[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200580037108.7

[51] Int. Cl.
A61K 8/49 (2006.01)
A61Q 17/04 (2006.01)
A61Q 5/02 (2006.01)
A61Q 19/10 (2006.01)
A61Q 5/06 (2006.01)
A61Q 19/00 (2006.01)

[43] 公开日 2007 年 10 月 3 日

[11] 公开号 CN 101048129A

[51] Int. Cl. (续)
A61Q 5/12 (2006.01)
[22] 申请日 2005.11.9
[21] 申请号 200580037108.7
[30] 优先权
[32] 2004.11.9 [33] DE [31] 102004054080.2
[86] 国际申请 PCT/EP2005/011990 2005.11.9
[87] 国际公布 WO2006/050929 英 2006.5.18
[85] 进入国家阶段日期 2007.4.27
[71] 申请人 宝洁公司
地址 美国俄亥俄州
[72] 发明人 简·鲍迈斯特 帕斯卡尔·杜古德 克努特·迈纳特
[74] 专利代理机构 北京市柳沈律师事务所
代理人 封新琴 巫肖南
权利要求书 3 页 说明书 28 页

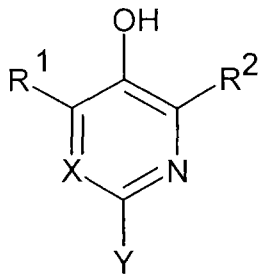
[54] 发明名称

包含 3 - 羟基吡啶和/或 5 - 羟基嘧啶的皮肤或毛发处理剂

[57] 摘要

本发明涉及用于对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理的试剂，所述试剂包含羟基吡啶或羟基嘧啶、或它们的混合物。

1. 一种具有通式 I 结构的化合物的应用，



(I),

其中 X 代表 N 或 C，R^1 代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基残基、苯基残基、C_{7-28} 苯基烷基残基，其中所述苯基烷基残基在所述苯环上可被氟、氯、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、CF_3、糠基或噻吩基取代，R^2 代表氢、C_{1-24} 烷基、苯基、C_{7-28} 苯基烷基，其中所述苯基烷基在所述苯环上可被氟、氯、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、CF_3、糠基或噻吩基取代，并且 Y 代表 NH_2、NHR^3 或 NR^3R^4，其中 R^3 和 R^4 彼此独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基，或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 羟基烷基，或 R^3 和 R^4 合在一起形成环，以使 Y 代表咪唑基或喹啉基、或吗啉基或吡唑基或哌啶基，或者 Y 代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷氧基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 羟基烷氧基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基羧酸基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基氨基甲酰基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基磺酸基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基磺酸酯基，或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基磺酰胺基，或者其中 R^3 与 X 合在一起形成具有 5 或 6 个原子的增环，或具有通式 I 结构的化合物的异构体或立体异构体形式，或具有通式 I 结构的上述化合物生理上相容的盐，或具有通式 I 结构的化合物的异构体或立体异构体形式，作为对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理的试剂组分。

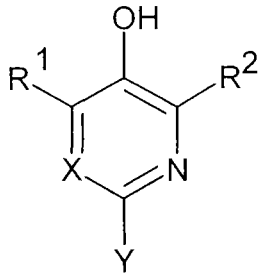
2. 如权利要求 1 所述的应用，其特征在于 R^1 和 R^2 各自彼此独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-6} 烷基残基。

3. 如权利要求 1 所述的应用，其特征在于 Y 代表 NH_2、NHR^3 或 NR^3R^4，其中 R^3 和 R^4 彼此独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-6} 烷基，或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-6} 羟基烷基。

4. 如权利要求 1 至 3 中任一项所述的应用，其特征在于 R^1 和 R^2 各自彼此独立地代表甲基或乙基残基。

5. 如权利要求 1 至 4 中任一项所述的应用，其特征在于所述试剂涉及一种护发剂、深层护发剂、深层护发霜、免洗型深层护发喷剂、含高度挥发性物质的毛发处理剂、毛发定型凝胶、毛发定型泡沫、毛发喷剂、光泽喷雾产品、定型润发油、烫发剂、用于烫发或染色处理后进行后护理的试剂、发蜡、洗发剂、沐浴露、防晒剂或毛发和躯体防晒喷剂。

6. 一种用于对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理的试剂，所述试剂包含至少一种液体载体、一种表面活性剂和一种具有通式 I 结构的化合物，



(I),

其中 X 代表 N 或 C，R^1 代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基残基、苯基残基、C_{7-28} 苯基烷基残基，其中所述苯基烷基残基在所述苯环上可被氟、氯、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、CF_3、糠基或噻吩基取代，R^2 代表氢、C_{1-24} 烷基、苯基、C_{7-28} 苯基烷基，其中所述苯基烷基残基在所述苯环上可被氟、氯、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、CF_3、糠基或噻吩基取代，并且 Y 代表 NH_2、NHR^3 或 NR^3R^4，其中 R^3 和 R^4 彼此独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基、或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 羟基烷基，或 R^3 和 R^4 合在一起形成环，以使 Y 代表咪唑基或喹啉基、或吗啉基或吡唑基或哌啶基，或者 Y 代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷氧基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 羟基烷氧基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基羧酸基，直链或支链的、饱和或

不饱和的 C_{1-24} 烷基氨基甲酰基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基磺酸基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基磺酸酯基，或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基磺酰胺基，或者其中 R^3 与 X 合在一起形成具有 5 或 6 个原子的增环，或它们中两种或多种的混合物，其中具有通式 I 结构的化合物的试剂的含量按重量计小于 10%。

7. 如权利要求 6 所述的试剂，其特征在于它以按重量计至少 30% 的量，包含水或沸点低于 120℃ 的醇作为液体载体。

8. 如权利要求 6 或 7 所述的试剂，其特征在于它包含至少一种阴离子表面活性剂或至少一种阳离子表面活性剂，或它们中两种或多种的混合物。

9. 如权利要求 6 至 8 所述的试剂，其特征在于它包含季铵化合物。

10. 如权利要求 6 至 9 所述的试剂，其特征在于它包含至少以下组分:

a) 按重量计 0.0001% 至 10% 的具有通式 I 结构的化合物

b) 按重量计 1% 至 99% 的水或沸点低于 120℃(248℉)的醇

c) 按重量计 0.1% 至 90% 的阴离子或阳离子表面活性剂

d) 按重量计至少 0.01% 的其它添加剂，所述添加剂选自由下列物质组成的组：非离子表面活性剂、两性离子表面活性剂、甜菜碱、非离子聚合物、聚硅氧烷、两性离子和两性聚合物、阴离子聚合物、增稠剂、结构化试剂、毛发调理化合物、香料油、溶剂和增溶剂、改善毛发的纤维结构的活性化合物、季铵、酰氨基胺、消泡剂、染料、活性去头皮屑化合物、光保护剂、用于调节 pH 值的物质、植物提取物、胆固醇、稠度调节剂、脂肪和蜡、螯合剂、溶胀和渗透物质、遮光剂、珠光剂、颜料、稳定剂、气溶胶推进剂或抗氧化剂。

11. 一种用于对皮肤或毛发进行非治疗性、预防性、调理性、去污性或美容性处理的方法，通过所述方法使皮肤或毛发与如权利要求 6 至 10 所述的试剂接触。

包含 3-羟基吡啶和/或 5-羟基嘧啶的皮肤或毛发处理剂

本发明涉及用于对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理的试剂，所述试剂包含羟基吡啶或羟基嘧啶、或它们的混合物。

人的体表，尤其是毛发，受到众多有害的影响。除了隐蔽性较高的结构损伤以外，这些影响还具有较明显或较不明显的视觉作用。

例如，即使受到正常（而绝不是过度）的日光照射，也会发生上述严重的毛发损伤，这显然削弱了毛发的魅力。尤其是当毛发潮湿时，毛发会由于光的作用而丧失其光泽和弹性。毛发经常会变得蓬乱、易断并且如同稻草。然而，最显著的损伤通常是涉及发色改变的毛发损伤。自然毛发如此脱色，如同人工施用了氧化性毛发染色剂或直接渗透性染料。

除了完全脱色以外，所述毛发还丧失了光泽、深度以及光彩。由于上述变化通常不会均匀地发生，结果是通常呈现大体上无吸引力且不调和的毛发总体外观。在最不利的情况下，尤其是在使用人造染发剂的情况下，由于个体染色组分的不同光敏性，因此不存在持续不变的光亮性，却存在色调的变化。

因此，需要有一种可防止毛发被日光脱色的产品。由于高度日光照射的影响常常与水有关，例如到南部海滨度假，因此向毛发提供防水保护也是可取的。上述保护必须是可保留下来的，即使是在用氯消过毒的水中或海水中游泳时。此外，在此上下文中，日光照射后其毛发保护功效得到改善的产品将是可取的。

