)(=2,4,6-三苯胺基-(对-羰基-2'-乙基己基-1'-氧基)-1,3,5-三嗪)(Uvinul®T150)

[0156] 在本发明的制剂中优选与一种或多种式(I)的化合物结合的宽波过滤物质选自组包括

- [0157] • 2-氰基-3,3-二苯基丙烯酸-2-乙基己酯(NeoHeliopan®303)
- [0158] • 2-氰基-3,3'-二苯基丙烯酸乙酯
- [0159] • 2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮(NeoHeliopan®BB)
- [0160] • 2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮-5-磺酸
- [0161] • 二羟基-4-甲氧基二苯甲酮
- [0162] • 2,4-二羟基二苯甲酮
- [0163] • 四羟基二苯甲酮
- [0164] • 2,2'-二羟基-4,4'-二甲氧基二苯甲酮
- [0165] • 2-羟基-4-正辛氧基二苯甲酮
- [0166] • 2-羟基-4-甲氧基-4'-甲基二苯甲酮
- [0167] • 羟基甲氧基二苯甲酮磺酸钠
- [0168] • 2,2'-二羟基-4,4'-二甲氧基-5,5'-二磺基-二苯甲酮二钠
- [0169] • 苯酚,2-(2H-苯并三唑-2-基)-4-甲基-6-(2-甲基-3(1,3,3,3-四甲基-1-(三甲基硅烷基)-氧)-二甲硅氧基)-丙基)(Mexoryl®XL)
- [0170] • 2,2'-亚甲基-二-(6-(2H-苯并三唑-2-基)-4-1,1,3,3-四甲基丁基)-苯酚)(Tinosorb®M)
- [0171] • 2,4-二-[4-(2-乙基己氧基)-2-羟苯基]-1,3,5-三嗪
- [0172] • 2,4-二-[[4-(2-乙基己氧基)-2-羟基}苯基]-6-(4-甲氧基苯基)-1,3,5-三嗪(Tinosorb®S)
- [0173] • 2,4-二-[[4-(3-磺酸基)-2-羟基丙氧基)-2-羟基}苯基]-6-(4-甲氧基苯基)-1,3,5-三嗪钠盐
- [0174] • 2,4-二-[[4-(3-(2-丙氧基)-2-羟基丙氧基)-2-羟基}苯基]-6-(4-甲氧基苯基)-1,3,5-三嗪
- [0175] • 2,4-二-[[4-(2-乙基己氧基)-2-羟基}苯基]-6-[4-(2-甲氧乙基羰基)苯基氨基]-1,3,5-三嗪
- [0176] • 2,4-二-[[4-(3-(2-丙氧基)-2-羟基丙氧基)-2-羟基}苯基]-6-[4-(2-乙基羰基)苯基氨基]-1,3,5-三嗪
- [0177] • 2,4-二-[[4-(2-乙基己氧基)-2-羟基}苯基]-6-(1-甲基吡咯-2-基)-1,3,5-三嗪
- [0178] • 2,4-二-[[4-三-(三甲基硅氧基甲硅烷基丙氧基)-2-羟基}苯基]-6-(4-甲氧基苯基)-1,3,5-三嗪
- [0179] • 2,4-二-[[4-(2"-甲基丙氧烯基)-2-羟基}苯基]-6-(4-甲氧基苯基)-1,3,5-三嗪
- [0180] • 2,4-二-[[4-(1',1',1',3',5',5',5'-七甲基硅氧基-2"-甲基丙氧基)-2-羟基}苯基]-6-(4-甲氧基苯基)-1,3,5-三嗪
- [0181] 组合物还可以含有其他典型的洗涤剂 and 清洁组合物成分如UV-A过滤物质,其在本发明的制剂中优选与一种或多种式(I)的化合物结合,选自组包括
- [0182] • 4-异丙基二苯甲酰甲烷
- [0183] • 对苯二亚甲基-二苄烷磺酸和盐(Mexoryl®SX)

- [0184] • 4-叔丁基-4'-甲氧基二苯甲酰基甲烷(阿伏苯宗)/(NeoHeliopan®357)
- [0185] • 亚苯基-二-苯并咪唑基-四磺酸二钠盐(NeoHeliopan®AP)
- [0186] • 2,2'-(1,4-亚苯基)-二-(1H-苯并咪唑-4,6-二磺酸),一钠盐
- [0187] • 2-(4-二乙氨基-2-羟基苯甲酰基)-苯甲酸己基酯(Uvinul®A Plus)
- [0188] • 根据DE 100 55 940 A1(=WO 2002038537)的茚满亚基化合物
- [0189] 组合物还可以含有其他典型的洗涤剂和清洁组合物成分如UV过滤物质,其在本发明的制剂中优选与一种或多种式(I)的化合物结合,选自组包括
- [0190] • 对氨基苯甲酸
- [0191] • 3-(4'-三甲基铵)-亚苄基苄基-2-酮硫酸甲酯
- [0192] • 水杨酸高薄荷醇酯(NeoHeliopan®HMS)
- [0193] • 2-羟基-4-甲氧基二苯酮(NeoHeliopan®BB)
- [0194] • 2-苯基苯并咪唑磺酸(NeoHeliopan®Hydro)
- [0195] • 对苯二亚甲基-二苄烷磺酸和盐(Mexoryl®SX)
- [0196] • 4-叔丁基-4'-甲氧基二苯甲酰基甲烷(NeoHeliopan®357)
- [0197] • 3-(4'-磺基)亚苄基-苄基-2-酮和盐
- [0198] • 2-氰基-3,3-二苯基丙烯酸-2-乙基己酯(NeoHeliopan®303)
- [0199] • N-[(2和4)-[2-(氧代亚冰片-3-基)甲基]苄基]-丙烯酰胺聚合物
- [0200] • 对甲氧基肉桂酸2-乙基己酯(NeoHeliopan®AV)
- [0201] • 乙氧基化(25mol)对氨基苯甲酸乙酯(INCI名称:PEG-25 PABA)
- [0202] • 对甲氧基肉桂酸异戊酯(NeoHeliopan®E1000)
- [0203] • 2,4,6-三苯胺基-(对-羰基-2'-乙基己基-1'-氧基)-1,3,5-三嗪(Uvinul®T150)
- [0204] • 苯酚,2-(2H-苯并三唑-2-基)-4-甲基-6-(2-甲基-3(1,3,3,3-四甲基-1-(三甲基硅烷基)-氧)-二甲硅氧基)-丙基)(Mexoryl®XL)
- [0205] • 4,4'-[(6-[4-(1,1-二甲基)-氨基羰基]苯基氨基)-1,3,5-三嗪-2,4-二基]二亚氨基]-二-(苯甲酸2-乙基己基酯)(Uvasorb HEB)
- [0206] • 3-(4'-甲基亚苄基)-D,L-樟脑(NeoHeliopan®MBC)
- [0207] • 3-亚苄基-樟脑
- [0208] • 水杨酸-2-乙基己酯(NeoHeliopan®OS)
- [0209] • 4-二甲基氨基苯甲酸-2-乙基己酯(Padimate 0)
- [0210] • 羟基-4-甲氧基二苯甲酮-5-磺酸和钠盐
- [0211] • 2,2'-亚甲基-二-(6-(2H-苯并三唑-2-基)-4-1,1,3,3-四甲基丁基)-苯酚)(Tinosorb®M)
- [0212] • 亚苯基-二-苯并咪唑基-四磺酸二钠盐(NeoHeliopan®AP)
- [0213] • 2,4-二-[(4-(2-乙基己氧基)-2-羟基)苯基]-6-(4-甲氧基苯基)-1,3,5-三嗪(Tinosorb®S)
- [0214] • 亚苄基丙二酸酯-聚硅氧烷(Parsol®SLX)
- [0215] • 邻氨基苯甲酸薄荷醇酯(NeoHeliopan®MA)
- [0216] • 2-(4-二乙氨基-2-羟基苯甲酰基)-苯甲酸己酯(Uvinul®A Plus)
- [0217] • 根据DE 100 55 940(=WO 02/38537)的茚满亚基化合物。

[0218] 有利的主要以及二级防晒剂记载于W0 2005 123101 A1。有利地这些制剂含有至少一种UVA过滤物质和/或至少一种UVB过滤物质和/或至少一种无机颜料。该制剂在本发明中可以各种形式存在,如通常用于防晒制剂的形式。因此,它们的形式可以为溶液、油包水型(W/O)或水包油型(O/W)乳剂或多重乳剂,例如水包油包水型(W/O/W)乳剂、凝胶、水分散体、固体棒或气雾剂。

[0219] 在另一个优选实施方案中本发明的制剂含有遮光剂,即,特别是UV过滤物质和/或无机颜料(UV过滤颜料)的总量能够使本发明的制剂具备大于或等于2的光照防护系数(优选大于或等于5)。本发明的该制剂特别适用于保护皮肤和头发。

[0220] 二级防晒剂

[0221] 除了上述主要防晒剂组,也可以使用抗氧化剂型的二级防晒剂。抗氧化剂型的二级防晒剂阻断了当紫外线渗透进入皮肤时引发的光化学反应链。典型实例是氨基酸类(例如甘氨酸、组氨酸、酪氨酸、色氨酸)及其衍生物、咪唑类(例如尿刊酸)及其衍生物、肽类例如D,L-肌肽、D-肌肽,L-肌肽及其衍生物(例如鹅肌肽)、类胡萝卜素类、胡萝卜素类(例如A-胡萝卜素、B-胡萝卜素、番茄红素)及其衍生物、氯原酸及其衍生物、硫辛酸及其衍生物(例如二氢硫辛酸)、金硫葡萄糖、丙基硫氧嘧啶和其他硫醇(例如硫氧还蛋白、谷胱甘肽、半胱氨酸、胱氨酸、胱胺及其糖基、N-乙酰基、甲基、乙基、丙基、戊基、丁基和月桂基、棕榈酰基、油烯基、A-亚油酰基、胆甾醇基和其甘油酯)及其盐、硫代二丙酸二月桂酯、硫代二丙酸双十八酯、硫代二丙酸及其衍生物(酯类、醚类、肽类、脂类、核苷酸类、核苷类和盐)以及非常低的耐药剂量的亚砷亚胺化合物(例如丁硫氨酸亚砷亚胺、同型半胱氨酸亚砷亚胺、丁硫氨酸砷、五-、六-和七-硫氨酸亚砷亚胺)、以及(金属)螯合剂类(例如,A-羟基脂肪酸类、棕榈酸、植酸、乳铁蛋白)、A-羟基酸类(例如柠檬酸、乳酸、苹果酸)、腐殖酸、胆汁酸、胆汁提取物、胆红素、胆绿素、EDTA、EGTA及其衍生物、不饱和脂肪酸及其衍生物(例如亚油酸、油酸)、叶酸及其衍生物、泛醌和泛醇及其衍生物、维生素C及其衍生物(例如抗坏血酸棕榈酸酯、抗坏血酸磷酸镁、抗坏血酸乙酸酯)、生育酚及衍生物(例如维生素E乙酸酯)、维生素A及衍生物(维生素A棕榈酸酯)以及安息香树脂的苯甲酸松酯、芸香十烯酸及其衍生物、糖基芦丁、阿魏酸、亚糠基山梨醇、肌肽、丁基羟甲苯、丁基羟基茴香醚、去甲二氢愈创木酸木脂酸、去甲二氢愈创木酸、三羟基丁酰苯、尿酸及其衍生物、甘露糖及其衍生物、超氧化物歧化酶、二氧化钛(例如乙醇中的分散体)、锌及其衍生物(例如ZnO、ZnSO₄)、硒及其衍生物(例如蛋氨酸硒)、芪类及其衍生物(例如均二苯乙烯氧化物、反-均二苯乙烯氧化物)及这些活性化合物的适合本发明目的的衍生物(盐类、酯类、醚类、糖类、核苷酸类、核苷类、肽类和脂类)。

[0222] 有利的无机二级光照防护颜料精细分散于金属氧化物和金属盐中,其记载于W0 2005 123101 A1中。无机颜料,特别是疏水性无机微颜料,在本发明的最终化妆品制剂中的总量有利地是0.1至30重量%,优选0.5至10.0重量%,基于制剂总量计。

[0223] 同样优选的是使用微粒状UV过滤物质或无机颜料,其可任选为疏水性的,如钛的氧化物(TiO₂)、锌的氧化物(ZnO)、铁的氧化物(Fe₂O₃)、锆的氧化物(ZrO₂)、硅的氧化物(SiO₂)、镁的氧化物(例如MnO)、铝的氧化物(Al₂O₃)、铈的氧化物(例如Ce₂O₃)和/或其混合物。

[0224] 调节皮肤色素沉着的活性物质

[0225] 用于皮肤和/或毛发亮化的优选活性成分选自组包括:曲酸(5-羟基-2-羟基甲基-

4-吡喃酮)、曲酸衍生物,优选地曲酸二棕榈酸酯、熊果苷、抗坏血酸,抗坏血酸衍生物、优选地抗坏血酸磷酸镁、氢醌、氢醌衍生物、间苯二酚、间苯二酚衍生物,优选4-烷基间苯二酚和4-(1-苯乙基)1,3-间苯二酚(苯乙基间苯二酚)、环己基氨基甲酸酯类(优选W0 2010/122178和W0 2010/097480中公开的一种或多种氨基甲酸环己基酯类),含硫分子,优选地谷胱甘肽或半胱氨酸、 α -羟基酸类(优选柠檬酸、乳酸、苹果酸),其盐类和酯类、N-乙酰基酪氨酸和衍生物、十一碳烯酰基苯基丙氨酸、葡萄糖酸、色酮衍生物,优选芦荟苦素、黄酮类化合物、1-氨基乙基次磷酸、硫脲衍生物、鞣花酸、烟酰胺(niacinamide)、锌盐类,优选氯化锌或葡萄糖酸锌、崖柏素和衍生物、三萜类,优选山楂酸、甾醇类,优选地麦角甾醇、苯并呋喃酮类,优选川芎内酯、乙基愈疮木酚、乙基愈疮木酚、二酸类(dionic acids)、优选十八烯二酸和/或壬二酸,氮氧化物合成的抑制剂,优选地L-硝基精氨酸及其衍生物、2,7-二硝基吡啶或硫瓜氨酸、金属螯合剂(优选 α -羟基脂肪酸类、植酸、腐殖酸、胆酸、胆汁提取物、EDTA、EGTA及其衍生物)、维甲酸类化合物、豆奶和提取物、丝氨酸蛋白酶抑制剂或硫辛酸或者用于皮肤和毛发亮化的其他合成或天然活性成分,后者优选地以取自植物的提取物的形式使用,优选熊果提取物、大米提取物、番木瓜提取物、姜黄提取物、桑果提取物、凉薯提取物、香附提取物、甘草根提取物或从其中浓缩或分离的组成成分,优选光甘草定或甘草查尔酮甲、桂木提取物、酸模属的提取物、松属(松树)的提取物、葡萄属的提取物或者从其中分离或浓缩的芪类衍生物、虎耳草提取物、黄芩提取物(scutellaria extract)、葡萄提取物和/或微藻提取物,尤其是四肩突四鞭藻提取物。

