



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 109640659 B

(45) 授权公告日 2021.08.31

(21) 申请号 201780050483.8

J·P·格罗曼

(22) 申请日 2017.06.27

(74) 专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所
有限公司 11038

(65) 同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 109640659 A

代理人 邹智弘

(43) 申请公布日 2019.04.16

(51) Int.Cl.

(30) 优先权数据

A01N 43/08 (2006.01)

16176830.4 2016.06.29 EP

A61K 8/42 (2006.01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日
2019.02.18

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 5/02 (2006.01)

A61Q 19/10 (2006.01)

A01P 1/00 (2006.01)

(86) PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2017/065927 2017.06.27

(56) 对比文件

(87) PCT国际申请的公布数据
W02018/002100 EN 2018.01.04

CN 107429156 A, 2017.12.01

CN 102438451 A, 2012.05.02

CN 104582678 A, 2015.04.29

US 2993887 A, 1961.07.25

(73) 专利权人 科莱恩国际有限公司
地址 瑞士穆滕茨

审查员 李杨军

(72) 发明人 J·高金斯基 F-X·施尔
M·诺贝尔 B·西弗 U·巴克

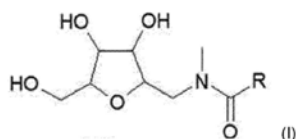
权利要求书2页 说明书49页

(54) 发明名称

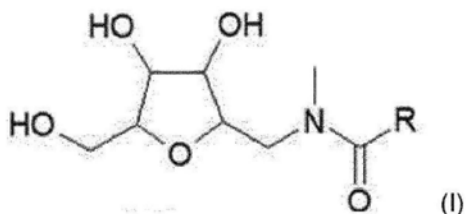
用于抑制微生物的组合物

(57) 摘要

本发明涉及用于抑制微生物的组合物以及相关的方法、制剂、浓缩物和用途。组合物包含至少30重量%的化合物X, 其中化合物X为根据式(I): 其中, R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链, 或其混合物。



1. 用于抑制微生物的组合物,其中所述组合物包含至少30重量%的化合物X,其中化合物X为根据式(I):



其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物。

2. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述组合物为水溶液。

3. 根据前述权利要求任一项所述的组合物,其中所述组合物包含至少40重量%的化合物X。

4. 根据权利要求1或2所述的组合物,其中所述组合物包含至少60重量%的化合物X。

5. 根据权利要求1或2所述的组合物,其中所述组合物为能够泵送的液体。

6. 根据权利要求1或2所述的组合物,其中所述组合物的粘度为1mPa.s至20,000mPa.s。

7. 根据权利要求1或2所述的组合物,其中化合物X为根据式(I)的化合物的混合物,其中R为 $-(CH_2)_8CH_3$ 或 $-(CH_2)_6CH_3$ 。

8. 根据权利要求1或2所述的组合物,其中所述组合物包含选自水、二醇、乙醇,及其组合的溶剂。

9. 根据权利要求1或2所述的组合物,其中所述组合物除了化合物X以外不含有任何抗微生物活性物质。

10. 用于合成根据权利要求1或2所述的组合物的方法,包括:

(a) 使N-甲基-葡萄糖胺与辛酸、癸酸或其混合物接触,以形成反应混合物;

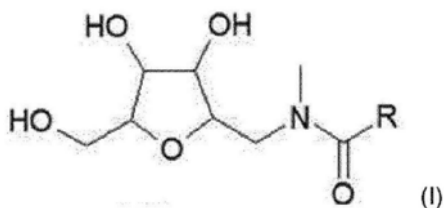
(b) 加热所述反应混合物以蒸发掉任何水;

(c) 使所述反应混合物反应至少1小时;

(d) 任选地分离根据权利要求1或2所述的组合物。

11. 防腐浓缩物,其包含:

- 化合物X,其中所述化合物X为根据式(I):



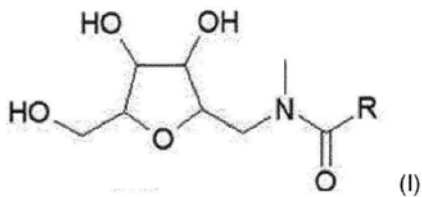
其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物;和

- 抗微生物活性物质。

12. 根据权利要求11所述的浓缩物,其中所述化合物X比所述抗微生物活性物质的重量比为1:9至9:1。

13. 根据权利要求11或12所述的浓缩物,其中所述抗微生物活性物质为防腐剂,其中所述防腐剂选自芳族醇、有机酸及其盐、羟基吡啶酮、烷基二醇、卤化的化合物、异噻唑啉酮及其组合。

14. 化合物X作为防腐剂增效剂或作为抗微生物剂的用途,其中化合物X为根据式(I):



其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物。

15. 根据权利要求14所述的用途,其中化合物X为根据式I的化合物的混合物,其中R为- $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或- $(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$ 。

16. 降低微生物的作用的方法,其中所述方法包括将根据权利要求1至9任一项所述的组合物添加至抗微生物活性物质以形成制剂。

用于抑制微生物的组合物

技术领域

[0001] 本发明涉及用于抑制微生物的组合物以及相关的方法、制剂、浓缩物和用途。

背景技术

[0002] 家用制剂,如化妆品制剂的保存延长它们的贮藏期限,并且因此使得消费者更合算。此外,防腐剂防止消费者在它们的家中或自身周围散布微生物并且因此提供健康益处。抗微生物活性物质在本领域中有充分的描述,并且存在许多可用的提供优异的性能。

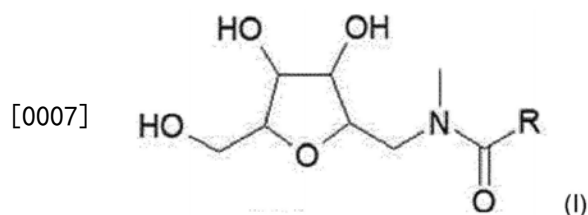
[0003] Klug等人在US-2012/0100085A1 (2012, Clariant) 中公开了液体组合物,其含有a) 5至95重量%的失水山梨醇单辛酸酯和b) 5至95重量%的一种或更多种其中公开的式(1)的醇。Klug等人在第4节中讨论了目的在于使抗微生物活性醇在化妆品、皮肤病学或药制剂中的总量保持低并且发现以增效方式支持抗微生物活性醇的抗微生物作用的皮肤病学和毒理学有害的物质。Klug等人然后继续指出,已发现失水山梨醇单辛酸酯已经是已知的并且在化妆品中用作表面活性剂和乳化剂精确地满足这些条件。

[0004] 然而,需要提供一系列复杂的保存系统,由此提供优异的抗微生物性能,同时将保存活性物质的水平保持在最低限度。与Klug等人的陈述一致,许多具有优异效力的公知的保存活性物质不是优选的,这例如由于下降的消费者接受度,健康问题或由于监管限制。出于同样的原因,这些活性物质的水平也可能(合法地)受到限制。此外,希望保存系统的所有要素都能实现可持续性目标,并确保家用制剂尽可能是环境友好的。

[0005] 因此,需要提供甚至更复杂的保存系统及其要素,其提供优异的抗微生物效果并且仍然被消费者高度接受,不会引起健康或监管问题,并且具有优异的可持续性和环境友好特性。

发明内容

[0006] 在第一方面,本发明涉及用于抑制微生物的组合物,其中组合物包含至少30重量%的化合物X,其中化合物X为根据式(I):



[0008] 其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物。

具体实施方式

[0009] 定义和一般性

[0010] 在本文件中,包括在本发明所有方面的所有实施方案中,除非另外特别说明,否则适用以下定义。所有百分比为按总组合物的重量计(w/w)。所有比例为重量比例。“重量%”

意指重量百分比。对“份”的提及,例如1份X和3份Y的混合物,为按重量计的比例。“QS”或“QSP”意指到100%或到100g的足够量。+/-表示标准偏差。所有范围都是包容性和可组合的。有效数字的数量既不表示对指示量的限制,也不表示测量的准确性。所有数值量都理解为由词语“约”修饰。所有测量都理解为在23℃和在环境条件完成,其中“环境条件”意指在压力为1个大气压(atm)和在50%相对湿度。“相对湿度”是指空气的水分含量与在相同温度和压力时的饱和水分水平相比的比例(以百分比表示)。可以采用湿度计,尤其是采用来自VWR® International的探针湿度计测量相对湿度。在本文中,“min”意指“分”或“分钟”。在本文中,“mol”意指摩尔。在本文中,在数字之后的“g”意指“克”。“Ex.”意指“实施例”。与所列成分有关的所有量基于活性物质水平(“固体”)并且不包括可能包括在商业上可得的材料中的载剂或副产物。在本文中,“包括/包含”意指另外可以有其它步骤和其它成分。“包括/包含”涵盖术语“由……组成”和“基本上由……组成”。本发明的组合物、制剂、方法、用途、试剂盒和过程可以包括/包含本文中描述的本发明的要素和限制以及任意本文中描述的另外的或任选的成分、组分/组件、步骤或限制,由它们组成和基本上由它们组成。除非说明不相容,否则本文中描述的实施方案和方面可以包括/包含尽管没有清楚组合示例的其它实施方案和/或方面的要素、特征或组分/组件或可以与尽管没有清楚组合示例的其它实施方案和/或方面的要素、特征或组分/组件组合。“在至少一个实施方案中”意指本发明的一个或更多个实施方案,任选地所有实施方案或实施方案的大的亚组具有随后描述的特征。当给出量的范围时,将这些理解为所述成分在组合物中的总量,或当多于一种物类落入成分定义的范围时,为匹配所述定义的所有成分在组合物中的总量。例如,如果组合物包含1%至5%的脂肪醇,则包含2%的硬脂醇和1%的鲸蜡醇并且不包含其它脂肪醇的组合物将会落入该范围内。

[0011] “分子量”或“M.Wt.”或“MW”和语法等价物意指数均分子量。

[0012] “粘度”在25℃使用具有冷却/加热容器和传感器系统的HAAKE Rotation Viscometer VT 550根据DIN 53019在 12.9s^{-1} 的剪切率测量。

[0013] “水溶性”是指在25℃以在水中0.1重量%的材料浓度充分溶于水中以形成对肉眼澄清的溶液的任何材料。术语“水不溶性”是指并非“水溶性”的任何材料。

[0014] “干燥(的)”或“基本上干燥(的)”意指当在25℃在环境条件测量时,包含小于5%,小于3%,或小于2%,小于1%或约0%的呈液体形式的任意化合物或组合物。呈液体形式的这样的化合物或组合物包括水、油、有机溶剂和其它润湿剂。“无水”意指组合物包含组合物总重量的小于5%,小于3%,或小于2%,小于1%或约0%的水。

[0015] “基本上不含”或“基本上不含有”意指组合物或制剂的总重量的小于1%,或小于0.8%,或小于0.5%,或小于0.3%或约0%。

[0016] “衍生物”包括,但不限于,给定化合物的酰胺、醚、酯、氨基、羧基、乙酰基、酸、盐和/或醇衍生物。在至少一个实施方案中,“其衍生物”意指酰胺、醚、酯、氨基、羧基、乙酰基、酸、盐和醇衍生物。

[0017] “单体”意指离散的、非聚合的化学结构部分,其能够经历在引发剂存在下的聚合或产生大分子的任意合适的反应,例如缩聚、加聚、阴离子或阳离子聚合。“单元”意指已经聚合,即成为聚合物的一部分的单体。

[0018] “聚合物”意指由两种或更多种单体聚合形成的化学品。术语“聚合物”应当包括通

过单体的聚合制成的所有材料以及天然聚合物。由仅一种类型的单体制成的聚合物被称为均聚物。在本文中,聚合物包含至少两个单体。由两种或更多种不同类型的单体制成的聚合物被称为共聚物。不同的单体的分布可以是随机的、交替的或嵌段的(即,嵌段共聚物)。本文中所使用的术语“聚合物”包括任意类型的聚合物,包括均聚物和共聚物。

[0019] “试剂盒”意指包括多个组件的包装。可以将“试剂盒”称为“套装试剂盒”。试剂盒的实例例如为第一组合物和单独包装的第二组合物和任选的使用说明书。

[0020] “毛发定型聚合物”意指在表面上形成膜的毛发固定性聚合物,即成膜聚合物。“毛发定型聚合物”和“成膜聚合物”在本领域中互换地使用。在毛发科学的领域中,该表面为单独的毛发纤维或其多个的表面。毛发定型聚合物导致毛发纤维胶粘在一起以连成整体(weld),这有效地交联,提供保持有益效果。在一致的情况下,这些整体形成“发网”,为消费者提供毛发保持和体积益处。当有效地形成网或整体时,保持和体积益处可以持续一整天并且提供对环境湿度的良好的耐性。

[0021] 本发明提供的益处的解释

[0022] 本发明涉及用于抑制微生物的组合物,其中所述组合物包含化合物X。化合物X涉及特定类型的一种或多种脂肪N-甲基环状葡糖酰胺。出人意料地,现已发现,这样的具体的脂肪N-甲基环状葡糖酰胺能够抑制微生物的生长。

[0023] Zech在US-2993887(1961,Atlas Powder Company)中公开了“杂环酰胺”并且提及它们可以“用作化学中间体、乳化剂、润湿和分散剂、染色助剂、抗静电剂、腐蚀抑制剂、洗涤剂、织物柔软剂和润滑剂、润滑添加剂”。在Zech的第1栏中公开的通式(I)具有取代基R、R1和R2,其可以各自选自可能的选项的非常长的列表。Zech的权利要求1要求R相当于经验式(C₆H₈(OH)₃O)。在Zech中没有关于本发明的清楚和毫无疑义地可得出的公开,不管是出于化学结构的观点还是出于目的和效果的观点。此外,Zech的从属权利要求中公开的结构以及Zech的实施例中使用的材料的描述教导技术人员远离本发明。

[0024] Piggott在US-1985424(1934,ICI)中公开了“织物助剂”和“多羟基烷基-烷基酰胺的氧化烯烃衍生物”。在Piggott中没有关于本发明的清楚和毫无疑义地可得出的公开,不管是出于化学结构的观点还是出于目的和效果的观点。尤其是,在Piggott中没有关于在此所要求保护的特定类型的脂肪N-甲基环状葡糖酰胺的明确公开。

[0025] Yutaka等人在JPH0753988(1995,Lion)中公开了洗涤剂组合物。在Yutaka中没有关于本发明的清楚和毫无疑义地可得出的公开,不管是出于化学结构的观点还是出于目的和效果的观点。

[0026] Connor等人在W0-92/06070(1992,P&G)中公开了葡糖酰胺洗涤剂的高催化剂过程。在Connor中没有关于本发明的清楚和毫无疑义地可得出的公开,不管是出于化学结构的观点还是出于目的和效果的观点。此外,由Connor的权利要求2和3的最终条款中教导技术人员避免环状葡糖酰胺化合物。

[0027] 本文中所要求保护的具体的脂肪N-甲基环状葡糖酰胺为短烷基链多元醇并且代表两亲性化合物。疏水性烷基链和亲水性头部基团促使化合物X进入油/水、水/空气或水/磷脂层的相间。由此降低了表面张力。这允许与例如微生物的细胞壁相互作用,并且在传统防腐剂的作用机理中具有重要的增效作用。化合物X可以使油/水相间稳定化,这例如通过使成分乳化或溶解在极性溶剂中或者改变表面活性剂基体系/表面活性剂溶液的粘度。

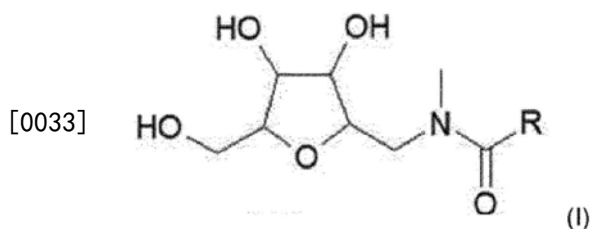
[0028] 防腐剂领域中的监管限制导致配制者具有更小的工具箱来有效地保存其制剂。合成和石油基成分由于许多原因,例如可持续性、安全性、杂质、非环境友好的工艺、废物产生、缓慢的生物降解性、消费者声誉不佳而受到公众监督。必须支持/改进较低量的防腐剂的保存效力,以便提供针对制剂被微生物污染的充分保护。由于所使用的经典防腐剂的水平方面的降低并且协同地使防腐剂增效,将防腐增效剂用于克服效力方面的差距。通常使用的防腐增效剂水溶性差或完全是水不溶性的。这使得配制它们变得困难,因为大多数制剂含有大量的水。可能必须使用增溶剂,以将成分保留在制剂中。通过本发明,可以节省增溶剂的成本,降低制剂复杂性并且减少对更多成分的储存需求。

[0029] 实际上,本发明提供了优异的性能,并且在决定保存制剂的手段时为配制者提供了优异的选择。本发明的特定类型的脂肪N-甲基环状葡糖酰胺抑制微生物的生长,因此扩展了配制者的选择。实际上,化合物X为水溶性的并且可以以1%溶解在水中,以获得澄清的溶液。类似地,可以将10%的水溶解在90%的化合物X的组合物中,以获得澄清的溶液;其由于提供相对于通常使用的酯更优的稳定性的酰胺键而在pH 4-10的pH范围内是稳定的;其可以在成本有效的反应中合成而不需要加工助剂(在酰胺化期间)。另一有利之处在于这样的事实:化合物X为粘性液体并且因此可以容易地用于各种各样的不同的制剂中。此外,本发明的特定类型的脂肪N-甲基环状葡糖酰胺基于可再生的原料葡萄糖和脂肪酸,这提供了更可持续的解决方案,其还比通常使用的增效剂如乙基己基甘油(EHG)或辛二醇更可持续。此外,葡萄糖比许多其它糖更容易获得并且糖衍生的成分被消费者高度理解和接受。此外,本发明的特定类型的脂肪N-甲基环状葡糖酰胺提供许多其它益处。由于它们的表面活性剂样结构,它们可以起水溶助长剂以及润湿剂的作用。由于它们的高HLB非离子表面活性剂样结构,它们还可以起乳化剂的作用并且出于相同原因可以起增溶剂的作用。

[0030] 在下文提供本发明的细节及其方面。

[0031] 第一方面

[0032] 第一方面涉及用于抑制微生物的组合物,其中所述组合物包含至少30重量%的化合物X,其中化合物X为根据式(I):



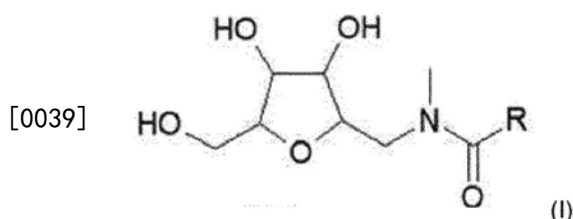
[0034] 其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物。在至少一个实施方案中,组合物包含组合物总重量的至少30重量%的化合物X的总量。

[0035] 化合物X为特定类型的脂肪N-甲基环状葡糖酰胺。式(I)包括这样的特定脂肪N-甲基环状葡糖酰胺的多种物类,其中R为可以是饱和的或不饱和的并且必须具有7或9个碳原子的烃链。在至少一个实施方案中,组合物包含至少30重量%的化合物X,其中化合物X为根据式(I)的C7和C9化合物的组合。在至少一个实施方案中,化合物X为根据式(I)的不同化合物的混合物,其中R为 $-(CH_2)_8CH_3$ 或 $-(CH_2)_6CH_3$ 。

[0036] 在至少一个实施方案中,组合物包含至少40%,优选至少50%,更优选至少60%,甚至更优选70重量%,甚至更优选至少80重量%,最优选至少90重量%的化合物X。

[0037] 在至少一个实施方案中,组合物包含唯一的根据式(I)的化合物X,并且其中R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链。换言之,组合物可以包含仅一种类型的根据式(I)的化合物X,其中R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链。具有这样的纯组合物的益处在于,可以更容易地预期与其它成分的化学相互作用。此外,当成分涉及一种类型的分子而不是更复杂的混合物时,对消费者而言更加理想。

[0038] 组合物可能需要包含最小量的一种根据式(I)的化合物X的特定物类,其中R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链。在至少一个实施方案中,组合物包含至少15重量%的化合物X,其中化合物X为根据式(I):



[0040] 其中,R为 $-(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或 $-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$ 。在至少一个实施方案中,组合物包含至少30重量%,优选至少40重量%,优选至少50重量%,更优选至少60重量%,甚至更优选70重量%,甚至更优选至少80重量%,最优选至少90重量%的根据式(I)的化合物X,其中R为 $-(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或 $-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$ 。

[0041] 在至少一个实施方案中,化合物X为根据式(I)的不同化合物的混合物,其中R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,优选其中C7:C9的重量比为3:7至7:3,优选4:6至6:4。理想的是使用不同化合物的混合物,因为可以避免纯化步骤和/或可以使用更多变的起始原料。实际上,提高的纯度通常与增加的花费相关。因此,化合物的混合物可以提供经济上的益处。