现有技术已知，有众多可用于抑制人的毛发光致变色的方法。在使用紫外线吸收剂保护毛发方面已进行了多种尝试并取得了不同程度的成效。所述紫外线吸收剂可非常有效地用于皮肤化妆品中。

尽管解决所述问题的上述方法似乎具有逻辑性，但是它们通常以失败而告终，因为在不加剧对外观的负面影响的情况下，仅可在毛发上施用非常薄的层。因此，使用普通紫外线吸收剂，因为它们的固有颜色，经常会使灰白的毛发显现出黄色。另一方面，基于二氧化钛的光散射颜料客观上是看的见的，尤其是在黑色的毛发上。

此外，在无不利影响（如油质外观以及对毛发的粘着感）的情况下，产生粘着的防护膜不是一件简单的事情。此外，与在皮肤上晒斑的形成不同，发色不仅受到紫外线的损伤，而且还受到整个频率范围的可见光谱的损伤。为阻隔可见光，必须在毛发上施用黑色或高度光散射的（从而它们自身进行颜色调整）保护剂。

在假定漂白过程为氧化性或自由基诱导过程的基础上，已使用还原剂和自由基清除剂进行了多种尝试。在个别情况下，使用某些天然或合成的抗氧化剂已检测出具有可测量的光保护作用。然而，还远没有获得明显可见的效果。

持久地保护毛发免受上述影响既不可能也不可取，因为到户外去有助于提高生活品质，就像清洁和定型毛发一样。此外，根据现有技术，已知没有一种毛发定型或毛发改色方法能够在不产生一定程度损伤的情况下改善其功效。由于毛发在其形成后不会受到任何生物再生作用，因此其遭受到由外部影响导致的重大损伤，其中的有害影响还会进一步增加毛发的寿命。

作为抗氧化剂的羟基嘧啶和羟基吡啶衍生物阻碍自由基反应的特性是已知的。因此，例如 WO 02/00683 A2 描述了亲水和疏水环境中作为链终止剂的 5-羟基嘧啶和 3-羟基吡啶衍生物。具体地讲，已对上述化合物被用作燃料添加剂、润滑剂添加剂、聚合物添加剂、溶剂添加剂和食品添加剂进行了描述。此外，对所述化合物作为用于延缓衰老或预防癌症、心脏病或肺病、炎症、阿尔兹海默氏症或帕金森氏症的药物组分的适宜性已进行的描述。此外，所述化合物还可被用作化妆品如整发液、发霜和发乳中的氧化作用抑制剂。然而，所述化合物作为用于保护毛发和皮肤免受阳光辐射和化学试剂作用以及用于调理和清洁毛发和皮肤的化妆品组合物组分的适宜性，尤其是作为毛发化妆品组合物中活性物质的适宜性，无法从所引用的文献中得知。

Pratt 等人在 2003 年第 9 期“Chem. Eur. J.”第 4997 至 5010 页中描述了环中氮原子在苯酚化合物均裂反应中的作用。尤其研究了 5-羟基嘧啶捕获自由基的能力。根据所述公布，制备了六取代的羟基嘧啶，并对它们与自由基反应的热化学和动力学进行了研究。所述化合物被描述为抗氧化剂、

潜在的抗炎剂组分和细胞保护药物。在所述公布中，没有描述使用相应化合物来对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理。

EP 0 210 044 A2 涉及羟基和烷氧基嘧啶。尤其描述了可在 6 位被取代的 2-氨基-4-取代的-5-(羟基或烷氧基)嘧啶。所述化合物被称为类脂化合物合成的抑制剂，从而被认为适用于炎症、过敏性反应、心血管疾病或呼吸道疾病的治疗。在所述公布中，没有描述在试剂中使用所指定的化合物来对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理。

US 5 196 431 A 描述了 2-取代氨基-4,6-二叔丁基-5-羟基-1,3-嘧啶及其可药用的盐、药物组合物及其使用方法。所述化合物具有作为 5-脂氧合酶和环加氧酶抑制剂的活性，提供对医学病症如炎症、关节炎、疼痛、发烧等症状的治疗。此外，所述化合物可局部使用以用于对医学病症如粉刺、晒斑、牛皮癣和湿疹的医疗。

EP 0 373 827 B1 涉及使用 5-羟基- 和 5-甲氧基-2-氨基嘧啶的某些衍生物及其可药用盐来抑制哺乳动物体内白介素-1 的产生。所述化合物被用于治疗以白介素-1 作为媒介的疾病和机能障碍，如骨质疏松、过敏性反应和牛皮癣，然而所述化合物适宜以例如洗剂、霜膏和凝胶形式，以范围为 0.1mg 至最多 100mg/kg 体重的剂量局部施用。

EP 0 138 464 B1 描述了 2-氨基-5-羟基-4-甲基嘧啶、它们的可药用盐、它们的制备以及以药用有效量包含那些化合物的医疗组合物。所述化合物在哮喘、炎症、心血管痉挛、牛皮癣和癌症的治疗方面是有价值的试剂。此外，所述化合物具有“细胞保护”特性，例如它们可抑制大鼠体内溃疡的形成。所述化合物可以范围为每天 1 至 100mg/kg 体重，具体地讲为 1 至 20mg/kg 体重的治疗有效剂量局部施用。

2003 年第 42 期“Angew. Chem. Int. Ed.”第 4370 至 4373 页涉及 3-羟基吡啶和 5-羟基嘧啶中 O-H 键焓的计算和实验测定，以及某些新型 3-羟基吡啶的合成。其指出，O-H 键焓在测定那些化合物抗氧化剂功效方面起了重要的作用。6-氨基-3-羟基吡啶被描述为比任何其它酚类抗氧化剂更有效的抗氧化剂。

DE 600 07 046 T2 涉及一种包含至少一种硅氧烷-丙烯酸酯共聚物和至少一种光保护剂的化妆品组合物。肉桂酸衍生物被用作光保护剂如 4-甲氧

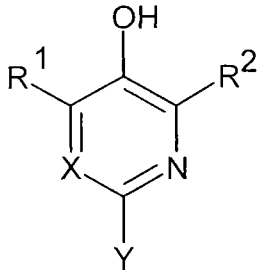
基肉桂酸异戊酯以及原始颗粒平均粒径为 5 至 100nm 的颜料或纳米颜料。

现有技术已知解决方案中常见的是，它们常常显示具有上文已描述的与它们在皮肤或毛发上行为有关的缺点，所述行为涉及它们的分配和保护功效。因此，需要在化妆品制剂中显示具有抗氧化功效，并因此可被用作例如毛发和皮肤防晒剂或紫外线防护剂的化合物。

因此，本发明的基本任务是能够制得一种克服了现有技术已知组合物缺点的组合物。此外，本发明的基本任务是能够制得一种用于处理活体体表的组合物，所述组合物可保护所述体表免受外界环境的影响，尤其是高能辐射如紫外线辐射或上述辐射后果的影响，由此所述体表例如毛发的大部分外观正如可避免一样，没有被不适宜地影响。

令人惊奇地发现，与普通市售紫外线吸收剂不同，已知的天然或合成还原剂、抗氧化剂、还或自由基清除剂，如抗坏血酸（维生素 C）、生育酚（维生素 E）或丁基羟基苯甲醚（商品名 Oxynex）、适宜的羟基嘧啶和羟基吡啶，可在即使薄层的情况下，对紫外线造成的毛发损伤提供有利的防护。显然，羟基嘧啶和羟基吡啶可满足对上述化合物所提出的关于它们在试剂中效用的要求，所述试剂用于对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理。尤其确定的是，包含某种羟基嘧啶或羟基吡啶或它们混合物的上述试剂可极好地保护毛发结构免受紫外线造成的毛发损伤。

因此，本发明的主题是使用具有通式 I 结构的化合物，或具有通式 I 结构的上述化合物生理上相容的盐，或具有通式 I 结构的化合物的异构体或立体异构体形式，作为对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理的试剂组分



(I),

其中 X 代表 N 或 C，R^1 代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基残基、苯基残基、C_{7-28} 苯基烷基残基，其中所述苯基烷基残基在苯环上可被氟、氯、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、CF_3、糠基或噻吩基取代，R^2 代表氢、C_{1-24} 烷基、苯基、C_{7-28} 苯基烷基，其中所述苯基烷基在苯环上可被氟、氯、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、CF_3、糠基或噻吩基取代，并且 Y 代表 NH_2、NHR^3 或 NR^3R^4，其中 R^3 和 R^4 彼此独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基，或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 羟基烷基，或 R^3 和 R^4 合在一起形成环，以使 Y 代表咪唑基或喹啉基、或吗啉基或吡唑基或哌啶基，或者 Y 代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷氧基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 羟基烷氧基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基羧酸基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基酰胺基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基磺酸基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基磺酸酯基，或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基磺酰胺基，或者其中 R^3 与 X 合在一起形成具有 5 或 6 个原子的增环(anelated ring)环状体系。