[0226] 优选的作为成分(b)的皮肤亮白剂是作为酪氨酸酶抑制剂的曲酸和苯乙基间苯二酚、 β -和 α -熊果苷、氢醌、烟酰胺、二酸、抗坏血酸磷酸镁和维生素C及其衍生物、桑果提取物、凉薯提取物、番木瓜提取物、姜黄提取物、香附提取物、甘草提取物(含有甘草甜素)、 α -羟基酸类、4-烷基间苯二酚类、4-羟基苯甲醚。由于具有非常好的活性,这些皮肤亮白剂是优选的,尤其是与根据本发明的香紫苏内酯组合。另外,所述优选的皮肤亮白剂可容易地得到。

[0227] 在此方面有利的皮肤和毛发鞣制活性成分是酪氨酸酶的底物或底物类似物,如L-酪氨酸、N-乙酰基酪氨酸、L-DOPA或L-二羟基苯基丙氨酸、黄嘌呤生物碱类,如咖啡因、可可碱和茶碱及其衍生物、阿黑皮素原肽类,如ACTH、 α -MSH、其肽类似物、和与黑皮质素受体结合的其他物质、肽类如Val-Gly-Val-Ala-Pro-Gly、Lys-Ile-Gly-Arg-Lys或Leu-Ile-Gly-Lys、嘌呤类、嘧啶类化合物、叶酸、铜盐类如葡萄糖酸铜、氯化铜或吡咯烷铜、1,3,4-噁二唑-2-硫醇如5-吡嗪-2-基-1,3,4-噁二唑-2-硫醇、姜黄素、锌二甘氨酸盐(Zn(Gly)₂)、锰(II)二碳酸盐络合物("pseudocat-alases"),如例如EP 0584178中所描述、四取代的环己烯衍生物,例如W02005/032501中所描述、异戊二烯萜类,如W0 2005/102252和W02006/010661中所描述、黑色素衍生物诸如Melasyn-100和MelanZe、二酰基丙三醇类、脂肪族或环状二醇类、补骨脂素类、前列腺素及其类似物、腺苷酸环化酶的活化剂和激活毛发黑色素小体转化成角蛋白细胞的化合物,如丝氨酸蛋白酶或PAR-2受体激动剂、菊属的植物和植物部分的提取物、地榆属的植物和植物部分的提取物、核桃提取物、urucum提取物、大黄提取物、微藻提取物,尤其是球等鞭金藻、海藻糖、赤藓酮糖和二羟基丙酮。也可以使用引起皮肤和毛发染色或变褐色的黄酮类化合物(例如槲皮素、鼠李醚、山奈酚、漆黄素、染料木黄酮、黄豆苷元、白杨素和芹菜素、表儿茶素、香叶木苷和香叶木素、桑色素、槲皮苷、柚皮素、橙皮

苷、根皮苷、根皮素)。

[0228] 根据本发明的产品中用于对皮肤和毛发染色(一种或多种化合物)进行调整的其他活性成分的前述例子的量优选为0.00001至30重量%、更优选0.0001至20重量%,尤其优选0.001至5重量%,基于制剂总量计。

[0229] 抗衰老活性物

[0230] 在本发明中抗衰老剂或生物活性剂是,例如抗氧化剂、基质金属蛋白酶抑制剂(MMPI)、皮肤保湿剂、粘多糖刺激剂(glycosaminoglycan stimulators)、抗炎剂、TRPV1拮抗剂和植物提取物。

[0231] 抗氧化剂。适当的抗氧化剂包括氨基酸类(优选甘氨酸,组氨酸,酪氨酸,色氨酸)及其衍生物、咪唑类(优选尿刊酸)及其衍生物、肽类,优选D,L-肌肽、D-肌肽、L-肌肽及其衍生物(优选鹅肌肽)、肉碱、肌酸、马曲金(matrikine)肽类(优选赖氨酰-苏氨酰-苏氨酰-赖氨酰-丝氨酸)和棕榈酰化五肽类、类胡萝卜素类、胡萝卜素类(优选 α -胡萝卜素、 β -胡萝卜素、番茄红素)及其衍生物、硫辛酸及其衍生物(优选二氢硫辛酸)、金硫葡萄糖、丙基硫氧嘧啶和其他硫醇(优选硫氧还蛋白、谷胱甘肽、半胱氨酸、胱氨酸、胱胺和糖基、N-乙酰基、甲基、乙基、丙基、戊基、丁基和月桂基、棕榈酰基、油烯基、 γ -亚油烯基、胆甾醇基、甘油基及其寡甘油酯)及其盐、硫代二丙酸二月桂酯、硫代二丙酸二硬脂酯、硫代二丙酸及其衍生物(优选酯类、醚类、肽类、脂类、核苷酸类、核苷类和盐)和非常低的耐药剂量(例如pmol至 μ mol/kg)的亚砷亚胺化合物(优选丁硫氨酸亚砷亚胺、同型半胱氨酸亚砷亚胺、丁硫氨酸砷、五-、六-和七-硫氨酸亚砷亚胺)、以及(金属)螯合剂(优选 α -羟基脂肪酸、棕榈酸、植酸、乳铁蛋白)、 α -羟基酸(优选柠檬酸、乳酸、苹果酸)、腐殖酸、胆汁酸、胆汁提取物、单宁类、胆红素、胆绿素、EDTA、EGTA及其衍生物、不饱和脂肪酸及其衍生物(优选 γ -亚麻酸,亚油酸,油酸)、叶酸及其衍生物、泛醌及其衍生物,泛醇及其衍生物、维生素C及衍生物(优选抗坏血酸棕榈酸酯、抗坏血酸磷酸镁、抗坏血酸基乙酸酯、抗坏血酸葡萄糖苷)、生育酚及衍生物(优选维生素E乙酸酯)、维生素A及衍生物(维生素A棕榈酸酯)以及安息香树脂的苯甲酸松酯、芸香十烯酸及其衍生物、黄酮类及其糖基化前体,特别是槲皮素及其衍生物,优选 α -葡萄糖基芦丁、迷迭香酸、鼠尾草酚、卡诺酸、白藜芦醇、咖啡酸及其衍生物、芥子酸及其衍生物、阿魏酸及其衍生物、姜黄素类、绿原酸及其衍生物、类视黄醇类,优选类视黄醇棕榈酸酯、视黄醇或维甲酸、乌索酸、乙酰丙酸、丁基羟基甲苯、丁基羟基茴香醚、去二氢愈创木酸、去甲二氢愈创木酸、三羟基丁酰苯、尿酸及其衍生物、甘露糖及其衍生物、锌及其衍生物(优选ZnO、ZnSO₄)、硒及其衍生物(优选硒蛋氨酸)、超氧化物歧化酶、二苯乙烯类及其衍生物(优选二苯乙烯氧化物、反式-二苯乙烯氧化物)及这些引用的活性成分的适合本发明的衍生物(盐、酯类、醚类、糖类、核苷酸类、核苷类、肽类和脂类)或者具有抗氧化作用的植物的提取物或馏分,优选绿茶、路易波士(rooibos)茶、蜜树茶、葡萄、迷迭香、鼠尾草、蜜蜂花、百里香、薰衣草、橄榄、燕麦、可可、银杏、人参、甘草、金银花、苦参、葛根、松、柑橘、余甘子或St. John麦汁、葡萄籽、小麦胚芽、余甘子、辅酶,优选辅酶Q10、质体醌和甲基萘醌。优选的抗氧化剂选自组包括维生素A及衍生物,维生素C及衍生物,生育酚及衍生物,优选生育酚醋酸酯、以及泛醌。

[0232] 如果将维生素E和/或其衍生物用作抗氧化剂,有利的是选择它们的浓度为约0.001至约10%体重量范围内,基于配方总重量计。如果将维生素A或维生素A衍生物或者

胡萝卜素类或其衍生物用作抗氧化剂,有利的是选择它们的浓度为约0.001至约10% b.w.的范围内,基于制剂总重量计。

[0233] 基质金属蛋白酶抑制剂(MMPI)。优选的组合物包含基质金属蛋白酶抑制剂,尤其是那些抑制基质金属蛋白酶裂解胶原的抑制剂,选自组包括:熊果酸、视黄醇棕榈酸酯、没食子酸丙酯、早熟素类、6-羟基-7-甲氧基-2,2-二甲基-1(2H)-苯并吡喃、3,4-二氢-6-羟基-7-甲氧基-2,2-二甲基-1(2H)-苯并吡喃、盐酸苯甲脒、半胱氨酸蛋白酶抑制剂N-乙基马来酰胺和丝氨酸蛋白酶抑制剂的 ϵ -氨基-正己酸:苯基甲基磺酰基氟化物、collhibin(Pentapharm公司;INCI:水解大米蛋白)、oenotherol(Soliance公司;INCI:丙二醇、水、月见草根提取物、鞣花酸和鞣花单宁类,例如来自石榴的提取物)、磷酸阿米酮桉木醇、EDTA、加拉定(galardin)、EQUISTAT(Collaborative Group公司;苹果提取物、大豆种子提取物、熊果酸、大豆异黄酮类和大豆蛋白类)、鼠尾草提取物、MDI(Atrium公司;INCI:粘多糖(glycosaminoglycans)),fermiskin(Silab/MAWI公司;INCI:水和香菇提取物)、actimpl.9.3(Expanscience/Rahn公司;INCI:水解羽扇豆蛋白),lipobelle大豆糖苷配基(Mibelle公司;INCI:醇、聚山梨醇酯80、卵磷脂和大豆异黄酮)、绿茶和黑茶提取物以及W002069992A1中列出的其它植物提取物(见其中的表1-12,通过引用并入本文)、大豆蛋白或大豆糖蛋白、来自大米、豌豆或羽扇豆的水解蛋白、抑制MMP的植物提取物,优选香菇提取物、蔷薇科、蔷薇亚科的叶提取物,特别是黑莓叶提取物(优选地,如W02005123101A1中所述,通过引用并入本文),例如SymMatrix(Symrise公司,INCI:麦芽糖糊精、欧洲黑莓(Rubus Fruticosus)叶提取物)。优选的活性物质选自组包括视黄醇棕榈酸酯、熊果酸、蔷薇科、蔷薇亚科的叶提取物、染料木素和黄豆苷元。

[0234] 润肤剂。优选的润肤剂选自 Hydroviton24Plus、脲、吡咯烷酮羧酸钠、糖类、甘油、和氨基酸。

[0235] 粘多糖刺激剂。优选的组合物含有刺激粘多糖合成的物质,选自组包括透明质酸和衍生物或盐,Subliskin(Sederma,INCI:苜蓿中华根瘤菌发酵滤液、十六烷基羟乙基纤维素、卵磷脂)、Hyalufix(BASF,INCI:水、丁二醇、高良姜叶提取物、黄原胶、辛酸/癸酸甘油三酯、Stimulhyal(Soliance,INCI:酮葡萄糖酸钙(Calcium ketogluconate)),Syn-Glycan(DSM,INCI:十四烷基氨基丁酸基缬氨酰氨基丁脒三氟乙酸酯(Tetradecyl Aminobutyroylvalylaminobutyric脒Trifluoroacetate)、甘油、氯化镁)、Kalpariane(Biotech Marine)、DC Upregulex(Distinctive Cosmetic成分,INCI:水、丁二醇、磷脂质类、水解丝胶蛋白)、葡萄糖胺、N-乙酰基葡萄糖胺、类视黄醇类,优选视黄醇和维生素A、牛蒡果提取物、枇杷提取物、荜花素、N-甲基-L-丝氨酸、(-)- α -没药醇或合成的 α -没药醇,例如Symrise的Dragosantol和Dragosantol100、燕麦葡聚糖、松果菊提取物和大豆蛋白水解物。优选的活性物质选自组包括透明质酸和衍生物或盐、视黄醇和衍生物、(-)- α -没药醇或合成的 α -没药醇,例如Symrise的Dragosantol和Dragosantol100、燕麦葡聚糖、松果菊提取物、苜蓿根瘤菌发酵滤液、酮葡萄糖酸钙、高良姜叶提取物和十四烷基氨基丁酸基缬氨酰氨基丁脒三氟醋酸酯。

[0236] 如果在本发明中使用姜提取物,优选地使用新鲜或干燥的姜根提取物,其通过使用甲醇、乙醇、异丙醇、丙酮、乙酸乙酯、二氧化碳(CO₂)、己烷、二氯甲烷、氯仿或其他溶剂或

类似极性的溶剂混合物提取制备。提取物的特征在于存在减小皮肤刺激活性量的成分,如姜醇、姜烯酚、姜二醇、脱氢姜二酮和/或paradolols。

[0237] 角质剥离溶解剂。组合物也可含有约0.1至约30% b.w.、优选地约0.5至约15% b.w.、尤其优选地约1至约10% b.w.的角质剥离溶解剂(组分b5),基于制剂总量计。词语“角质剥离溶解剂(desquamating agent)”被理解成表示能够起以下作用的任何化合物:

[0238] • 通过促进剥离而直接地作用于角质剥离,如 β -羟基酸类,尤其是水杨酸及其衍生物(包括5-正辛酰基水杨酸); α -羟基酸类,如乙醇酸、柠檬酸、乳酸、酒石酸、苹果酸或扁桃酸;尿素;龙胆酸;低聚果糖;肉桂酸;槐树的提取物;白藜芦醇和茉莉酸的一些衍生物;

[0239] • 或者参与以下物质剥离或者降解的酶:角蛋白桥粒、糖苷酶类、角质层胰凝乳蛋白酶(SCCE)或其他蛋白酶(胰蛋白酶、chymo胰蛋白酶-like)。可能存在螯合无机盐类的试剂:EDTA;N-酰基-N,N',N'-乙二胺四乙酸;氨基磺酸化合物和尤其是(N-2-羟乙基哌嗪-N-2-乙烷)磺酸(HEPES);2-氧代噻唑烷-4-甲酸的衍生物(前半胱氨酸);甘氨酸类型的 α -氨基酸类的衍生物(如EP-0852949中所述描述,由BASF公司以商品名称TRILON M销售的甲基甘氨酸二乙酸钠);蜂蜜;糖衍生物,如O-辛酰基-6-D-麦芽糖和N-乙酰葡萄糖胺;如由SILAB公司以商品名称Recoverine®销售的板栗提取物、如由SILAB公司以商品名称Exfolactive®销售的商品刺梨提取物、或者由Degussa公司销售的植物鞘氨醇SLC®(与水杨酸接枝的植物鞘氨醇)。

[0240] 适用于本发明的角质剥离溶解剂可以特别选自组包括磺酸类、钙螯合剂、 α -羟基酸类,如乙醇酸、柠檬酸、乳酸、酒石酸、苹果酸或扁桃酸;抗坏血酸及其衍生物,如抗坏血酸葡萄糖苷和抗坏血酸磷酸镁;烟酰胺;尿素;(N-2-羟基乙基哌嗪-N-2-乙烷)磺酸(HEPES)、 β -羟基酸类如水杨酸及其衍生物、维甲酸类化合物如视黄醇及其酯类、视黄醛、维甲酸及其衍生物、专利文件FR 2570377A1、EP 0199636A1、EP 0325540A1、EP0402072A1中描述的那些、板栗或刺梨提取物,尤其是由SILAB公司销售的产品;还原化合物,如半胱氨酸或半胱氨酸前体。