[0042] 在至少一个实施方案中,组合物为水溶液。

[0043] 在至少一个实施方案中,组合物包含溶剂。在至少一个实施方案中,组合物包含溶剂,其中溶剂包括水和/或醇。溶剂可用于以液体形式提供用于本发明中的化合物。在至少一个实施方案中,溶剂是化妆品可接受的。在至少一个实施方案中,组合物包含至少10重量%,优选至少20重量%,更优选至少30重量%,甚至更优选至少50重量%的水。水出于经济原因是有用的,但还因为它是化妆品可接受的。任选地,组合物包含水混溶性或水溶性溶剂,如低级烷基醇。在至少一个实施方案中,组合物包含 C_1 - C_5 烷基一元醇,优选 C_2 - C_3 烷基醇。可以存在的醇尤其为常规地用于化妆品目的的具有1至4个碳原子的低级一元醇或多元醇,如优选乙醇和异丙醇。

[0044] 任选地,组合物包含水溶性多元醇。在至少一个实施方案中,水溶性多元醇为在分子中具有两个或更多个羟基的多元醇。在至少一个实施方案中,水溶性多元醇选自:二元醇,如乙二醇、丙二醇、三亚甲基二醇、1,2-丁二醇、1,3-丁二醇、1,4-丁二醇、四亚甲基二醇、2,3-丁二醇、五亚甲基二醇、2-丁烯-1,4-二醇、己二醇、辛二醇;三元醇,如甘油、三羟甲基丙烷、1,2,6-己三醇等;四元醇,如季戊四醇;五元醇,如木糖醇(xylytol)等;六元醇,如山梨醇、甘露醇;多元醇聚合物,如二乙二醇、二丙二醇、聚乙二醇、聚丙二醇、四乙二醇、二甘油、聚乙二醇、三甘油、四甘油、聚甘油;二元醇烷基醚,如乙二醇单甲醚、乙二醇单乙醚、乙二醇单丁醚、乙二醇单苯基醚、乙二醇单己基醚、乙二醇单-2-甲基己基醚、乙二醇异戊

醚、乙二醇苄基醚、乙二醇异丙醚、乙二醇二甲醚、乙二醇二乙醚、乙二醇二丁醚；二元醇烷基醚，如二乙二醇单甲醚、二乙二醇单乙醚、二乙二醇单丁醚、二乙二醇二甲醚、二乙二醇二乙醚、二乙二醇二丁醚、二乙二醇甲基乙基醚、三乙二醇单甲醚、三乙二醇单乙醚、丙二醇单甲醚、丙二醇单乙醚、丙二醇单丁醚、丙二醇异丙醚、二丙二醇甲醚、二丙二醇乙醚、二丙二醇丁醚；二元醇醚酯，如乙二醇单甲醚乙酸酯、乙二醇单乙醚乙酸酯、乙二醇单丁醚乙酸酯、乙二醇单苄基醚乙酸酯、乙二醇二己二酸酯、乙二醇二琥珀酸酯、二乙二醇单乙醚乙酸酯、二乙二醇单丁醚乙酸酯、丙二醇单甲醚乙酸酯、丙二醇单乙醚乙酸酯、丙二醇单丙醚乙酸酯、丙二醇单苄基醚乙酸酯；甘油单烷基醚，如xyl alcohol、鲨油醇、鲨肝醇；糖醇，如山梨醇、麦芽醇、麦芽三糖、甘露醇、蔗糖、赤藓醇、葡萄糖、果糖、淀粉糖、麦芽糖、xylytose、淀粉糖还原醇、glysolid、四氢糠醇、POE四氢糠醇、POP丁醚、POP POE丁醚、三聚氧化丙烯甘油醚、POP甘油醚、POP甘油醚磷酸、POP POE季戊四醇醚，及其混合物。

[0045] 在优选的实施方案中，组合物包含选自水、二醇、乙醇，及其组合的溶剂。

[0046] 在优选的实施方案中，组合物包含含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂和其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、乙醇、丙醇、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇、异丁醇、丁醇、丁基乙二醇、二乙二醇丁醚、甘油，或其混合物；优选地其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、乙醇、丙醇、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇、甘油，或其混合物；更优选地，其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇，或其混合物；甚至更优选地，其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂由水组成或由水与醇的混合物组成，其中所述醇选自异丙醇、1,2-丙二醇和1,3-丙二醇。

[0047] 还可以使用天然溶剂。在至少一个实施方案中，组合物包含选自植物油、蜂蜜、植物来源的糖组合物，及其混合物的溶剂。

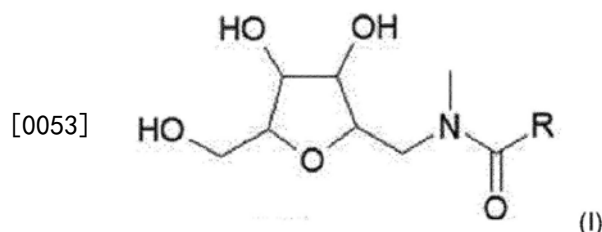
[0048] 在至少一个实施方案中，组合物为能够泵送的液体。在至少一个实施方案中，组合物为糊状的。

[0049] 在至少一个实施方案中，组合物的粘度为1mPa.s至20,000mPa.s。

[0050] 在至少一个实施方案中，组合物为除了化合物X以外基本上不含有任何抗微生物活性物质的组合物。在第三方面中更详细地讨论抗微生物活性物质。

[0051] 第一方面的实例实施方案：

[0052] 在优选的实施方案中，第一方面涉及用于抑制微生物的组合物，其中所述组合物包含至少60重量%的化合物X，其中化合物X为根据式(I)：



[0054] 其中，R为 $-(CH_2)_8CH_3$ 或 $-(CH_2)_6CH_3$ ，或其混合物；

[0055] 和其中，组合物为水溶液。

[0056] 第二方面

[0057] 第二方面涉及用于合成根据第一方面的组合物的方法，包括：

[0058] (a) 使N-甲基-葡萄糖胺与辛酸、癸酸或其混合物接触，以形成反应混合物；

[0059] (b) 加热反应混合物以蒸发掉任何水；

[0060] (c) 使反应混合物反应至少1小时；

[0061] (d) 任选地分离根据第一方面的组合物。

[0062] N-甲基-葡糖胺、辛酸和癸酸全部可得自Sigma-Aldrich。

[0063] 将“反应混合物”理解为起始原料和任选的任意溶剂或用于或可用于反应的其它材料的混合物。在至少一个实施方案中，N-甲基-葡糖胺作为水溶液添加。在至少一个实施方案中，步骤(a)中的反应混合物包括水。

[0064] 在至少一个实施方案中，步骤(b)中的加热通过将反应混合物加热至至少100℃，更优选至少110℃，甚至更优选至少115℃，甚至更优选120℃至150℃而进行。

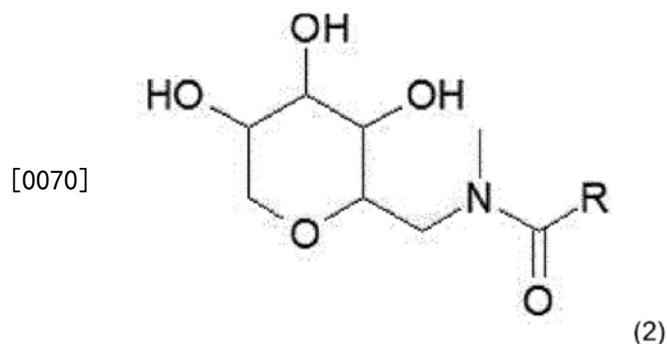
[0065] 在至少一个实施方案中，步骤(b)中的加热在真空下进行。在至少一个实施方案中，真空条件为至少20mbar压力。

[0066] 在至少一个实施方案中，步骤(c)进行至少2小时，更优选至少3小时，甚至更优选至少4小时，最优选至少6小时。

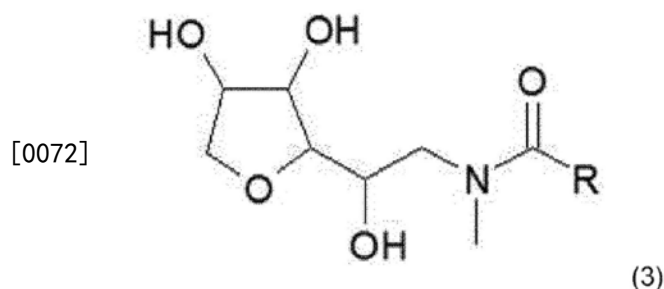
[0067] 在至少一个实施方案中，步骤(c)在至少100℃，更优选至少110℃，甚至更优选至少115℃，甚至更优选120℃至180℃，最优选140℃至170℃进行。

[0068] 在至少一个实施方案中，步骤(c)采用搅拌和在氮气气体下进行。

[0069] 在合成过程期间，可能形成许多副产物。实例包括例如根据式(2)的化合物：



[0071] 其中，R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链，或其混合物。副产物的另一个实例为根据式(3)的化合物：



[0073] 其中，R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链，或其混合物。典型地在方法中以低水平，例如组合物总重量的小于10重量%产生根据式(2)和(3)的化合物。根据式(2)和(3)的化合物也可以具有抗微生物活性。

[0074] 可能产生的其它副产物包括：N-甲基环状葡糖胺的脂肪酯；线型脂肪N-甲基-葡糖酰胺；线型脂肪N-甲基-二葡糖酰胺(即，两个葡萄糖结构部分作为极性头部基团)。

[0075] 第二方面的实例实施方案：

[0076] 在至少一个实施方案中,第二方面涉及用于合成根据第一方面的组合物的方法,包括:

[0077] (a) 提供在至少100℃的温度的N-甲基-葡萄糖胺的热熔体;

[0078] (b) 使N-甲基-葡萄糖胺与辛酸、癸酸或其混合物接触,以形成反应混合物;

[0079] (c) 加热反应混合物以蒸发掉任何水,优选通过将反应混合物加热至至少100℃,更优选至少110℃,甚至更优选至少115℃,甚至更优选120℃至150℃;

[0080] (d) 使反应混合物反应至少1小时,优选至少2小时,更优选至少3小时,甚至更优选至少4小时,最优选至少6小时;

[0081] (e) 任选地分离根据第一方面的组合物。

[0082] 在至少一个实施方案中,所述方法包括:

[0083] (a) 提供N-甲基-葡萄糖胺的水溶液;

[0084] (b) 通过从N-甲基-葡萄糖胺的水溶液中蒸发掉水,产生在至少100℃的温度的N-甲基-葡萄糖胺的热熔体;

[0085] (c) 使N-甲基-葡萄糖胺的热熔体与辛酸、癸酸或其混合物接触,以形成反应混合物;

[0086] (d) 将反应混合物加热至至少100℃,优选至少110℃,甚至更优选至少115℃,甚至更优选120℃至150℃;

[0087] (e) 使反应混合物反应至少1小时,优选至少2小时,更优选至少3小时;

[0088] (f) 任选地分离根据第一方面的组合物。

[0089] 在至少一个实施方案中,所述方法包括:

[0090] (a) 提供N-甲基-葡萄糖胺的水溶液;

[0091] (b) 通过从N-甲基-葡萄糖胺的水溶液中蒸发掉水,产生在至少100℃的温度的N-甲基-葡萄糖胺的热熔体;

[0092] (c) 使N-甲基-葡萄糖胺的热熔体与辛酸、癸酸或其混合物接触,以形成反应混合物,其中在至少100℃,优选至少110℃,甚至更优选至少115℃,甚至更优选120℃至150℃的温度进行接触;

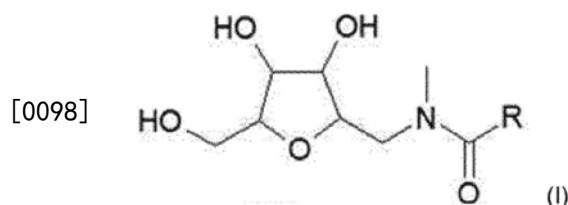
[0093] (d) 使反应混合物反应至少1小时,优选至少2小时,更优选至少3小时;并且在至少100℃,优选至少110℃,甚至更优选至少115℃,甚至更优选120℃至150℃的温度;和采用搅拌和在氮气气体下;

[0094] (e) 任选地分离根据第一方面的组合物。

[0095] 第三方面

[0096] 第三方面涉及防腐浓缩物,其包含:

[0097] -化合物X,其中化合物X为根据式(I):



[0099] 其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物;和

[0100] -抗微生物活性物质。

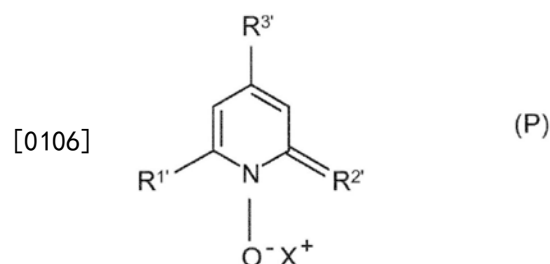
[0101] 在至少一个实施方案中,化合物X为根据式(I)的化合物的混合物,其中R为 $-(CH_2)_8CH_3$ 或 $-(CH_2)_6CH_3$ 。

[0102] 在至少一个实施方案中,浓缩物包含1重量%至99重量%,或5重量%至90重量%,或5重量%至95重量%,或20重量%至80重量%,或30重量%至80重量%的化合物X。

[0103] 在至少一个实施方案中,浓缩物包含1重量%至99重量%,或5重量%至95重量%,10重量%至95重量%,或20重量%至80重量%,或20重量%至70重量%的抗微生物活性物质。

[0104] 在至少一个实施方案中,化合物X比抗微生物活性物质的重量比为1:9至9:1。

[0105] 在至少一个实施方案中,抗微生物活性物质选自:芳族醇、有机酸及其盐、根据式(P)的化合物、烷基二醇、卤化的化合物、异噻唑啉酮、防腐增效剂及其组合;其中式(P)为如下:



[0107] 其中,

[0108] $R^{1'}$ 独立地选自H,未取代的或卤素取代的、支化的或未支化的 C_1 - C_{20} -烷基基团,未取代的或卤素取代的 C_5 - C_8 -环烷基基团,未取代的或卤素取代的 C_6 - C_{10} -芳基基团或者未取代的或卤素取代的、支化的或未支化的 C_7 - C_{20} -芳烷基基团;

[0109] $R^{2'}$ 为O或S,

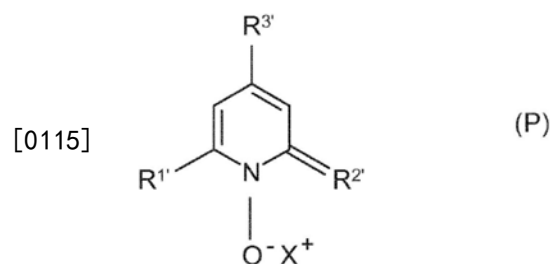
[0110] $R^{3'}$ 为H或 C_1 - C_4 -烷基基团;

[0111] X^+ 为阳离子。

[0112] 优选地, $R^{3'}$ 为甲基。

[0113] 在至少一个实施方案中,芳族醇选自苯甲醇、苯氧乙醇、藜芦醇、亚丙基苯氧乙醇、苯乙醇、苯基丙醇、香兰素、2-甲基-1-苯基-2-丙醇及其组合。

[0114] 在至少一个实施方案中,有机酸及其盐选自苯甲酸、山梨酸、脱氢乙酸、乳酸、水杨酸、对甲氧基苯甲酸、十一烯酸、乙醇酸、丙酸,及其组合。



[0116] 在至少一个实施方案中,根据式(P)的化合物选自2-羟基吡啶-N-氧化物、2-巯基吡啶-1-氧化物及其盐、1-羟基-4-甲基-6-(2,4,4-三甲基戊基)-2(1H)-吡啶酮及其盐(优选单乙醇胺盐),及其组合。式(P)公开了并且涵盖这些化合物的互变异构等价物,因为总是存在平衡。在至少一个实施方案中,根据式(P)的化合物为羟吡酮。

[0117] 在至少一个实施方案中,烷基二醇选自1,2-戊二醇、1,2-己二醇、1,6-己二醇、1,2-辛二醇、1,2-癸二醇、甲基丙二醇,及其组合。

[0118] 在至少一个实施方案中,卤化的化合物选自氯己定及其盐、三氯生(triclosan)、氯苯甘醚、trichlorcarban、氯二价酚、丁基氨基甲酸碘代丙炔酯、Bonopol、甘宝素,及其组合。

[0119] 在至少一个实施方案中,异噻唑啉酮选自甲基异噻唑啉酮、甲基氯异噻唑啉酮、苄基异噻唑啉酮及其组合。

[0120] 在至少一个实施方案中,防腐增效剂选自乙基己基甘油、失水山梨醇辛酸酯、异山梨醇辛酸酯、辛酸甘油酯、十一烯酸甘油酯,及其组合。

[0121] 在至少一个实施方案中,防腐增效剂为乙基己基甘油。

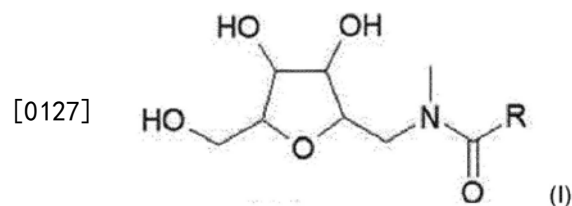
[0122] 在至少一个实施方案中,抗微生物活性物质选自防腐增效剂和防腐剂。

[0123] 在至少一个实施方案中,防腐剂选自芳族醇、有机酸及其盐、羟基吡啶酮、烷基二醇、卤化的化合物、异噻唑啉酮及其组合。

[0124] 在至少一个实施方案中,防腐剂选自羟基-4-甲基-6-(2,4,4-三甲基戊基)-2(1H)-吡啶酮、苯甲酸、苯乙醇、苯甲醇、苯氧乙醇、其盐,及其组合。

[0125] 在至少一个实施方案中,防腐浓缩物包含:

[0126] -化合物X,其中化合物X为根据式(I):



[0128] 其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物;和

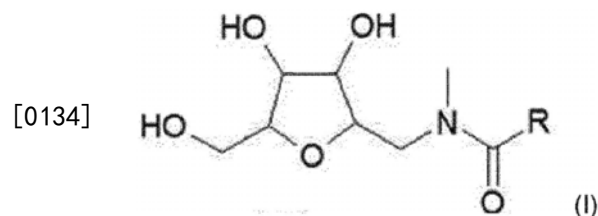
[0129] -至少一种防腐增效剂;和

[0130] -至少一种防腐剂,其中防腐剂优选选自芳族醇、有机酸及其盐、羟基吡啶酮、烷基二醇、卤化的化合物、异噻唑啉酮及其组合。

[0131] 优选地,防腐增效剂选自乙基己基甘油、失水山梨醇辛酸酯、异山梨醇辛酸酯、辛酸甘油酯、十一烯酸甘油酯,及其组合。

[0132] 优选地,防腐浓缩物包含:

[0133] -化合物X,其中化合物X为根据式(I):



[0135] 其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物;优选地,其中R为 $-(CH_2)_8CH_3$ 或 $-(CH_2)_6CH_3$;和

[0136] -失水山梨醇单辛酸酯;和

[0137] -苯甲醇。

[0138] 在至少一个实施方案中,浓缩物基本上不含有防腐增效剂。

[0139] 在至少一个实施方案中,浓缩物为水溶液。

[0140] 在至少一个实施方案中,浓缩物包含溶剂。在至少一个实施方案中,浓缩物包含溶剂,其中溶剂包括水和/或醇。溶剂可用于以液体形式提供用于本发明中的化合物。在至少一个实施方案中,溶剂是化妆品可接受的。在至少一个实施方案中,浓缩物包含至少10重量%,优选至少20重量%,更优选至少30重量%,甚至更优选至少50重量%的水。水出于经济原因是有用的,但还因为它是化妆品可接受的。任选地,浓缩物包含水混溶性或水溶性溶剂,如低级烷基醇。在至少一个实施方案中,浓缩物包含C₁-C₅烷基一元醇,优选C₂-C₃烷基醇。可以存在的醇尤其为常规地用于化妆品目的的具有1至4个碳原子的低级一元醇或多元醇,如优选乙醇和异丙醇。