适宜的具有通式 I 结构的一般化合物生理上相容的盐为例如碱金属盐、碱土金属盐、铵盐、三乙基胺盐或三(2-羟基乙基)胺盐，以及由具有化学式 I 结构的化合物与无机酸或有机酸转化形成的那些，所述无机酸或有机酸如盐酸、磷酸、硫酸、支化或未支化的、取代（例如被一个或多个羟基取代）或未取代的 C_{1-4} 一元羧酸或二元羧酸、芳族羧酸和磺酸（如乙酸、柠檬酸、苯甲酸、马来酸、富马酸、酒石酸和对甲苯磺酸）。适宜的生理上相容的盐的示例是符合化学式 I 结构化合物的 Na 盐、K 盐、Mg 盐、Ca 盐和铵盐，以及由符合结构(I)或(II)的化合物与盐酸、乙酸、柠檬酸和苯甲酸转化形成的盐。

依照本发明，具有通式 I 结构的化合物异构体和立体异构体形式应被理解为它们存在的所有光学异构体、非对映体、外消旋体、两性离子、阳离子、或它们的混合物。

如果就本发明用途而言，使用具有通式 I 结构的化合物，其中 R^1 和 R^2 彼此独立地代表直链或支链的 C_{1-12} 烷基残基或 C_{1-6} 烷基残基、苯基残基或苯环上被 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基取代的苯基残基，则在许多情况下确定是有利的。

在取代基 Y 的类型方面，就本发明而言可使用这样的化合物，例如其中 Y 代表 NH_2、NHR^3 或 NR^3R^4，其中的 R^3 和 R^4 彼此独立地代表直链或支链的 C_{1-6} 烷基或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-6} 羟基烷基，或 Y 代表直链或支链的 C_{1-6} 烷氧基、直链或支链的 C_{1-6} 羟基烷氧基、直链或支链的 C_{1-6} 烷基羧酸基、直链或支链的 C_{1-6} 烷基氨基甲酰基、直链或支链的 C_{1-12} - C_{1-6} 烷基磺酸基、直链或支链的 C_{1-12} 烷基磺酸酯基或直链或支链的 C_{1-12} 烷基磺酰胺基。

就本发明的另一个实施方案而言，当在每种情况下 R^1 和 R^2 彼此独立地代表甲基或乙基残基时，已显示是有利的。尤其适宜的具有通式 I 结构的化合物为例如 2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶、2-二乙基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶、2-二甲基氨基-4,6-二乙基-5-羟基嘧啶、或 2-二乙基氨基-4,6-二乙基-5-羟基嘧啶、或 2-甲基乙基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶、或 2-甲基乙基氨基-4,6-二乙基-5-羟基嘧啶等。

就本发明而言，在每种情况下，具有通式 I 结构的化合物可被单独使用，或作为其两种或多种化合物的混合物使用。因此，依照本发明，受权利要求书保护的应用包括使用单独的羟基吡啶或羟基嘧啶，或使用两种或多种羟基吡啶的混合物，或使用两种或多种羟基嘧啶的混合物，或使用一种羟基吡啶和一种羟基嘧啶的混合物，或使用两种或多种羟基吡啶和一种羟基嘧啶的混合物，或使用两种或多种羟基嘧啶和一种羟基吡啶的混合物，或使用两种或多种羟基吡啶的混合物和两种或多种羟基嘧啶的混合物。

具有通式 I 结构的化合物可与通常属于以上用途范畴内的所有物质一起用于皮肤和毛发处理产品中。活性化合物可以气溶胶、凝胶、蜡、粉末或泡沫形式，溶解、乳化（w/o 和 o/w）、悬浮于液体结晶相中。具有通式 I 结构的化合物可甚至在 0.00001% 至 20%，优选介于 0.001% 至 5% 之间，例如介于约 0.0001% 至约 2% 之间，更优选介于约 0.01% 至约 1% 之间，例如介于约 0.01% 至约 0.5% 之间，例如介于约 0.01% 至约 0.1% 之间的浓度范围内作为高度有效的保护剂使用，以保护毛发免受由日光辐射或化学试剂造成的损伤。通常，具有通式 I 结构的化合物或两种或多种上述化合物的混合物可单独使用，或也可与其它抗氧化剂/自由基清除剂一起使用。在户外或日光浴室或化学侵蚀的毛发处理中，可在日光浴之前、期间或之后施用所涉及的试剂。所涉及产品的 pH 值可介于 2.0（如例如

在酸性体系中）或 14.0(碱性矫直剂）之间。所述 pH 优选介于 3.0 至 9.0 之间。所述试剂更详细地分别描述于下文中。

就上文详细论述的羟基吡啶或羟基嘧啶或它们混合物的量而言，已确定在较宽的浓度范围内存在相应的活性范围。因此，依照本发明，受权利要求书保护的应用包括以按重量计约 0.0001% 至约 15% 或约 0.0005% 至约 10% 的量，使用具有通式 I 结构的化合物或两种或多种上述化合物的混合物。已发现，适宜的活性范围在例如按重量计约 0.001% 至约 5% 或约 0.005% 至约 3%，或约 0.01% 至 2%，或约 0.1% 至 1.5% 的数量范围内。

依照本发明的应用按类别包括具有通式 I 结构的化合物在试剂中的每种应用，所述试剂用于对皮肤进行预防性、调理性、去污性或美容性处理，或用于对毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理。因此，大体上，如果具有通式 I 结构的化合物是发炎医学指征治疗的既定部分，则原则上不包括上述治疗。依照本发明，皮肤或毛发是指哺乳动物的皮肤或毛发，具体地讲是人的皮肤或人的毛发。

对皮肤或毛发进行预防性处理是指这样的处理，用本发明试剂对皮肤或毛发进行处理以预防将要发生的损伤，具体地讲是将要由环境影响造成的损伤，例如由紫外线辐射造成的损伤。对皮肤和毛发进行调理性处理是指这样的处理，用包含具有通式 I 结构化合物的试剂对皮肤或毛发进行处理，其中所述试剂适于在机械或触觉性质方面改善皮肤或毛发，例如皮肤或毛发的弹性，或毛发的相容性或拉伸强度。对皮肤和毛发进行去污性处理是指这样的处理，用包含具有通式 I 结构化合物的试剂对皮肤或毛发进行处理，其中所述试剂适于从皮肤或毛发上除去污物。对皮肤和毛发进行美容性处理是指对皮肤或毛发进行的致使皮肤或毛发外观改变的所有处理。关于这一点要强调的是，通常难以在所述试剂各自功效方面来对它们彼此进行区分。因此，还包括于本发明范畴内的是本发明的那些应用，其中包含具有通式 I 结构化合物的试剂显示具有上述两种或多种功效，例如去污和美容功效，或去污、调理和美容功效，或更多适宜的组合。

在本发明的一个优选的实施方案范围内，依照本发明的应用涉及在护发剂、深层护发剂、深层护发霜、免洗喷雾型深层护发剂、含挥发性物质的毛发处理剂、毛发定型凝胶、毛发定型泡沫、毛发喷剂、光泽喷雾产品、

定型润发油、烫发剂、用于烫发或染色处理后进行后护理的试剂、发蜡、洗发剂、沐浴露、防晒剂或毛发和躯体防晒喷剂中，使用具有通式 I 结构的化合物或两种或多种上述化合物的混合物。

依照本发明所述的试剂可包含已知用于上述制剂中的所有活性物质、添加剂和辅剂。这些是例如胶凝剂和/或增稠剂、阴离子聚合物、表面活性剂、水化剂、润肤剂、亲水性或亲脂性活性化合物如神经酰胺、抗自由基的试剂、多价螯合剂、抗氧化剂、防腐剂、碱化剂或酸化剂、香料、填充剂、染色剂、挥发性或非挥发性的、改性或未改性的硅氧烷以及还原剂。

不同添加剂的比例为各自领域中所用的那些。本领域技术人员通常选择掺入到依照本发明组合物中的本发明任选组合物，以使与依照本发明组合物有关的有利特性不会或不会显著地因预知的加入而改变。

在许多情况下，所述试剂包含至少一种表面活性剂，其中阴离子表面活性剂以及两性离子表面活性剂、两性表面活性剂、非离子表面活性剂和阳离子表面活性剂大体上是适宜的。然而，已证实在许多情况下，选自阴离子表面活性剂、阳离子表面活性剂、两性离子表面活性剂或非离子表面活性剂的表面活性剂是有利的。

适用于人体的所有阴离子表面活性物质均适用作依照本发明制剂中的阴离子表面活性剂。这些的特征在于具有调节水溶性的阴离子基团和具有约 10 至 22 个 C 原子的亲脂性烷基，所述阴离子基团例如羧酸根、硫酸根、磺酸根或磷酸根。此外，所述分子中可存在乙二醇醚或聚乙二醇醚、酯、醚、氨基以及羟基。在每种情况下，为钠盐、钾盐和铵盐以及链烷醇基团中具有 2 或 3 个 C 原子的一链烷醇铵盐、二链烷醇铵盐和三链烷醇铵盐形式的适宜阴离子表面活性剂的示例为