[0241] 也可以使用的角质剥离溶解剂是烟酸及其酯类和烟酰胺,所谓的维生素B3或维生素PP、和抗坏血酸及其前体,尤其如专利申请EP1529522A1中所描述。

[0242] 抗橘皮组织剂。抗橘皮组织剂和脂解剂优选自组包括W0 2007/077541中所描述的那些、和 β -肾上腺素受体激动剂,如辛弗林及其衍生物、和W0 2010/097479中所描述的氨基甲酸环己基酯类。增强或提高抗橘皮组织剂的活性制剂,尤其是刺激和/或去极化C神经纤维的制剂,优选自组包括辣椒素及其衍生物、香草基壬酰胺和其衍生物、L-肉碱、辅酶A、异黄酮类、大豆提取物、菠萝提取物和共轭亚油酸。

[0243] 加脂剂。根据本发明的制剂和产品也可包含一种或多种加脂剂和/或成脂剂以及增强或提高加脂剂活性的制剂。加脂剂是例如羟基甲氧基苯基丙基甲基甲氧基苯并咪唑(商品名称:Sym3D®)。

[0244] 生理清凉剂

[0245] 组合物还可含有一种或多种具有生理清凉作用的物质(清凉剂),其优选自以下列表:薄荷醇和薄荷醇衍生物(例如L-薄荷醇、D-薄荷醇、外消旋薄荷醇、异薄荷醇、新异薄荷醇、新薄荷醇)、薄荷基醚(例如(I-薄荷氧基)-1,2-丙二醇、(I-薄荷氧基)-2-甲基-1,2-丙二醇、I-薄荷基-甲醚)、薄荷酯(例如甲酸薄荷酯、乙酸薄荷酯、异丁酸薄荷酯、乳酸薄荷酯、L-乳酸L-薄荷酯、D-乳酸L-薄荷酯、(2-甲氧基)-乙酸薄荷酯、(2-甲氧基乙氧基)乙酸薄荷

酯、焦谷氨酸薄荷酯)、碳酸薄荷酯(例如丙二醇碳酸薄荷酯、乙二醇碳酸薄荷酯、甘油碳酸薄荷酯或其混合物)、薄荷醇与二元羧酸的半酯或其衍生物(例如琥珀酸单薄荷酯、戊二酸单薄荷酯、丙二酸单薄荷酯、0-薄荷基琥珀酸酯-N,N-(二甲基)酰胺、0-薄荷基丁二酸酯酰胺)、薄荷烷羧酸酰胺(在这种情况下优选如US 4,150,052中所描述的薄荷烷羧酸-N-乙酰胺[WS3]或N^a-(薄荷烷羧基)甘氨酸乙酯[WS5]、如W02005049553A1中描述的薄荷烷羧酸-N-(4-氰基苯基)酰胺或薄荷烷羧酸-N-(4-氰基甲基苯基)酰胺、甲烷羧酸-N-(烷氧基烷基)酰胺类)、薄荷酮和薄荷酮衍生物(例如L-薄荷酮甘油缩酮)、2,3-二甲基-2-(2-丙基)-丁酸衍生物(例如2,3-二甲基-2-(2-丙基)-丁酸-N-甲酰胺[WS23])、异胡薄荷醇或其酯(I-(-)-异胡薄荷醇、I-(-)-异胡薄荷醇乙酸酯)、薄荷烷衍生物(例如p-薄荷烷-3,8-二醇)、萆澄茄醇或含有萆澄茄醇的合成或天然混合物、环烷基二酮衍生物的吡咯烷酮衍生物(例如3-甲基-2(1-吡咯烷基)-2-环戊烯-1-酮)或四氢嘧啶-2-酮(例如W02004/026840中描述的iciline或相关化合物)、其它甲酰胺(例如N-(2-(吡啶-2-基)乙基)-3-p-薄荷烷甲酰胺或相关化合物)、(1R,2S,5R)-N-(4-甲氧基苯基)-5-甲基-2-(1-异丙基)环己烷-甲酰胺[WS12]、草氨酸酯(优选EP 2033688A2中描述的)和[(1R,2S,5R)-2-异丙基-5-甲基-环己基]2-(乙基氨基)-2-氧代乙酸酯(X Cool)。

[0246] 抗炎剂

[0247] 所述组合物还可含有抗炎和/或抗发红和/或瘙痒缓解成分,特别是,选自以下的皮质类固醇的甾类物质有利地用作抗炎活性成分或缓解发红和瘙痒的活性成分:皮质醇(hydrocortisone)、地塞美松、磷酸地塞美松、甲基脱氢皮质或可的松,还包括其它甾类抗炎剂。还可使用非甾类抗炎剂。本文可引用的实例为昔康类,如吡罗昔康或替诺昔康;水杨酸盐类如阿司匹林、双水杨酸(disalcid)、solprin或芬度柳;乙酸衍生物如双氯芬酸、氯芬酸、吲哚美辛、舒林酸、托美丁或clindanac;灭酸酯类如甲灭酸、甲氯灭酸、氟芬那酸或尼氟灭酸;丙酸衍生物如布洛芬、萘普生、苯恶洛芬或吡唑类如保泰松、羟保松、非普拉宗(febrazone)或阿扎丙宗。邻氨基苯甲酸衍生物,特别是W0 2004047833A1中描述的燕麦蕈酰胺(avenanthramides),为本发明的组合物中的优选的抗瘙痒成分。

[0248] 同样有用的是天然或天然生成的抗炎物质混合物或缓解发红和/或瘙痒的物质混合物,特别是洋甘菊、芦荟、没药类、茜草类、柳树、柳叶菜、燕麦、金盏花、山金车、St John's 麦汁、金银花、迷迭香、西番莲、金缕梅、姜或紫锥菊的提取物或馏分;优选地选自组包括洋甘菊、芦荟、燕麦、金盏花、山金车、金银花、迷迭香、金缕梅、姜或紫锥菊的提取物或馏分、和/或纯物质,优选地 α -没药醇、芹黄素、芹黄素-7-葡萄糖苷、姜酚类、姜烯酚类、姜二醇类、脱氢姜二酮类、姜酮酚类(paradol)s)、天然或天然生成的燕麦蕈酰胺,优选曲尼司特(tranilast)、燕麦蕈酰胺A、燕麦蕈酰胺B、燕麦蕈酰胺C、非天然或非天然生成的燕麦蕈酰胺,优选二氢燕麦蕈酰胺D、二氢燕麦蕈酰胺E、燕麦蕈酰胺D、燕麦蕈酰胺E、燕麦蕈酰胺F、乳香脂酸、植物甾醇、甘草甜素、光甘草定和甘草查尔酮A;优选地,选自组包括 α -没药醇、天然燕麦蕈酰胺、非天然燕麦蕈酰胺,优选二氢燕麦蕈酰胺D(如W02004047833A1中描述)、乳香脂酸、植物甾醇、甘草甜素、和甘草查尔酮A、和/或尿囊素、泛醇、羊毛脂、(假-)神经酰胺类[优选神经酰胺2、羟丙基双棕榈酰胺MEA、十六基氧丙基甘油基甲氧基丙基十四酰胺、N-(1-十六酰)-4-羟基-L-脯氨酸(1-十六基)酯、羟乙基棕榈基氧羟丙基棕榈酰胺]、鞘糖脂、植物甾醇、壳聚糖、甘露糖、乳糖和 β -葡聚糖,特别是燕麦的1,3-1,4- β -葡聚糖。

[0249] 当在本发明中使用没药醇时,其可以为天然或合成源,并且优选 α -没药醇。优选地,使用的没药醇合成制得或为天然(-)- α -没药醇和/或 α -没药醇的合成混合异构体。如果使用天然(-)- α -没药醇,其可作为精油或植物提取物或其馏分的组分采用,例如作为甘菊或Vanillosmopsis (特别是香子兰菊(Vanillosmopsis erythropappa)或Vanillosmopsis arborea)的油或提取物(的馏分)的组分采用。合成的 α -没药醇可例如从Symrise名称“Dragosantol”得到。

[0250] 抗微生物剂

[0251] 适当的抗微生物剂理论上是能够抵抗革兰氏阳性菌的所有物质,如例如4-羟基苯甲酸及其盐和酯、N-(4-氯苯基)-N'-(3,4-二氯苯基)脲、2,4,4'-三氯-2'-羟基-二苯基醚(三氯生)、4-氯-3,5-二甲基-苯酚、2,2'-亚甲基双(6-溴-4-氯苯酚)、3-甲基-4-(1-甲基乙基)苯酚、2-苄基-4-氯-苯酚、3-(4-氯苯氧基)-1,2-丙二醇、3-碘-2-丙炔氨基甲酸丁酯、氯己定、3,4,4'-三氯碳酰替苯胺(TTC)、抗菌芳香剂、麝香草酚、麝香草油、丁香酚、丁香油、薄荷醇、薄荷油、金合欢醇、苯氧乙醇、甘油单癸酸酯、单辛酸甘油酯、月桂酸单甘油酯(GML)、双甘油单癸酸酯(DMC)、水杨酸N-烷基胺,例如,正辛基水杨酰胺或正癸基水杨酰胺。

[0252] 载体和助水溶物

[0253] 优选的化妆品载体材料在25℃和1013mbar下为固体或液体(包括高粘度物质),例如甘油、1,2-丙二醇、1,2-丁二醇、1,3-丙二醇、1,3-丁二醇、乙醇、水以及两种或多种所述液体载体物质与水的混合物。任选地,本发明的这些制剂可使用防腐剂或助溶剂制备。可作为本发明制剂的成分的其它优选的液体载体物质选自组包括油类,例如植物油、中性油和矿物油。

[0254] 可作为本发明制剂的成分的优选的固体载体物质为水胶体,例如淀粉、降解淀粉、化学或物理改性淀粉、糊精、(粉末状)麦芽糊精(优选地具备葡糖值为5至25,优选10-20)、乳糖、二氧化硅、葡萄糖、改性纤维素、阿拉伯树胶、印度树胶、胶黄树胶、梧桐胶、卡拉胶、普鲁兰多糖、凝胶多糖、黄原胶、结冷胶、瓜尔豆胶、角豆粉、藻酸盐、琼脂、果胶和菊粉以及两种或两种以上这些固体物质的混合物,特别是,麦芽糊精(优选地,葡糖值为15至20)、乳糖,二氧化硅和/或葡萄糖。

[0255] 此外,助水溶物,例如乙醇、异丙醇或多元醇,可用于改善流动性。适当的多元醇优选含有2至15个碳原子和至少两个羟基。这种多元醇可含有其它官能团,更具体地为氨基,或可被氮修饰。典型实例为:

[0256] • 甘油;

[0257] • 烷二醇,例如乙二醇、二乙二醇、丙二醇、丁二醇、己二醇和平均分子量为100至1000道尔顿的聚乙二醇;

[0258] • 自缩合度为1.5至10的寡甘油技术混合物,二甘油含量为40至50重量%的二甘油技术混合物;

[0259] • 羟甲基化合物,特别是,例如三羟甲基乙烷、三羟甲基丙烷、三羟甲基丁烷、季戊四醇和二季戊四醇;

[0260] • 低级烷基糖苷,尤其是烷基中含有1至8个碳原子的那些烷基糖苷,例如甲基糖苷和丁基糖苷;

[0261] • 含有5至12个碳原子的糖醇,例如山梨醇或甘露糖醇;

- [0262] • 含有5至12个碳原子的糖,例如葡萄糖或蔗糖;
- [0263] • 氨基糖,例如葡糖胺;
- [0264] • 二醇胺,例如二乙醇胺或2-氨基丙烷-1,3-二醇。

[0265] 防腐剂

[0266] 适当的防腐剂是例如,苯氧基乙醇、甲醛溶液、对羟基苯甲酸酯类、戊二醇或山梨酸以及Kosmetikverordnung (“化妆品指南”)中附录6,A和B部分中列举的其它类别的化合物。

[0267] 芳香油和芳香剂

[0268] 适当的芳香油是天然芳香剂与合成芳香剂的混合物。天然芳香剂包括花(百合、薰衣草、玫瑰、茉莉、橙花、依兰)、茎和叶(天竺葵、广藿香、苦橙)、水果(茴香、胡荽、香菜、杜松)、果皮(佛手柑、柠檬、橙)、根(肉豆蔻、当归、芹菜、小豆蔻、木香、虹膜、菖蒲)、木材(松木、檀香、愈创木、雪松木、花梨木)、草本植物和禾本植物(龙蒿、柠檬草、鼠尾草、百里香)、松针和树枝(云杉、冷杉、松树、矮松)、树脂和香脂(格蓬、榄香脂、安息香、没药、乳香、红没药)的提取物。还可使用动物原料,例如麝猫香和海狸香。典型的合成芳香剂化合物是酯、醚、醛、酮、醇和烃类产物。酯类芳香剂化合物实例是乙酸苄酯,异丁酸苯氧基乙酯、环己基乙酸p-叔丁酯、乙酸芳樟酯、乙酸二甲基苄基原酯(dimethyl benzyl carbinyl acetate)、乙酸苯乙酯、苯甲酸芳樟酯、甲酸苄酯、苯基甘氨酸乙基甲酯、环己基丙酸烯丙酯、丙酸苏合香酯和水杨酸苄酯。醚类包括,例如苄基乙基醚;而醛类包括,例如含有8至18个碳原子的直链烷醛、柠檬醛、香茅醛、香茅基氧基乙醛、仙客来醛、羟基香茅醛、铃兰醛和波洁红醛。适当的酮类的实例是紫罗兰酮、 α -异甲基紫罗酮和甲基柏木酮。适当的醇类是茴香脑、香茅醇、丁香酚、异丁香酚、香叶醇、芳樟醇、苯乙醇和松油醇。烃类主要包括萜烯类和香脂类。然而,优选使用不同芳香剂化合物的混合物,它们一起产生令人愉快的香味。其它适当的芳香油为大多用作芳香成分的挥发性较低的精油。实例是鼠尾草油、甘菊油、丁香油、蜂花油、薄荷油、肉桂叶油、莱姆花油、杜松子油、香根草油、乳香油、白松香油、岩蔷薇油和熏衣草油。以下为单独或以混合形式优选使用的物质:佛手柑油、二氢月桂烯醇、铃兰醛、新铃兰醛、香茅醇、苯乙醇、己基肉桂醛、香叶醇、苄丙酮、仙客来醛、芳樟醇、乙氧基甲氧基环十一烷、龙涎呔喃、吡啶、二氢茉莉酮酸甲酯(hedione)、sandelice、柑橘类精油、柑橘油、橙油、乙醇酸烯丙基戊酯、cyclovertal、醒目熏衣草油、鼠尾草油、大马酮、波旁香叶油、水杨酸环己酯、Vertofix Coeur、Iso-E-Super、Fixolide NP、evernyl、iraldein gamma、苯乙酸、乙酸香叶酯、乙酸苄酯、玫瑰醚、romilat、2-乙基-己酸乙酯(irotyl)和2-叔丁基环己基乙基碳酸酯(floramant)。