[0141] 任选地,浓缩物包含水溶性多元醇。在至少一个实施方案中,水溶性多元醇为分子中具有两个或更多个羟基的多元醇。在至少一个实施方案中,水溶性多元醇选自:二元醇,如乙二醇、丙二醇、三亚甲基二醇、1,2-丁二醇、1,3-丁二醇、1,4-丁二醇、四亚甲基二醇、2,3-丁二醇、五亚甲基二醇、2-丁烯-1,4-二醇、己二醇、辛二醇;三元醇,如甘油、三羟甲基丙烷、1,2,6-己三醇等;四元醇,如季戊四醇;五元醇,如木糖醇等;六元醇,如山梨醇、甘露醇;多元醇聚合物,如二乙二醇、二丙二醇、聚乙二醇、聚丙二醇、四乙二醇、二甘油、聚乙二醇、三甘油、四甘油、聚甘油;二元醇烷基醚,如乙二醇单甲醚、乙二醇单乙醚、乙二醇单丁醚、乙二醇单苯基醚、乙二醇单己基醚、乙二醇单-2-甲基己基醚、乙二醇异戊醚、乙二醇苄基醚、乙二醇异丙醚、乙二醇二甲醚、乙二醇二乙醚、乙二醇二丁醚;二元醇烷基醚,如二乙二醇单甲醚、二乙二醇单乙醚、二乙二醇单丁醚、二乙二醇二甲醚、二乙二醇二乙醚、二乙二醇丁醚、二乙二醇甲基乙基醚、三乙二醇单甲醚、三乙二醇单乙醚、丙二醇单甲醚、丙二醇单乙醚、丙二醇单丁醚、丙二醇异丙醚、二丙二醇甲醚、二丙二醇乙醚、二丙二醇丁醚;二元醇醚酯,如乙二醇单甲醚乙酸酯、乙二醇单乙醚乙酸酯、乙二醇单丁醚乙酸酯、乙二醇单苯基醚乙酸酯、乙二醇二己二酸酯、乙二醇二琥珀酸酯、二乙二醇单乙醚乙酸酯、二乙二醇单丁醚乙酸酯、丙二醇单甲醚乙酸酯、丙二醇单乙醚乙酸酯、丙二醇单丙醚乙酸酯、丙二醇单苯基醚乙酸酯;甘油单烷基醚,如xyl醇、鲨油醇、鲨肝醇;糖醇,如山梨醇、麦芽醇、麦芽三糖、甘露醇、蔗糖、赤藓醇、葡萄糖、果糖、淀粉糖、麦芽糖、xylytose、淀粉糖还原醇、glysolid、四氢糠醇、POE四氢糠醇、POP丁醚、POP POE丁醚、三聚氧化丙烯甘油醚、POP甘油醚、POP甘油醚磷酸、POP POE季戊四醇醚,及其混合物。

[0142] 在优选的实施方案中,浓缩物包含选自水、二醇、乙醇,及其组合的溶剂。

[0143] 在优选的实施方案中,浓缩物包含含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂和其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、乙醇、丙醇、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇、异丁醇、丁醇、丁基乙二醇、二乙二醇丁醚、甘油,或其混合物;优选地其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、乙醇、丙醇、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇、甘油,或其混合物;更优选地,其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇,或其混合物;甚至更优选地,其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂由水组成或由水与醇的混合物组成,其中所述醇选自异丙醇、1,2-丙二醇和1,3-丙二醇。

[0144] 还可以使用天然溶剂。在至少一个实施方案中,浓缩物包含选自植物油、蜂蜜、植物来源的糖组合物,及其混合物的溶剂。

[0145] 在至少一个实施方案中,浓缩物包含化妆品学、药学和皮肤病学中通常使用的添

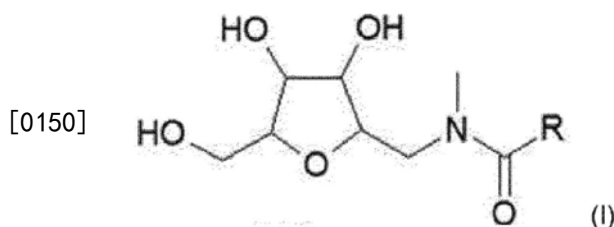
加剂,其在下文中称为助剂。在至少一个实施方案中,助剂选自油状物质、乳化剂、助乳化剂、阳离子聚合物、成膜剂、富脂剂、稳定剂、活性生物源物质、甘油、防腐剂、珠光剂、染料和香料、溶剂、遮光剂、官能酸以及还有蛋白质衍生物如明胶、胶原蛋白水解物、天然或合成基多肽、蛋黄、卵磷脂、羊毛脂和羊毛脂衍生物、脂肪醇、有机硅、除臭剂、具有角质层分离和角质层形成(keratoplastic)作用的物质、酶和/或载剂/溶剂。优选地,助剂选自油状物质、乳化剂、助乳化剂、阳离子聚合物、成膜剂、富脂剂、稳定剂、活性生物源物质、甘油、珠光剂、染料、香料、遮光剂、官能酸、蛋白质衍生物如明胶、胶原蛋白水解物、天然或合成基多肽、蛋黄、卵磷脂、羊毛脂和羊毛脂衍生物、脂肪醇、有机硅、除臭剂、具有角质层分离和角质层形成作用的物质、酶,及其组合。

[0146] 在至少一个实施方案中,浓缩物包含水溶性微生物和它们的衍生物、水溶性氨基酸和它们的盐和/或衍生物、粘度调节剂、染料、非挥发性溶剂或稀释剂(水溶性和水不溶性)、珠光助剂、增稠剂、泡沫促进剂、另外的表面活性剂或非离子助表面活性剂、灭虱剂(pediculocide)、pH调节剂、香精、防腐剂、螯合剂、蛋白质、皮肤活性剂、防晒剂、UV吸收剂、维生素、烟酰胺、咖啡因、米诺地尔及其组合。在至少一个实施方案中,浓缩物包含0重量%至5重量%的维生素和氨基酸,按浓缩物的总重量计。浓缩物还可以包含颜料材料,如无机、亚硝基、单偶氮、双偶氮、类胡萝卜素、三苯基甲烷、三芳基甲烷、咕吨、喹啉、噁嗪、吡嗪、葱醌、靛系、硫靛系(thionindigoid)、喹吖啶酮、酞菁(phthalocyanine)、植物性、天然颜料,包括:水溶性组分,如具有C.I.名称的那些。浓缩物可以包含0重量%,优选0.0001重量%至5重量%的颜料材料。

[0147] 第三方面的实例实施方案:

[0148] 在至少一个实施方案中,第三方面涉及由以下组成的防腐浓缩物:

[0149] -化合物X,其中化合物X为根据式(I):



[0151] 其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物;和

[0152] -抗微生物活性物质;

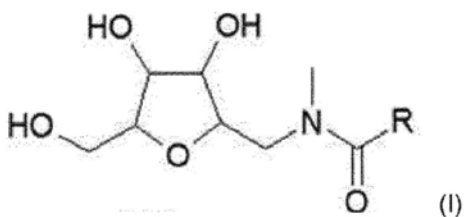
[0153] -任选的溶剂;

[0154] -任选的助剂,其中助剂选自油状物质、乳化剂、助乳化剂、阳离子聚合物、成膜剂、富脂剂、稳定剂、活性生物源物质、甘油、珠光剂、染料、香料、遮光剂、官能酸、蛋白质衍生物如明胶、胶原蛋白水解物、天然或合成基多肽、蛋黄、卵磷脂、羊毛脂和羊毛脂衍生物、脂肪醇、有机硅、除臭剂、具有角质层分离和角质层形成作用的物质、酶,及其组合。

[0155] 在至少一个实施方案中,第三方面涉及由以下组成的防腐浓缩物:

[0156] -至少15重量%的化合物X,其中化合物X为根据式(I)

[0157]



[0158] 其中化合物X为根据式 (I) 的化合物的混合物

[0159] 其中R为 $-(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或 $-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$;和

[0160] -至少10重量%的抗微生物活性物质;

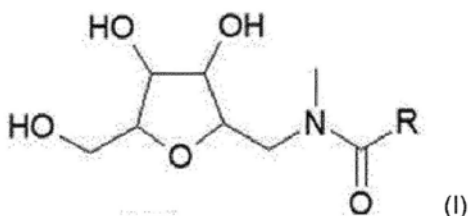
[0161] -任选的至少75重量%的溶剂;

[0162] -任选的助剂,其中助剂选自油状物质、乳化剂、助乳化剂、阳离子聚合物、成膜剂、富脂剂、稳定剂、活性生物源物质、甘油、珠光剂、染料、香料、遮光剂、官能酸、蛋白质衍生物如明胶、胶原蛋白水解物、天然或合成基多肽、蛋黄、卵磷脂、羊毛脂和羊毛脂衍生物、脂肪醇、有机硅、除臭剂、具有角质层分离和角质层形成作用的物质、酶,及其组合。

[0163] 在至少一个实施方案中,第三方面涉及由以下组成的防腐浓缩物:

[0164] -至少15重量%的化合物X,其中化合物X为根据式 (I)

[0165]



[0166] 其中,化合物X为根据式 (I) 的化合物的混合物

[0167] 其中,R为 $-(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或 $-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$;和

[0168] -防腐剂,其中防腐剂选自羟基-4-甲基-6-(2,4,4-三甲基戊基)-2(1H)-吡啶酮、苯甲酸、苯乙醇、苯甲醇、苯氧乙醇、其盐,及其组合;

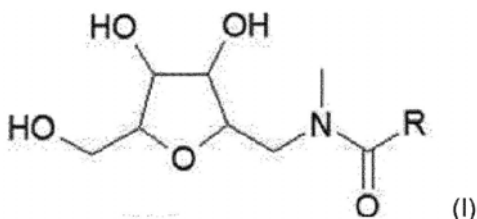
[0169] -任选的溶剂;

[0170] -任选的助剂,其中助剂选自油状物质、乳化剂、助乳化剂、阳离子聚合物、成膜剂、富脂剂、稳定剂、活性生物源物质、甘油、珠光剂、染料、香料、遮光剂、官能酸、蛋白质衍生物如明胶、胶原蛋白水解物、天然或合成基多肽、蛋黄、卵磷脂、羊毛脂和羊毛脂衍生物、脂肪醇、有机硅、除臭剂、具有角质层分离和角质层形成作用的物质、酶,及其组合。

[0171] 在至少一个实施方案中,第三方面涉及由以下组成的防腐浓缩物:

[0172] -至少15重量%的化合物X,其中化合物X为根据式 (I)

[0173]



[0174] 其中,化合物X为根据式 (I) 的化合物的混合物

[0175] 其中,R为 $-(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或 $-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$;和

[0176] -至少10重量%的防腐剂,其中防腐剂选自羟基-4-甲基-6-(2,4,4-三甲基戊基)-

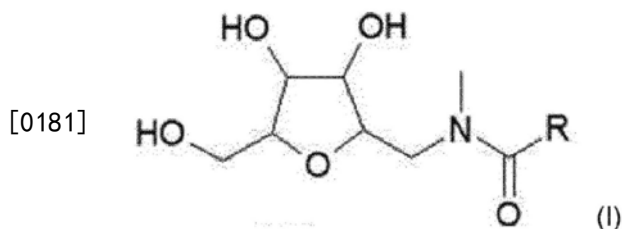
2 (1H) -吡啶酮、苯甲酸、苯乙醇、苯甲醇、苯氧乙醇、其盐, 及其组合;

[0177] -任选的溶剂;

[0178] -任选的助剂, 其中助剂选自油状物质、乳化剂、助乳化剂、阳离子聚合物、成膜剂、富脂剂、稳定剂、活性生物源物质、甘油、珠光剂、染料、香料、遮光剂、官能酸、蛋白质衍生物如明胶、胶原蛋白水解物、天然或合成基多肽、蛋黄、卵磷脂、羊毛脂和羊毛脂衍生物、脂肪醇、有机硅、除臭剂、具有角质层分离和角质层形成作用的物质、酶, 及其组合。

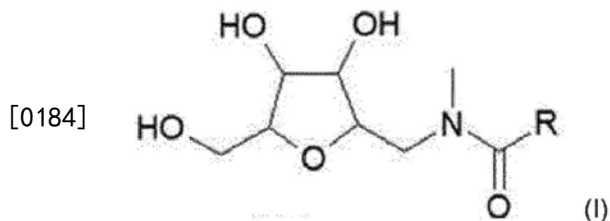
[0179] 第四方面

[0180] 第四方面涉及化合物X作为防腐增效剂或作为抗微生物剂的用途, 其中化合物X为根据式 (I) :



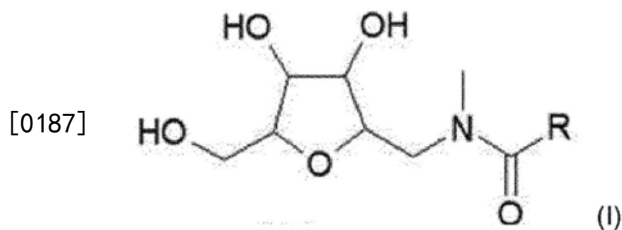
[0182] 其中, R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链, 或其混合物。优选地, 化合物X为根据式 (I) 的化合物的混合物, 其中R为 $-(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或 $-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$ 。

[0183] 至少一个实施方案涉及化合物X作为抗真菌剂的用途, 其中化合物X为根据式 (I) :



[0185] 其中, R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链, 或其混合物。优选地, 化合物为根据式 (I) 的化合物的混合物, 其中, R为 $-(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或 $-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$ 。

[0186] 第四方面的替代性实施方案涉及化合物X作为乳化剂或增溶剂的用途, 其中化合物X为根据式 (I) :



[0188] 其中, R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链, 或其混合物。优选地, 化合物为根据式 (I) 的化合物的混合物, 其中, R为 $-(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$ 或 $-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$ 。

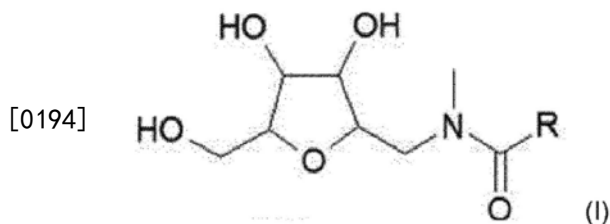
[0189] 第五方面

[0190] 第五方面涉及降低微生物的作用的方法, 其中所述方法包括将根据第一方面的组合物添加至抗微生物活性物质以形成制剂。在至少一个实施方案中, 制剂为根据第六方面。

[0191] 在至少一个实施方案中, 添加至制剂的组合物水平为制剂的总重量的0.001重量%至20重量%, 优选0.01重量%至10重量%, 更优选0.1重量%至5重量%。

[0192] 第六方面

[0193] 第六方面涉及包含根据式 (I) 的化合物X的制剂



[0195] 其中,R为具有7或9个碳原子的饱和的或不饱和的烃链,或其混合物。在至少一个实施方案中,制剂包含0.001重量%至20重量%,优选0.01重量%至10重量%,更优选0.1重量%至5重量%的化合物X,按制剂的总重量计。优选地,化合物为根据式 (I) 的化合物的混合物,其中,R为 $-(CH_2)_8CH_3$ 或 $-(CH_2)_6CH_3$ 。

[0196] 在至少一个实施方案中,制剂包含根据第一方面的组合物和/或根据第三方面的浓缩物。

[0197] 在至少一个实施方案中,制剂选自化妆品制剂和家用清洁制剂。

[0198] 在至少一个实施方案中,制剂为选自以下的制剂:洗发剂、沐浴露、洁面乳、清洁面膜、气泡浴、沐浴油、清洁乳、胶束水、卸妆剂、清洁湿巾、香水、皂、剃须皂、剃须膏和洁面泡沫。

[0199] 在至少一个实施方案中,制剂为用于清洁毛发和/或皮肤的化妆品制剂。

[0200] 在至少一个实施方案中,制剂为水溶液。

[0201] 在至少一个实施方案中,制剂包含溶剂。在至少一个实施方案中,制剂包含溶剂,其中溶剂包括水和/或醇。溶剂可用于以液体形式提供用于本发明中的化合物。在至少一个实施方案中,溶剂是化妆品可接受的。在至少一个实施方案中,制剂包含至少10重量%,优选至少20重量%,更优选至少30重量%,甚至更优选至少50重量%的水。水出于经济原因是有用的,但还因为它是化妆品可接受的。任选地,制剂包含水混溶性或水溶性溶剂,如低级烷基醇。在至少一个实施方案中,制剂包含 C_1 - C_5 烷基一元醇,优选 C_2 - C_3 烷基醇。可以存在的醇尤其为常规地用于化妆品目的的具有1至4个碳原子的低级一元醇或多元醇,如优选乙醇和异丙醇。

[0202] 任选地,制剂包含水溶性多元醇。在至少一个实施方案中,水溶性多元醇为分子中具有两个或更多个羟基的多元醇。在至少一个实施方案中,水溶性多元醇选自:二元醇,如乙二醇、丙二醇、三亚甲基二醇、1,2-丁二醇、1,3-丁二醇、1,4-丁二醇、四亚甲基二醇、2,3-丁二醇、五亚甲基二醇、2-丁烯-1,4-二醇、己二醇、辛二醇;三元醇,如甘油、三羟甲基丙烷、1,2,6-己三醇等;四元醇,如季戊四醇;五元醇,如木糖醇等;六元醇,如山梨醇、甘露醇;多元醇聚合物,如二乙二醇、二丙二醇、聚乙二醇、聚丙二醇、四乙二醇、二甘油、聚乙二醇、三甘油、四甘油、聚甘油;二元醇烷基醚,如乙二醇单甲醚、乙二醇单乙醚、乙二醇单丁醚、乙二醇单苯基醚、乙二醇单己基醚、乙二醇单-2-甲基己基醚、乙二醇异戊醚、乙二醇苄基醚、乙二醇异丙醚、乙二醇二甲醚、乙二醇二乙醚、乙二醇二丁醚;二元醇烷基醚,如二乙二醇单甲醚、二乙二醇单乙醚、二乙二醇单丁醚、二乙二醇二甲醚、二乙二醇二乙醚、二乙二醇丁醚、二乙二醇甲基乙基醚、三乙二醇单甲醚、三乙二醇单乙醚、丙二醇单甲醚、丙二醇单乙醚、丙二醇单丁醚、丙二醇异丙醚、二丙二醇甲醚、二丙二醇乙醚、二丙二醇丁醚;二元醇醚酯,如乙二醇单甲醚乙酸酯、乙二醇单乙醚乙酸酯、乙二醇单丁醚乙酸酯、乙二醇单苯基醚乙酸

酯、乙二醇二己二酸酯、乙二醇二琥珀酸酯、二乙二醇单乙醚乙酸酯、二乙二醇单丁醚乙酸酯、丙二醇单甲醚乙酸酯、丙二醇单乙醚乙酸酯、丙二醇单丙醚乙酸酯、丙二醇单苯基醚乙酸酯；甘油单烷基醚，如xyl alcohol、鲨油醇、鲨肝醇；糖醇，如山梨醇、麦芽醇、麦芽三糖、甘露醇、蔗糖、赤藓醇、葡萄糖、果糖、淀粉糖、麦芽糖、xylytose、淀粉糖还原醇、glysolid、四氢糠醇、POE四氢糠醇、POP丁醚、POP POE丁醚、三聚氧化丙烯甘油醚、POP甘油醚、POP甘油醚磷酸、POP POE季戊四醇醚，及其混合物。

[0203] 在优选的实施方案中，制剂包含选自水、二醇、乙醇，及其组合的溶剂。

[0204] 在优选的实施方案中，制剂包含含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂，和其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、乙醇、丙醇、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇、异丁醇、丁醇、丁基乙二醇、二乙二醇丁醚、甘油，或其混合物；优选地其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、乙醇、丙醇、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇、甘油，或其混合物；更优选地，其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂包括水、异丙醇、1,2-丙二醇、1,3-丙二醇，或其混合物；甚至更优选地，其中所述含水的、含醇的或含水-含醇的溶剂由水组成或由水与醇的混合物组成，其中所述醇选自异丙醇、1,2-丙二醇和1,3-丙二醇。

[0205] 还可以使用天然溶剂。在至少一个实施方案中，制剂包含选自植物油、蜂蜜、植物来源的糖组合物，及其混合物的溶剂。

[0206] 在至少一个实施方案中，制剂包含化妆品学、药学和皮肤病学中通常使用的添加剂，其在下文中称为助剂。在至少一个实施方案中，助剂选自油状物质、乳化剂、助乳化剂、阳离子聚合物、成膜剂、富脂剂、稳定剂、活性生物源物质、甘油、防腐剂、珠光剂、染料和香料、溶剂、遮光剂、官能酸，以及还有蛋白质衍生物如明胶、胶原蛋白水解物、天然或合成基多肽、蛋黄、卵磷脂、羊毛脂和羊毛脂衍生物、脂肪醇、有机硅、除臭剂、具有角质层分离和角质层形成作用的物质、酶和/或载剂/溶剂。

[0207] 在至少一个实施方案中，制剂包含水溶性维生素和它们的衍生物、水溶性氨基酸和它们的盐和/或衍生物、粘度调节剂、染料、非挥发性溶剂或稀释剂（水溶性和水不溶性）、珠光助剂、增稠剂、泡沫促进剂、另外的表面活性剂或非离子助表面活性剂、灭虱剂、pH调节剂、香精、防腐剂、螯合剂、蛋白质、皮肤活性剂、防晒剂、UV吸收剂、维生素、烟酰胺、咖啡因、米诺地尔及其组合。在至少一个实施方案中，制剂包含0重量%至5重量%的维生素和氨基酸，按制剂的总重量计。制剂还可以包含颜料材料，如无机、亚硝基、单偶氮、双偶氮、类胡萝卜素、三苯基甲烷、三芳基甲烷、咕吨、喹啉、噁嗪、吡嗪、蒽醌、靛系、硫靛系、喹吡啶酮、酞菁、植物性、天然颜料，包括：水溶性组分，如具有C.I.名称的那些。制剂可以包含0重量%，优选0.0001重量%至5重量%的颜料材料。