- 具有 10 至 22 个 C 原子的直链脂肪酸（皂），
- 结构为 R-O-(CH_2-CH_2O)X-CH_2-COOH 的羧酸醚，其中 R 代表具有 10 至 22 个 C 原子的直链烷基，而 X 代表 0 或 1 至 16，
- 酰基中具有 10 至 18 个 C 原子的酰基肌氨酸盐，
- 酰基中具有 10 至 18 个 C 原子的酰胺基乙磺酸盐，
- 酰基中具有 10 至 18 个 C 原子的酰基羟乙基磺酸盐，

- 烷基中具有 8 至 18 个 C 原子的磺酰基琥珀酸单烷基酯和二烷基酯，和烷基中具有 8 至 18 个 C 原子且具有 1 至 6 个乙氧基的磺酰基琥珀酸单烷基聚氧乙烯基酯，

- 具有 12 至 18 个 C 原子的直链链烷磺酸盐，

- 具有 12 至 18 个 C 原子的直链 α-烯烃磺酸盐，

- 具有 12 至 18 个 C 原子的脂肪酸甲基 α-磺酸盐，

- 结构为 $R-O(CH_2-CH_2O)_x-SO3H$ 的烷基硫酸盐和烷基聚乙二醇醚硫酸盐，其中 R 优选代表具有 10 至 18 个 C 原子的直链烷基，而 x 代表 0 或 1 至 12，

- 如 DE-A-37 25 030 中所述的表面活性羟基磺酸盐混合物，

- 如 DE-A-37 23 354 中所述的硫酸化羟烷基聚乙烯和/或羟基亚烷基丙二醇醚，

- 如 DE-A-39 26 344 中所述的具有 12 至 24 个 C 原子和 1 至 6 个双键的不饱和脂肪酸磺酸盐，

- 酒石酸和柠檬酸与醇的酯，其代表了约 2 至 15 分子的环氧乙烷和/或环氧丙烷与具有 8 至 22 个 C 原子的脂肪醇的加成产物。

优选的阴离子表面活性剂是在烷基中具有 10 至 18 个 C 原子且分子中具有最多 12 个乙二醇醚基团的烷基硫酸盐、烷基聚乙二醇醚硫酸盐和烷基聚乙二醇醚羧酸，尤其是饱和或不饱和 C_8-C_{22} 羧酸如油酸、硬脂酸、异硬脂酸和棕榈酸的盐。

非离子表面活性剂包含亲水性基团，例如多元羟基、聚亚烷基二醇醚基团或多元羟基和聚乙二醇醚基团的组合。上述化合物为例如

- 2 至 30 摩尔环氧乙烷和/或 0 至 5 摩尔环氧丙烷与具有 8 至 22 个 C 原子的直链脂肪酸、具有 12 至 22 个 C 原子的脂肪酸以及烷基中具有 8 至 15 个 C 原子的烷基苯酚的加成产物，

- 1 至 30 摩尔环氧乙烷与甘油加成产物的 $C_{12}-C_{22}$ 脂肪酸单酯和二酯，

- C_8-C_{22} 烷基单葡糖苷、低聚葡糖苷和它们的乙氧基化类似物，以及 5 至 60 摩尔环氧乙烷与蓖麻油和氢化蓖麻油的加成产物。

此外，适宜的非离子表面活性剂还可以是通式为 $RO-(Z)_x$ 的烷基聚葡糖苷，其中烷基残基 R 具有 6 至 22 个碳原子并且其可以是直链和支链

的。优选主要为直链的脂族残基和在 2 位上以甲基支化的那些。上述烷基残基为例如 1-辛基、1-癸基、1-月桂基、1-十四烷基、1-鲸蜡基和 1-硬脂基。尤其优选 1-辛基、1-癸基、1-月桂基、1-十四烷基。在使用所谓的"羰基合成醇"作为原料时，以烷基链中具有奇数碳原子的化合物为主。

依照本发明，可使用的聚葡糖苷可仅包含例如一种既定的烷基残基 R。然而，通常这些化合物是以天然脂肪和油或矿物油为原料而制备的。在此情况下，与起始化合物相应或与这些化合物各自组成相应的混合物显现出烷基残基 R。

尤其优选那些烷基聚葡糖苷，其中 R 基本上由 C_8- 和 C_{10} 烷基构成，

- 基本上由 C_{12}- 和 C_{14} 烷基构成，
- 基本上由 C_8-C_{16} 烷基构成，或
- 基本上由 C_{12}-C_{16} 烷基构成。

烷基聚葡糖苷可具有任何适宜的单糖或低聚糖作为糖构建嵌段 Z。它们通常包含具有 5 或 6 个碳原子的糖或相应的低聚糖。上述糖为例如葡萄糖、果糖、半乳糖、阿拉伯糖、核糖、木糖、来苏糖、阿洛糖、阿卓糖、甘露糖、古罗糖、艾杜糖、塔罗糖和蔗糖。优选的糖构建嵌段是葡萄糖、果糖、半乳糖、阿拉伯糖和蔗糖；尤其优选葡萄糖。

依照本发明，可使用的烷基聚葡糖苷包含平均 1.1 至 5 个糖单元。优选 x 值为 1.1 至 1.6 的烷基聚葡糖苷。x 为 1.1 至 1.4 的烷基聚葡糖苷也是适宜的。

依照本发明，还可使用指定烷基聚葡糖苷的烷氧基化同系物。这些同系物在每个烷基聚葡糖苷单元中可包含平均最多 10 个环氧乙烷和/或环氧丙烷单元。

此外，可使用两性离子表面活性剂，尤其可用作辅助表面活性剂。两性离子表面活性剂是在分子中带有至少一个季铵基团和至少一个 $-COO^-$ 或 $-SO_3^-$ 基团的那些表面活性化合物。尤其适宜的两性离子表面活性剂是所谓的甜菜碱，例如 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 2-烷基-3-羧甲基-3-羟乙基咪唑啉以及椰油酰胺基乙基羟乙基羧甲基甘氨酸盐。在每种情况下，烷基或酰基中均具有 8 至 18 个 C 原

子。优选的两性离子表面活性剂是 INCI 命名称为椰油酰胺丙基甜菜碱的脂肪酸酰胺衍生物。

两性表面活性剂同样尤其适用作辅助表面活性剂。两性表面活性剂被认为是分子中除了 C_8-C_{18} 烷基或酰基以外，还包含至少一个游离胺基和至少一个 -COOH- 或 $-SO_3H$ 基团并且能够形成内盐的那些表面活性剂。适宜两性表面活性剂的示例是 N-烷基氨基乙酸、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-烷基酰胺丙基氨基乙酸、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，在每种情况下烷基中均具有约 8 至 18 个 C 原子。尤其优选的两性表面活性剂是 N-椰油烷基氨基丙酸盐、椰油酰胺基乙氨基丙酸盐和 C_{12-18} 酰基肌氨酸。

依照本发明，季铵化合物、酯基季铵盐和酰氨基胺尤其可被用作阳离子表面活性剂。

优选的季铵化合物是卤化铵，尤其是氯化物和溴化物，如烷基三甲基氯化铵、二烷基二甲基氯化铵和三烷基甲基氯化铵，如鲸蜡基三甲基氯化铵、硬脂基三甲基氯化铵、二硬脂基二甲基氯化铵、月桂基二甲基氯化铵、月桂基二甲基苄基氯化铵和三鲸蜡基甲基氯化铵，以及 INCI 命名称为季铵-27 和季铵-83 的咪唑鎓盐化合物。上述表面活性剂的烷基长链优选具有 10 至 18 个碳原子。

酯基季铵盐是包含至少一个酯官能团和至少一个季铵基团作为结构部件的已知化合物。优选的酯基季铵盐是脂肪酸与三乙醇胺的酯季铵盐、脂肪酸与二乙醇烷基胺的酯季铵盐、以及脂肪酸与 1,2-二羟基丙基二烷基胺的酯季铵盐。上述产品以商标例如 Stepantex®、Dehyquart® 和 Armocare® 市售。产品 Arnlocare® VGH-70（N,N-二(2-棕榈酰乙氧基)二甲基氯化铵）以及 DehyquarC F-75 和 DehyquarC AU-35 是上述酯基季铵盐的示例。

通常可通过天然或合成脂肪酸以及脂肪酸片段与二烷氨基胺的酰胺化反应来制备烷基酰氨基胺。依照本发明，此物质种类中尤其适宜的化合物可由以名称 Tegoamid® S 18 市售的硬脂酰氨基丙基二甲胺代表。