[0269] 染料

[0270] 适合的染料是例如德国研究学会染料协会(Farbstoff-kommission der Deutschen Forschungsgemeinschaft)的公开物“Kosmetische”,Verlag Chemie, Weinheim,1984,页81至106中列举的适于并批准用于化妆品的物质中的任何一种。实例包括胭脂红A(C.I.16255)、专利蓝V(C.I.42051)、靛蓝(C.I.73015)、叶绿酸(C.I.75810)、喹啉黄(C.I.47005)、二氧化钛(C.I.77891)、阴丹士林蓝RS(C.I.69800)和茜草红(C.I.58000)。鲁米诺(Luminol)也可用作荧光染料。有利的着色颜料是例如二氧化钛、云母、铁氧化物(例如 Fe_2O_3 、 Fe_3O_4 、 $\text{FeO}(\text{OH})$)和/或氧化锡。有利的染料是例如胭脂红、柏林蓝、

氧化铬绿、群青和/或锰紫。

[0271] 制剂

[0272] 本发明的优选组合物选自用于治疗、防护、护理和清洁皮肤和/或毛发的产品或作为化妆产品,优选地,作为滞留(leave-on)产品(是指与洗去(rinse-off)产品相比,一种或多种式(I)的化合物停留在皮肤和/或毛发上持续更长的时间,从而使其保湿和/或抗老化和/或伤口治愈的促进作用更显著)。

[0273] 本发明的制剂优选以乳剂形式,例如W/O(油包水)、O/W(水包油)、W/O/W(水包油包水)、O/W/O(油包水包油)乳剂、PIT乳剂、皮克林(Pickering)乳剂、油含量低的乳剂、微米乳剂或纳米乳剂;溶液,例如在油(脂肪油或脂肪酸酯,特别是 C_6-C_{32} 脂肪酸 C_2-C_{30} 酯)或硅油、分散体、悬浮液、乳霜、乳液或奶液中的溶液,取决于制备方法和成分;凝胶(包括水凝胶、水分散凝胶、油凝胶);喷雾剂(例如泵喷雾剂或含有推进剂的喷雾剂)或用于擦拭化妆品的泡沫或浸渍溶液;洗涤剂,如肥皂、合成洗涤剂、洗涤液、淋浴和沐浴制剂、沐浴产品(胶囊、油剂、片剂、盐、浴盐、肥皂等);泡腾制剂、皮肤护理产品,如乳剂(如上所述)、软膏剂、糊剂、凝胶(如上所述)、油、香油、乳清、粉末(如擦脸粉、身体粉)、面膜、眉笔、唇膏、走珠、泵剂、气雾剂(发泡、非发泡或后发泡)、除臭剂和/或止汗剂、漱口水和口腔清洗剂、足部护理产品(包括去角质、除臭剂)、驱虫剂、防晒霜、晒后用品、剃须产品、须后膏、剃须前和剃须后洗剂、脱毛剂、头发护理产品,如洗发香波(包括2合1香波,去屑香波,婴儿香波,干性发质香波,浓缩香波)、护发素、生发油、生发水、染发液、造型膏、润发油、烫发和卷发药水、发胶、定型助剂(如凝胶或蜡)、头发光滑剂(护发剂、松弛剂)、染发剂如短时直接染发剂、半永久性染发剂、永久性染发、护发素、护发摩丝、眼睛护理产品、化妆、卸妆或婴儿产品。

[0274] 本发明的制剂尤其优选以乳剂形式,特别是W/O、O/W、W/O/W、O/W/O乳剂形式、PIT乳剂、皮克林乳剂、油含量低的乳剂、微米乳剂或纳米乳剂、凝胶(包括水凝胶、水分散凝胶、油凝胶)、溶液,例如在油(脂肪油或脂肪酸酯,特别是 C_6-C_{32} 脂肪酸 C_2-C_{30} 酯)或硅油中的溶液、或喷雾剂(例如泵喷雾剂或具有推进剂的喷雾剂)。

[0275] 辅助物质和添加剂的含量为5至99重量%,优选10至80重量%,基于制剂总量计。本领域技术人员容易根据特定产品的性质通过简单试凑法确定在各情况下所使用的化妆品或护肤用品助剂和添加剂以及芳香剂的量。

[0276] 所述制剂还可含有至多99重量%,优选地,5至80重量%的水,基于制剂总量计。

[0277] 口服组合物

[0278] 本发明的另一个主题涉及含有如上所述的TRPV1/TRPV3调节剂和烷二醇混合物的口服组合物,优选以适用于影响在人类皮肤或粘膜上的温暖感受的用量,如0.01至约5重量%,优选0.1至2重量%,并且更优选约0.2至约1重量%,基于最终组合物计。

[0279] 适当口服组合物的典型实例包括(硬高温熬制)糖果、压制片剂、口香糖、牙膏和漱口水。所述口服组合物的制备和组成如下记载:

[0280] 糖果

[0281] 根据本发明,优选的糖果是所谓的硬高温熬制糖果。其底物通常由保持在无定形或玻璃质状态下的糖和其他碳水化合物的混合物制备。这种形式可以被认为是通常含有至多约4.5重量%水分的糖类的固态糖浆,基于糖底物的重量计,其中优选约0.5至约2.5重量%,并且最优选约1.0至约1.5重量%。这类材料通常含有至多约65重量%玉米糖浆,至多

80重量%的糖和0.1至5.0重量%的水。通常,糖(或其他适用于糖果配方的甜味剂)与玉米糖浆之间的比例在约70:25至约45:55的范围内,优选约60:40。糖浆成分通常由高果糖玉米糖浆制备,但也可以包括其他材料。也可以加入其他成分,如香料、甜味剂、酸化剂、色素等。

[0282] 硬高温熬制糖果底物也可以由非发酵糖类如山梨糖醇,甘露醇,木糖醇,麦芽糖醇,氢化淀粉水解产物,氢化玉米糖浆及其混合物制备。糖果底物可以含有至多约95重量%山梨糖醇、山梨糖醇和甘露醇比例为约9.5至0.5,至多约7.5至2.5的混合物,和糖浆成分至多为约55%的氢化玉米糖浆。

[0283] 压制片剂

[0284] 根据本发明口服制剂是压制片剂,通常含有约0.1至约0.6重量%,并且优选约0.5重量%的液态香料。

[0285] 口香糖

[0286] 口香糖通常由水不溶性底物成分、水溶性成分和提供例如特定香味的添加剂构成。

[0287] 水不溶性底物,其也被称为“胶基”,通常含有天然或合成弹性体、树脂、脂肪和油体、塑化剂、填料、软化剂、染料和任选蜡。底物在总制剂中的比例通常为5至95重量%,优选10至50重量%并且特别是20至35重量%。在本发明的典型实施方案中底物由20至60重量%的合成弹性体、0至30重量%的天然弹性体、5至55重量%的塑化剂、4至35重量%的填料以及少量添加剂如染料、抗氧化剂等构成,前提是少量的它们在所有情况下是水溶性。

[0288] 适当的合成弹性体是例如平均分子量(根据GPC)为10000至100000,并且优选50000至80000的聚异丁烯,异丁烯/异戊二烯共聚物(“丁基弹性体”)、苯乙烯/丁二烯共聚物(苯乙烯:丁二烯比例如1:3至3:1)、平均分子量(根据GPC)为2000至90000,并且优选10000至65000的聚乙烯乙酸酯、聚异戊二烯、聚乙烯、乙酸乙烯酯/月桂酸乙烯酯共聚物及其混合物。适当的天然弹性体实例是橡胶,例如烟熏乳胶或液态乳胶或银胶菊以及天然橡胶如节路顿胶(jelutong)、lechi caspi、派里罗胶(perillo)、香豆果胶(sorva)、二齿铁线子木胶(massaranduba balata)、巧克力铁线子木胶(massaranduba chocolate)、红檀木胶(nispero)、柔星丁哈胶(rosindinha)、糖胶树胶、古塔胶(gutta hang kang)及其混合物。合成和天然弹性体的选择及其混合比例主要根据口香糖是否会产生气泡(“泡泡糖”)。优选使用含有节路顿胶、chicle、香豆果胶和铁线子木胶的弹性体混合物。

[0289] 在大多数情况下,弹性体太硬或缺少塑性进行令人满意的加工,因此已经发现有利的是使用特定的塑化剂,其当然必须特别满足允许作为食品添加剂的所有要求。在这方面特别适当的是树脂酸的酯,例如低脂肪醇或多元醇与完全或部分硬化的单体或低聚树脂酸的酯。为此特别使用甲基、甘油或季戊四醇酯或其混合物。或者,也可以使用萜烯树脂,其源自 α -蒎烯、 β -蒎烯、 δ -柠檬烯或其混合物。

[0290] 适当的填料或增稠剂是碳酸镁或碳酸钙、磨碎的泡沫岩、硅酸盐,特别是硅酸镁或硅酸铝、黏土、氧化铝、滑石粉、二氧化钛、磷酸单钙、二钙和三钙以及纤维素聚合物。

[0291] 适当的软化剂或乳化剂是牛脂、硬化牛脂、硬化或部分硬化植物油、可可脂、偏甘油酯、卵磷脂、三醋精和含有6至22,优选12至18个碳原子的饱和或未饱和脂肪酸,及其混合物。

[0292] 适当的染料和漂白剂的是例如允许用于食物调色的FD和C型植物和水果提取物以

及二氧化钛。胶基可以含有蜡或不含蜡。

[0293] 除了水不溶性胶基,口香糖组合物通常含有水溶性成分,其例如由软化剂、甜味剂、填料、味觉物质、味道增强剂、乳化剂、染料、酸化剂、抗氧化剂等构成,前提是这些成分具备至少充分的水溶性。根据特定代表物质的水溶性,单一成分可以属于水不溶相或者水溶性相。然而,也可以使用例如水溶性乳化剂和水不溶性乳化剂的结合,其中单一代表物质位于不同相。通常,水不溶成分构成制剂的5至95重量%,并且优选约20至80重量%。

[0294] 将水溶性软化剂或塑化剂加入口香糖组合物用于改善咀嚼性和咀嚼感受,并且在混合物中用量通常为0.5至15重量%。典型实例是甘油、卵磷脂以及山梨糖醇、硬化淀粉水解物或玉米糖浆的水溶液。

[0295] 特别地,为了生产低卡路里口香糖,适当的填料选自聚葡萄糖、低聚果糖(raftilose)、菊粉(raftilin)、寡聚果糖(NutraFlora)、帕拉金寡糖(palatinose oligosaccharides)、瓜尔胶水解产物(sunFiber)和糊精。

[0296] 此外口香糖可以含有其他适用于牙齿护理,尤其是适用于抵抗牙斑和牙龈炎的助剂和添加剂,如洗必泰、CPC或三氯生。也可以含有pH调节剂(例如缓冲剂或尿素)、抗龋齿活性物质(例如磷酸盐或氟化物)、生物活性成分(抗体、酶、咖啡因、植物提取物),只要这些物质允许用于食物,并且不会以不想要的方式相互反应。

[0297] 牙膏和漱口水

[0298] 牙膏通常是指水、增稠剂、保湿剂、研磨剂或抛光剂、表面活性剂、甜味剂、香料、除臭剂和抵抗口腔和牙齿疾病的活性制剂的类糊制剂。在本发明的牙膏中,可以使用任何常规的抛光剂,如白垩,磷酸二钙,不溶性偏磷酸钠,硅酸铝,焦磷酸钙,细颗粒合成树脂,二氧化硅,氧化铝和三水合氧化铝。特别适用于本发明牙膏的抛光剂是细颗粒干凝胶二氧化硅,水凝胶二氧化硅,沉淀二氧化硅,三水合氧化铝和细颗粒 α -氧化铝,或这些抛光剂的混合物。这种抛光剂的用量优选为牙膏重量的约15-40重量%。用于本发明牙膏的优选保湿剂包括用量至多为约牙膏50%重量的低分子量聚乙二醇,甘油,山梨糖醇或其混合物。用于本发明牙膏的已知增稠剂中,特别优选的是增稠的,细颗粒状的凝胶二氧化硅和非离子水胶体,例如羟乙基纤维素,羟丙基瓜尔胶,羟乙基淀粉,聚乙烯吡咯烷酮,高分子量聚乙二醇和植物胶,如黄蓍胶,琼脂,角叉菜苔,阿拉伯树胶和黄原胶。通过添加组分(a)和/或(b)和任选的(c),可以获得本发明制剂所需的风味和香味。同样有利的是向口服制剂加入例如碱金属氟化物、碱金属单氟磷酸盐或有机磷酸的碱金属盐形式的龋齿抑制剂。此外,根据本发明的口服制剂可以含有其他标准助剂,如染料、防腐剂和遮光剂,例如二氧化钛。对于漱口水,根据本发明的口服制剂可与含有各种量的醚油,乳化剂,收敛剂和调理药物提取物,龋齿抑制添加剂和调味剂的水-醇溶液混合。

[0299] 添加剂

[0300] 根据本发明的口服制剂可以包括额外的添加剂作为例如甜味剂或维生素,用量为约0.1至约10重量%。这些添加剂也可以是相应药物的成分。

[0301] 甜味剂

[0302] 适当的甜味物质,包括以下这些物质的天然来源(成分e5),例如甜味碳水化合物或糖类(例如蔗糖)、海藻糖、乳糖、麦芽糖、melizitose、棉子糖、帕拉金糖、乳果糖、D-果糖、D-葡萄糖、D-半乳糖、L-鼠李糖、D-sorbose、D-甘露糖、D-塔格糖、D-阿拉伯糖、L-阿拉伯糖、

D-核糖、D-甘油醛、麦芽糖糊精)或主要含有这些碳水化合物的植物制剂(例如来自甜菜(Beta vulgaris ssp.、糖分、糖浆、糖蜜、来自甘蔗(Saccharum officinarum ssp.、例如糖蜜、糖浆),来自枫糖(Acer ssp.),来自龙舌兰(龙舌兰浓汁),淀粉或蔗糖的合成/酶水解产物(例如转化糖浆,玉米淀粉制成的高浓缩果糖)、水果浓缩物(例如源自苹果或梨、苹果糖浆、梨糖浆)、糖醇(例如赤藓糖醇、苏糖醇、阿拉伯糖醇、核糖醇、木糖醇、山梨糖醇、甘露醇、卫矛醇、乳糖醇)、蛋白质(例如非洲奇果蛋白、莫耐林甜蛋白、甜味蛋白、仙茅甜蛋白、brazzein)、甜味剂(magap、环己基氨基磺酸钠、乙酰磺胺酸钾、新橙皮苷二氢查耳酮、糖精钠、阿斯巴甜®、超阿斯巴甜、纽甜、阿力甜(Alitam)、三氯蔗糖(Sucralose)、甜菊苷、瑞鲍迪甙、lugduname、carrelame、sucrononate、sucrooctate、monatin、叶甜素)、某些甜味道氨基酸(甘氨酸、D-亮氨酸、D-苏氨酸、D-天门冬氨酸、D-苯丙氨酸、D-色氨酸、L-脯氨酸),其他甜味道小分子物质(例如糖苷元(hernandulcin)、二氢查耳酮糖苷(dihydrochalconeglycosides)、甘草甜素(glycyrrhizin)、甘草甜酸铵盐或其他甘草甜酸衍生物、甘草提取物(Glycyrrhizza glabra ssp.)、Lippia dulcis提取物、Momordica ssp.提取物或单一物质(特别是Momordica grosvenori[罗汉果]以及由其得到的罗汉果甜甙)、Hydrangea dulcis或Stevia ssp.(例如甜叶菊)提取物或单一物质。