[0208] 在至少一个实施方案中，制剂包含油状物质，其为在室温（25℃）为液体的任意脂肪物质。在至少一个实施方案中，制剂包含选自以下的油状物质：硅油，挥发性或非挥发性、直链、支链或环状、任选被有机改性的；苯基有机硅；有机硅树脂和硅酮胶；矿物油如石蜡油或凡士林油；动物源的油如全氢化角鲨烯、羊毛脂；植物源的油如液体甘油三酯，例如葵花籽油、玉米油、大豆油、米糠油、霍霍巴油、巴巴苏油（babusscu oil）、南瓜油、葡萄籽油、芝麻油、核桃油、杏仁油、澳洲坚果油、鳄梨油、甜杏仁油、酢浆草油、蓖麻油、辛酸/癸酸甘油三酯、橄榄油、花生油、菜籽油、摩洛哥坚果油、海甘蓝籽油和椰子油；合成油如purcellin油、异链烷烃、直链和/或支链脂肪醇和脂肪酸酯，优选具有6至18个，优选8至10个碳原子的吉

尔伯特 (guerbet) 醇;直链直链 (C_6-C_{13}) 脂肪酸与直链 (C_6-C_{20}) 脂肪醇的酯;支链 (C_6-C_{13}) 羧酸与直链 (C_6-C_{20}) 脂肪醇的酯,直链 (C_6-C_{18}) 脂肪酸与支链醇,特别是2-乙基己醇的酯;直链和/或支链脂肪酸与多元醇(例如二聚二醇或三聚二醇)和/或吉尔伯特醇的酯;基于 (C_6-C_{10}) 脂肪酸的甘油三酯;酯如己二酸二辛酯、二聚二亚油酸二异丙酯;丙二醇/二辛酸酯或者蜡如蜂蜡、石蜡或微晶蜡,单独的或与亲水性蜡,例如鲸蜡硬脂醇组合;氟化和全氟化的油;氟化的硅油;前述化合物的混合物。

[0209] 在至少一个实施方案中,制剂包含非离子助乳化剂。在至少一个实施方案中,非离子助乳化剂例如选自0至30mol氧化乙烯和/或0至5mol氧化丙烯与具有8至22个碳原子的直链脂肪醇、与具有12至22个碳原子的脂肪酸、与烷基中具有8至15个碳原子的烷基酚和与失水山梨醇或山梨醇酯的加合物;0至30mol氧化乙烯与甘油的加合物的 ($C_{12}-C_{18}$) 脂肪酸单酯和二酯;具有6至22个碳原子的饱和和不饱和脂肪酸的甘油单酯和二酯以及失水山梨醇单酯和二酯,当适当时的它们的氧化乙烯加合物;15至60mol氧化乙烯与蓖麻油和/或氢化蓖麻油的加合物;多元醇酯并且特别是聚甘油酯,如聚蓖麻酸聚甘油酯和聚-12-羟基硬脂酸聚甘油酯。类似地合适的是,来自一种或更多种这些类别的物质的化合物的混合物。合适的离子化助乳化剂的实例包括阴离子乳化剂,如磷酸单酯、磷酸二酯或磷酸三酯,但还有阳离子乳化剂,如单烷基季铵盐、二烷基季铵盐和三烷基季铵盐以及它们的聚合物衍生物。

[0210] 在至少一个实施方案中,制剂包含阳离子聚合物。合适的阳离子聚合物包括以INCI名称“聚季铵盐 (Polyquaternium)”已知的那些,特别是聚季铵盐-31、聚季铵盐-16、聚季铵盐-24、聚季铵盐-7、聚季铵盐-22、聚季铵盐-39、聚季铵盐-28、聚季铵盐-2、聚季铵盐-10、聚季铵盐-11,以及还有聚季铵盐37&矿物油&PPG十三烷醇聚醚 (trideceth) (Salcare SC95)、PVP-二甲氨基乙基甲基丙烯酸酯共聚物、瓜尔胶-羟丙基三铵盐酸盐,以及还有藻酸钙和藻酸铵。另外可以使用阳离子纤维素衍生物;阳离子淀粉;二烯丙基铵盐和丙烯酰胺的共聚物;季铵化的乙烯基吡咯烷酮/乙烯基咪唑聚合物;聚甘醇和胺的缩合产物;季铵化的胶原蛋白多肽;季铵化的小麦多肽;聚乙烯亚胺;阳离子有机硅聚合物,例如酰氨基聚甲基硅氧烷;己二酸与二甲氨基羟丙基二亚乙基三胺的共聚物;聚氨基聚酰胺和阳离子甲壳质衍生物,例如壳聚糖。

[0211] 在至少一个实施方案中,制剂包含富脂剂。作为富脂剂,可以使用例如以下的物质:聚乙氧基化的羊毛脂衍生物,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,后者同时充当泡沫稳定剂。可得的增湿剂例如包括棕榈酸异丙酯、甘油和/或山梨醇。

[0212] 在至少一个实施方案中,制剂包含稳定剂。作为稳定剂,例如可以使用脂肪酸的金属盐,如硬脂酸镁、硬脂酸铝和/或硬脂酸锌。

[0213] 在至少一个实施方案中,制剂包含护理添加剂。可以将制剂与常规神经酰胺、假神经酰胺 (pseudoceramide)、脂肪酸N-烷基聚羟基烷基酰胺、胆固醇、胆固醇脂肪酸酯、脂肪酸、甘油三酯、脑苷脂、磷脂、泛醇和作为护理添加剂的类似物质混合。

[0214] 在至少一个实施方案中,制剂包含抗真菌物质。在至少一个实施方案中,抗真菌物质选自酮康唑,奥昔康唑,联苯苄唑,布康唑,氯康唑,克霉唑,益康唑,恩利康唑,芬替康唑,异康唑,咪康唑,舒康唑,噻康唑,氟康唑,伊曲康唑,特康唑,萘替芬和特比萘芬,吡啶硫酮锌、羟吡酮及其组合。在至少一个实施方案中,制剂包含0.1重量%至1重量%的在制剂中的抗真菌物质的总量。在至少一个实施方案中,制剂包含吡啶硫酮抗头皮屑颗粒,例如1-羟

基-2-吡啶硫酮盐为高度优选的颗粒状抗头皮屑剂。吡啶硫酮抗头皮屑颗粒物的浓度可以在0.1重量%至4重量%范围内,基于制剂的总重量计,优选0.1重量%至3重量%,更优选0.3重量%至2重量%。优选的吡啶硫酮盐包括由重金属如锌、锡、镉、镁、铝和锆,优选锌形成的那些,更优选1-羟基-2-吡啶硫酮的锌盐(称为“吡啶硫酮锌”或“ZPT”),更优选小片状颗粒形式的1-羟基-2-吡啶硫酮盐。由其它阳离子如钠形成的盐也可以是合适的。吡啶硫酮抗头皮屑剂描述于例如US-2,809,971;US-3,236,733;US-3,753,196;US-3,761,418;US-4,345,080;US-4,323,683;US-4,379,753;和US-4,470,982中。当将ZPT作为抗头皮屑颗粒物用于本文中的制剂中时,预期可以刺激或调节毛发的生长和再生长或这二者,或者可以减少或抑制毛发损失,或者毛发可以看起来更厚实或更丰满。

[0215] 官能酸为在应用时用于将临床功能赋予皮肤或毛发的酸性物质。合适的官能酸包括 α -羟基酸、 β -羟基酸、乳酸、视黄酸和类似物质。

[0216] 在至少一个实施方案中,制剂包含收敛剂。在至少一个实施方案中,收敛剂选自氧化镁、氧化铝、二氧化钛、二氧化锆、氧化锌、氧化物水合物、氧化铝水合物(勃姆石)和氢氧化物,钙、镁、铝、钛、锆或锌的氯化物水合物。在至少一个实施方案中,制剂包含0.001重量%至10重量%,或0.01重量%至9重量%,或0.05重量%至8重量%,或0.1重量%至5重量%的收敛剂。

[0217] 在至少一个实施方案中,制剂包含除臭剂。在至少一个实施方案中,除臭剂选自尿囊素、红没药醇及其组合。在至少一个实施方案中,制剂包含0.001重量%至10重量%,或0.01重量%至9重量%,或0.05重量%至8重量%,或0.1重量%至5重量%的除臭剂。

[0218] 在至少一个实施方案中,制剂包含防晒剂和/或紫外线过滤剂。合适的防晒剂和紫外线过滤剂公开于W0-2013/017262A1(于2013年2月7日公开),第32页第11行至第33页末尾中。在至少一个实施方案中,防晒剂和/或紫外线过滤剂选自4-氨基苯甲酸,3-(4'-三甲基铵)-亚苄基-硼烷-2-酮-甲基硫酸酯,樟脑苯扎铵甲基硫酸盐,3,3,5-三甲基-环己基水杨酸酯,2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮,2-苯基苯并咪唑-5-磺酸及其钾盐、钠盐和三乙醇胺盐,3,3'-(1,4-亚苄基二次甲基)-双-(7,7-二甲基-2-氧代双环[2.2.1]-庚烷-1-甲磺酸)及其盐,1-(4-叔丁基苯基)-3-(4-甲氧基苯基)丙烷-1,3-二酮,3-(4'-磺基)-亚苄基-苄烷-2-酮及其盐,2-氰基-3,3-二苯基-丙烯酸-(2-乙基己基酯),N-[2(和4)-(2-氧代冰片-3-亚基甲基)苄基]-丙烯酰胺的聚合物,4-甲氧基-肉桂酸-2-乙基己基酯,乙氧基化的乙基-4-氨基-苯甲酸酯,4-甲氧基-肉桂酸异戊酯,2,4,6-三-[对-(2-乙基己氧羰基)苯胺基]-1,3,5-三嗪,2-(2H-苯并三唑-2-基)-4-甲基-6-(2-甲基-3-(1,3,3,3-四甲基-1-(三甲基甲硅烷氧基)-二硅氧烷基)-丙基)苯酚,4,4'-[(6-[4-((1,1-二甲基乙基)-氨基-羰基)苯基氨基]-1,3,5-三嗪-2,4-基)二亚氨基]双-(苯甲酸-2-乙基己基酯),3-二苯甲酮,4-二苯甲酮(acic),3(4'-甲基亚苄基)-D,L-樟脑,3-亚苄基-樟脑,水杨酸-2-乙基己基酯,4-二甲氨基苯甲酸-2-乙基己基酯,羟基-4-甲氧基-二苯甲酮-5-磺酸及其钠盐,4-异丙基苄基水杨酸酯,N,N,N-三甲基-4-(2-氧代冰片-3-亚基甲基)苯铵甲基硫酸盐,胡莫柳酯(INN),氧苯酮(INN),2-苯基苯并咪唑-5-磺酸及其钠、钾和三乙醇胺盐,甲氧基肉桂酸辛酯,4-甲氧基肉桂酸异戊酯,对甲氧基肉桂酸异戊酯,2,4,6-三苯胺基-(对碳-2'-乙基己基-1'-氧基)-1,3,5-三嗪(辛基三嗪酮)苯酚,2,2(2H-苯并三唑-2-基)-4-甲基-6-(2-甲基-3-(1,3,3,3-四甲基-1-(三甲基甲硅烷基)氧基)-二硅氧烷基)丙基(甲酚曲唑三硅氧烷)苯甲酸,4,4'-((6-

((1,1-二甲基乙基)氨基)羰基)苯基)氨基)-1,3,5-三嗪-2,4-二基)二亚氨基)双,双(2-乙基己基)酯)苯甲酸,4,4-((6-(((1,1-二甲基乙基)氨基)-羰基)苯基)氨基)-1,3,5-三嗪-2,4-二基)二亚氨基)双,双(2-乙基己基)酯),3-(4'-甲基亚苄基)-D,L-樟脑(4-甲基亚苄基樟脑),亚苄基-樟脑-磺酸,奥克立林,聚丙烯酰氨基甲基-亚苄基-樟脑,2-乙基己基水杨酸酯(水杨酸辛酯),4-二甲基-氨基苯甲酸乙基-2-己酯(辛基二甲基PABA),PEG-25PABA,2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮-5-磺酸(5-二苯甲酮)及其钠盐,2,2'-亚甲基-双-6-(2H-苯并三唑-2-基)-4-(四甲基-丁基)-1,1,3,3-苯酚,2,2'-双-(1,4-亚苄基)1H-苯并咪唑-4,6-二磺酸的钠盐,(1,3,5)-三嗪-2,4-双((4-(2-乙基-己氧基)-2-羟基)-苯基)-6-(4-甲氧基苯基),2-乙基己基-2-氰基-3,3-二苯基-2-丙烯酸酯、辛酸甘油酯,二对甲氧基肉桂酸,对氨基苯甲酸及其酯,4-叔丁基-4'-甲氧基二苯甲酰基甲烷,4-(2-β-吡喃葡萄糖氧基)丙氧基-2-羟基二苯甲酮,水杨酸辛酯,甲基-2,5-二异丙基肉桂酸,西诺沙酯,二羟基-二甲氧基二苯甲酮,2,2'-二羟基-4,4'-二甲氧基-5,5'-二磺基二苯甲酮的二钠盐,二羟基二苯甲酮,1,3,4-二甲氧基苯基-4,4'-二甲基-1,3-戊二酮,2-乙基己基-二甲氧基亚苄基-二氧代咪唑烷丙酸酯,亚甲基-双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚,苯基二苯并咪唑四磺酸酯,双-乙基己氧基苯酚-甲氧基苯酚-三嗪,四羟基二苯甲酮,对苯二甲酰亚基二樟脑-磺酸,2,4,6-三[4,2-乙基己氧基羰基)苯胺基]-1,3,5-三嗪,甲基-双(三甲基甲硅烷氧基)甲硅烷基-异戊基三甲氧基肉桂酸,对二甲氨基苯甲酸戊酯,对二甲氨基苯甲酸戊酯,对二甲氨基苯甲酸2-乙基己基酯,对甲氧基肉桂酸/二异丙基肉桂酸异丙酯,对甲氧基肉桂酸2-乙基己基酯,2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮,2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮-5-磺酸和三水合物,2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮-5-磺酸钠盐,苯基-苯并咪唑磺酸及其组合。在至少一个实施方案中,制剂包含0.001重量%至10重量%,优选0.05重量%至5重量%,甚至更优选0.1重量%至3重量%,最优选0.05重量%至1重量%的防晒剂和/或紫外线过滤剂。在至少一个实施方案中,制剂包含0.01至10重量%,或0.1至5重量%,更优选0.2至2重量%的量的光保护性物质。合适的光保护性物质尤其是包括EP1084696A1(L' OREAL)中所列出的全部光保护性物质,通过引用将其并入本文。在优选的实施方案中,光保护性物质选自4-甲氧基肉桂酸2-乙基己基酯,甲氧基肉桂酸甲酯,2-羟基-4-甲氧基二苯甲酮-5-磺酸,聚乙氧基化的对氨基苯甲酸酯,及其组合。

[0219] 在至少一个实施方案中,制剂包含抗氧化剂。在至少一个实施方案中,抗氧化剂选自氨基酸、肽、糖、咪唑类、类胡萝卜素类、胡萝卜素类、绿原酸、硫辛酸、硫醇、硫醇葡萄糖基酯、硫醇N-乙酰基酯、硫醇甲基酯、硫醇乙基酯、硫醇丙基酯、硫醇戊基酯、硫醇丁基酯、硫醇月桂基酯、硫醇棕榈酰基酯、硫醇油烯基酯、硫醇亚油基酯、硫醇胆固醇酯、硫醇甘油酯、二月桂基硫代二丙酸酯、二硬脂基硫代二丙酸酯、硫代二丙酸、金属螯合剂、羟基酸、脂肪酸、叶酸、维生素C、生育酚、维生素A、二苯乙烯,及其衍生物和组合。在至少一个实施方案中,抗氧化剂选自甘油、组氨酸、酪氨酸、色氨酸、尿刊宁酸、D,L-肌肽、D-肌肽、L-肌肽、β-胡萝卜素、α-胡萝卜素、番茄红素、二氢硫辛酸、葡糖硫金、丙基硫尿嘧啶、硫氧还蛋白、谷胱甘肽、半胱氨酸、胱氨酸、胱胺、丁硫氨酸-亚砷亚胺(buthioninsulfoximine)、同型半胱氨酸-亚砷亚胺(homocysteinsulfoximine)、丁硫氨酸砷(buthioninsulfone)、戊硫氨酸-亚砷亚胺、己硫氨酸-亚砷亚胺、庚硫氨酸-亚砷亚胺(penta-,hexa-,heptathioninsulfoximine)、羟基脂肪酸、棕榈酸、植烷酸、乳铁蛋白、柠檬酸、乳酸、苹果酸、腐殖酸、胆酸、胆红素、胆绿

素、EDTA、EGTA、亚油酸、亚麻酸、油酸、丁基羟基苯甲醚、三羟基苯丁酮、泛醌、泛醇、抗坏血酸棕榈酸酯、抗坏血酸磷酸镁、抗坏血酸乙酸酯、维生素E乙酸酯、维生素A棕榈酸酯、肌肽、甘露糖、ZnO、ZnSO₄、蛋氨酸硒、二苯乙烯、超氧化物歧化酶及其组合。在至少一个实施方案中，抗氧化剂选自维生素A、维生素A衍生物、维生素E、维生素E衍生物，及其组合。在至少一个实施方案中，制剂包含0.001重量%至10重量%，优选0.05重量%至5重量%，甚至更优选0.1重量%至3重量%，最优选0.05重量%至1重量%的抗氧化剂。

[0220] 在至少一个实施方案中，制剂包含染料或颜料。在至少一个实施方案中，制剂包含至少一种颜料。合适的染料和颜料公开于W02013/017262A1的横跨第36至43页的表中。这些可以为着色的颜料，其将颜色效果赋予产物物料或赋予毛发，或它们可以为光泽效果颜料，其将光泽效果赋予产物物料或赋予毛发。毛发上的颜色或光泽效果优选为临时性的，即它们持续到下一次毛发洗涤并且可以通过用常规洗发剂洗涤毛发而再次除去。在至少一个实施方案中，制剂包含0.01重量%至25重量%，优选5重量%至15重量%的总量的颜料。在至少一个实施方案中，颜料的粒度为1微米至200微米，优选3微米至150微米，更优选10微米至100微米。颜料为几乎不溶于应用介质中的着色剂并且可以为无机的或有机的。无机-有机混合颜料也是可能的。优选的是无机颜料。无机颜料的有利之处在于它们对光、气候和温度的优异耐性。无机颜料可以具有天然来源。在至少一个实施方案中，无机颜料选自白垩、赭石、棕土、绿土、烧赭石、石墨，及其组合。颜料可以为白色颜料，例如二氧化钛或氧化锌，黑色颜料，例如氧化铁黑，着色的颜料，例如群青或氧化铁红，光泽颜料，金属效果颜料，珠光颜料以及荧光或磷光颜料，其中优选地，至少一种颜料是着色的非白色颜料。在至少一个实施方案中，颜料选自金属氧化物、氢氧化物和氧化物水合物，混合相颜料，含硫硅酸盐，金属硫化物，络合金属氰化物，金属硫酸盐，铬酸盐和钼酸盐，和金属本身（青铜颜料），及其组合。在至少一个实施方案中，颜料选自二氧化钛（CI 77891）、氧化铁黑（CI 77499）、氧化铁黄（CI 77492）、氧化铁红和氧化铁棕（CI 77491）、锰紫（CI 77742）、群青（磺基硅酸铝钠，CI 77007，颜料蓝29）、氧化铬水合物（CI 77289）、普鲁士蓝（亚铁氰化铁，CI 77510）、胭脂红（胭脂虫红），及其组合。在至少一个实施方案中，颜料选自基于云母的珠光和着色的颜料，其被金属氧化物或金属氧氯化物，如二氧化钛或氧氯化铍和任选的另外的赋予颜色的物质，如铁氧化物、普鲁士蓝、群青、胭脂红等涂覆，和其中可以通过改变层厚度确定颜色。这样的颜料例如以商品名 **Rona®**、**Colorona®**、**Dichrona®**和 **Timiron®** 由德国 Merck 销售。在至少一个实施方案中，颜料选自有机颜料如乌贼墨、藤黄、骨炭、卡塞尔（Cassel）棕、靛蓝、叶绿素和其它颜料。在至少一个实施方案中，颜料选自合成有机颜料如偶氮颜料，蒽醌类（anthraquinoids）、靛系、二噁嗪、喹吖啶酮、酞菁、异吲哚啉酮、花和紫环酮、金属络合物、碱性蓝和二酮吡咯并吡咯颜料。

[0221] 在至少一个实施方案中，制剂包含0.01重量%至10重量%，优选0.05重量%至5重量%的至少一种颗粒状物质。合适的物质例如为在室温（25℃）为固体并且呈颗粒形式的物质。在至少一个实施方案中，颗粒状物质选自二氧化硅，硅酸盐，铝酸盐，粘土，云母，不溶的盐，尤其是不溶的无机金属盐，金属氧化物，例如二氧化钛，矿物和不溶的聚合物颗粒是合适的。颗粒可以在制剂中以未溶解的，优选稳定分散的形式存在，并且在施加至角蛋白基底和蒸发溶剂之后可以沉积以固体形式在基底上。可以通过提供具有足够大以防止固体颗粒下沉的屈服点（yield point）的制剂实现稳定的分散体。可以以合适的量使用合适的凝胶