依照本发明，可使用的其它阳离子表面活性剂是季铵化蛋白质水解产物。依照本发明，同样适宜的是阳离子硅氧烷油，例如市售产品 Q2-7224（制造商：Dow Corning；稳定的三甲基甲硅烷基氨代聚二甲基硅氧烷）、Dow Corning 929 乳液（包含羟基氨基改性的硅氧烷，还被称为氨基封端的

聚二甲基硅氧烷）、SM-2059（制造商：General Electric）、SLM-55067（制造商：Wacker）以及 Abil®-Quat 3270 和 3272（制造商：Th. Goldschmidt; 双季胺聚二甲基硅氧烷，季铵-80)。

可用作阳离子表面活性剂的季铵糖衍生物的示例是市售的 Glucquat© 100，依照 INCI 命名称为“月桂基甲基葡萄糖聚氧乙烯醚-10 羟丙基二甲基氯化铵”。

对可用作表面活性剂的具有烷基的化合物而言，它们可以是均质体。然而，通常优选假定在由天然植物或动物原料制备这些物质时，根据各自的原料可获得具有不同烷基链长的物质混合物。

对作为乙烯和/或环氧丙烷与脂肪醇加成产物或这些加成产物衍生物的表面活性剂而言，可使用具有“标准”同系物分布的产品和具有有限同系物浓度的那些。“标准”同系物分布被认为是指在作为催化剂的碱金属、碱金属氢氧化物或碱金属醇化物的存在下，由脂肪醇与烯化氧的反应获得的同系物的混合物。当例如水滑石、醚羧酸碱金属盐、碱土金属氧化物、氢氧化物或醇化物被用作催化剂时，可获得有限同系物分布。优选使用具有有限同系物分布的产品。

此外，依照本发明的试剂优选包含护发剂，所述护发剂选自由下列物质组成的组：阳离子表面活性剂、阳离子聚合物、烷基酰氨基胺、石蜡油、植物油和合成油。

优选的护发剂是阳离子聚合物。这些通常是例如以铵基形式包含季氮原子的聚合物。

优选的阳离子聚合物为例如

- 季铵化纤维素衍生物，如以名称 Celquat© 和 Polymer JR.® 市售的那些。化合物 Celquat® H 100、Celquat® L 200- 和 Polymer JR® 400 是优选的季铵化纤维素衍生物。

- 聚二甲基二烯丙基铵盐和它们与丙烯酸的共聚物，以及丙烯酸和甲基丙烯酸的酯和酰胺。以名称 Merquat© 100（聚（二甲基二烯丙基氯化铵））、Merquat© 550（二甲基二烯丙基氯化铵-丙烯酰胺共聚物）和 Merquat® 280（二甲基二烯丙基氯化铵-丙烯酸共聚物）市售的这些产品是上述阳离子聚合物的示例。

- 乙烯基吡咯烷酮与二烷基氨基丙烯酸脂和甲基丙烯酸酯季铵化衍生物的共聚物，例如硫酸二乙酯-季铵化乙烯基吡咯烷酮-二甲基氨基甲基丙烯酸酯共聚物。上述化合物可以名称 Gafquat® 734 和 Gafquat© 755 商购获得。

- 以名称 Luviquat® 市售的乙烯基吡咯烷酮-氯化 N-甲基咪唑啉共聚物。

- 季铵化聚乙烯醇以及在聚合物主链上具有季氮原子的聚合物，所述物质被称为聚季铵盐 2、聚季铵盐 17、聚季铵盐 18 和聚季铵盐 27。

尤其优选具有四个第一指定基团的阳离子聚合物，在一定程度上尤其优选聚季铵盐-2、聚季铵盐-10 和聚季铵盐-22。

还适于作为护发剂的是硅氧烷油，尤其是二烷基- 和烷基芳基硅氧烷，例如二甲基聚硅氧烷和甲基苯基聚硅氧烷，以及它们的烷氧基化物和季铵化类似物。上述硅氧烷的示例是以名称 DC 190、DC 200、DC 344、DC 345 和 DC 1401 由 Dow Corning 市售的产品，以及商品 Q2-7224（制造商：Dow Corning；稳定的三甲基甲硅烷基氨代聚二甲基硅氧烷）、Dow Corning 929 乳液（包含羟基氨基改性的硅氧烷，其还被称为氨基封端的聚二甲基硅氧烷）、SM-2059（制造商：General Electric）、SLM-55067（制造商：Wacker）和 Abil®-Quat 3270 和 3272 （制造商：Th. Goldschmidt；双季胺聚二甲基硅氧烷，季铵-80)。

同样可用作护发剂的是石蜡油、合成低聚烯烃以及植物油，如霍霍巴油、向日葵油、橙油、杏仁油、小麦胚芽油和核桃油。

同样，适宜的毛发调理化合物是磷脂，例如大豆卵磷脂、蛋黄卵磷脂和脑磷脂。

其它活性化合物、辅剂和添加剂为例如，

- 非离子聚合物，如乙烯基吡咯烷酮/丙烯酸乙烯脂共聚物、聚乙烯吡咯烷酮和乙烯基吡咯烷酮/乙酸乙烯酯共聚物以及聚硅氧烷，

- 两性离子和两性聚合物，如丙烯酰胺丙基三甲基氯化铵/丙烯酸酯共聚物，和辛基丙烯酰胺/甲基丙烯酸甲酯/甲基丙烯酸叔丁氨基乙酯/甲基丙烯酸 2-羟丙酯共聚物，

- 阴离子聚合物，例如聚丙烯酸、交联聚丙烯酸、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/马来酸酐共聚物以及丙烯酸/丙烯酸乙酯/N-叔丁基丙烯酰胺三元共聚物，

- 增稠剂，如琼脂、瓜耳胶、藻酸盐、黄原胶、阿拉伯树胶、刺梧桐树胶、角豆粉、亚麻籽胶、葡聚糖、纤维素衍生物（如甲基纤维素、羟烷基纤维素和羧甲基纤维素）、淀粉成分和衍生物（如直链淀粉、支链淀粉和糊精）、粘土如膨润土或全合成水胶体如聚乙烯醇，

- 结构化试剂，如马来酸和乳酸，

- 毛发调理化合物，如磷脂（例如大豆卵磷脂、蛋黄卵磷脂和脑磷脂）、蛋白质水解产物（尤其是弹性蛋白、胶原、角蛋白、牛乳蛋白、大豆蛋白和小麦蛋白水解产物，它们与脂肪酸的缩合产物以及季铵化蛋白质水解产物），

- 香料油、异山梨醇二甲醚和环糊精，

- 溶剂和增溶剂，如乙醇、异丙醇、乙二醇、丙二醇、甘油和二甘醇，

- 纤维结构改进剂，尤其是单糖、二糖和低聚糖，如葡萄糖、半乳糖、果糖、D-果糖和乳糖，

- 季铵，如甲基-1-烷基酰胺乙基-2-烷基咪唑啉硫酸二甲酯，

- 泡沫抑制剂如硅氧烷，用于将试剂着色的染料，

- 活性去头皮屑剂，如羟甲辛吡酮乙醇胺、1-氧-2-巯基吡啶锌和甘宝素，

- 光保护剂，尤其是衍生的二苯甲酮、肉桂酸衍生物和三嗪，

- 缓冲剂，例如常见的酸，尤其是有益的酸和碱，

- 植物提取物，如以下物质的提取物：绿茶、橡木皮、荨麻、金缕梅、蛇麻子、春黄菊、牛蒡根、问荆、山楂、菜檬花、杏仁、芦荟、松针、马栗、檀木、杜松、椰子、芒果、杏、柠檬、小麦、猕猴桃、瓜、橙、柚子、鼠尾草、迷迭香、桦树、锦葵、仙翁花、宽叶百里香、蓍草、百里香、蜜蜂花、匍匐芒柄花、药用蜀葵、分生组织、人参和姜根，

- 胆固醇，

- 稠度调节剂，如糖酯、多羟基酯或多羟基烷基醚、脂肪和蜡（如鲸蜡、蜂蜡、蒙旦蜡和石蜡）、脂肪酸链烷醇酰胺，

- 螯合剂，如 EDTA、NTA、β-丙氨酸二乙酸和磷酸，

- 溶胀和渗透剂，如甘油、丙二醇一乙基醚、碳酸盐、碳酸氢盐、胍、脲以及磷酸二氢盐、磷酸氢盐和磷酸盐，

- 遮光剂，如胶乳、苯乙烯/PVP 和苯乙烯/丙烯酰胺共聚物，

- 珠光剂，如一硬脂酸乙二醇酯和二硬脂酸乙二醇酯，以及 PEG-3 二硬脂酸酯，颜料，

- 过氧化氢和其它氧化剂的稳定剂，

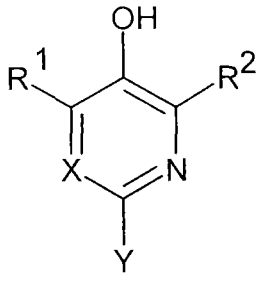
- 气溶胶推进剂，如丙烷-丁烷混合物、N20、二甲基醚、C02 和空气，

- 抗氧化剂。

至于其它任选组分以及化合物的用量，可详细参考本领域技术人员熟悉的综合性参考书，如 Kh. Schrader 的“Grundlagen und Rezepturen der Kosmetika”第 2 版（Hüthig Buch Verlag，Heidelberg，1989）。