[0303] 维生素

[0304] 在本发明的另一个实施方案中,组合物可以含有维生素(成分e1)。维生素具备不同的生物化学功能。一些具备类激素功能作为矿物质代谢调节剂(例如维生素D)或细胞和组织生长和分化调节剂(例如维生素A的一些形式)。其他用作抗氧化剂(例如维生素E和有时的维生素C)。大部分维生素(例如B族复合维生素)作为酶辅助因子的前体,帮助酶作为新陈代谢的催化剂。在这个角色中,维生素可能与酶紧密结合,作为假体组的一部分:例如,生物素是参与制造脂肪酸的酶的一部分。维生素也可能与酶不紧密结合,作为辅酶,用作在分子之间携带化学基团或电子的可分离分子。例如,叶酸在细胞中携带各种形式的碳基团-甲基,甲酰基和亚甲基。虽然这些辅助酶-底物反应的作用是维生素最著名的功能,其他维生素功能同样重要。在本发明中适当的维生素选自组包括

[0305] • 维生素A(视黄醇,视黄醛,β-胡萝卜素),

[0306] • 维生素B₁(硫胺素),

[0307] • 维生素B₂(核黄素),

[0308] • 维生素B₃(烟酸,烟酰胺),

[0309] • 维生素B₅(泛酸),

[0310] • 维生素B₆(吡哆醇,吡哆胺,吡哆醛),

[0311] • 维生素B₇(生物素),

[0312] • 维生素B₉(叶酸,亚叶酸),

[0313] • 维生素B₁₂(氰钴胺,羟钴胺,甲基钴胺),

[0314] • 维生素C(抗坏血酸),

[0315] • 维生素D(胆钙化醇),

[0316] • 维生素E(生育酚,三烯生育酚),和

[0317] • 维生素K(叶绿醌,甲萘醌)。

[0318] 优选的维生素是抗坏血酸和生育酚。所述维生素在食物组合物中的含量为约0.1

至约5重量%，并且优选约0.5至约1重量%。

[0319] 工业应用性

[0320] 本发明的另一个主题涉及一种用于改善TRPV1和/或TRPV3调节剂温暖感受和/或皮肤病相容性的方法，包括以下步骤

[0321] (a) 提供至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂；

[0322] (b) 将所述至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂与至少一种含有5至12个碳原子的1,2-丙二醇混合；

[0323] (c) 任选地将步骤(b)的混合物加入化妆品制剂，以及

[0324] (d) 将步骤(b)的混合物或步骤(c)的制剂施用至人类皮肤或粘膜。

[0325] 本发明的另一个主题包括含有或由以下成分

[0326] (a) 至少一种TRPV1和/或TRPV3调节剂和

[0327] (b) 至少一种含有5至12个碳原子的1,2-丙二醇混合

[0328] 构成的组合物用于同时改善在人类皮肤和粘膜上的温暖感受和皮肤病相容性的用途。

[0329] 最后，本发明也涉及含有6至12个碳原子的1,2-丙二醇用于同时改善TRPV1和/或TRPV3调节剂被施用至人类皮肤和粘膜上时的温暖感受和皮肤病相容性的用途。

[0330] 应当注意的是上述选择的优选种类和优选范围也适用于所述方法和用途。因此不必重复。在下文中本发明通过一些工作和制剂实施例说明，但并不限于此。

实施例

[0331] 实施例1和2，对比实施例C1和C2

[0332] 小组测试1

[0333] 温暖感受的测定由一组16名未受训志愿者进行。将0.2g标准乳霜制剂样本涂于所有志愿者前臂(约55cm², 50圈) 20分钟。使用以下标准评估感受：(-1) = 凉爽；(0) = 没有感觉；(1) = 轻微温暖；(2) = 温暖；(3) = 非常温暖；(4) = 灼烧。结果总结于表1。所有数据为平均值。Δ代表标准方差。

[0334] 实施例1和2为根据本发明并且涉及分别含有0.4重量%的香草醇丁醚(VBE)+0.8重量% 1,2-辛二醇(Hydrolite®8)和0.4重量%香草醇丁醚+0.6重量% 1,2-己二醇/1,2-辛二醇(1:1)(SymDiol®68)的乳霜。

[0335] 对比实施例C1和C2涉及不含暖化剂的第一安慰组合物和含有0.4重量%的香草醇丁醚但没有丙二醇的第二组合物。

[0336] 表1

[0337] 温暖感受

[0338]

时间 [分钟]	C1		C2		1		2	
	平均值	Δ	平均值	Δ	平均值	Δ	平均值	Δ
0.5	-0,938	0,250	-0,800	0,561	-0,938	0,250	-0,813	0,403
2	-0,813	0,403	-0,333	0,816	-0,438	0,964	-0,375	0,806
5	-0,143	0,403	0,733	1,033	1,714	1,223	1,063	1,124
10	-0,063	0,250	1,933	1,223	2,031	0,865	2,219	1,080
15	-0,063	0,250	1,733	1,163	1,938	0,873	1,938	0,929
20	0,000	0,365	1,433	0,990	1,500	0,730	1,438	0,814

[0339] 由表1可知,向香草醇丁醚加入烷二醇导致整个20分钟内改善的温暖感受。图1示出温暖感受随时间变化的结果。

[0340] 实施例3和4,对比实施例C3和C4

[0341] 小组测试2

[0342] 使用另一种标准乳霜制剂重复上述小组测试。结果示于表2。所有数据为平均值。

[0343] 实施例3和4为根据本发明并且涉及分别含有0.4重量%的香草醇丁醚(VBE)+0.6重量%1,2-辛二醇(Hydrolite®8)和0.4重量%香草醇丁醚+0.6重量%1,2-己二醇/1,2-辛二醇(1:1)(SymDiol®68)的乳霜。

[0344] 对比实施例C3和C4涉及不含暖化剂的第一安慰组合物和含有0.4重量%的香草醇丁醚但没有烷二醇的第二组合物。

[0345] 表2

[0346] 温暖感受

[0347]

时间 [分钟]	C3		C4		3		4	
	平均值	Δ	平均值	Δ	平均值	Δ	平均值	Δ
0.5	-0,882	0,332	-0,824	0,529	-1,000	0,000	-0,882	0,332
2	-0,765	0,437	-0,471	0,717	0,059	1,298	-0,765	0,437
5	0,000	0,500	0,971	1,256	2,313	1,105	1,647	1,367
10	0,000	0,000	1,971	1,205	2,765	1,033	2,353	1,272
15	0,118	0,485	1,853	1,057	2,059	0,966	2,118	0,993
20	0,059	0,243	1,588	1,176	1,882	1,269	1,647	0,996

[0348] 由表2可知,向香草醇丁醚加入烷二醇导致整个20分钟改善的温暖感受。图2示出温暖感受随时间变化的结果。

[0349] 实施例5至8,对比实施例C5至C8

[0350] 除了评估温暖感受,小组表决样品是否导致不想要的副作用,如灼烧、瘙痒等。组合物对应于上述实施例。结果示于表3。给出的是指出在其皮肤上有所述不良效果的小组成员百分比。

[0351] 表3

[0352] 在皮肤上的不良副作用

[0353]

时间[分钟]	C1	C2	1	2	C3	C4	3	4
0.5	0	0	0	0	6	0	0	0
2	0	0	0	0	6	6	0	0
5	0	6	6	6	6	6	6	6
10	0	20	20	13	6	18	16	16

[0354]

15	0	33	25	13	0	24	21	21
20	0	27	13	19	0	29	25	18

[0355] 如上所见,向VEB加入1,2-烷二醇导致不良副作用的显著降低。结果也示于图3和4。

[0356] TREK受体筛查

[0357] 人类TREK-1受体是温度敏感、机械门控钾通道,存在于人类皮肤和神经细胞中。已知其参与温度感受的信号发出。其在相关细胞中与其他离子通道合作。文献指出TREK-1受体的阻塞将导致TRP-通道活化更高效。

[0358] 为了筛查TREK-1受体阻断剂,转染青蛙卵母细胞以瞬时过表达人类TREK-1受体。在细胞上筛查物质数据库。读出手动膜片钳测出的TREK-1介导电流。结果示于下表4。

[0359] 表4

[0360] 1mM下TREK-1受体的阻塞

[0361]

化合物	F.I.	S.E.M.	试验数量
无	1.000		
对比样(氟西汀)	0.679	0.042	3
1,2-十二烷二醇	0.733	0.027	4
1,2-癸二醇	0.773	0.014	3
1,2-辛二醇	0.855	0.014	3
1,2-己二醇	0.942	0.022	3

[0362] 结果清楚指出1,2烷二醇能够在阳性对比物(氟西汀)的范围内抑制TREK-1介导的电流。

[0363] 制剂实施例

[0364] 本发明通过以下实施例进一步说明。

[0365] 表5

[0366] O/W乳液(用量以重量%计)

[0367]

成分	用量
石蜡油	5.00
棕榈酸异丙酯	5.00
鲸蜡醇	2.00
蜂蜡	2.00
鲸蜡硬脂醇聚醚-20	2.00
PEG-20-甘油硬脂酸酯	1.50

甘油	3.00
芳香油	0.30
羟苯甲酯	0.30
香草醇丁醚	0.30
1,2-辛二醇	0.30
水	加至100.00

[0368] 表6

[0369] 身体乳液(用量以重量%计)

成分	用量
鲸蜡硬脂醇	2.00
异壬酸乙基己酯	5.00
鲸蜡硬脂醇乙基己酸酯. 肉豆蔻酸异丙酯	3.00
甘油油酸酯柠檬酸酯. 辛酸/癸酸甘油三酯	4.00
水	79.50
卡波姆	0.30
苯甲酸钠	0.100
丙二醇	5.00
氢氧化钠 30% 溶液	0.30

[0370]

[0371]

芳香油	0.30
三甘醇. 咪唑烷基脲. 羟苯甲酯. 羟苯丙酯. 脱氢乙酸	0.30
香草醇丁醚	0.10
1,2-辛二醇	0.10

[0372] 表7

[0373] 乳霜(用量以重量%计)

[0374]

成分	用量
石蜡油	10.00
地蜡	4.00
凡士林	4.00
植物油	10.00
羊毛蜡醇	2.00
硬脂酸铝	0.40
芳香油P1.P2.P3或P4	0.70
1,2-戊二醇	2.00
苯氧乙醇	0.50
香草醇丁醚	0.25
1,2-辛二醇	0,25

水	加至100.00
---	----------

[0375] 表8

[0376] 乳霜(用量以重量%计)

[0377]

成分	INCI	用量
Dracorin® CE	甘油硬脂酸酯柠檬酸酯	1.00
Lanette® O	鲸蜡硬脂醇	2.00
Cutina® GMS-V	甘油硬脂酸酯	1.00
Tegosoft® MM	肉豆蔻醇肉豆蔻酸酯	1.00
Xiameter® PMX-0246. Cyclosiloxane	环己硅氧烷 (和) 环五聚二甲基硅氧烷	0.50
Dragoxat® 89	异壬酸乙基己酯	2.00
PCL-Liquid 100	鲸蜡硬脂醇乙基己酸酯	4.00
中性油	辛酸/癸酸甘油三酯	4.00

[0378]

Carbopol® Ultrez 21	丙烯酸(酯)类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	0.20
Keltrol® CG-T	黄原胶	0.10
水	水	加至100
甘油 99.5 P.	甘油	3.00
丙二醇 -1.2 99 P GC	丙二醇	2.00
苯甲酸钠	苯甲酸钠	0.10
氢氧化钠 10% 溶液	氢氧化钠	0.50
芳香油	细料	0.30
Euxyl® K702	脱氢乙酸. 苯甲酸. 苯氧乙醇. 聚氨基丙基双胍. 乙基己基甘油	0.30
	香兰基戊醚	0.35
SymDiol® 68	1,2-己二醇 和 1,2-辛二醇	0.35

[0379] 表9

[0380] 足部凝胶霜(用量以重量%计)

[0381]

相	成分	INCI	用量
A	水	水	加至100
	Extrapone Lemongras	丙二醇, 水, PEG-40 氢化蓖麻油, Trdeceth-9, 柠檬香茅 (CYMBOPOGON CITRATUS) 叶油, 乳酸	0.50
	甘油	甘油	3.00
	Symdiol® 68	1,2 己二醇, 辛甘醇	0.80
		香草醇丁醚	0.40
B	Dracorin® GOC	甘油油酸酯柠檬酸酯, 辛酸/癸酸甘油三酯	0.30
	Dragoxat® 89	异壬酸乙基己酯	6.00
	中性油	辛酸/癸酸甘油三酯	4.00
	SymMollient S	鲸蜡硬脂醇壬酸酯	2.00
	乙醇	变性醇	20.00
	SymDeo® B 125	2-甲基-5-环己戊醇	0.50
	Frescolat® X-cool	薄荷乙酰氨基草酸盐	0.50
	SymRepair® 100	己基癸醇, 红没药醇, N-棕榈酰羟基脯氨酸 鲸蜡酯, 硬脂酸, 油菜 (BRASSICA CAMPESTRIS) 甾醇类	1.00

[0382]

C	Cosmedia® SP	聚丙烯酸钠	1.20
D	Tapioca Pure	木薯淀粉	1.00
E	氢氧化钠 10 %	氢氧化钠	0.65
	香料	香料	1.0

[0383] 表10

[0384] 温和头皮洗剂(用量以重量%计)

[0385]

相	成分	INCI	用量
A	Lanette® O	鲸蜡硬脂醇	5.00
	Emulsiphos®	鲸蜡醇磷酸酯钾, 氢化棕榈油甘油酯类	1.00
	SymMollient® S	鲸蜡硬脂醇壬酸酯	2.00
	SymSitive® 1609	戊二醇, 4-叔丁基环己醇	1.00
	Crinipan® AD	氯咪巴唑	0.40
B	水	水	加至100
	Jaguar® C-500	瓜儿胶羟丙基三甲基氯化铵	0.60
	Symdiol® 68	1,2 己二醇, 辛甘醇	0.80
		香草醇丁醚	0.50
C	Aristoflex® AVC	丙烯酰二甲基牛磺酸铵/VP 共聚物	0.50
D	SymCalmin®	戊二醇, 丁二醇, 羟苯基丙酰胺苯甲酸	0.10
E	Frescolat® Plus	乳酸甲酯, 乳酸薄荷酯	0.50
F	Hydroviton® Plus	水, 戊二醇, 甘油, 果糖, 脲, 柠檬酸, 氢氧化钠, 麦芽糖, PCA钠, 氯化钠, 乳酸钠, 海藻糖, 尿囊素, 透明质酸钠, 葡萄糖	1.00
G	芳香剂	香料	1.00
H	柠檬酸 10 % 溶液	水, 柠檬酸	0.20
I	Gotalene® 120 Black	聚乙烯	1.00