形成剂建立足够的屈服点。在至少一个实施方案中,颗粒状物质选自二氧化硅(硅胶,二氧化硅)和金属盐,尤其是无机金属盐,其中二氧化硅是特别优选的。金属盐例如为碱金属或碱土金属卤化物,如氯化钠或氯化钾;碱金属或碱土金属硫酸盐,如硫酸钠或硫酸镁。

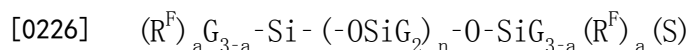
[0222] 在至少一个实施方案中,制剂包含直接染料。直接染料中优选的是以下化合物(单独的或彼此组合):羟乙基-2-硝基-对甲苯胺、2-羟乙基苦氨酸、4-硝基苯基氨基脲、氯化三(4-氨基-3-甲基苯基)碳鎓(碱性紫2)、1,4-二氨基-9,10-蒽二酮(分散紫1)、1-(2-羟乙基)氨基-2-硝基-4-[二(2-羟乙基)氨基]苯(HC蓝2号)、4-[乙基-(2-羟乙基)氨基]-1-[(2-羟乙基)氨基]-2-硝基苯盐酸盐(HC蓝12号)、1-氨基-4-[二(2-羟乙基)氨基]-2-硝基苯盐酸盐(HC红13号)、4-氨基-1-[(2-羟乙基)氨基]-2-硝基苯(HC红3号)、4-氨基-3-硝基苯酚、4-[(2-羟乙基)氨基]-3-硝基苯酚、1-氨基-5-氯-4-[(2,3-二羟丙基)氨基]-2-硝基苯(HC红10号)、5-氯-1,4-[(2,3-二羟丙基)氨基]-2-硝基苯(HC红11号)、2-氯-6-乙基氨基-4-硝基苯酚、2-氨基-6-氯-4-硝基苯酚、4-[(2-羟乙基)氨基]-3-硝基-1-三氟甲基苯(HC黄13号)、8-氨基-2-溴-5-羟基-4-亚氨基-6-[[3-(三甲基铵基)-苯基]氨基]-1(4H)-萘酮氯化物(C.I.56059;碱性蓝99号)、1-[(4-氨基苯基)偶氮]-7-(三甲基铵基)-2-萘酚氯化物(C.I.12250;碱性棕16号)、1-[(4-氨基-2-硝基苯基)偶氮]-7-(三甲基铵基)-2-萘酚氯化物(碱性棕17号)、2-羟基-1-[(2-甲氧基苯基)偶氮]-7-(三甲基铵基)萘氯化物(C.I.12245;碱性红76号)、3-甲基-1-苯基-4-[[3-(三甲基铵基)苯基]偶氮]吡啶-5-酮氯化物(C.I.12719;碱性黄57号)和2,6-二氨基-3-[(吡啶-3-基)偶氮]吡啶以及其盐。前述直接染料中特别优选的是以下化合物(单独的或彼此组合):羟乙基-2-硝基-对甲苯胺、2-羟乙基苦氨酸、4-硝基苯基氨基脲、氯化三(4-氨基-3-甲基苯基)碳鎓(碱性紫2)、1,4-二氨基-9,10-蒽二酮(分散紫1)、1-(2-羟乙基)氨基-2-硝基-4-[二(2-羟乙基)氨基]苯(HC蓝2号)、4-[乙基-(2-羟乙基)氨基]-1-[(2-羟乙基)氨基]-2-硝基苯盐酸盐(HC蓝12号)、1-氨基-4-[二(2-羟乙基)氨基]-2-硝基苯盐酸盐(HC红13号)、4-氨基-1-[(2-羟乙基)氨基]-2-硝基苯(HC红3号)、4-氨基-3-硝基苯酚、4-[(2-羟乙基)氨基]-3-硝基苯酚、1-氨基-5-氯-4-[(2,3-二羟丙基)氨基]-2-硝基苯(HC红10号)、5-氯-1,4-[(2,3-二羟丙基)氨基]-2-硝基苯(HC红11号)、2-氯-6-乙基氨基-4-硝基苯酚、2-氨基-6-氯-4-硝基苯酚、4-[(2-羟乙基)氨基]-3-硝基-1-三氟甲基苯(HC黄13号)、8-氨基-2-溴-5-羟基-4-亚氨基-6-[[3-(三甲基铵基)-苯基]氨基]-1(4H)-萘酮氯化物(C.I.56059;碱性蓝99号)、1-[(4-氨基苯基)偶氮]-7-(三甲基铵基)-2-萘酚氯化物(C.I.12250;碱性棕16号)、1-[(4-氨基-2-硝基苯基)偶氮]-7-(三甲基铵基)-2-萘酚氯化物(碱性棕17号)、2-羟基-1-[(2-甲氧基苯基)偶氮]-7-(三甲基铵基)萘氯化物(C.I.12245;碱性红76号)、3-甲基-1-苯基-4-[[3-(三甲基铵基)苯基]偶氮]吡啶-5-酮氯化物(C.I.12719;碱性黄57号)和2,6-二氨基-3-[(吡啶-3-基)偶氮]吡啶以及其盐。在至少一个实施方案中,制剂中的直接染料的总量为0.01至15重量%,优选0.1至10重量%,最优选0.5至8重量%。

[0223] 在至少一个实施方案中,制剂包含调理剂。在至少一个实施方案中,调理剂为水不溶性的、水可分散的、非挥发性液体,起形成乳化的液体颗粒。在至少一个实施方案中,调理剂为有机硅(例如硅油、阳离子有机硅、硅酮胶、高折射有机硅和有机硅树脂)、有机调理油(例如烃油、聚烯烃和脂肪酯)、阳离子调理表面活性剂、高熔点脂肪化合物或其组合。

[0224] 在至少一个实施方案中,调理剂为有机硅,和其中制剂包含0.01%至10%,或

0.1%至5%的有机硅调理剂,按制剂的总重量计。合适的有机硅调理剂和任选的用于有机硅的悬浮试剂描述于US-5,104,646中。在至少一个实施方案中,制剂包含硅酮胶,其选自聚二甲基硅氧烷、(聚二甲基硅氧烷)(甲基乙烯基硅氧烷)共聚物、聚(二甲基硅氧烷)(二苯基硅氧烷)(甲基乙烯基硅氧烷)共聚物,及其混合物。

[0225] 在至少一个实施方案中,制剂包含末端氨基有机硅。本文中定义的“末端氨基有机硅”意指在有机硅骨架的一个或两个末端处包含一个或更多个氨基的有机硅。在至少一个实施方案中,制剂基本上不含有任何包含悬垂氨基的有机硅化合物。在一个实施方案中,制剂基本上不含有任何不是末端氨基有机硅的有机硅化合物。在至少一个实施方案中,末端氨基有机硅的有机硅骨架的至少一个末端的氨基选自伯胺、仲胺和叔胺。在至少一个实施方案中,制剂包含符合式(S)的末端氨基有机硅:



[0227] 其中,

[0228] G为氢、苯基、羟基或C₁-C₈烷基,优选甲基;

[0229] a为具有1至3,优选1的值的整数;b为0、1或2,优选1;

[0230] n为0至1,999的数;

[0231] R^F为符合通式C_qH_{2q}L的一价基团,其中q为具有2至8的值的整数和L选自以下基团:-N(R^T)CH₂-CH₂-N(R^T)₂;-N(R^T)₂;-N(R^T)₃A⁻;-N(R^T)CH₂-CH₂-NR^TH₂A⁻;其中R^T为氢、苯基、苄基或饱和烃基团,优选具有1至20个碳原子的烷基基团;A⁻为卤离子。

[0232] 在至少一个实施方案中,对应于式(S)的末端氨基有机硅具有a=1,q=3,G=甲基,n为1000至2500,替代地为1500至1700;和L为-N(CH₃)₂。合适的对应于式(III)的末端氨基有机硅具有a=0,G=甲基,n为100至1500,或200至800,和L选自以下基团:-N(R^T)CH₂-CH₂-N(R^T)₂;-N(R^T)₂;-N(R^T)₃A⁻;-N(R^T)CH₂-CH₂-NR^TH₂A⁻;其中R^T为氢、苯基、苄基或饱和烃基团,优选具有1至20个碳原子的烷基;A⁻为卤离子,替代地L为-NH₂。在至少一个实施方案中,末端氨基有机硅选自双氨基甲基聚二甲基硅氧烷、双氨基乙基聚二甲基硅氧烷、双氨基丙基聚二甲基硅氧烷、双-氨基丁基聚二甲基硅氧烷,及其混合物。在一个实施方案中,末端氨基有机硅的在25℃测量的粘度为1,000至30,000cPs,或5,000至20,000cPs。

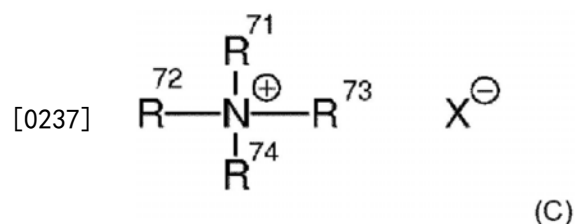
[0233] 在至少一个实施方案中,制剂包含0.1%至20%,或0.5%至10%,或1%至6%的末端氨基有机硅,按制剂的总重量计。

[0234] 在至少一个实施方案中,制剂包含高熔点脂肪化合物。高熔点脂肪化合物具有25℃以上的熔点。在至少一个实施方案中,高熔点脂肪化合物选自脂肪醇、脂肪酸、脂肪醇衍生物、脂肪酸衍生物,及其混合物。高熔点化合物的非限制性实例见于国际化妆品成分词典(International Cosmetic Ingredient Dictionary),1993年第五版和CTFA化妆品成分手册(Cosmetic Ingredient Handbook),1992年第二版中。制剂可以包含0.1%至40%,或1%至30%,或1.5%至16%,或1.5%至8%的高熔点脂肪化合物,按制剂的总重量计。鉴于提供改进的调理益处,如施加至湿发上的顺滑感觉、在干发上的柔软和增湿感觉,这是有利的。在至少一个实施方案中,脂肪醇选自:鲸蜡醇、硬脂醇、山萘醇,及其混合物。在至少一个实施方案中,制剂包含直链脂肪醇,其中直链脂肪醇包括在层状凝胶基质中。层状凝胶基质适合于提供各种调理益处,如在施加至湿发期间的顺化感觉以及在干发上的柔软和增湿感觉。直链脂肪醇可以包含8至24个碳原子。在一个实施方案中,直链脂肪醇选自:鲸蜡醇、硬

脂醇,及其混合物。在一个实施方案中,总直链脂肪醇比末端氨基有机硅的重量比为0.5:1至10:1,或1:1至5:1,或2.4:1至2.7:1。

[0235] 在至少一个实施方案中,层状凝胶基质包含阳离子调理表面活性剂和高熔点脂肪化合物。鉴于提供层状凝胶基质,以这样的水平含有阳离子调理表面活性剂和高熔点脂肪化合物,使得阳离子表面活性剂比高熔点脂肪化合物的重量比在1:1至1:10,或1:1至1:6范围内。

[0236] 在至少一个实施方案中,制剂包含阳离子调理表面活性剂。在至少一个实施方案中,制剂包含0.05%至3.0%,或0.075%至2.0%,或0.1%至1.0%的阳离子调理表面活性剂,按制剂的总重量计。在至少一个实施方案中,阳离子调理表面活性剂包含在层状凝胶基质中。换言之,制剂包含层状凝胶基质并且层状凝胶基质包含阳离子调理表面活性剂。在一个实施方案中,阳离子调理表面活性剂为根据式(C):



[0238] 其中, R^{71} 、 R^{72} 、 R^{73} 和 R^{74} 的至少一个选自8至30个碳原子的脂族基团、芳族基团、烷氧基、聚氧亚烷基、烷基酰氨基、羟基烷基、芳基或具有至多22个碳原子的烷基芳基;其余的 R^{71} 、 R^{72} 、 R^{73} 和 R^{74} 独立地选自由1至22个碳原子组成的脂族基团,芳族基团、烷氧基、聚氧亚烷基、烷基酰氨基、羟基烷基、芳基或具有至多22个碳原子的烷基芳基;

[0239] X选自:卤素、乙酸根、柠檬酸根、乳酸根、乙醇酸根、磷酸根、硝酸根、磺酸根、硫酸根、烷基硫酸根、烷基磺酸根基团,及其组合。

[0240] 在至少一个实施方案中,阳离子调理表面活性剂选自山箭基三甲基氯化铵、山箭基三甲基甲基硫酸铵或山箭基三甲基乙基硫酸铵,和硬脂基三甲基氯化铵、硬脂基三甲基甲基硫酸铵或硬脂基三甲基乙基硫酸铵。相信与具有较短的烷基的阳离子表面活性剂相比,较长的烷基提供在湿和干发上的改进的光滑度和柔软的感觉。还相信这样的阳离子表面活性剂与具有较短的烷基相比可以提供降低的刺激性。

[0241] 在至少一个实施方案中,阳离子表面活性剂为选自以下的二长烷基季铵盐:二烷基(14-18)二甲基氯化铵、二牛油烷基二甲基氯化铵、二氢化牛油烷基二甲基氯化铵、二硬脂基二甲基氯化铵、二鲸蜡基二甲基氯化铵,及其混合物。

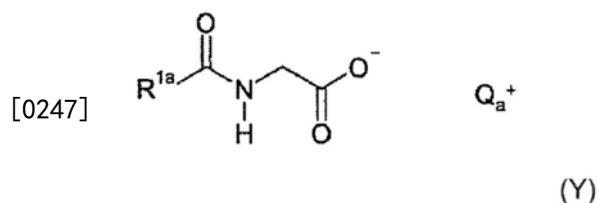
[0242] 在至少一个实施方案中,阳离子表面活性剂为具有12至22个碳原子的叔酰氨基胺。叔酰氨基胺可以选自硬脂酰氨基丙基二甲基胺、硬脂酰氨基丙基二乙基胺、硬脂酰氨基乙基二乙基胺、硬脂酰氨基乙基二甲基胺、棕榈酰氨基丙基二甲基胺、棕榈酰氨基丙基二乙基胺、棕榈酰氨基乙基二乙基胺、棕榈酰氨基乙基二甲基胺、山箭酰氨基丙基二甲基胺、山箭酰氨基丙基二乙基胺、山箭酰氨基乙基二乙基胺、山箭酰氨基乙基二甲基胺、花生酰氨基丙基二甲基胺、花生酰氨基丙基二乙基胺、花生酰氨基乙基二乙基胺和花生酰氨基乙基二甲基胺、二乙基氨基乙基硬脂酰胺,及其混合物。可以将叔酰氨基胺与酸组合使用。典型地将酸用作成盐阴离子。在一个实施方案中,酸选自乳酸、苹果酸、盐酸、1-谷氨酸、乙酸、柠檬酸,及其混合物。

[0243] 在至少一个实施方案中,阳离子表面活性剂选自鲸蜡基三甲基氯化铵(CTAC)、硬脂基三甲基氯化铵(STAC)、山萘基三甲基甲基硫酸铵、硬脂酰氨基丙基二甲基胺(SAPDMA)、二硬脂基二甲基氯化铵,及其混合物。

[0244] 在至少一个实施方案中,制剂包含表面活性剂体系。在至少一个实施方案中,表面活性剂体系包含选自阴离子表面活性剂、阳离子表面活性剂、非离子表面活性剂、两性离子表面活性剂和/或两性表面活性剂的表面活性剂。在至少一个实施方案中,制剂包含0.01重量%至70重量%,0.1重量%至40%,1重量%至30%,2重量%至20重量%的表面活性剂总量。

[0245] 在至少一个实施方案中,制剂包含阴离子表面活性剂。在至少一个实施方案中,阴离子表面活性剂选自(C₁₀-C₂₀)-烷基和亚烷基羧酸盐、烷基醚羧酸盐、脂肪醇硫酸盐、脂肪醇醚硫酸盐、烷基酰胺硫酸盐和磺酸盐、脂肪酸烷基酰胺聚二醇醚硫酸盐、烷烃磺酸盐和羟基烷烃磺酸盐、烯烃磺酸盐、羟乙基磺酸盐的酰基酯、 α -磺基脂肪酸酯、烷基苯磺酸盐、烷基苯酚二醇醚磺酸盐、磺基琥珀酸盐、磺基琥珀酸单酯和二酯、脂肪醇醚磷酸盐、蛋白质/脂肪酸缩合产物、烷基单缩水甘油酯硫酸盐和磺酸盐、烷基缩水甘油酯醚磺酸盐、脂肪酸甲基牛磺酸盐、脂肪酸肌氨酸盐、磺基蓖麻油酸盐、酰基谷氨酸盐,及其混合物。阴离子表面活性剂(和它们的混合物)可以以它们的水溶性或水可分散性盐的形式使用,例如为钠、钾、镁、铵、单乙醇铵、二乙醇铵和三乙醇铵以及类似的烷基铵盐。在至少一个实施方案中,阴离子表面活性剂为包含12至14个碳原子的阴离子表面活性剂。在至少一个实施方案中,阴离子表面活性剂选自月桂基硫酸钠、月桂聚醚硫酸钠、十三烷基硫酸钠、十三烷醇聚醚硫酸钠、肉豆蔻基硫酸钠、肉豆蔻基聚醚硫酸钠,及其混合物。

[0246] 在至少一个实施方案中,制剂包含酰基甘氨酸盐表面活性剂。在至少一个实施方案中,酰基甘氨酸盐表面活性剂符合式(Y):



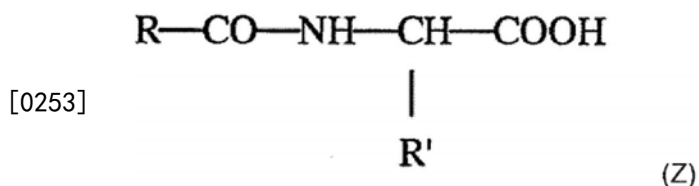
[0248] 其中,

[0249] R^{1a}为具有6至30,优选8至22,特别优选8至18个碳原子的直链或支链的、饱和的烷酰基或为具有6至30,优选8至22,更优选12至18个碳原子的直链或支链的、单不饱和或多不饱和的烷酰基,和

[0250] Q_a⁺为阳离子。

[0251] 在至少一个实施方案中,Q_a⁺选自Li⁺、Na⁺、K⁺、Mg⁺⁺、Ca⁺⁺、Al⁺⁺⁺、NH₄⁺、单烷基铵离子、二烷基铵离子、三烷基铵离子和四烷基铵离子,或其组合。任选地,R^{1a}彼此独立地为(C₁-C₂₂)-烷基基团或(C₂-C₁₀)-羟基烷基基团。在至少一个实施方案中,酰基甘氨酸盐表面活性剂选自椰油酰基甘氨酸钠和椰油酰基甘氨酸钾。在至少一个实施方案中,酰基甘氨酸盐表面活性剂选自符合式(Y)的那些,其中R为C₁₂烷基或C₁₄烷基。在至少一个实施方案中,酰基甘氨酸盐表面活性剂选自符合式(Y)的那些,其中R为C₁₆烷基或C₁₈烷基。

[0252] 在至少一个实施方案中,制剂包含对应于式(Z)的谷氨酸盐表面活性剂或其盐:



[0254] 其中,

[0255] R' 为 $\text{HOOCH}_2\text{-CH}_2\text{-}$ 或 $\text{M}^+-\text{OOC-CH}_2\text{-CH}_2\text{-}$, 其中 M^+ 为阳离子; 和其中

[0256] R 为具有 6 至 30, 优选 8 至 22, 更优选 8 至 18 个碳原子的直链或支链的饱和的烷基或为具有 6 至 30, 优选 8 至 22 并且更优选 12 至 18 个碳原子的直链或支链的、单不饱和或多不饱和烷基。在至少一个实施方案中, M^+ 为金属阳离子。在至少一个实施方案中, M^+ 选自 Li^+ 、 Na^+ 、 K^+ 、 Mg^{++} 、 Ca^{++} 、 Al^{+++} 、 NH_4^+ 、单烷基铵离子、二烷基铵离子、三烷基铵离子和四烷基铵离子, 或其组合。在至少一个实施方案中, 谷氨酸盐表面活性剂选自椰油酰基谷氨酸钠和椰油酰基谷氨酸钾。在至少一个实施方案中, 谷氨酸盐表面活性剂选自符合式 (Z) 的那些, 其中 R 为 C_{12} 烷基或 C_{14} 烷基。在至少一个实施方案中, 谷氨酸盐表面活性剂选自符合式 (Z) 的那些, 其中 R 为 C_{16} 烷基或 C_{18} 烷基。

[0257] 在至少一个实施方案中, 制剂包含 0.01 重量% 至 30 重量% 或 1 重量% 至 25 重量%, 优选 5 重量% 至 20 重量%, 更优选 12 重量% 至 18 重量% 的阴离子表面活性剂。