就本发明而言，许多情况下在用于对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理的试剂中使用具有通式 I 结构的化合物，与现有技术已知的试剂相比，显然会在性质方面发生显著的改善。就此而论，需要相关试剂包含至少一种具有通式 I 结构的化合物，至少一种液体载体和至少一种表面活性剂。

因此，本发明的主题是一种用于对皮肤或毛发进行预防性、调理性、去污性或美容性处理的试剂，所述试剂包含至少一种液体载体、一种表面活性剂和一种具有通式 I 结构的化合物，



(I),

其中 X 代表 N 或 C，R^1 代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基残基、苯基残基、C_{7-28} 苯基烷基残基，其中所述苯基烷基残基在苯环上可被氟、氯、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、CF_3、糠基或噻吩基取代，R^2 代表氢、C_{1-24} 烷基、苯基、C_{7-28} 苯基烷基，其中所述苯基烷基在苯环上可被氟、氯、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 烷氧基、CF_3、糠基或噻吩基取代，并且 Y 代表 NH_2、

NHR^3 或 NR^3R^4，其中 R^3 和 R^4 彼此独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 羟基烷基，或 R^3 和 R^4 合在一起形成环状体系，以使 Y 代表咪唑基或喹啉基、或吗啉基或吡唑基或哌啶基，或者 Y 代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷氧基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 羟基烷氧基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基羧酸基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基氨基甲酰基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-12} 烷基磺酸基，直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基磺酸酯基，或直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-24} 烷基磺酰胺基，或者其中 R^3 与 X 合在一起形成具有 5 或 6 个原子的增环环状体系，或具有通式 I 结构的上述体系生理上相容的盐，或具有通式 I 结构的化合物的异构体或立体异构体形式，或其两种或多种的混合物，其中具有通式 I 结构的化合物的试剂的含量小于 10%。

基本上，作为载体物质的一方面可使试剂分别有效分配，另一方面相应可使且优选支持上述内含物质在皮肤或毛发上施用的所有与皮肤或毛发相容的液体均适用作液体载体。

适宜的液体载体主要包含水以及任选的美容上可接受的有机溶剂。适宜的液体有机载体为例如选自有机溶剂类别的化合物，例如醇、酯、酮、石蜡或酯基醇。

所述有机溶剂在液体载体物质总重量中的含量按重量计为 0% 至 99%，例如按重量计为 0.5% 至 90%。它们可选自亲水性有机溶剂、亲脂性有机溶剂、两亲溶剂、或它们的混合物。

例如在所述亲水性有机溶剂中，具有 1 至 8 个碳原子的直链或支链低级一元醇、具有 6 至 80 个环氧乙烷单元的聚乙二醇和多羟基化合物，适用作液体载体物质。

例如在所述两亲有机溶剂中，丙二醇衍生物(PPG)是适宜的，如丙二醇和脂肪酸的酯，以及 PPG 和脂肪醇的醚，如 PPG-油基醚和 PPG 油酸酯。

在所述亲脂性有机溶剂中，脂肪酸酯如己二酸二异丙酯、己二酸二辛酯、苯甲酸烷酯和马来酸二辛酯可存在于相应的液体载体中。

还可以将脂肪相掺入到依照本发明试剂的介质中，从而在某些应用中对本发明试剂产生影响。

所述脂肪相在所述试剂总重量中含量最多为 50%。所述脂肪相可包含油或蜡、或它们的混合物，或脂肪酸、脂肪醇以及脂肪酸酯。所述油可选自动物油、植物油、矿物油或合成油或液体硅氧烷，并且尤其可选自凡士林油、石蜡油、异链烷烃、聚烯烃、氟化油和全氟化油、聚二甲基硅氧烷、环状聚甲基硅氧烷等。类似地，所述蜡可选自已知的动物油、矿物油、植物油、矿物油或合成油。

在许多情况下，使用水作为至少部分液体载体是明智的。因此，在本发明的另一个实施方案范围内，本发明涉及一种包含至少一种具有通式 I 结构的化合物和按重量计至少 1% 含量水的试剂。例如，水的份数也可显著高于所指定的按重量计 1% 的量。水的适宜量可为例如按重量计约 1.5% 至 99.5%，例如按重量计约 5% 至约 98%，或按重量计约 10% 至约 95%，或按重量计约 20% 至约 80%，或按重量计约 30% 至约 70%，或按重量计约 40% 至约 60%。

在本发明的另一个实施方案范围内，本发明试剂以按重量计至少 30% 的量包含水或沸点低于 120℃(248℉)的醇作为液体载体。

在依照本发明的范围内，除了具有通式 I 结构的化合物以外，本发明试剂还包含至少一种表面活性剂。就此而论，其是至少一种阴离子表面活性剂或至少一种阳离子表面活性剂，或它们中两种或多种的混合物。

适宜的表面活性剂是本文上下文中上面指定的表面活性剂。在众多应用中，例如已发现，如果依照本发明的试剂包含季铵化合物则是有利的。例如，上述试剂尤其可被用作毛发调理剂。

在依照本发明的范围内，本发明试剂可被改性，例如可尤其作为防晒剂被施用到皮肤上。

在此情况下，依照本发明的试剂可包含例如金属氧化物纳米颜料，所述金属氧化物选自钛、铈、锆、锌、铁的氧化物、或它们的混合物。

纳米颜料被认为是指其基本颗粒平均尺寸位于 5nm 以上 100nm 以下的颜料。依照本发明一个优选的实施方案，此尺寸低于 50nm。所述纳米颜料可以是涂层的或未涂层的。

涂层颜料是已受一种或多种化学性、电导性、机械-化学性和/或机械性表面处理的颜料，所述表面处理使用描述于例如 1990 年二月“Cosmetics & Toiletries”第 105 卷第 53 至 64 页中的化合物，例如氨基酸、蜂蜡、脂肪

酸、脂肪醇、阴离子表面活性物质、卵磷脂、脂肪酸钠盐、脂肪酸钾盐、脂肪酸锌盐、脂肪酸铁盐或脂肪酸铝盐、金属醇盐（钛或铝的醇盐）、聚乙烯、硅氧烷、蛋白质（胶原、弹性蛋白）、链烷醇胺、二氧化硅、金属氧化物或六偏磷酸钠。

硅氧烷被公认为是具有直链或环状支链或交联结构的具有不定分子量的有机硅聚合物或低聚物，其可通过适宜官能化硅烷的聚合反应和/或缩聚反应制备，并且其基本上由主要重复单元组成，其中所述硅原子通过氧原子彼此键合（硅氧烷键），由此任选的取代烃基通过碳原子与硅原子直接键合短语“硅氧烷”还包括硅烷，并且尤其包括它们制备所需的烷基硅烷。

依照本发明，适用于将纳米颜料涂层的硅氧烷优选选自烷基硅烷、聚二烷基硅氧烷和聚烷基氢硅氧烷。更优选选自辛基三甲基硅烷、聚二甲基硅氧烷和聚甲基氢硅氧烷的硅氧烷。

金属氧化物纳米颜料在用硅氧烷处理之前通常可用其它表面活性物质处理，尤其是氧化铈、氧化铝、二氧化硅、氧化铝化合物、硅化合物或它们的混合物。

就涂层颜料而言，尤其是氧化钛，可用以下物质将其涂层：二氧化硅、二氧化硅和氧化铁、二氧化硅和氧化铝、氧化铝、氧化铝和硬脂酸铝、氧化铝和月桂酸铝、氧化铁和硬脂酸铁、氧化锌和硬脂酸锌、二氧化硅和氧化铝，并且可用硅氧烷、二氧化硅、氧化铝、硬脂酸铝处理，并且可用硅氧烷、氧化铝处理，并且可用硅氧烷、三乙醇胺、硬脂酸或六偏磷酸钠处理。

也可使用金属氧化物的混合物，尤其是由二氧化钛和二氧化铈组成的混合物，包括由被二氧化硅涂层的按重量计等量二氧化钛和二氧化铈组成的混合物，以及被氧化铝、二氧化硅和硅氧烷涂层的二氧化钛和二氧化锌的混合物。

与所述组合物的总重量相比，纳米颜料在依照本发明试剂中的浓度含量通常在按重量计 0.1% 至 30% 的范围内，并且优选在按重量计 0.5% 至 10% 的范围内。

除了纳米颜料以外，依照本发明的试剂还可包含平均尺寸在 100 至 700nm 范围内的常规非有色颜料，例如氧化锌、由 SACHTLEBEN CHEMIE GmbH 公司出售的基本颗粒平均尺寸为 400nm 的二氧化钛“FT.