[0386] 表11

[0387] 须后修复(用量以重量%计)

[0388]

相	成分	INCI	用量
A	水	水	加至100
	Carbopol® Ultrez 21 聚合物	丙烯酸(酯)类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	0.60

[0389]

B	甘油	甘油	2.00
C	Biotive® L-精氨酸	精氨酸	0.50
D	乙醇	变性醇	10.00
E	Hydrolite® 5	戊二醇	5.00
		香草醇丁醚	0.60
	Frescolat® MGA	薄荷酮甘油缩酮	0.50
	Xiameter® PMX-345	环五聚二甲基硅氧烷, 环己硅氧烷	4.00
	SymRelief® 100	姜(ZINGIBER OFFICINALE)根提取物	0.10
F	Tapioca Pure	木薯淀粉	2.00
G	芳香剂	香料	1.00

[0390] 表12

[0391] 须后修复(用量以重量%计)

[0392]

Phase	成分	INCI	用量
A	水	水	加至100
	Carbopol® Ultrez 21 聚合物	丙烯酸(酯)类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	0.45
B	氢氧化钠 10 % 溶液	氢氧化钠	0.40
C	SymGlucan®	水, 甘油, 1,2-己二醇, 辛甘醇, B-葡聚糖	5.00
		香草醇丁醚	0.30
	Aloe Vera Gel 浓缩物	库拉索芦荟 (ALOE BARBADENSIS) 叶汁	0.50
D	SymOcide® PH	苯氧乙醇, 羟基苯乙酮, 辛甘醇, 水	1.20
	SymRelief® 100	姜 (ZINGIBER OFFICINALE) 根提取物	0.10
	Dracorin® GOC	甘油油酸酯柠檬酸酯, 辛酸/癸酸甘油三酯	1.00
	Frescolat® ML Cryst.	乳酸薄荷酯	1.00
	芳香剂	香料	0.30
E	氢氧化钠 30 % 溶液	氢氧化钠	0.37

[0393] 表13

[0394] 丝质面膜(用量以重量%计)

[0395]

相	成分	INCI	用量
A	Dracorin® GOC	甘油油酸酯柠檬酸酯, 辛酸/癸酸甘油三酯	2.20

[0396]

	PCL-Liquide® 100	鲸蜡醇乙基己酸酯	3.00
	SymCalmin®	戊二醇, 丁二醇, 羟基苯基丙酰胺苯甲酸	1.00
		香草醇丁醚	0.30
	Frescolat® X-cool	薄荷乙酰氨基草酸盐	0.50
	芳香剂	香料	0.20
B	水	水	加至100
	Pemulen TR-2 Polymeric Emulsifier	丙烯酸(酯)类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	0.20
	SymOcide® PH	苯氧乙醇, 羟基苯乙酮, 辛甘醇, 水	1.30
	山梨酸钾	山梨酸钾	0.10
	Extrapone® Camomille GW	甘油, 水, 母菊 (CHAMOMILLA RECUTITA) 花提取物	0.50
C	氢氧化钠 10 % 溶液	氢氧化钠	0.45

[0397] 表14

[0398] 除臭滚珠(用量以重量%计)

[0399]

相	成分	INCI	用量
A	SymSitive® 1609	戊二醇, 4-叔丁基环己醇	1.20
	SymWhite® 377	苯乙基间苯二酚	0.30
	Arlacel 165	甘油硬脂酸酯, PEG-100硬脂酸酯	3.00
	Brij® 72	硬脂醇聚醚-2	0.30
	Brij® 721 P	硬脂醇聚醚-21	2.50
	Arlamol PS15	PPG15 硬脂基醚	2.00
	Lanette® O OR	鲸蜡硬脂醇	1.00
	Copherol® 1250	生育酚乙酸酯	0.50
B	水	水	加至100
	甘油	甘油	2.0
	EDTA NA 2	EDTA二钠	0.10
	SymTriol®	辛甘醇, 1,2-己二醇, 甲基苄醇	0.60
		香草醇丁醚	0.30
	Veegum HV	硅酸铝镁	1.00CC
C	水	水	3.00
	Covastyle MBS	焦亚硫酸钠	0.15

[0400]

D	Oxynex ST liquid	亚丁香基丙二酸二乙基己酯, 辛酸/癸酸甘油三酯	0.10
	SymDeo® B125	2-甲基-5-环己基戊醇	0.50
E	Extrapone® aquamarine GW	水, 甘油, 黄原胶, 海蓝宝石粉	0.50
G	芳香剂	香料	1.00

[0401] 表15

[0402] 身体洗剂(用量以重量%计)

[0403]

相	成分	INCI	用量
A	甜杏仁油	甜扁桃（PRUNUS AMYGDALUS DULCIS）油	20.00
	生育酚乙酸酯	生育酚乙酸酯	0.50
	中性油	辛酸/癩酸甘油三酯	8.00
	芳香剂	香料	1.50
	Caropol® ETD 2020	丙烯酸（酯）类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	1.10
B	Crodasinic® LS-30	月桂酰肌氨酸钠	35.00
	Protelan® AGL	月桂酰谷氨酸二钠	8.00
	Proteol® APL	椰油酰基苹果氨基酸钠	2.00
	SymOcide® PL	苯氧乙醇, 癩二醇, 1,2-己二醇	1.00
		香草醇丁醚	0.25
C	水	水	加至100
D	氢氧化钠 30 % 溶液	氢氧化钠	0.70
E	Hydroviton® Plus	水, 戊二醇, 甘油, 果糖, 脲, 柠檬酸, 氢氧化钠, 麦芽糖, PCA钠, 氯化钠, 乳酸钠, 海藻糖, 尿囊素, 透明质酸钠, 葡萄糖	4.00
	Extrapone® Lotus Flower	水, 丁二醇, 莲（NELUMBO NUCIFERA）花提取物	1.00
F	Lipo Luffa 30/100	丝瓜（LUFFA CYLINDRICA）果	1.00

[0404] 表16

[0405] 舒缓头皮洗发香波(用量以重量%计)

[0406]

相	成分	INCI	用量
A	水	水	加至100
	SymSave® H	羟基苯乙酮	0.50

[0407]

	Hydrolite® CG	辛甘醇	0.50
		香草醇丁醚	0.30
	Carbopol® Aqua SF-2 聚合物	丙烯酸(酯)类交联聚合物-4	7.00
	Texapon® NSO IS	月桂醇聚醚硫酸酯钠水	40.00
	氢氧化钠 10 % Sol.	氢氧化钠	0.50
B	Tego® Betain CK KB5	椰油酰胺丙基甜菜碱, 水, 氯化钠	7.00
	Ucare® Polymer JR 400	聚季铵盐-10	0.20
C	Euperlan® PK 4000	乙二醇二硬脂酸酯, 月桂醇聚醚-4, 椰油酰胺丙基甜菜碱	3.00
D	芳香剂	香料	1.00
E	Hydroviton® Plus	水, 戊二醇, 甘油, 果糖, 脲, 柠檬酸, 氢氧化钠, 麦芽糖, PCA钠, 氯化钠, 乳酸钠, 海藻糖, 尿囊素, 透明质酸钠, 葡萄糖	2.00
	甜杏仁油	甜扁桃 (PRUNUS AMYGDALUS DULCIS) 油	0,20
	Extrapone® Acacia Honey	丙二醇, Miel	0,20
	SymCalmin®	戊二醇, 丁二醇, 羟基苯基丙酰胺苯甲酸	0.10
F	柠檬酸 10 % 溶液	水, 柠檬酸	1.00
G	氯化钠	氯化钠	0.20

[0408] 表17

[0409] 须后凝胶(用量以重量%计)

[0410]

相	成分	INCI	用量
A	SymSol® PF-3	水, 戊二醇, 月桂醇磺基乙酸酯钠, 油酰基肌氨酸钠, 氯化钠, 磺基乙酸二钠, 油酸钠, 硫酸钠	3.00
	SymSitive® 1609	戊二醇, 4-叔丁基环己醇	1.00
	Frescolat® ML	乳酸薄荷酯	0.30
	芳香剂	香料	0.15
	甘油	甘油	5.00
B	水	水	加至100
	Pemulen® TR-2 Polymeric Emulsifier	丙烯酸(酯)类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	1.00
	Extrapone® Glacier Water GW	甘油, 水	1.00
	SymCalmin®	戊二醇, 丁二醇, 羟基苯基丙酰胺苯甲酸	0.50

[0411]

	Dragosine®	肌肽	0.10
	Hydrolite® 5	戊二醇	5.00
		香草醇丁醚	0.60
	氢氧化钠 10 % 溶液	氢氧化钠	3.15
C	乙醇	变性醇	10.00
	染料	染料	0.50

[0412] 表18

[0413] 除臭棒(用量以重量%计)

[0414]

相	成分	INCI	用量
A	Dragoxat® 89	异壬酸乙基己酯	1.00
	1,2 丙二醇	丙二醇	54.50
	硬脂酸钠	硬脂酸钠	8.00
	Hydrolite® 5	戊二醇	0.50
		香草醇丁醚	0.40
	甘油	甘油	20.00
	水	水	加至100
B	SymDeo® B 125	2-甲基 5-环己基戊醇	0.50
	芳香剂	香料	1.50

[0415] 表19

[0416] 护手和护体霜(用量以重量%计)

[0417]

成分	INCI	用量
Dracorin® GOC	甘油油酸酯柠檬酸酯, 辛酸/癸酸甘油三酯	2.00
PCL-Solid	硬脂醇庚酸酯, 硬脂醇辛酸酯	2.50
Lanette® O	鲸蜡硬脂醇	1.50
Cutina® GMS-V	甘油硬脂酸酯	1.00
Dragoxat® 89	异壬酸乙基己酯	3.00
PCL-Liquid 100	鲸蜡硬脂醇乙基己酸酯	7.00
Isodragol®	三异壬精	4.00
Xiameter® PMX-0345 Cyclosiloxane	环五聚二甲基硅氧烷 (和) 环己硅氧烷	0.50

[0418]

水	水(水)	加至100
Carbopol® Ultrez 21	丙烯酸(酯)类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	0.20
Keltrol® CG-RD	黄原胶	0.10
甘油 85 P.	甘油	3.00
DragoBetaGlucan	水(水). 丁二醇. 甘油. 燕麦(AVENA SATIVA)仁提取物	1.50
山梨酸钾	山梨酸钾	0.10
氢氧化钠 10% 溶液	氢氧化钠	0.50
芳香剂	香料	0.20
Euxyl® K300	羟苯甲酯. 羟苯丁酯. 羟苯乙酯. 羟苯丙酯. 羟苯异丁酯. 苯氧乙醇.	0.30
	香草醇丁醚	0.20
SymDiol® 68	1,2-己二醇 和 1,2-辛二醇	0.10

[0419] 表20

[0420] 面霜(用量以重量%计)

[0421]

成分	INCI	用量
Emulsiphos®	鲸蜡醇磷酸酯钾. 氢化棕榈油甘油酯类	1.50
Cutina® GMS-V	甘油硬脂酸酯	1.70
Lanette® O	鲸蜡硬脂醇	3.00
Tegosoft® MM	肉豆蔻醇肉豆蔻酸酯	1.00
PCL-Liquid 100	鲸蜡硬脂醇乙基己酸酯	1.00
Isodragol®	三异壬精	3.00
Dragoxat® 89	异壬酸乙基己酯	4.00
鳄梨油	鳄梨(PERSEA GRATISSIMA)油	3.00
Abil® 350	二甲基硅氧烷	0.50
Covi-ox® T-70	生育酚(维生素E)	0.10
Edeta® BD	EDTA二钠	0.10
Carbopol® Ultrez 21	丙烯酸(酯)类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	0.30
Keltrol® CG-RD	黄原胶	0.150
水	水(水)	加至100
甘油 99.5 P.	甘油	4.00

[0422]

丙二醇 -1.2 99 P GC	丙二醇	3.00
SymMatrix®	麦芽糊精, 黑莓 (RUBUS FRUTICOSUS) 叶提取物	0.50
氢氧化钠 10% 溶液	氢氧化钠	0.50
芳香油	香料	0.30
Euxyl® K712	苯甲酸钠, 山梨酸钾	0.20
	香草醇丁醚	0.25
SymDiol® 68	1,2-己二醇 和 1,2-辛二醇	0.35

[0423] 表21

[0424] 润湿护体霜 (用量以重量%计)

[0425]

成分	用量
PEG-7氢化蓖麻油	6.00
鲸蜡醇乙基己酸酯	10.00
肉豆蔻酸异丙酯	5.00
矿物油	7.00
牛油果树 (BUTYROSPERMUM PARKII) 果脂	0.50
硬脂酸铝	0.50
硬脂酸镁	0.50
红没药醇	0.20
Quaternium-18-Hectorit	0.70
二丙二醇	5.0
硫酸镁	0.70
戊二醇	4.00
芳香油	0.30
防腐剂 (苯氧乙醇)	0.20
辣椒素	0.20
1,2-庚二醇	0,20
软化水	加至100

[0426] 表22

[0427] 抗皱霜 (用量以重量%计)

[0428]

成分	用量
甘油硬脂酸酯柠檬酸酯	1.00
甘油月桂酸酯	1.00
鲸蜡硬脂醇 (和) 肉豆蔻醇肉豆蔻酸酯	3.00
鲸蜡硬脂醇乙基己酸酯	4.00
矿物油	4.00
环五聚二甲基硅氧烷, 环己硅氧烷	0.50
丙烯酸 (酯) 类/C10-30醇丙烯酸酯交联聚合物	0.20

水	加至100
1,2-己二醇	2.00
氢氧化钠10%溶液	0.10
水仙(NARCISSUS TAZETTA)鳞茎提取物	1.00
芳香油	0.30
防腐剂(苯氧乙醇)	0.50
香草醇丁醚	0.25
1,2-庚二醇	0.25

[0429] 表23

[0430] 用于除菌的功能性皮肤油(用量以重量%计)

[0431]

成分	INCI	用量
中性油	辛酸/癩酸甘油三酯	加至100
甜杏仁油	甜杏仁油	20.00
Dragoxat® 89	异壬酸乙基己酯	4.00
棕榈酸异丙酯	棕榈酸异丙酯	6.00
PCL-Liquid 100	鲸蜡硬脂醇乙基己酸酯	15.00
Dragosantol® 100	红没药醇	0.20
油中视黄醇乙酸酯(1 Mio. le/G)	视黄醇乙酸酯	0.50
生育酚乙酸酯	生育酚乙酸酯	0.50
Covi-ox® T-70	生育酚(维生素E)	0.10
芳香油	香料	0.30
防腐剂	羟苯甲酯. 羟苯丁酯. 羟苯乙酯. 羟苯丙酯	0.30
	辣椒素	0.20