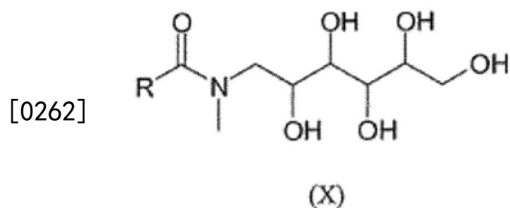
[0258] 在至少一个实施方案中, 制剂包含非离子表面活性剂。在至少一个实施方案中, 非离子表面活性剂具有大于 12 的 HLB (亲水亲油平衡)。任选地, 非离子表面活性剂选自乙氧基化的或乙氧基化的/丙氧基化的具有包含 12 至 22 个碳原子的脂肪链的脂肪醇, 乙氧基化的甾醇, 如硬脂基醇或月桂基醇 (E0-7), PEG-16 大豆甾醇或 PEG-10 大豆甾醇, 聚氧亚乙基聚氧亚丙基嵌段聚合物 (泊洛沙姆, poloxamers), 及其混合物。

[0259] 在至少一个实施方案中, 非离子表面活性剂选自乙氧基化的脂肪醇、脂肪酸、脂肪酸甘油酯或烷基苯酚, 尤其是 2 至 30mol 的氧化乙烯和/或 1 至 5mol 的氧化丙烯到 $\text{C}_8\text{-至C}_{22}\text{-}$ 脂肪醇上、到 $\text{C}_{12}\text{-至C}_{22}\text{-}$ 脂肪酸上或到烷基中具有 8 至 15 个碳原子的烷基酚上的加成产物, 1 至 30mol 的氧化乙烯到甘油上的加成产物的 $\text{C}_{12}\text{-至C}_{22}\text{-}$ 脂肪酸单酯和二酯, 5 至 60mol 的氧化乙烯到蓖麻油上或到氢化蓖麻油上的加成产物, 脂肪酸糖酯, 尤其是蔗糖与一个或两个 $\text{C}_8\text{-至C}_{22}\text{-}$ 脂肪酸的酯, INCI: 蔗糖椰油酸酯、蔗糖二月桂酸酯、蔗糖二硬脂酸酯、蔗糖月桂酸酯、蔗糖肉豆蔻酸酯、蔗糖油酸酯、蔗糖棕榈酸酯、蔗糖蓖麻油酸酯、蔗糖硬脂酸酯, 乙氧基化程度为 4 至 20 的失水山梨醇与一个、两个或三个 $\text{C}_8\text{-至C}_{22}\text{-}$ 脂肪酸的酯, 聚甘油基脂肪酸酯, 尤其是一个、两个或更多个 $\text{C}_8\text{-至C}_{22}\text{-}$ 脂肪酸与具有 2 至 20 个甘油基单元的聚甘油的聚甘油基脂肪酸酯, 烷基葡萄糖苷, 烷基低聚葡萄糖苷和烷基聚葡萄糖苷, 其具有 $\text{C}_8\text{至C}_{22}\text{-}$ 烷基, 例如癸基葡萄糖苷或月桂基葡萄糖苷, 及其混合物。

[0260] 在至少一个实施方案中, 非离子表面活性剂选自脂肪醇乙氧基化物 (烷基聚乙二醇)、烷基苯酚聚乙二醇、烷基硫醇聚乙二醇、脂肪胺乙氧基化物 (烷基氨基聚乙二醇)、脂肪酸乙氧基化物 (酰基聚乙二醇)、聚丙二醇乙氧基化物 (**Pluronic[®]**)、脂肪酸羟烷基酰胺、(脂肪酸酰胺聚乙二醇)、 N-烷基-多羟基-脂肪酸酰胺 、 N-烷氧基-多羟基-脂肪酸酰胺 、蔗糖酯、山梨醇酯、聚二醇醚, 及其混合物。

[0261] 在至少一个实施方案中, 制剂包含脂肪 N-甲基-N-葡萄糖酰胺 表面活性剂, 其中脂肪

N-甲基-N-葡萄糖酰胺表面活性剂符合式(X)：



[0263] 其中,R为具有3至30个碳原子的直链或支链的烷基或烯基。在至少一个实施方案中,R为具有3至30个碳原子的烷基。在至少一个实施方案中,R为饱和的脂族烃基,其可以为直链或支链的并且可以在烃链中具有3至20个碳原子,优选直链或支链的。支链意指低级烷基如甲基、乙基或丙基作为取代基存在于直链烷基链上。在至少一个实施方案中,R选自1-丙基、2-丙基、1-丁基、2-丁基、2-甲基-1-丙基(异丁基)、2-甲基-2-丙基(叔丁基)、1-戊基、2-戊基、3-戊基、2-甲基-1-丁基、3-甲基-1-丁基、2-甲基-2-丁基、3-甲基-2-丁基、2,2-二甲基-1-丙基、1-己基、2-己基、3-己基、2-甲基-1-戊基、3-甲基-1-戊基、4-甲基-1-戊基、2-甲基-2-戊基、3-甲基-2-戊基、4-甲基-2-戊基、2-甲基-3-戊基、3-甲基-3-戊基、2,2-二甲基-1-丁基、2,3-二甲基-1-丁基、3,3-二甲基-1-丁基、2-乙基-1-丁基、2,3-二甲基-2-丁基、3,3-二甲基-2-丁基、1-庚基、1-辛基、1-壬基、1-癸基、1-十一烷基、1-十二烷基、1-十四烷基、1-十六烷基和1-十八烷基。合适的脂肪N-甲基-N-葡萄糖酰胺表面活性剂描述于W0-2013/178700和EP-0550637中,通过引用将其并入本文。在至少一个实施方案中,N-甲基-N-葡萄糖酰胺表面活性剂选自符合式(X)的那些,其中R为C₁₂烷基或C₁₄烷基。在至少一个实施方案中,N-甲基-N-葡萄糖酰胺表面活性剂选自符合式(X)的那些,其中R为C₁₆烷基或C₁₈烷基。

[0264] 在至少一个实施方案中,制剂包含1重量%至20重量%,更优选2重量%至10重量%,甚至更优选3重量%至7重量%的非离子表面活性剂。

[0265] 在至少一个实施方案中,两性表面活性剂选自N-(C₁₂-C₁₈)-烷基-β-氨基丙酸盐和N-(C₁₂-C₁₈)-烷基-β-亚氨基二丙酸盐如碱金属盐和单烷基铵、二烷基铵和三烷基铵盐;N-酰基氨基烷基-N,N-二甲基乙酰甜菜碱,优选N-(C₈-C₁₈)-酰基氨基丙基-N,N-二甲基乙酰甜菜碱、(C₁₂-C₁₈)-烷基-二甲基-磺基丙基甜菜碱、基于咪唑啉的两性表面活性剂(商标名:**Miranol[®]**、**Steinapon[®]**),优选1-(β-羧甲基氧基乙基)-1-(羧甲基)-2-月桂基咪唑啉鎓的钠盐;胺氧化物,例如(C₁₂-C₁₈)-烷基-二甲基胺氧化物、脂肪酸酰氨基烷基二甲基胺氧化物,及其混合物。

[0266] 在至少一个实施方案中,制剂包含甜菜碱表面活性剂。任选地,甜菜碱表面活性剂选自C₈-至C₁₈-烷基甜菜碱。在至少一个实施方案中,甜菜碱表面活性剂选自椰油二甲基羧甲基甜菜碱、月桂基二甲基羧甲基甜菜碱、月桂基二甲基α羧乙基甜菜碱、鲸蜡基二甲基羧甲基甜菜碱、油烯基二甲基γ羧丙基甜菜碱和月桂基双(2-羟丙基)α羧乙基甜菜碱及其组合。任选地,甜菜碱表面活性剂选自C₈-至C₁₈-磺基甜菜碱。在至少一个实施方案中,甜菜碱表面活性剂选自椰油二甲基磺基丙基甜菜碱、硬酯基二甲基磺基丙基甜菜碱、月桂基二甲基-磺基乙基甜菜碱、月桂基双(2-羟乙基)磺基丙基甜菜碱,及其组合。任选地,甜菜碱表面活性剂选自咪唑啉的羧基衍生物,C₈-至C₁₈-烷基二甲基铵乙酸盐、C₈-至C₁₈-烷基二甲基羧基铵盐,和C₈-至C₁₈-脂肪酸烷基酰氨基甜菜碱,及其混合物。任选地,C₈-至C₁₈-脂肪酸烷基酰氨基甜菜碱选自椰子脂肪酸酰氨基丙基甜菜碱、N-椰子脂肪酸酰氨基乙基-N-[2-(羧

基甲氧基)乙基]甘油(CTFA名称:椰子两性羧基甘氨酸盐),及其混合物。

[0267] 在至少一个实施方案中,制剂包含0.5重量%至20重量%,优选1重量%至10重量%两性表面活性剂。

[0268] 在至少一个实施方案中,制剂包含表面活性剂体系。在至少一个实施方案中,表面活性剂体系包含选自月桂基硫酸盐、月桂聚醚硫酸盐、椰油酰氨基-丙基甜菜碱、椰油酰基谷氨酸钠、月桂两性乙酸盐,及其混合物的至少一种表面活性剂。在至少一个实施方案中,表面活性剂体系包含月桂聚醚硫酸钠、月桂基硫酸钠和任选的椰油酰氨基丙基甜菜碱。在至少一个实施方案中,表面活性剂体系包含月桂聚醚硫酸钠、椰油酰基谷氨酸钾和椰油酰氨基丙基甜菜碱。

[0269] 在至少一个实施方案中,制剂另外包含毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物选自:两性毛发定型聚合物、两性离子毛发定型聚合物,阴离子毛发定型聚合物,非离子毛发定型聚合物,阳离子毛发定型聚合物,及其混合物。在至少一个实施方案中,制剂包含0.01%至20%,或0.01%至16%,或0.01%至10%,或1%至8%,或2%至6%的毛发定型聚合物。

[0270] 在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物为水相容性毛发定型聚合物,替代地为水溶性毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,制剂基本上不含有水不相容的毛发定型聚合物。水不相容的毛发定型聚合物的实例包括丙烯酸酯/叔丁基丙烯酰胺共聚物,其为叔丁基丙烯酰胺与丙烯酸、甲基丙烯酸或它们的简单酯之一的一种或更多种单体的共聚物(例如来自BASF的 **Ultrahold**[®] 8)。来自Akzo Nobel的 **Balance**[®] CR为(甲基)丙烯酸或它们的简单酯之一的两种或更多种单体的丙烯酸酯共聚物,是水相容性的。辛基丙烯酰胺/丙烯酸酯/丁基氨基乙基甲基丙烯酸酯共聚物 **Amphomer**[®] 也是水相容性的。在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物为胶乳毛发定型聚合物。

[0271] 制剂可以包含阳离子毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,阳离子毛发定型聚合物选自具有伯、仲、叔或季氨基基团的那些。

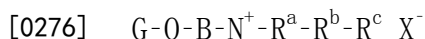
[0272] 在至少一个实施方案中,阳离子毛发定型聚合物具有阳离子电荷密度,和其中阳离子电荷密度为1至7meq/g。在至少一个实施方案中,阳离子毛发定型聚合物包含季氨基基团。在至少一个实施方案中,阳离子毛发定型聚合物为均聚物或共聚物,其中季氮基团包含在聚合物链中或作为在一种或更多种单体上的取代基。含铵基团的单体可以与非阳离子单体共聚。在至少一个实施方案中,阳离子毛发定型聚合物包含阳离子单体,其中阳离子单体为不饱和化合物,其可以经历自由基聚合和带有至少一个阳离子基团。在至少一个实施方案中,阳离子单体选自:铵取代的乙烯基单体,例如三烷基甲基丙烯酰氧基烷基铵、三烷基丙烯酰氧基烷基铵、二烷基二烯丙基铵和季乙烯基铵单体,其具有环状阳离子含氮基团,如吡啶鎓、咪唑鎓或季吡咯烷酮,例如烷基乙烯基咪唑鎓、烷基乙烯基吡啶鎓或烷基乙烯基吡咯烷酮盐。这些单体的烷基可以为低级烷基,例如C₁-至C₇-烷基并且还可以为C₁-至C₃-烷基。

[0273] 在至少一个实施方案中,阳离子毛发定型聚合物包含与非阳离子单体共聚的含铵基团的单体。非阳离子单体可以选自:丙烯酰胺、甲基丙烯酰胺、烷基丙烯酰胺和二烷基丙烯酰胺、烷基甲基丙烯酰胺和二烷基甲基丙烯酰胺、丙烯酸烷基酯、甲基丙烯酸烷基酯、乙

烯基己内酯、乙烯基己内酰胺、乙烯基吡咯烷酮、乙烯基酯,例如乙酸乙烯酯、乙烯醇、丙二醇或乙二醇,及其混合物。这些单体的烷基可以为 C_1 -至 C_7 -烷基,并且可以为 C_1 -至 C_3 -烷基。在至少一个实施方案中,阳离子毛发定型聚合物包含至少一个季氨基基团。具有至少一个季氨基基团的合适的聚合物包括例如在CTFA化妆品成分词典中以名称“聚季铵盐”描述的那些,如甲基乙烯基氯化咪唑鎓/乙烯基吡咯烷酮共聚物(聚季铵盐-16)或季铵化的乙烯基吡咯烷酮/二甲氨基乙基甲基丙烯酸酯共聚物(聚季铵盐-11;来自ISP的**Gafquat**[®] 755N-PW)以及季有机硅聚合物或有机硅低聚物,例如具有季端基的有机硅聚合物(聚季铵盐-80)。

[0274] 在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物为合成来源的阳离子毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,合成来源的阳离子毛发定型聚合物选自:聚(二甲基二烯丙基氯化铵);丙烯酰胺与二甲基二烯丙基氯化铵的共聚物;通过硫酸二乙酯与来自乙烯基吡咯烷酮和二甲氨基乙基甲基丙烯酸酯的共聚物,特别是乙烯基吡咯烷酮/二甲氨基乙基甲基丙烯酸酯硫酸甲酯共聚物的反应形成的季铵聚合物(例如**Gafquat**[®] 755N;**Gafquat**[®] 734);季铵polymers from甲基乙烯基氯化咪唑鎓和乙烯基吡咯烷酮(例如来自BASF的**Luviquat**[®] HM 550;来自BASF的**Luviquat**[®] Hold;来自BASF的聚季铵盐-46[乙烯基己内酰胺{VCap}、乙烯基吡咯烷酮{VP}和季铵化的乙烯基咪唑{QVI}];来自BASF的**Luviquat**[®] FC905[聚季铵盐-16]);来自BASF的**Luviquat Supreme**[®] (聚季铵盐-68,乙烯基吡咯烷酮、甲基丙烯酰胺、乙烯基咪唑和季铵化的乙烯基咪唑的季铵化的共聚物);聚季铵盐-35;聚季铵盐-57;三甲基铵乙基甲基丙烯酸酯氯化物的聚合物;来自二甲基二烯丙基氯化铵、丙烯酸钠和丙烯酰胺的三元共聚物(例如**Merquat**[®] Plus 3300);来自乙烯基吡咯烷酮、甲氨基丙基甲基丙烯酰胺和甲基丙烯酰氨基丙基月桂基二甲基氯化铵的共聚物;来自乙烯基吡咯烷酮、二甲氨基乙基甲基丙烯酸酯和乙烯基己内酰胺的三元共聚物(例如**Gaffix**[®] VC 713);乙烯基吡咯烷酮/甲基丙烯酰氨基丙基三甲基氯化铵共聚物(例如**Gafquat**[®] HS 100);来自乙烯基吡咯烷酮和二甲氨基乙基甲基丙烯酸酯的共聚物;来自乙烯基吡咯烷酮、乙烯基己内酰胺和二甲氨基丙基丙烯酰胺的共聚物;由至少一种选自被至少一个季铵基团取代的羧基酸的第一类型的单体形成的聚合酯或低聚酯;在末端位置被季铵基团取代的二甲基聚硅氧烷;及其混合物。

[0275] 在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物为天然来源的阳离子毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,天然来源的阳离子毛发定型聚合物选自:多糖的阳离子衍生物,例如阳离子纤维素衍生物、淀粉、瓜尔胶,及其混合物。多糖的阳离子衍生物可以由以下通式表示:



[0277] 其中,

[0278] G为脱水葡萄糖残基,例如淀粉或纤维素无水葡萄糖;

[0279] B为二价连接基团,例如亚烷基、氧亚烷基、聚氧亚烷基或羟基亚烷基;

[0280] R^a 、 R^b 和 R^c 彼此独立地为烷基、芳基、烷基芳基、芳基烷基、烷氧基烷基或烷氧基芳

基,其任意者可以具有至多22个碳原子,其中 R^a 、 R^b 和 R^c 中的碳原子的总数可以为20的最大值。

[0281] 在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物为选自以下的阳离子纤维素衍生物:具有至少一个季铵基团的那些,例如由羟乙基纤维素和二烯丙基二甲基氯化铵制成的共聚物(聚季铵盐-4),或由羟乙基纤维素与被三烷基铵基团取代的环氧化物制成的反应产物(聚季铵盐-10),其中烷基可以具有1至20个碳原子,或其中烷基为甲基。在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物为具有100,000Da至600,000Da,或200,000Da至400,000Da的分子量的阳离子纤维素衍生物。在至少一个实施方案中,阳离子纤维素衍生物具有氮含量,其中氮含量为0.5%至4%,或约1.5%至3%。在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物为阳离子纤维素衍生物,其为聚季铵盐-4。聚季铵盐-4以商品名**Celquat[®]**H100和**Celquat[®]**L200销售,其中特别优选的是**Celquat[®]**L200。

[0282] 在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物为阳离子胶乳毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,阳离子毛发定型聚合物选自:聚季铵盐-4、聚季铵盐-11、聚季铵盐-16、聚季铵盐-68、其混合物,和聚季铵盐-68与非离子毛发定型聚合物的混合物。在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物选自:聚季铵盐-4、聚季铵盐-11、聚季铵盐-68,及其混合物。在至少一个实施方案中,制剂包含壳聚糖、壳聚糖盐或壳聚糖衍生物。在至少一个实施方案中,制剂包含小于0.1重量%的壳聚糖、壳聚糖盐和壳聚糖衍生物。在另一实施方案中,制剂基本上不含壳聚糖、壳聚糖盐和壳聚糖衍生物。在至少一个实施方案中,制剂包含毛发定型聚合物,其选自:聚季铵盐-4、聚季铵盐-11、聚季铵盐-16、聚季铵盐-68、其混合物;或选自:聚季铵盐-4、聚季铵盐-68,及其混合物。在至少一个实施方案中,制剂包含毛发定型聚合物,其选自:聚季铵盐-4、聚季铵盐-11、聚季铵盐-68、其混合物;或选自:聚季铵盐-4、聚季铵盐-68,及其混合物。

[0283] 在至少一个实施方案中,制剂包含小于0.5重量%的阳离子毛发定型聚合物,按制剂的总重量计。

[0284] 在至少一个实施方案中,制剂包含两性或两性离子毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,两性或两性离子毛发定型聚合物选自:由烷基丙烯酰胺、烷基氨基烷基甲基丙烯酸酯和两种或更多种来自丙烯酸和甲基丙烯酸的单体以及如果需要的话的它们的酯形成的共聚物,特别是来自辛基丙烯酰胺、丙烯酸、丁基氨基乙基甲基丙烯酸酯、甲基丙烯酸甲酯和甲基丙烯酸羟丙酯的共聚物(辛基丙烯酰胺/丙烯酸酯/丁基氨基乙基甲基丙烯酸酯共聚物,例如来自Akzo Nobel的**Amphomer[®]**);由至少一种具有季氨基基团的第一类型的单体和至少一种具有酸基团的第二类型的单体形成的共聚物;来自脂肪醇丙烯酸酯、烷基胺氧化物甲基丙烯酸酯和至少一种选自丙烯酸和甲基丙烯酸以及如果需要的话的丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯的单体的共聚物,特别是来自丙烯酸月桂酯、丙烯酸硬脂基酯、乙胺氧化物甲基丙烯酸酯和至少一种选自丙烯酸和甲基丙烯酸以及如果需要的话的它们的酯的共聚物;来自甲基丙烯酰乙基甜菜碱和至少一种选自甲基丙烯酸和甲基丙烯酸酯的单体的共聚物;来自丙烯酸、丙烯酸甲酯和甲基丙烯酰氨基丙基三甲基氯化铵的共聚物(聚季铵盐-47);来自丙烯酰氨基丙基三甲基氯化铵和丙烯酸酯的共聚物或来自丙烯酰胺、丙烯酰氨基丙基三甲基氯化铵、2-酰氨基丙基丙烯酰胺磺酸盐和二甲氨基丙胺的共聚物(聚季铵

盐-43);可由季巴豆酰基甜菜碱或季巴豆酰基甜菜碱酯产生的低聚物或聚合物。在至少一个实施方案中,制剂包含两性或两性离子胶乳毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,毛发定型聚合物选自:聚季铵盐-47、辛基丙烯酰胺/丙烯酸酯/丁基氨基乙基甲基丙烯酸酯共聚物,及其混合物。