HOMBITAN”、或购自 LAMBERT RIVIERE 公司的氧化锌“NEIGE”，或还可包含有色颜料，例如购自 ANSTEAD 公司的氧化铁“FDC RED 40(37011/90119)”和购自 BASF 公司的“SICOMET BRUN ZP 3569”和“SICOVIT DAUNE 10 E 172”。

依照本发明的化妆品剂通常还可包含一种或多种可吸收 UV-A 和 UV-B 范围辐射的亲水性或亲脂性有机防晒过滤剂。这些过滤剂尤其可选自肉桂酸酯、水杨酸酯、亚苄基樟脑衍生物、三嗪衍生物、二苯甲酮衍生物、苯并三唑衍生物、β,β-二苯基丙烯酸脂衍生物、二苯甲酰甲烷衍生物、对氨基安息香酸酯、描述于专利申请 WO 93/04665 中的聚合物过滤剂和硅氧烷过滤剂。有机过滤剂的其它示例描述于专利申请 EP-A-0 487 404 中。与所述组合物的总重量相比，有机过滤剂在依照本发明试剂中的浓度含量按重量计为 0.1% 至 30%。

依照本发明的试剂还可包含用于美黑皮肤和/或使皮肤人工着色的试剂（自晒黑剂），例如二羟基丙酮(DHA)。

依照本发明的试剂还可包含美容上可接受的含水介质。它们显示出在 3.5 至 11，优选 5.5 至 11，并且更优选 5.5 至 8.5 范围内的 pH 值。

依照本发明的试剂可以任何适用于局部应用的任意形式存在，尤其可作为洗剂、囊泡分散体、简单或复杂的乳液(o/w、w/o、o/w/o、w/o/w)，例如可为霜膏或乳液、含水凝胶或含水醇凝胶或凝胶霜膏，可为粉末形式，或可为糊剂，并且它们可任选被配制成气溶胶以及泡沫或喷雾形式。所述试剂优选以凝胶-霜膏形式存在。它们可通过常规方法来制备。

依照本发明的试剂可被用作例如用于保护人体表皮或毛发免受紫外线辐射的试剂，可被用作防晒剂或被用作化妆品。

如果使用依照本发明的化妆品制剂来保护人体表皮免受紫外线辐射，或作为防晒剂，则其可以非离子囊泡分散体形式作为溶剂或脂肪物质中的悬浮液或分散体而存在，或还可作为乳液，如作为霜膏或乳液、油膏剂、凝胶、凝胶-霜膏、气溶胶泡沫或喷雾。

本发明试剂可包含例如至少以下组分:

a) 按重量计 0.0001% 至 10% 的具有通式 I 结构的化合物

b) 按重量计 1% 至 99% 的水或沸点低于 120℃(248℉)的醇

c) 按重量计 0.1% 至 90% 的阴离子或阳离子表面活性剂

d)按重量计至少 0.01% 的其它添加剂，所述添加剂选自由下列物质组成的组：非离子表面活性剂、两性离子表面活性剂、甜菜碱、非离子聚合物、聚硅氧烷、两性离子和两性聚合物、阴离子聚合物、增稠剂、结构化试剂、毛发调理化合物、香料油、溶剂和增溶剂、用于改善毛发纤维结构的活性物质、季铵、酰氨基胺、消泡剂、染料、活性去头皮屑化合物、光保护剂、用于调节 pH 值的物质、植物提取物、胆固醇、稠度调节剂、脂肪和蜡、螯合剂、溶胀和渗透物质、遮光剂、珠光剂、颜料、稳定剂、气溶胶推进剂或抗氧化剂。

依照本发明的试剂适于用作例如护发剂、深层护发剂、深层护发霜、深层护发免洗型喷剂、含挥发性物质的毛发处理剂、发蜡、洗发剂、沐浴露、防晒剂或毛发和躯体防晒喷剂。指定应用范围内的典型代表可具有以下组成：

护发剂：

阳离子表面活性剂：按重量计约 0.1% 至约 5%

脂肪醇：按重量计约 1% 至约 5%

具有通式 I 结构的化合物：按重量计约 0.001% 至约 10%

其它添加剂：按重量计约 0.01% 至约 10%

水：按重量计约 70% 至约 99%

深层护发剂：

阳离子表面活性剂：按重量计约 0.1% 至约 5%

脂肪醇：按重量计约 2% 至约 10%

具有通式 I 结构的化合物：按重量计约 0.001% 至约 10%

其它添加剂：按重量计约 0.01% 至约 10%

水：按重量计约 70% 至约 99%

洗发剂：

阴离子表面活性剂：按重量计约 5% 至约 50%

具有通式 I 结构的化合物：按重量计约 0.001% 至约 10%

其它添加剂：按重量计约 0.01% 至约 10%

水：按重量计约 50% 至约 95%

发蜡：

O/W 乳化剂：按重量计约 5% 至约 10%

具有通式 I 结构的化合物：按重量计约 0.001% 至约 10%

其它添加剂：按重量计约 0.01% 至约 10%

蜡组分：按重量计约 5% 至约 30%

水：按重量计约 50% 至约 80%

本发明化合物基本上适用于对皮肤或毛发进行非治疗性、预防性、调理性、去污性或美容性处理。因此，本发明的主题还是一种用于对皮肤或毛发进行非治疗性、预防性、调理性、去污性或美容性处理的方法，其中使所述皮肤或毛发与本发明的试剂接触。

通过以下实施例，可更详细地说明本发明。

实施例：

羟基嘧啶和羟基吡啶能够保护发色和毛发结构免受由光线作用造成的损伤。保护功效不仅确保获得可见的效果，而且在日光模拟研究中还是可测量的。以下所述的测量值仅适合肉眼已能看见的定量效果。除了保持天然发色或人工外加发色以外，技术测定显示用包含羟基嘧啶或羟基吡啶或它们中两种或多种的混合物的护理产品处理的毛发具有改善的纤维结构保持力。

通过使用包含羟基嘧啶或羟基吡啶或它们中两种或多种的混合物的产品可显著减少与辐射必然有关的毛发结构损伤。因此，用包含羟基嘧啶或羟基吡啶或它们中两种或多种的混合物的产品中的防晒产品处理后测得的峰值温度，在所有情况下均显著高于用常规产品处理的毛发。HPDSC 测定中的峰值温度代表了与角蛋白相关联的蛋白质抵抗中间丝 +α-螺旋区变性的承受度量度。毛发受损越多，HPDSC 中的变性温度越低。

a) 处方

实施例 1：护发剂

4.3g(0.2oz)	十六/十八醇(Lanette® O)
0.4g(0.01oz)	乳酸鲸蜡酯
0.5g(0.02oz)	凡士林
1.2g(0.04oz)	鲸蜡基三甲基氯化铵
0.45g(0.02oz)	聚乙烯吡咯烷酮
0.02g(0.0007oz)	2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶
余量至 100g(3.53oz)	水

实施例 2：深层护发剂

5.5g(0.2oz)	十六/十八醇(Lanette® O)
1.2g(0.04oz)	凡士林
1.0g(0.03oz)	液体石蜡
0.5g(0.02oz)	二甲基聚硅氧烷(Belsil® DM 500)
0.3g(0.01oz)	羊毛脂醇
0.2g(0.007oz)	羊毛脂
1.2g(0.04oz)	鲸蜡基三甲基氯化铵
0.3g(0.01oz)	柠檬酸
0.4g(0.01oz)	香料
0.02g(0.0007oz)	2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶
余量至 100g(3.53oz)	水

实施例 3：深层护发霜

6g(0.2oz)	十六/十八醇
1.7g(0.06oz)	甘油
1g(0.03oz)	鲸蜡基三甲基氯化铵
1g(0.03oz)	植物油
0.5g(0.02oz)	泛醇
0.5g(0.02oz)	硅油（二甲基聚硅氧烷）
0.2g(0.007oz)	香料
0.02g(0.0007oz)	2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶
余量至 100g(3.53oz)	水

实施例 4：深层护发免洗型喷剂

0.5g(0.02oz)	鲸蜡醇
0.3g(0.01oz)	甘油
0.25g(0.009oz)	鲸蜡基三甲基氯化铵
0.2g(0.007oz)	苯乙烯/乙烯基吡咯烷酮共聚物

0.2g(0.007oz)	泛醇
0.01g(0.0004oz)	2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶
0.2g(0.007oz)	香料
4.8g(0.2oz)	乙醇
余量至 100g(3.53oz)	水