[0432]

SymDiol® 68	1,2-己二醇 和 1,2-辛二醇	0.20
-------------	-------------------	------

[0433] 表24

[0434] 化脓性伤口霜(用量以重量%计)

[0435]

成分(INCI)	用量
山梨坦异硬脂酸酯. 氢化蓖麻油. 纯地蜡. 蜂蜡(白蜂蜡)	6.00
矿脂	21.00
白蜂蜡	5.00
鲸蜡硬脂醇	7.00
甜杏仁油	7.00
羊毛脂	5.00
液体石蜡	12.00
芳香油P1.P2.P3或P4	0.30
水(水)	加至100

泛醇	7.00
硫酸镁	0.70
戊二醇	1.00
生育酚乙酸酯	1.00
奥替尼啶二盐酸盐	0.10
苯氧乙醇	0.50
香草醇丁醚	0.25
1,2-辛二醇	0.25

[0436] 表25

[0437] 润湿和杀菌面膜(用量以重量%计)

成分	INCI	用量
水	水(水)	加至100
Stabileze QM	PVM / Ma 癸二烯交联聚合物	0.50
[0438] Biotive® L-精氨酸	精氨酸	0.75
Actipone® Laminaria Saccharina GW	甘油, 水(水), 糖海带(LAMINARIA SACCHARINA)提取物	1.00
Extrapone® Cucumber	水(水), 丙二醇, 黄瓜(CUCUMIS SATIVUS)汁	1.00

[0439]

甘油 99.5 P.	甘油	7.00
Neo Actipone® Soap Nutshell	无患子(SAPINDUS MUKUROSSI)果皮提取物	0.50
染料I	染料	0.01
Hydrolite® 5	戊二醇	5.00
Solubilizer	PEG-40 氢化蓖麻油, 十三醇聚醚-9, 水(水)	0.60
芳香油	香料	0.08
防腐剂	苯氧乙醇	0.40
	香草醇丁醚	0.20
SymDiol® 68	1,2-己二醇 和 1,2-辛二醇	0.20

[0440] 表26

[0441] 喷雾杀菌凝胶(用量以重量%计)

[0442]

成分	INCI	用量
水	水(水)	加至100
Stabileze QM	PVM / Ma 癸二烯交联聚合物	0.25
氢氧化钠 10% 溶液	氢氧化钠	0.40
纯咖啡因	咖啡因	0.50
Extrapone® Horse Chestnut	丙二醇, 水(水), 葡萄糖, 欧洲七叶树 (AESCULUS HIPPOCASTANUM) 籽提取物, 乳酸	1.00
Hydrolite® 5	戊二醇	3.00
1,3 丁二醇	丁二醇	5.00
Biotive® Esculin Sesquihydrate	马栗树皮苷	0.30
乙醇 96 %	变性醇	10.00
Solubilizer	PEG-40 氢化蓖麻油, 十三醇聚醚-9, 水(水)	0.50
芳香油	香料	0.20
奥替尼啶二盐酸盐		0.10
防腐剂	苯氧乙醇	0.70
	香草醇丁醚	0.20
SymDiol® 68	1,2-己二醇 和 1,2-辛二醇	0.10

[0443] 表27

[0444] 矿物质清洗凝胶(用量以重量%计)

[0445]

成分	INCI	用量
水	水(水)	加至100
Pionier® NP 37 G	卡波姆钠	1.50
SymSol® PF-3	水(水), 戊二醇, 月桂醇磺基乙酸酯钠, 油酰基肌氨酸钠, 氯化钠, 磺基乙酸二钠, 油酸钠, 硫酸钠	5.00
Hydroviton® 24	水(水), 戊二醇, 甘油, 乳酸钠, 乳酸, 丝氨酸, 脲, 山梨醇, 氯化钠, 尿囊素	1.00
Extrapone® Silk GW	水(水), 甘油, 水解蚕丝	1.00
Hydrolite® 5	1,2-庚二醇	4.00
Actipearls Red Star # DH10402/6	水(水), 丙二醇, 藻胶, 结冷胶, 黄原胶, 氯化钙, CI 12490 (染料红 5), 云母(CI 77019), 二氧化钛 (CI 77891)	1.00
芳香油	香料	0.50
3-苯基丙醇		0.70
	香兰基己醚	0.30

[0446] 表17

[0447] 抗痤疮洗剂(用量以重量%计)

[0448]

成分 (INCI)	用量
水 (水)	45.70
聚季铵盐-7	0.50
椰油酰胺丙基甜菜碱 9.000	9.00
椰油基葡萄糖2.000	2.00
聚山梨醇酯 80. 甘油. 草棉 (GOSSYPIUM HERBACEUM) 籽油. 水 (水)	1.00
十三醇聚醚-9. PEG-5 乙基己酸酯. 水 (水)	1.00
甘油聚醚-90硬脂酸酯. 月桂醇聚醚-2	0.50
月桂醇聚醚-12 硫酸酯钠37.000	37.00
甘油. 小麦 (TRITICUM VULGARE) 谷蛋白. 水 (水)	1.00
氯化钠	0.30
芳香油	1.00
苯氧乙醇. 羟苯甲酯. 羟苯乙酯. 羟苯丁酯. 羟苯丙酯. 羟苯异丁酯	0.30
香草醇丁醚	0.25

[0449]

1,2-辛二醇	0.25
---------	------

[0450] 表28

[0451] 化妆防晒组合物 (用量以重量%计)

[0452]

成分	用量
肉桂酸乙基己酯	7.50
二苯酮-3	2.00
聚甘油二聚大豆油酸酯	0.80
山梨坦硬脂酸酯	1.00
生育酚乙酸酯	0.50
甘油硬脂酸酯. PEG-100硬脂酸酯	3.00
PEG-40. 氢化蓖麻油	1.00
二氧化钛. 氧化铝水合物. 聚二甲基硅氧烷/聚甲基硅氧烷共聚物	3.00
牛油果树 (BUTYROSPERMUM PARKII) 果脂	1.00
苯甲酸C ₁₂₋₁₅ 烷酯	6.50
丁二醇	5.00
黄原胶	0.30
EDTA二钠	0.10
尿囊素	0.10
聚丙烯酰胺. C ₁₃₋₁₄ 异链烷烃. 月桂醇聚醚-7	1.00
戊二醇	5.00
4-叔丁基环己醇	1.00
芳香油	0.30

防腐剂(羟苯甲酯.羟苯丁酯.羟苯乙酯.羟苯丙酯.苯氧乙醇)	0.30
香草醇丁醚	0.35
1,2-庚二醇	0.25
软化水	加至100

[0453] 表29

[0454] 防晒喷雾(用量以重量%计)

[0455]

成分	INCI	用量
----	------	----

[0456]

软化水	水(水)	69.50
甘油	甘油	4.00
1.3 丁二醇	丁二醇	5.00
D-泛醇	泛醇	0.50
Lara Care A-200	半乳糖阿拉伯聚糖	0.25
Baysilone oil M 10	二甲基硅氧烷	1.00
Edeta BD	EDTA二钠	0.10
Copherol 1250	生育酚乙酸酯	0.50
Cetiol OE	二辛基醚	3.00
Neo Heliopan® HMS	胡莫柳酯	5.00
Neo Heliopan® AV	甲氧基肉桂酸乙基己酯	6.00
Neo Heliopan® 357	丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷	1.00
Corapan TQ	癸二甲酸二乙基己酯	2.00
Alpha 红没药醇	红没药醇	0.10
Pemulen TR-2	丙烯酸(酯)类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	0.25
NaOH. 10%	氢氧化钠	0.60
芳香油P1. P2. P3或 P4	香料	0.20
苯氧乙醇	苯氧乙醇	0.40
Solbrol M	羟苯甲酯	0.10
Solbrol P	羟苯丙酯	0.10
	香草醇丁醚	0.50
Hydrolite 5	1,2-庚二醇	0.25

[0457] 表30

[0458] 防晒喷雾O/W.SPE 15-20(用量以重量%计)

[0459]

成分	INCI	用量
Dracorin® GOC	甘油油酸酯柠檬酸酯. 辛酸/癸酸甘油三酯	2.00
Corapan® TQ	2,6-萘二甲酸二乙基己酯	3.00
Neo Heliopan® HMS	胡莫柳酯	7.00
Neo Heliopan® OS	水杨酸乙基己酯	5.00
Neo Heliopan® 357	丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷	3.00

[0460]

Isodipate	己二酸二异丙酯	6.00
Baysilone® Oil M10	二甲基硅氧烷	1.00
Edeta® BD	EDTA二钠	0.10
生育酚乙酸酯	生育酚乙酸酯	0.50
Dragosantol® 100	红没药醇	0.10
Pemulen® TR-2	丙烯酸（酯）类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	0.25
水	水(水)	加至100
甘油 99.5 P.	甘油	4.00
丁二醇	丁二醇	5.00
Neo Heliopan® Hydro (103089). 用作25%水溶液，用L-精氨酸中和	苯基苯并咪唑磺酸	8.00
Biotive® L-精氨酸	精氨酸	0.55
芳香油	香料	0.40
Sobrol M	羟苯甲酯	0.30
	香草醇丁醚	0.60
SymDiol® 68	1,2-己二醇 和 1,2-辛二醇	

[0461] 表31

[0462] 防晒软霜 (W/O) .SPF 40 (用量以重量%计)

[0463]

成分	INCI	用量
Dehymuls PGPH	聚甘油-2 二聚羟基硬脂酸酯	5.00
Copherol 1250	生育酚乙酸酯	0.50
Permulin 3220	地蜡	0.50
硬脂酸锌	硬脂酸锌	0.50
Tegosoft TN	C12-15 醇苯甲酸酯	10.00
Neo Heliopan® E1000	对甲氧基肉桂酸异戊酯	2.00
Neo Heliopan® 303	奥克立林	5.00
Neo Heliopan® MBC	4-甲基苄亚基樟脑	3.00
氧化锌, 中性	氧化锌	5.00
蒸馏水	水 (水)	加至100
EDETA BD	EDTA二钠	0.10

[0464]

甘油	甘油	4.00
硫酸镁	硫酸镁	0.50
芳香油	香料	0.30
SymDiol® 68	1,2 己二醇 (和) 1,2 辛二醇	0.30
	香草醇丁醚	0.30

[0465] 表32

[0466] 防晒乳(W/O) (用量以重量%计)

[0467]

成分	INCI	用量
Dehymuls PGPH	聚甘油-2 二聚羟基硬脂酸酯	3.00
蜂蜡 8100	蜂蜡	1.00
Monomuls 90-0-18	甘油油酸酯	1.00
硬脂酸锌	硬脂酸锌	1.00
Cetiol SN	鲸蜡硬脂醇异壬酸酯	5.00
Cetiol OE	二辛基醚	5.00
Tegosoft TN	C12-15 醇苯甲酸酯	4.00
维生素E	生育酚（维生素E）	0.50
Neo Heliopan® OS	水杨酸乙基己酯	5.00
Neo Heliopan® AV	甲氧基肉桂酸乙基己酯	7.50
Uvinul® T150	乙基己基三嗪酮	1.50
蒸馏水	水(水)	To 100
Trilon BD	EDTA二钠	0.10
甘油	甘油	5.00
Neo Heliopan® AP 10% 溶液. 用 NaOH中和	苯基二苯并咪唑四磺酸酯二钠	15.00
芳香油	香料	0.25
Alpha 红没药醇	红没药醇	0.10
SymOcide® PT	苯氧乙醇. 环庚三烯酚酮	0.25
SymDiol® 68	1,2 己二醇 (和) 1,2 辛二醇	0.10
	香草醇丁醚	0.15

[0468] 表33

[0469] 晒后凝胶(用量以重量%计)

[0470]

成分	INCI	用量
SymSol® PF-3	水 (水). 戊二醇. 月桂醇磺基乙酸酯钠. 油酰基肌氨酸钠. 氯化钠. 磺基乙酸二钠. 油酸钠. 硫酸钠	3.000
甘油 99.5 P.	甘油	5.000
SymHelios® 1031	亚苄基二甲氧基二甲基茛满酮	0.100
水	水 (水)	加至100
Pemulen® TR-2	丙烯酸 (酯) 类/C10-30 醇丙烯酸酯交联聚合物	1.000
D-泛醇 75 W	泛醇	0.500
SymFinity® 1298	紫松果菊 (ECHINACEA PURPUREA) 提取物	0.100
Extrapone® Pearl GW	水 (水). 甘油. 水解珍珠. 黄原胶	1.000
氢氧化钠 10% 溶液	氢氧化钠	2.500
乙醇 96 %	变性醇	15.000
芳香油	香料	0.20
SymOcide® PS	苯氧乙醇. 1,2-己二醇. 癸二醇	0.50
SymDiol® 68	1,2 己二醇 (和) 1,2 辛二醇	0.25
	香草醇丁醚	0.25

[0471] 表34

[0472] 晒后乳液 (用量以重量%计)

[0473]

成分	用量
丙烯酸酯/ C10-30烷基丙烯酸酯交联聚合物	0.4
鲸蜡硬脂醇乙基己酸酯	15.0
红没药醇	0.2
生育酚乙酸酯	1.0
泛醇	1.0
醇	15.0
甘油	3.0
芳香油	0.30

[0474]

1,2-己二醇	0.20
香草醇丁醚	0.10
戊二醇	4.0
软化水	加至100
三乙醇胺	0.2

[0475] 表35

[0476] 有机硅乳液(用量以重量%计)

[0477]	成分	用量
	鲸蜡醇磷酸酯钾.氢化棕榈油甘油酯类	1.00
	环己硅氧烷	4.00
	鲸蜡硬脂醇	1.50
	苯基聚三甲基硅氧烷	3.00
	硬脂醇庚酸酯.硬脂醇辛酸酯	3.00
	二甲基硅氧烷	1.00
	黄原胶	0.20
	P-甲氧基肉桂酸异戊酯	5.00
	水	加至100
	甲基丙二醇	3.00
	芳香油	0.30
	1,2-己二醇	0.25
	香草醇丁醚	0.25

[0478] 表36

[0479] 微乳凝胶(用量以重量%计)

	成分	用量
	甘油异硬脂酸酯	1.80
	乙基己基甘油	1.00
[0480]	鲸蜡硬脂醇聚醚-15	5.20
	PEG-150 二硬脂酸酯	1.00
	氢氯酸铝	5.00
	异十三醇异壬酸酯	3.30
	环聚二甲基硅氧烷	6.60
	芳香油	0.70
[0481]	1,2-己二醇	0.20
	香草醇丁醚	0.20
	水	加至100

[0482] 表37

[0483] 牙膏(用量以重量%计)

[0484]	成分	用量
	去离子水	加至100
	山梨醇70%	45.00
	磷酸三钾	0.10

糖精	0.20
单氟磷酸钠	1.14
PEG 1500	5.00
Sident9(磨料二氧化硅)	10.00
Sident 22 S(增稠二氧化硅)	8.00
羧甲基纤维素钠	1.10
氧化钛(IV)	0.50
去离子水	4.50
月桂基硫酸钠(SLS)	1.50
香料	1.00
Solbrol M(钠盐)(羟苯甲酯)	0.15
1,2-辛二醇	0.20
辣椒素	0.20