[0285] 毛发定型制剂可以包含阴离子毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,阴离子毛发定型聚合物选自:(甲基)丙烯酸或它们的酯之一的两种或更多种单体的丙烯酸酯共聚物(例如来自Akzo Nobel的 **Balance**[®] CR);丙烯酸酯/羟基酯丙烯酸酯共聚物,包括丙烯酸丁酯、甲基丙烯酸甲酯、甲基丙烯酸、丙烯酸乙酯和甲基丙烯酸羟乙酯的那些(例如来自Dow Personal Care的Acudyne[™]1000);丙烯酸、丙烯酸乙酯和N-叔丁基丙烯酰胺的三元共聚物;交联的或未交联的乙酸乙烯酯/巴豆酸共聚物;丙烯酸叔丁酯、丙烯酸乙酯和甲基丙烯酸的三元共聚物;聚苯乙烯磺酸钠;乙酸乙烯酯、巴豆酸和丙酸乙烯酯的共聚物;乙酸乙烯酯、巴豆酸和新癸酸乙烯酯的共聚物;氨基甲基丙醇/丙烯酸酯共聚物;乙烯基吡咯烷酮和至少一种选自丙烯酸、甲基丙烯酸、丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯的另外的单体的共聚物;甲基乙烯基醚和马来酸单烷基酯的共聚物;甲基丙烯酸烯丙酯和至少一种选自丙烯酸、甲基丙烯酸、丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯的另外的单体的共聚物的氨基甲基丙醇盐;丙烯酸乙酯和甲基丙烯酸的交联的共聚物;乙酸乙烯酯、马来酸单正丁酯和丙烯酸异冰片酯的共聚物;两种或更多种选自丙烯酸、甲基丙烯酸、丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯的单体的共聚物,辛基丙烯酰胺和至少一种选自丙烯酸、甲基丙烯酸、丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯的单体的共聚物;二甘醇、环己烷二甲醇、间苯二甲酸和磺基间苯二甲酸的聚酯;聚氨酯;和聚氨酯和丙烯酸酯的共聚物,例如聚氨酯-14/AMP-丙烯酸酯聚合物共混物(例如来自Akzo Nobel的 **DynamX**[®])。合适的聚酯聚合物包括聚酯-5聚合物,例如**AQ**[®]48Ultra Polymer,(二甘醇/CHDM/间苯二甲酸酯/SIP共聚物[二乙二醇、1,4-环己烷二甲醇和间苯二甲酸和磺基间苯二甲酸的简单酯的共聚物]),**AQ**[®]55S和**AQ**[®]38S,全部来自Eastman Chemical Company。还合适的是聚乙烯基甲基丙烯酸/马来酸共聚物(来自ISP的**Omnirez**[®]2000)。阴离子胶乳毛发定型聚合物也是合适的。在至少一个实施方案中,阴离子毛发定型聚合物选自:聚氨酯-1(例如来自BASF的**Luviset**[®]P.U.R.)、聚氨酯-14/AMP-丙烯酸酯共聚物共混物(例如来自Akzo Nobel的 **DynamX**[®])、(甲基)丙烯酸或它们的简单酯之一的两种或更多种单体的丙烯酸酯共聚物(例如来自Akzo Nobel的 **Balance**[®] CR),及其混合物。在至少一个实施方案中,阴离子毛发定型聚合物为聚氨酯-1。

[0286] 制剂可以包含非离子毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中,制剂包含非离子毛发定型聚合物,其中非离子毛发定型聚合物为由至少一种以下单体形成的均聚物或共聚物:乙烯基吡咯烷酮,乙烯基己内酰胺,乙烯基酯,例如乙酸乙烯酯、乙烯醇、丙烯酰胺、甲基丙烯酰胺、烷基丙烯酰胺和二烷基丙烯酰胺、烷基甲基丙烯酰胺和二烷基甲基丙烯酰胺、丙烯酸烷基酯、甲基丙烯酸烷基酯、丙二醇或乙二醇,其中这些单体中的烷基可以为C1-至C7-烷基或C1-至C3-烷基。在至少一个实施方案中,制剂包含选自以下的均聚物:乙烯基己内酰胺、乙烯基吡咯烷酮、N-乙烯基甲酰胺及其混合物。在至少一个实施方案中,非离子毛发定

型聚合物选自：乙烯基吡咯烷酮和乙酸乙烯酯的共聚物、乙烯基吡咯烷酮、乙酸乙烯酯和丙烯酸乙烯酯的三元共聚物、聚丙烯酰胺；聚乙烯基醇以及聚乙二醇/聚丙二醇共聚物；及其混合物。在至少一个实施方案中，非离子毛发定型聚合物选自：聚乙烯基吡咯烷酮/二甲氨基丙基氨基丙烯酸酯共聚物（来自ISP的 **Aquaflex**[®] SF 40）；亚异丁基乙基马来酰亚胺/羟基乙基马来酰亚胺共聚物（来自ISP的 **Aquaflex**[®] FX 64）；乙烯基己内酰胺/聚乙烯基吡咯烷酮/二甲氨基乙基甲基丙烯酸酯共聚物（来自ISP的 **Advantage**[®]）；及其混合物。胶乳毛发定型聚合物也是合适的。在至少一个实施方案中，非离子毛发定型聚合物选自：聚乙烯基吡咯烷酮（K90、85、80、60、30）、聚乙烯基吡咯烷酮/乙酸乙烯酯共聚物（PVP/VA 64）、乙烯基吡咯烷酮、甲基丙烯酰胺和乙烯基咪唑的三元共聚物（例如来自BASF的 **Luviset**[®] Clear），及其混合物。在至少一个实施方案中，非离子毛发定型聚合物选自：PVP K 60、30和PVP/VA 37/64。在至少一个实施方案中，非离子毛发定型聚合物选自：PVP K60和PVP/VA 37/64。

[0287] 在至少一个实施方案中，制剂包含阴离子胶乳毛发定型聚合物。在至少一个实施方案中，阴离子胶乳毛发定型聚合物是氨基甲酸酯基聚合物，例如聚氨酯-34（来自Bayer的 **Baycusan**[®]）。聚氨酯-34描述于EP-2105127A1中。在至少一个实施方案中，毛发定型聚合物为胶乳毛发定型聚合物聚氨酯-34。

[0288] 在至少一个实施方案中，阴离子毛发定型聚合物和/或阳离子毛发定型聚合物以中和的或部分中和的形式存在。在至少一个实施方案中，制剂包含中和剂，和其中中和剂选自：氢氧化钾、氢氧化钠、三异丙醇胺（TIPA）、2-氨基丁醇、2-氨基甲基丙醇（AMP）、氨基乙基丙二醇、二甲基硬脂胺（Armeen 18D）、硅酸钠、四羟丙基亚乙基二胺（**Neutrol**[®] TE）、氨（NH₃）、三乙醇胺、三甲胺（Tris Amino Ultra）、氨基甲基丙二醇（AMPD）及其混合物。在至少一个实施方案中，中和剂为2-氨基甲基丙醇。

[0289] 在至少一个实施方案中，制剂具有0cPs至20,000cPs的粘度。在至少一个实施方案中，制剂具有0.1cPs至10,000cPs，或1cPs至5,000cPs，或5cPs至3,500cPs的粘度。在上述定义部分限定了粘度测量条件。粘度出于抗滴落的原因可以是重要的。滴落对使用者可以是不便的。此外，更粘的制剂可以用于经测量的分散。在至少一个实施方案中，制剂具有0cPs至1,000cPs的粘度。当制剂为洁面乳形式时，鉴于需要在皮肤上分散和冲洗掉的能力，该粘度范围是有利的。

[0290] 在至少一个实施方案中，制剂另外包含粘度改变性物质。粘度改变性物质优选为增稠聚合物。

[0291] 在至少一个实施方案中，增稠聚合物为基于丙烯酰氨基甲基丙烷磺酸的聚合物（**AMPS**[®], Lubrizol）。这些聚合物，甚至在7以下的pH值也显示出良好的增稠性能。特别优选地，增稠聚合物选自丙烯酰氨基甲基丙烷磺酸及其盐的均聚物或共聚物。刚才提及的聚合物中，转而优选的是具有至少20mol-%的基于丙烯酰氨基甲基丙烷磺酸和/或其盐的单元的聚合物，并且尤其优选具有至少50mol-%的基于丙烯酰氨基甲基丙烷磺酸和/或其盐的单元的聚合物，摩尔数在每种情况下涉及整个聚合物。在共聚物的情况下，以及基于丙烯酰氨基甲基丙烷磺酸和/或其盐的结构单元，优选一个或更多个基于以下共聚单体的结构

单元存在于共聚物中：丙烯酸；甲基丙烯酸；丙烯酰胺；二甲基丙烯酰胺；乙烯基吡咯烷酮（VP）；丙烯酸羟乙酯；甲基丙烯酸羟乙酯；乙氧基化的醇 $R-O-(CH_2CH_2O)_mH$ 的丙烯酸酯或甲基丙烯酸酯，其中R为具有12至30个碳原子的烷基和m为3至30的数，和 $CH_2=CH-COO-(CH_2CH_2-COO)_nX$ ，其中n为0至10的数，和X为反离子并且优选为 H^+ 、 Na^+ 和/或 NH_4^+ 。选自丙烯酰氨基甲基丙烷磺酸及其盐的均聚物或共聚物的聚合物可以为交联的或未交联的。在交联的情况下，它们含有基于具有2个以上烯属双键的单体的结构单元。在交联的情况下，优选0.1至10mol-%的这样的结构单元存在于均聚物或共聚物中，基于整个聚合物计。如果丙烯酰氨基甲基丙烷磺酸和/或其盐的均聚物或共聚物中的一个或更多个基于丙烯酰氨基甲基丙烷磺酸和/或其盐的结构单元具有一个或更多个不是 H^+ 的反离子，则这些其它的反离子优选选自 Na^+ 和 NH_4^+ 。在公开文件中提及了合适的聚合物，包括EP-0816403、EP-1069142、EP-1116733和DE-10 2009 014877 (Clariant)、EP-1347736 (L'Oréal) 或EP-1496081 (Seppic)。实例包括：**Aristoflex**[®]AVC（丙烯酰基二甲基牛磺酸铵/VP共聚物）、**Aristoflex**[®]AVS（丙烯酰基二甲基牛磺酸钠/VP交联聚合物）、**Aristoflex**[®]TAC（丙烯酰基二甲基牛磺酸铵丙烯酸羧基乙基酯交联聚合物）、**Hostacerin**[®]AMP5（聚丙烯酰基二甲基牛磺酸铵）、**Aristoflex**[®]HMB（丙烯酰基二甲基牛磺酸铵/山萘聚醚-25甲基丙烯酸酯交联聚合物）、**Aristoflex**[®]BLV（丙烯酰基二甲基牛磺酸铵/山萘聚醚-25甲基丙烯酸酯交联聚合物）、**Aristoflex**[®]HMS（丙烯酰基二甲基牛磺酸铵/硬脂聚醚-25甲基丙烯酸酯交联聚合物）、**Aristoflex**[®]SNC（丙烯酰基二甲基牛磺酸铵/硬脂聚醚-8甲基丙烯酸酯共聚物）、**Aristoflex**[®]LNC（丙烯酰基二甲基牛磺酸铵/月桂聚醚-7甲基丙烯酸酯共聚物）或**Sepinov**[®]EMT 10（丙烯酸羟乙酯/丙烯酰基二甲基牛磺酸钠共聚物）、**Sepigel**[®]305。

[0292] 在至少一个实施方案中，增稠聚合物选自：至少一种选自丙烯酸和甲基丙烯酸的第一单体类型和至少一种选自丙烯酸和乙氧基化的脂肪醇的酯的第二单体类型的共聚物；交联的聚丙烯酸；至少一种选自丙烯酸和甲基丙烯酸的第一单体类型和至少一种选自丙烯酸与 C_{10} -至 C_{30} -醇的第二单体类型的交联的共聚物；至少一种选自丙烯酸和甲基丙烯酸的第一单体类型和至少一种选自衣康酸和乙氧基化的脂肪醇的酯的第二单体类型的共聚物；至少一种选自丙烯酸和甲基丙烯酸的第一单体类型和至少一种选自衣康酸和乙氧基化的 C_{10} -至 C_{30} -醇的酯的第二单体类型和选自 C_1 -至 C_4 -氨基烷基丙烯酸酯的第三单体类型的共聚物；选自丙烯酸、甲基丙烯酸、丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯的两种或更多种单体的共聚物；乙烯基吡咯烷酮和丙烯酰基二甲基牛磺酸铵的共聚物；丙烯酰基二甲基牛磺酸铵和选自甲基丙烯酸和乙氧基化的脂肪醇的酯的单体的共聚物；羟乙基纤维素；羟丙基纤维素；羟丙基瓜尔胶；聚丙烯酸甘油酯；聚甲基丙烯酸甘油酯；至少一种 C_2 -、 C_3 -或 C_4 -烯烃和苯乙烯的共聚物；聚氨酯；羟丙基淀粉磷酸酯；聚丙烯酰胺；用癸二烯交联的甲基乙烯基醚和马来酸酐的共聚物；角豆种子粉；瓜尔胶；黄原胶；脱氢黄原胶；角叉菜胶；刺梧桐树胶；氢化玉米淀粉；聚氧化乙烯、脂肪醇和饱和亚甲基二苯基二异氰酸酯的共聚物（例如PEG-150/硬脂醇/SMDI共聚物）；及其混合物。

[0293] 在至少一个实施方案中，制剂具有2.0至12.0，优选3.0至9.0，更优选4.5至7.5的

pH值。通过改变pH值,可以使得制剂可适合于不同的应用。

[0294] 在至少一个实施方案中,制剂包含碱化剂或pH调节剂。在至少一个实施方案中,氨或苛性钠是合适的,但是也可以考虑有机和无机碱的水溶性生理学上可容忍的盐。任选地,pH调节剂选自碳酸氢铵、氨、单乙醇胺、碳酸铵。在至少一个实施方案中,碱化剂选自2-氨基-2-甲基-1-丙醇、2-氨基-2-甲基-1,3-丙二醇、2-氨基-2-乙基-1,3-丙二醇、三(羟甲基)-氨基甲烷2-氨基-1-丁醇、三-(2-羟丙基)-胺、2,2-亚氨基双乙醇、赖氨酸、亚氨基脲(碳酸胍)、四氢-1,4-噁嗪、2-氨基-5-胍-戊酸、2-氨基乙烷磺酸、二乙醇胺、三乙醇胺、N-甲基乙醇胺、异丙醇胺、二异丙醇胺、三异丙醇胺、葡糖胺、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化锂和氧化镁,及其混合物。

[0295] 为了建立酸性pH值,可以包含酸。在至少一个实施方案中,制剂包含选自盐酸、磷酸、乙酸、甲酸、硫酸、盐酸、柠檬酸,及其混合物的酸。柠檬酸是最优选的,因为其具有高的消费者接受度。在至少一个实施方案中,用缓冲剂如磷酸盐缓冲剂、TRIS缓冲剂或柠檬酸缓冲剂调节酸性pH。缓冲剂可以单独或与酸组合使用。

[0296] 在至少一个实施方案中,制剂为液体形式。在替代性实施方案中,制剂为固体形式。任选地,制剂为粉末化或粒化形式。这是有利的,因为不需要运输液体,这典型地是长途跋涉,具有经济和环境益处。可以通过将制剂喷雾干燥或使用旋转蒸发器实现固体形式。可以将制剂在其运输之后例如通过添加水转变成液体形式。

[0297] 在至少一个实施方案中,组合物选自洗发剂、沐浴露、洁面乳、面膜、气泡浴、私处洗液、沐浴油、清洁乳、胶束水、卸妆剂、清洁湿巾、发膜、香精、液体皂、剃须皂、剃须膏、洁面泡沫、日霜、抗衰老霜、身体乳、润肤露、身体摩丝、面部精华、眼霜、防晒剂乳液、防晒霜、面霜、须后乳液、预剃须膏、脱毛膏、美白凝胶、自晒黑霜、抗痘凝胶、睫毛膏、粉底、妆前乳、遮瑕膏、腮红、古铜色、遮瑕(bb)膏、眼线、晚霜、眼眉凝胶、轮廓色、唇彩、免水洗手液、发油、卸甲油、护发素、毛发定型凝胶、毛发定型霜、抗毛躁精华、头皮护理、染发剂、发尾修护液、除臭剂、止汗剂、婴儿霜、驱虫剂、护手霜、防晒剂凝胶、护脚霜、去角质、身体磨砂、橘皮组织治疗剂、块皂、角质霜、润唇膏、毛发护理剂、眼影、沐浴添加剂、身体喷雾、淡香水、漱口水、牙膏、润滑凝胶、增湿剂、精华、爽肤水、保湿糕、膏状凝胶、定型摩丝、干洗剂、唇膏、唇釉、水醇凝胶、身体油、淋浴乳、高光液、唇蜡笔、发胶、精梳霜和防晒剂。

[0298] 在至少一个实施方案中,制剂为家用清洁制剂。

[0299] 在至少一个实施方案中,制剂为手洗制剂。在至少一个实施方案中,手洗制剂包含阴离子表面活性剂。在至少一个实施方案中,手洗制剂包含5重量%至25重量%的阴离子表面活性剂。在至少一个实施方案中,手洗制剂包含表面活性剂体系,所述表面活性剂体系包含至少一种阴离子表面活性剂和选自非离子表面活性剂、两性表面活性剂或两性离子表面活性剂的另外的表面活性剂。优选地,手洗制剂包含椰油酰氨基丙基甜菜碱或胺氧化物。优选地,胺氧化物为月桂胺氧化物、椰油酰基胺氧化物或其组合。在至少一个实施方案中,手洗制剂的pH值为介于pH 5.0与pH 10之间,优选pH 5.5至9.0。在包含胺氧化物的手洗制剂的情况下,手洗制剂优选具有介于pH 7.5与pH 9.5之间,最优选pH 8.0与pH 9.0之间的pH。

[0300] 在至少一个实施方案中,制剂为硬表面清洁剂。在至少一个实施方案中,硬表面清洁剂包含阴离子表面活性剂。在至少一个实施方案中,硬表面清洁剂包含1重量%至10重量%的阴离子表面活性剂。在至少一个实施方案中,硬表面清洁剂包含非离子表面活性剂。

在至少一个实施方案中,硬表面清洁剂包含1重量%至10重量%的非离子表面活性剂。在至少一个实施方案中,硬表面清洁剂包含表面活性剂体系,所述表面活性剂体系包含至少一种阴离子表面活性剂和选自非离子表面活性剂、两性表面活性剂和两性离子表面活性剂,或其组合的另外的表面活性剂。优选地,硬表面清洁剂包含直链烷基苯磺酸盐/酯和脂肪醇乙氧基化物。在至少一个实施方案中,硬表面清洁剂的pH值为介于pH 5.0与pH 11之间,优选pH 6.0至pH 9.0。

[0301] 在至少一个实施方案中,制剂为包含一种或更多种表面活性剂的液体衣物洗涤剂制剂。优选地,液体衣物洗涤剂制剂的一种或更多种表面活性剂选自阴离子、非离子、阳离子和两性离子表面活性剂,并且更优选选自阴离子、非离子和两性离子表面活性剂。

[0302] 阴离子表面活性剂

[0303] 在至少一个实施方案中,制剂包含阴离子表面活性剂。阴离子表面活性剂特别可用于清洁制剂,如家用清洁制剂中。优选的阴离子表面活性剂为烷基磺酸盐和烷基醚磺酸盐。

[0304] 优选的烷基磺酸盐为烷基苯磺酸盐,特别是具有C8-C15烷基链长度的直链烷基苯磺酸盐(LAS)。浓缩的碱性液体的可能的反离子为铵离子,例如通过用一种或更多种乙醇胺,例如单乙醇胺(MEA)和三乙醇胺(TEA)中和烷基苯磺酸产生那些,或替代地为碱金属,例如由用碱金属氢氧化物中和烷基苯磺酸产生的那些。直链烷基苯磺酸表面活性剂可以为具有8至15并且更优选12至14的烷基链长的LAS。优选的烷基醚磺酸盐(AES)为烷基聚乙氧基化物磺酸盐阴离子表面活性剂。

[0305] 非离子表面活性剂

[0306] 在至少一个实施方案中,制剂包含非离子表面活性剂。非离子表面活性剂包括伯和仲醇乙氧基化物,特别是用每摩尔醇平均1至20摩尔的氧化乙烯乙氧基化的C8-C20脂族醇,并且更特别是用每摩尔醇平均1至10摩尔氧化乙烯乙氧基化的C10-C15伯和仲脂族醇。非乙氧基化的非离子表面活性剂包括烷基聚糖苷、甘油单醚和多羟基酰胺(葡糖酰胺)。可以使用非离子表面活性剂的混合物。

[0307] 当包括在其中时,家用清洁制剂,特别是液体衣物洗涤剂制剂,优选包含0.2重量%至40重量%,更优选1重量%至20重量%的非离子表面活性剂,如醇乙氧基化物、壬基苯酚乙氧基化物、烷基聚糖苷、烷基二甲基胺氧化物、乙氧基化的脂肪酸单乙醇酰胺、脂肪酸单乙醇酰胺、多羟基烷基脂肪酸酰胺、葡糖胺的N-酰基-N-烷基衍生物(“葡糖酰胺”),或其组合。可以使用的非离子表面活性剂包括伯和仲醇乙氧基化物,特别是用每摩尔醇1至35摩尔氧化乙烯乙氧基化的C8-C20脂族醇,并且更特别是用每摩尔醇平均1至10摩尔氧化乙烯乙氧基化的C10-C15伯和仲脂族醇。