实施例 5：含高度挥发性物质的毛发处理剂

10g(0.4oz)	丙二醇
2g(0.07oz)	十六/十八醇(Lanette® O)
2g(0.07oz)	环状聚甲基硅氧烷（Dow Corning 345 流体）
0.4g(0.01oz)	香料
0.2g(0.007oz)	PHB 甲酯
0.1g(0.004oz)	PHB 丙酯
0.002g(0.00007oz)	2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶
余量至 100g(3.53oz)	水

实施例 6：发蜡

10g(0.4oz)	三鲸蜡硬脂醇聚醚-4 磷酸酯
6g(0.2oz)	PEG-200 氢化棕榈酸甘油酯
18g(0.6oz)	辛酸/癸酸甘油三酯
0.5g(0.02oz)	香料
0.5g(0.02oz)	防腐剂
0.01g(0.0004oz)	2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶
余量至 100g(3.53oz)	水

实施例 7：洗发剂

30g(1.1oz)	月桂基醚硫酸钠
8g(0.3oz)	椰油酰胺丙基甜菜碱
3g(0.1oz)	二硬脂酸乙二醇酯
0.5g(0.02oz)	香料

0.35g(0.01oz)	苯甲酸钠
0.15g(0.005oz)	甲酸钠
0.2g(0.007)	氯化钠
0.2g(0.007oz)	2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶
余量至 100g(3.53oz)	水

实施例 8：沐浴露

12g(0.4oz)	70% 月桂基醚硫酸钠
0.7g(0.02oz)	防腐剂
0.4g(0.01oz)	香料
7.5g(0.3oz)	不透明剂（按重量计 20% PEG-3 二硬脂酸酯和按重量计 18% 月桂基醚硫酸钠的水溶液）
0.3g(0.01oz)	聚季铵盐-10（阳离子纤维素）
0.4g(0.01oz)	PEG-7 椰油酸甘油酯
0.3g(0.01oz)	D-泛醇
0.2g(0.007oz)	2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶
5g(0.2oz)	椰油酰胺丙基甜菜碱，30% 的水溶液
1g(0.03oz)	NaCl
余量至 100g(3.53oz)	水

实施例 9：防晒剂

油相：	INCI/EU	按重量计的百分比
Parsol 1789	丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷	0.30
Neo Heliopan AV/OA	甲氧基肉桂酸辛酯	10.00
Hostaphat KL 340 N	三月桂醇聚醚-4 磷酸酯	0.60
Hostacerin DGI	聚甘油基-2 倍半异硬脂酸酯	0.70
phenoxetol	苯氧基乙醇	1.00
Cetiol 868	硬脂酸辛酯	5.00
Primol 352	矿物油	5.00
水相：		

Carbopol 2984	卡波姆	0.30
氢氧化钠	氢氧化钠	0.06
甘油 86%	甘油	5.00
2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶		0.01
完全脱盐的水	水	余量至 100

实施例 10: 防晒剂

油相:	INCI/EU	按重量计的百分比
Parsol 1789	丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷	0.30
Neo Heliopan AV/OA	甲氧基肉桂酸辛酯	10.00
Hostaphat KL 340 N	三月桂醇聚醚-4 磷酸盐	0.60
Hostacerin DGI	聚甘油基-2 倍半异硬脂酸酯	0.70
phenoxetol	苯氧基乙醇	1.00
Cetiol 868	硬脂酸辛酯	9.00
Abil Wax 9801D	鲸蜡基聚二甲硅氧烷	1.00
水相:		
Carbopol 2984	卡波姆	0.30
氢氧化钠	氢氧化钠	0.06
甘油 86%	甘油	5.00
2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶		0.01
完全脱盐的水	水	余量至 100

实施例 11: 防晒剂

类脂相:	INCI/EU	按重量计的百分比
Parsol 1789	丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷	1.50
PHB 甲酯	对羟基苯甲酸甲酯	0.20
Neo Heliopan AV/OA	甲氧基肉桂酸辛酯	10.00
Neo Heliopan Type 303	氰双苯丙烯酸辛酯	10.00

Finsolv TN	苯甲酸 C12-15 烷基酯	2.50
Eutanol G	辛基十二烷醇	10.00
Antaron V 216	PVP/十六碳烯共聚物	2.00
维生素 E 乙酸酯	乙酸生育酚酯	0.50
香料	香料	0.30
Abil Wax 9801D	鲸蜡基聚二甲硅氧烷	0.50
水相:		
Carbopol 1382	丙烯酸酯/丙烯酸 C10-30 烷基酯交联聚合物	0.45
Colorona Oriental Beige 17237	MICA(和)CI 77891(和)CI 77491	0.05
甘油 86%	甘油	5.00
Edeta BD	乙二胺四乙酸二钠	0.10
氢氧化钠	氢氧化钠	0.18
D-泛醇	泛醇	0.50
2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶		0.01
完全脱盐的水	水	余量至 100
Dekaben LMB	碘代丙炔基氨基甲酸丁酯	0.50

实施例 12: 毛发和躯体防晒喷剂

类脂相:	INCI/EU	按重量计的百分比
Parsol 1789	丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷	0.50
Neo Heliopan AV/OA	甲氧基肉桂酸辛酯	2.00
Finsolv TN	苯甲酸 C12-15 烷基酯	2.50
Eutanol G	辛基十二烷醇	10.00
JAGUAR c-13-S	瓜耳羟丙基三甲基氯化铵	0.50
维生素 E 乙酸酯	乙酸生育酚酯	0.50
香料	香料	0.30
D-泛醇	泛醇	0.50

2-二甲基氨基-4,6-二甲基-5-羟基嘧啶		0.02
含水乙醇	变性醇	60.0
完全脱盐的水	水	余量至 100

拉伸强度的测定:

毛发物质:

优质机制发辫，Kerling 公司，颜色 8/0，束带下方长度 16cm（6.3 英寸），宽 3.5cm（1.4 英寸），扣除束带后重 0.8g(0.03oz)，磺基丙氨酸值: 21.1μmol/g(527.5μmol/oz)毛发

毛发预处理:

在每种情况下，每束毛发使用 0.2mL(0.007oz)标准洗发剂(10% Na-LES，4% NaCl)，将毛发洗涤 1 分钟，并在自来水(35℃(95℉))下冲洗 1 分钟。在 20℃(68℉)和 65% 相对湿度的调节室中，使所述发束干燥至少整夜。

测试样本的施用:

测试样本的施用: 在 85% 相对湿度和 35℃(95℉)下，用购自 Atlas 公司的 Xenotest Alpha 装置（配有 Xenochrome 滤光器 270），以 600W/m^2 的功率将干发束照射 16h。然后使它们在 35℃(95℉)的温热自来水中放置 15 分钟，拍干，以使它们具有按重量计 50% 的残余含水量。对实施例 1 而言，不用产品处理发束，对实施例 2 和 3 而言，在每种情况下，每束毛发使用 0.2mL(0.007oz)产品（实施例 2: 不含具有通式 I 结构化合物的深层护发剂，实施例 3: 包含具有通式 I 结构化合物的深层护发剂）来处理所述发束，并均匀摩擦一分钟。使产品作用 10 分钟，然后在流动的 35℃(95℉)自来水下，在一分钟内冲洗掉。接着，每束毛发用 7.5mL(0.3oz)标准洗发剂将所述发束洗涤 1 分钟，并用水(35℃(95℉))冲洗 1 分钟，并在调节室（20℃(68℉)/65% 相对湿度）中干燥。

拉伸强度的测量

如下测定拉伸强度:

每个实施例准备三个发束。为进行拉伸强度测定，从每股干发束中取出单根毛发，并在两端（卷曲的）从末端施加金属套管。每个样本共使用 25 根单独毛发来测定拉伸强度。

使卷曲的毛发在调节室中保存过夜，其后用计算机控制的激光测微器（Zimmer 公司，Roßdorf）来测定单独毛发的直径。接着，使用张力检验器（MTT 160/600 系列微型张力检验器，系列号 600.95.05.001，Fa. DIA-STRON Ltd.，England）来测定每根单独毛发的应力-应变图表。在湿发上发生了断裂。

为了以图表方式进行评价和陈述，首先将因毛发直径不同而导致彼此偏离很大的单独毛发拉伸强度，按照平均直径或平均毛发交叉部分进行标准化（考虑各自毛发直径，通过线性回归，以 0.08mm（平均直径）的毛发直径将发束 25 个独立值进行标准化）。

对毛发保护研究，使用新的评价方法：考虑各自毛发直径，计算 0.08mm（0.003 英寸）毛发直径的拉伸强度，并转换成单位峰值载荷(N)。

结果：

实施例 1（没有用深层护发剂处理）：

拉伸强度 ＝0.741N

实施例 2（不含具有通式 I 结构的化合物的深层护发剂）：

拉伸强度 ＝0.786N

实施例 3（包含具有通式 I 结构的化合物的深层护发剂）：

拉伸强度 ＝0.812N