[0485] 表38

[0486] 含柠檬酸锌的牙膏(用量以重量%计)

成分	用量
去离子水	加至100
山梨醇 70%	45.00

[0487]

磷酸三钠	0.10
糖精	0.20
单氟磷酸钠	1.14
PEG 1500	5.00
Sident 9(磨料二氧化硅)	10.00
Sident 22 S(增稠二氧化硅)	8.00
羧甲基纤维素钠	1.10
柠檬酸锌	1.00
氧化钛(IV)	0.50
去离子水	4.50
月桂基硫酸钠(SLS)	1.50
香料	1.00
SymDiol® 68	0.25
Sanshool I+II	0.10

[0488]

[0489] 表39

[0490] 口腔清洗剂(用量以重量%计)

[0491]

成分	用量
乙醇	10.00
Cremophor CO 40 (PEG 40 氢化蓖麻油)	1.00
香料	0.25
去离子水	加至 100.00
山梨醇 70%	5.00
糖精钠 450	0.07
氟化钠	0.18
苯甲酸	0.12
SymDiol® 68	0.20
壬酸香兰基酰胺	0.10

[0492] 表40

[0493] 凝胶牙霜 (用量以重量%计)

[0494]

成分	用量
羧甲基纤维素钠	0.40
水中山梨醇 70 %.	72.00
聚乙二醇 (PEG) 1500	3.00
糖精钠	0.07
氟化钠	0.24
香料	1.00
磨料二氧化硅	11.00
增稠二氧化硅	6.00
十二烷基硫酸钠(SDS)	1.40
蒸馏水	加至100
对羟基苯甲酸 (PHB) 乙酯	0.15
SymDiol® 68	0.15
千日菊素	0.05

[0495] 表41

[0496] 抗牙斑牙膏 (用量以重量%计)

[0497]

成分	用量
卡拉胶	0.90
甘油	15.00
水中山梨醇 70 %.	25.00
PEG 1000	3.00
氟化钠	0.24
二磷酸四钾	4.50
二磷酸四钠	1.50
糖精钠	0.40
沉淀二氧化硅	20.00
二氧化钛	1.00
三氯生	0.30
薄荷香料 (含有 60 重量% l-香芹酮和 25 重量% l-薄荷醇)	1.00
十二烷基硫酸钠	1.30

[0498]

蒸馏水	加至100
苧醇	0.50
SymDiol® 68	0.15
香草醇丁醚	0.10

[0499] 表32

[0500] 敏感牙齿用牙膏 (用量以重量%计)

[0501]

成分	用量
羧甲基纤维素钠	0.70
黄原胶	0.50
甘油	15.00
水中山梨醇 70 %.	12.00
硝酸钾	5.00
单氟磷酸钠	0.80
糖精钠	0.20
香料	1.00
碳酸钙	35.00
二氧化硅	1.00
十二烷基硫酸钠(SDS)	1.50
PHB 甲酯 和 PHB 丙酯	0.20
SymDiol® 68	0.25
香草醇丁醚	0.25
蒸馏水	加至100

[0502] 表33

[0503] 牙膏和漱口水二合一产品(用量以重量%计)

[0504]

成分	用量
山梨醇	40.00
甘油	20.00
乙醇	5.00
水	加至100

[0505]

单氟磷酸钠	0.75
糖精	0.20
Sident 9 (磨料二氧化硅)	20.00
Sident 22 S (增稠二氧化硅)	2.00
羧甲基纤维素钠	0.30
十二烷基硫酸钠(SDS)	1.20
染料 (水中1% 悬浮液) C.I. 染料蓝 15	0.50
香料	0.90
羟苯甲. 钾盐 (羟苯甲酯. 钾盐)	0.20
Hydrolite® 5	0.15
香草醇丁醚	0.15

[0506] 表34

[0507] 含氟即用漱口水(用量以重量%计)

[0508]

成分	用量
乙醇	7.00
甘油	12.00
氟化钠	0.05
Pluronic F-127® (BASF. 表面活性物质)	1.40
磷酸铵缓冲液 pH 7.0	1.10
糖精钠	0.10
香料	0.15
葡萄糖酸氯己定	0.2
山梨酸	0.20
Hydrolite® 5	0.15
香草醇丁醚	0.15
蒸馏水	加至100

[0509] 表35

[0510] 无糖口香糖(用量以重量%计)

[0511]

成分	用量
口香糖胶基	30.00
山梨醇粉末	加至100
方辉玄质岩	9.50
木糖醇	2.00
甘露醇	3.00
阿斯巴甜	0.10
乙酰磺胺酸钾	0.10
乳化剂	0.30
水中山梨醇 70 %	14.00
甘油	1.00
香料	1.50
Hydrolite® 5	0.10
香草醇丁醚	0.10

[0512]

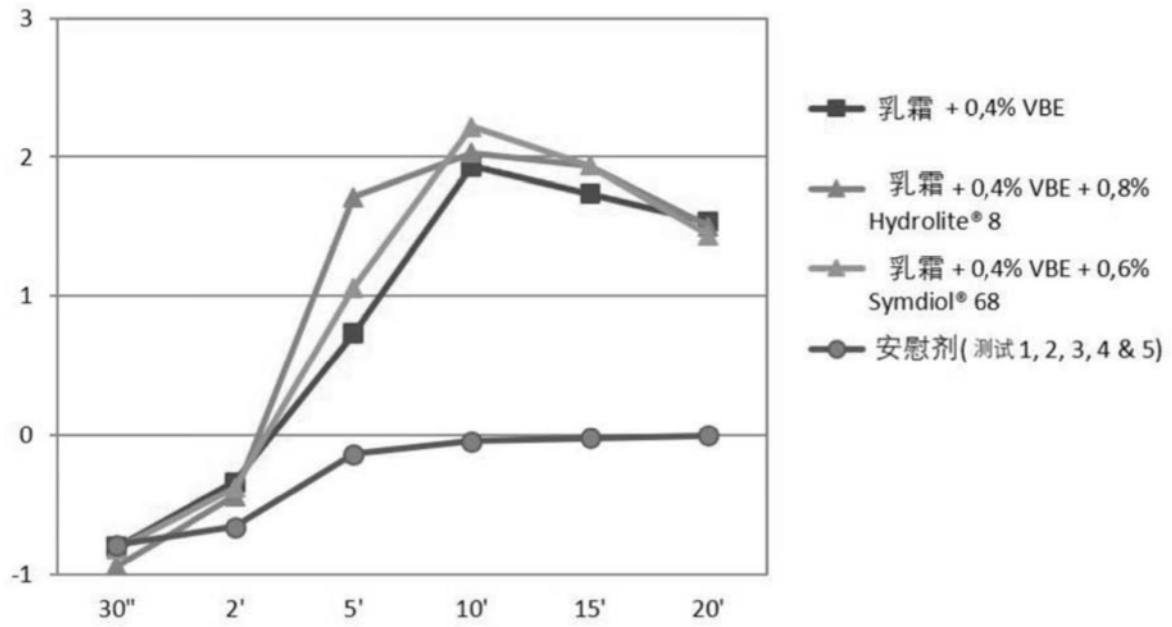


图1

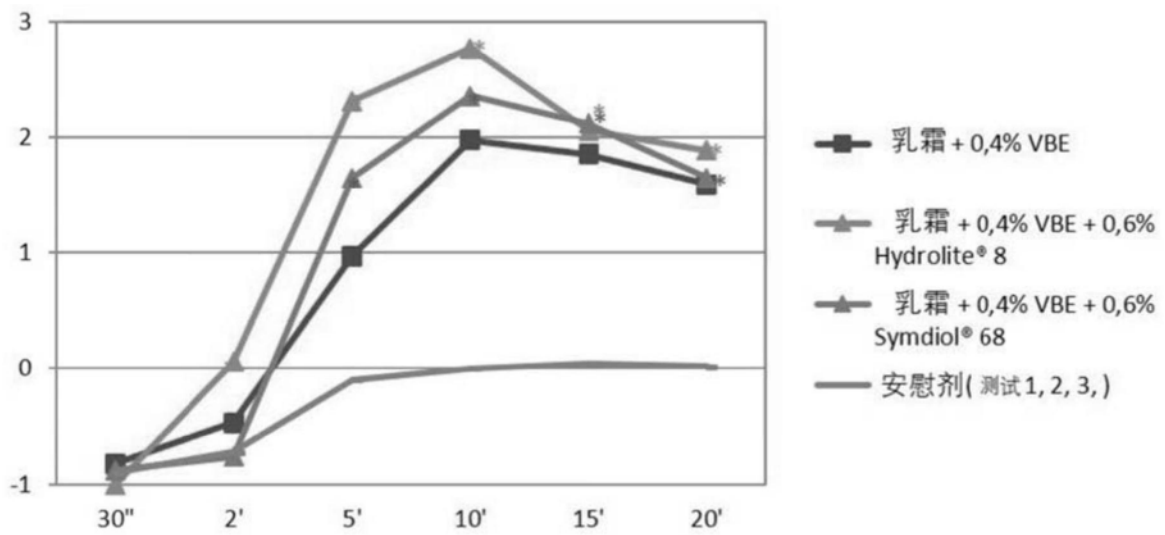


图2

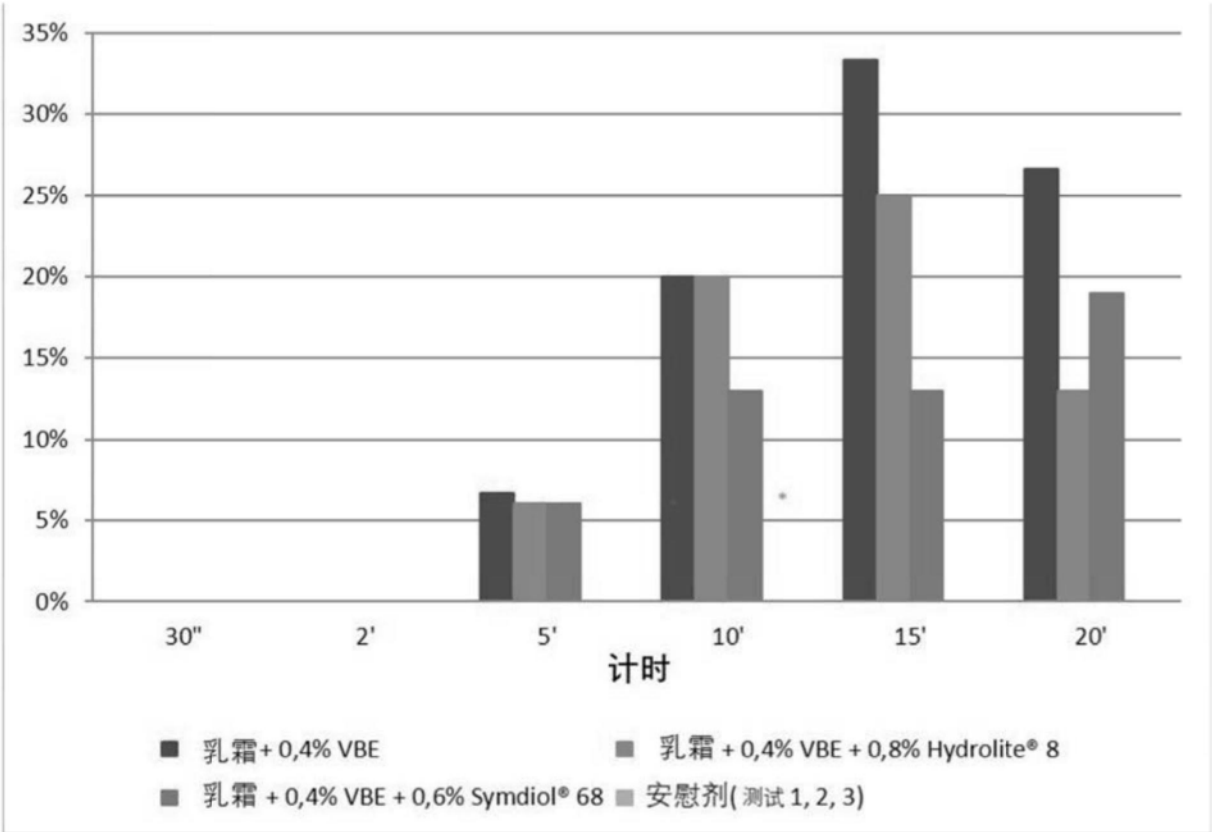


图3

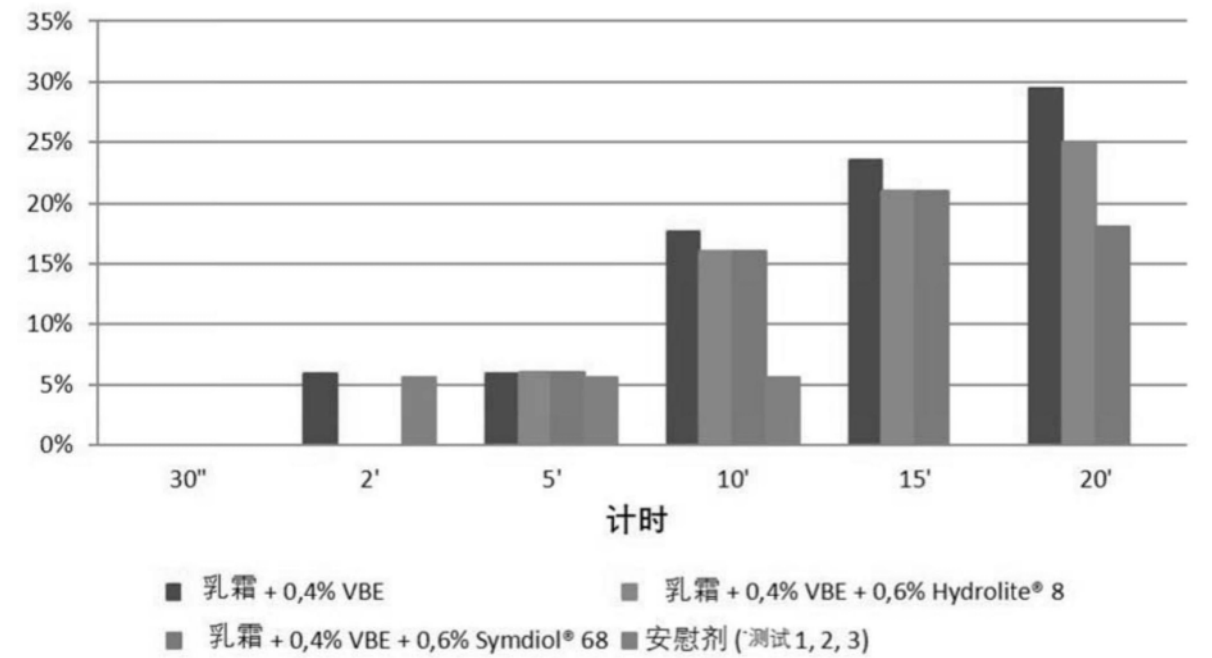


图4