[0308] 两性离子表面活性剂

[0309] 在至少一个实施方案中,制剂包含两性离子表面活性剂。液体衣物洗涤剂制剂可以包含两性离子表面活性剂,例如胺氧化物或甜菜碱,优选以至多10重量%的量,基于液体衣物洗涤剂制剂的总重量计。

[0310] 甜菜碱可以为烷基二甲基甜菜碱或烷基酰氨基甜菜碱,其中烷基具有C12-18链。

[0311] 另外的表面活性剂

[0312] 在至少一个实施方案中,液体衣物洗涤剂制剂包含选自阴离子表面活性剂、非离

子表面活性剂,及其混合物的表面活性剂;优选地,表面活性剂选自直链烷基苯磺酸盐、烷基醚硫酸盐、非离子表面活性剂、胺氧化物和甜菜碱;并且更优选选自直链烷基苯磺酸盐、烷基醚硫酸盐和非离子表面活性剂。

[0313] 可以将不同于优选的LAS、AES和非离子表面活性剂的表面活性剂添加至根据第六方面的制剂。

[0314] 尽管没那么优选,但是可以使用一些烷基硫酸盐表面活性剂,特别是非乙氧基化的C12-15伯和仲烷基硫酸盐。还可以使用皂。皂的水平优选低于10重量%。

[0315] 优选地,液体衣物洗涤剂制剂中的一种或更多种表面活性剂以至少5重量%,更优选5重量%至65重量%,甚至更优选6至60重量%并且极其优选7重量%至55重量%的量存在,在每种情况下基于液体衣物洗涤剂制剂的总重量计。

[0316] 另外的任选的成分

[0317] 家用清洁制剂可以包含一种或更多种任选的成分,例如它们可以包含通常用于洗涤剂组合物,特别是衣物洗涤剂组合物中的常规成分。任选的成分的实例包括,但不限于,助洗剂、漂白剂、漂白活性化合物、漂白活化剂、漂白催化剂、光漂白剂、染料转移抑制剂、色素保护剂、抗再沉积剂、分散剂、织物柔软剂和抗静电剂、荧光增白剂、酶、酶稳定剂、泡沫调节剂、消泡剂、恶臭减少剂、防腐剂、消毒剂、水溶助长剂、纤维润滑剂、抗收缩剂、缓冲剂、香料、加工助剂、着色剂、染料、颜料、抗腐蚀剂、填料、稳定剂和用于衣物洗涤剂组合物的其它常规成分。

[0318] 聚合物

[0319] 对于洗涤增效,可以有利地在家用清洁制剂中,特别是在液体衣物洗涤剂制剂中使用聚合物。该聚合物优选为聚烷氧基化的聚亚乙基亚胺(EPEI)。聚亚乙基亚胺为由亚乙基亚胺单元-CH₂CH₂NH-组成的材料,并且当支化时,氮上的氢被亚乙基亚胺单元地另一个链替代。可以例如通过在催化剂如二氧化碳、亚硫酸氢钠、硫酸、过氧化氢、盐酸、乙酸等存在下聚合亚乙基亚胺制备这些聚亚乙基亚胺。用于制备这些多胺骨架的具体方法公开于US 2,182,306、US 3,033,746、US 2,208,095、US2,806,839和US 2,553,696中。

[0320] 家用清洁制剂,特别是液体衣物洗涤剂制剂可以包含其它聚合物材料,例如:染料转移抑制聚合物、抗再沉积聚合物和棉污垢释放聚合物,特别是基于改性的纤维素材料的那些。特别是当不存在EPEI时,制剂可以另外包含聚乙二醇和乙酸乙烯酯的聚合物,例如WO 2007/138054中描述的轻度接枝的共聚物。基于水溶性聚亚烷基氧化物作为接枝基础和通过聚合乙烯基酯组分形成的侧链的这样的两亲性接枝聚合物具有使得表面活性剂水平降低同时保持高水平的油性污垢去除的能力。

[0321] 水溶助长剂

[0322] 在至少一个实施方案中,制剂包含水溶助长剂。在本文中,“水溶助长剂”为溶剂,其不是水也不是常规表面活性剂,并且辅助表面活性剂和其它成分,特别是任何聚合物和/或螯合剂在液体中的溶解,以促使其各向同性。水溶助长剂在家用清洁制剂中特别有用。在合适的水溶助长剂中,以下是特别值得注意的:单丙二醇(MPG),甘油,枯烯磺酸钠,乙醇,其它二醇,例如二丙二醇,二醚和脲。MPG和甘油是优选的水溶助长剂。

[0323] 酶

[0324] 在至少一个实施方案中,制剂,特别是液体衣物洗涤剂制剂包含酶。在至少一个实

施方案中,酶选自蛋白酶、甘露聚糖酶、果胶酸裂解酶、角质酶、酯酶、脂肪酶、淀粉酶、纤维素酶,及其组合。不那么优选的另外的酶可以选自过氧化物酶和氧化酶。酶优选与对应的酶稳定剂一起存在。制剂中的总酶含量优选为0重量%至5重量%,更优选0.5重量%至5重量%并且甚至更优选1重量%至4重量%,按制剂的总重量计。

[0325] 螯合剂

[0326] 螯合剂优选包括在制剂中,特别是家用清洁制剂中。优选的螯合剂包括有机膦酸盐、烷烃羟基膦酸盐和羧酸盐,其以DEQUEST商标可得自Thermphos。优选的螯合剂水平小于10重量%并且优选小于5重量%,按制剂的总重量计。特别优选的螯合剂为HEDP(1-羟基次乙基-1,1-二膦酸),例如作为Dequest 2010销售。还合适的但没那么优选(因为产生较差的清洁结果)的是**Dequest®2066**(二亚乙基三胺五(亚甲基膦酸)或Heptasodium DTPMP)。

[0327] 缓冲剂

[0328] 在至少一个实施方案中,制剂,特别是液体衣物洗涤剂制剂包含缓冲剂。除了任选包括的用于例如由LAS或脂肪酸产生阴离子表面活性剂的试剂以外,缓冲剂的存在对于pH控制而言是优选的。可能的缓冲剂为一种或更多种乙醇胺,例如单乙醇胺(MEA)或三乙醇胺(TEA)。它们优选以1.0至15重量%的水平用于制剂中。其它合适的氨基醇缓冲剂材料可以选自具有大于61g/mol的分子量的化合物,其包括MEA。除了已经提及的材料以外,合适的材料还包括:单异丙醇胺、二异丙醇胺、三异丙醇胺、单氨基己醇、2-[(2-甲氧基乙基)甲基氨基]-乙醇、丙醇胺、N-甲基乙醇胺、二乙醇胺、单丁醇胺、异丁醇胺、单戊醇胺、1-氨基-3-(2-甲氧基乙氧基)-2-丙醇、2-甲基-4-(甲基氨基)-2-丁醇及其混合物。

[0329] 氨基乙醇缓冲剂的潜在的替代物为碱金属氢氧化物如氢氧化钠或氢氧化钾。

[0330] 实施例

[0331] 以下实施例旨在说明本发明的主题而不将其限制于此。

[0332] 第一方面的化合物X的合成实施例

[0333] 合成实施例1:制备N-辛酰基-N-甲基环状葡糖酰胺:

[0334] 在250mL玻璃烧瓶(配备有搅拌器、滴液漏斗、水分离器、氮气线和真空线)中放置221.8g的N-甲基-葡糖胺(0.50mol)的约44%水溶液。在搅拌时将该溶液加热至135℃以蒸发水。然后在135℃施加30mbar真空1h。之后将温度升高至160℃并且用氮气破坏真空。将72.1g(0.50mol)经升温的辛酸(120℃)缓慢地添加至N-甲基-葡糖胺的热熔体以避免起泡和凝胶相。随着适中的氮气流将反应混合物搅拌另外的小时数(约6)以得到低于1%的酸浓度(酸数的滴定)并且在整个时间期间收集水。然后将热混合物填充在合适的玻璃瓶中。获得150g黄色至淡棕色高粘性液体。得到的产物含有92%的期望的N-辛酰基-N-甲基环状葡糖酰胺,通过GC在衍生化之后测量。

[0335] 合成实施例2:遵循根据合成实施例1的步骤,不同之处在于放置(0.50mol)经升温的辛酸(120℃)与0.50mol经升温的癸酸(120℃)。得到的产物含有N-癸酰基-N-甲基环状葡糖酰胺,通过GC在衍生化之后测量。

[0336] 合成实施例3:遵循根据合成实施例1的步骤,不同之处在于放置(0.50mol)经升温的辛酸(120℃)与0.50mol经升温(120℃)的癸酸和辛酸的混合物。得到的产物含有N-辛酰基-N-甲基环状葡糖酰胺和N-癸酰基-N-甲基环状葡糖酰胺的混合物,通过GC在衍生化之后测量。

[0337] 表1:第一方面的组合物实施例

	实施例								
	1	2	3	4	5	6	7	8	9
* N-癸酰基-N-甲基环状葡糖酰胺	-	92	15	-	30	35	85	40	-
# N-辛酰基-N-甲基环状葡糖酰胺	60	-	15	92	30	47	-	40	30
根据式(2)和/或(3)的化合物	-	-	-	-	-	8	-	1	5
其它副产物	-	8	-	8	-	10	5	4	2
水	40	-	70	-	40	-	10	15	63
总计[%]	100	100	100	100	100	100	100	100	100

[0339] 注释:

[0340] * = 根据式 (I) 的化合物, 其中R为- (CH₂)₈CH₃;[0341] # = 根据式 (I) 的化合物, 其中R为- (CH₂)₆CH₃。

[0342] 表2:第三方面的浓缩物实施例

实施例	10	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20	21	22	23	23a
* N-癸酰基-N-甲基-葡糖酰胺	45	15	30	30	25	25	20	-	65	30	20	30	20	40	30
#N-辛酰基-N-甲基-葡糖酰胺	45	15	30	30	25	25	20	65	-	30	40	65	40	20	30
羟吡酮	10	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	5	-
苯氧乙醇	-	70	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
苯甲醇	-	-	40	-	-	-	-	-	-	25	-	-	-	-	-
苯乙醇	-	-	-	40	-	-	-	-	-	-	-	-	-	5	-
苯甲酸	-	-	-	-	20	-	-	-	15	-	-	-	-	-	-
苯甲酸钠	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	20	-	-	-	-
山梨酸	-	-	-	-	-	20	-	-	15	-	-	-	-	-	-
山梨酸钾	-	-	-	-	-	-	-	25	-	-	-	-	-	-	-
脱氢乙酸	-	-	-	-	-	-	-	-	-	14	-	-	-	-	-
生育酚	-	-	-	-	-	1	-	1	-	1	-	0.5	-	0.5	-
对甲氧基苯甲酸	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	20	10	-
苯并异噻唑啉酮 (BIT)															2
香精	-	-	-	-	-	-	5	-	-	-	-	4.5	-	5	-
丙二醇	-	-	-	-	15	14	20	-	5	-	10	-	15	-	-
甘油	-	-	-	-	-	15	30	-	-	-	-	-	-	14.5	-
水	-	-	-	-	15	-	5	9	-	-	10	-	5	-	38
总计 (%)	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100

[0344] 表2的注释:

[0345] * = 根据式 (I) 的化合物, 其中R为- (CH₂)₈CH₃;[0346] # = 根据式 (I) 的化合物, 其中R为- (CH₂)₆CH₃。

[0347] 表3:第六方面的制剂实施例

[0348]

	实施例				
	24	25	26	27	28
制剂	液体皂	沐浴露	湿巾乳液	洗发剂	洗发剂
实施例 10 的浓缩物 ¹	-	-	-	-	2
实施例 13 的浓缩物 ¹	-	-	-	1.5	-
实施例 14 的浓缩物 ¹	-	2	-	-	-
组合物 6 ²	1.5	-	1.0	-	-
SLES	10	-	-	-	9
椰油酰氨基-丙基甜菜碱	2	4.5	-	-	2
椰油酰胺 MEA	-	-	-	-	1
椰油酰基谷氨酸钠	-	2	1	2	-
椰油酰基甘氨酸钠	-	2	1	2	-
椰油酰基羟乙基磺酸钠	-	2		-	-
椰油酰基甲基葡萄糖酰胺	-	3	2	-	-
EGDS	-	0.5	-	-	0.7
PEG-7 椰油酸甘油酯	-	-	1	-	-
椰油酰基葡萄糖苷	-	-	-	5	-
月桂基葡萄糖苷	-	-	-	5	-
丙烯酸共聚物	-	-	-	2	-
甘油	-	-	-	1	2
泛醇	-	-	-	0.2	0.2
聚二甲基硅氧烷	-	-	-	-	-
聚季铵盐 7 (PQ-7)	-	-	-	-	0.6
瓜尔羟丙基三甲基氯化铵	-	-	-	-	0.3
水解蛋白	-	-	-	-	0.1
香精	0.2	0.2	0.1	-	0.8
NaCl	1.5	1.0	0.5	0.3	1.5
水	QSP	QSP	QSP	QSP	QSP
总计	100%	100%	100%	100%	100%
pH	5.0	4.5	7	6.5	ND
粘度 (mPa.s)	4000	3000	100	5500	ND

[0349] 注释:

[0350] 1=参见上表2;

[0351] 2=参见上表1;

[0352] ND=未测定。

[0353] 表3:第六方面的制剂实施例(续表)

[0354]

	实施例				
	29	30	31	32	33
制剂	§	§	§	§	§
实施例 11 的浓缩物 ¹	-	-	-	-	2
实施例 14 的浓缩物 ¹	-	-	-	1.5	-
实施例 15 的浓缩物 ¹	-	2	-	-	-
实施例 23a 的浓缩物 ¹	2	-	1.0	-	-
月桂醚硫酸钠(SLES)	18	18	19	8	-
椰油酰氨基丙基甜菜碱	8	-	-	4	-
烷烃磺酸钠	-	-	-	24	-
月桂基二甲基胺氧化物	-	-	6	-	5
乙醇	7	4	-	-	-
椰油葡糖酰胺	-	8	-	-	-
香精	0.2	0.2	0.1	0.1	0.8
枯烯磺酸盐	-	-	1.5	-	-
α-烯基磺酸盐(Na 盐)	-	-	-	-	15
水 & 助剂	QSP	QSP	QSP	QSP	QSP
总计	100%	100%	100%	100%	100%
pH 值	6.0	5.5	8.5	5.5	8.5

[0355] 注释:

[0356] 1=参见上表2;

[0357] 2=参见上表1;

[0358] §=手洗制剂。

[0359] 表3:第六方面的制剂实施例(续表)

[0360]

	实施例			
	34	35	36	37
制剂	身体乳液	强效手和身体乳液	抗衰老晚霜	婴儿霜
实施例 10 的浓缩物 ¹	-	-	-	-
实施例 13 的浓缩物 ¹	-	-	-	1.5
实施例 14 的浓缩物 ¹	-	2	-	-
组合物 1 至 9 之一 ²	1.5	-	1.0	-
硬脂酸乙基己基酯	7	-	-	-
油酸癸酯	5	-	-	-
Plantasens® Natural Emulsifier HE 20 (Clariant), 其为鲸蜡硬脂基葡糖苷(和)失水山梨醇橄榄油酸酯	3	-	-	-
聚二甲基硅氧烷	2	-	-	-
甘油	3	3	7	-
黄原胶	0.2	-	-	-
来自 Clariant 的 Aristoflex® AVC (丙烯酸基二甲基牛磺酸铵/VP 共聚物)	0.5	1	-	-
香料	0.3	-	0.3	0.3
聚甘油基-2-倍半异硬脂酸酯	-	0.5	-	2
三月桂醇聚醚-4 磷酸酯	-	2	-	-
矿物油 (液体石蜡, Paraffinum Liquidum)	-	5	-	-
来自 Clariant 的 Plantasens®精制有机巴巴苏脂(巴巴苏籽油)	-	2	-	-
角鲨烷	-	2	12	-

[0361]

澳洲坚果籽油(和)深海两节荠籽油(和)巴巴苏籽油	-	2	-	-
来自 Clariant 的 Silcare [®] 有机硅 SEA (十三烷醇聚醚-9 PG-氨基聚二甲基硅氧烷和十三烷醇聚醚-12)	-	0.5	-	-
鲸蜡硬脂醇	-	2	-	-
棕榈酸异丙酯	-	4	-	-
Dow Corning [®] 345 (环戊硅氧烷和环己硅氧烷)	-	-	10	-
石蜡油, 低粘度	-	-	4	10
凡士林	-	-	4	15
鲸蜡醇	-	-	3	-
Cutina [®] GMS (硬脂酸甘油酯)	-	-	2.5	-
PEG-40 硬脂酸酯	-	-	3	-
白蜂蜡	-	-	2	-
芒果(Mango)籽脂	-	-	2	-
深海两节荠油(和)植物甾醇(和)油橄榄(Olive)油, 不可皂化的	-	-	0.5	-
失水山梨醇三硬脂酸酯	-	-	0.3	-
泛醌	-	-	0.05	-
来自 Clariant 的 Aristoflex [®] Velvet (丙烯酸酯交联聚合物-11)	-	-	0.3	-
来自 Clariant 的 Hostacerin [®] SFO (葵花籽油山梨醇酯)	-	-	-	3.5
Paracera [®] M (Cera Microcristallina)	-	-	-	2
蜂蜡	-	-	-	1
硬脂酸镁	-	-	-	1
滑石	-	-	-	10
氧化锌	-	-	-	10

[0362]

尿囊素(Clariant)	-	-	-	0.3
Extrapon Hamamelis	-	-	-	2
D-泛醇	-	-	-	2
水	QSP	QSP	QSP	QSP
pH	pH 5	pH 5.2-5.7	ND	ND
总计	100%	100%	100%	100%

[0363] 注释:

[0364] 1=参见上表2;

[0365] 2=参见上表1,

[0366] ND=未测定。

[0367] 表3:第六方面的制剂实施例(续表)

[0368]

	实施例				
	38	39	41	42	43
制剂	\$	\$	\$	\$	\$
实施例 11 的浓缩物 ¹	-	-	-	2	2
实施例 14 的浓缩物 ¹	-	-	2	-	-
实施例 15 的浓缩物 ¹	-	2	-	-	-
任意组合物 1 至 23a ¹	1	-	-	-	-
月桂醚硫酸钠 (SLES)	2	2	2	-	-
月桂基二甲基胺氧化物	2	-	-	-	2
烷基苯磺酸盐	-	-	-	2	2
月桂聚醚-7	-	-	2	2	
己酰/辛酰-葡萄糖酰胺	-	2	-	-	-
香精	0.2	0.2	0.1	0.1	0.8
水 & 助剂	QSP	QSP	QSP	QSP	QSP
总计	100%	100%	100%	100%	100%
pH 值	8.0	5.0	5.5	7.0	8.5

[0369] 注释:

[0370] 1=参见上表2;

[0371] 2=参见上表1;

[0372] §=硬表面清洁剂

[0373] 表3:第六方面的制剂实施例(续表)

[0374]

	实施例				
	38	39	41	42	43
制剂	&	&	&	&	&
实施例 11 的浓缩物 1	-	2	-	2	2
组合物 1 至 23a 之一 1	1	-	1	-	-
月桂醚硫酸钠 (SLES)	10	15	5	15	2
烷基苯磺酸盐	10	5	15	0	15
月桂聚醚-7	10	10	10	10	8
C12/14 脂肪酸皂	3	3	3	5	5
香精	0.2	0.2	0.1	0.1	0.8
水 & 助剂	QSP	QSP	QSP	QSP	QSP
总计	100%	100%	100%	100%	100%

[0375] 注释:

[0376] 1=参见上表2;

[0377] 2=参见上表1;

[0378] &=液体衣物洗涤剂制剂

[0379] 表3:第六方面的制剂实施例(续表)

[0380]

实施例	44	45	46	47	48	49
制剂	皂制剂	皂条	沐浴露	洗发剂	沐浴霜	沐浴露
实施例 10 的浓缩物 ¹	-	-	-	-	1	-
实施例 13 的浓缩物 ¹	-	-	-	1.5	-	0.8
实施例 14 的浓缩物 ¹	-	2	-	-	-	-
组合物 6 ²	1.5	-	1.0	-	-	-
月桂基硫酸钠	-	-	10	-	-	-
月桂基硫酸铵	-	-	-	12	-	-

[0381]

月桂醚硫酸钠(SLES)	15	-	2	-	-	-
椰油酰氨基-丙基甜菜碱	7	-	2	3	-	2
椰油酰胺 MEA	-	-	1	-	-	2
月桂酸	0.5	2	-	-	-	10
肉豆蔻酸	1.5	2	-	-	-	10
硬脂酸	0.5	2	-	-	10	-
棕榈酸	-	2	-	-	-	10
牛脂酸钾	-	2	-	-	-	-
棕榈仁油酸钠	-	20	-	-	-	-
椰油酸钠	-	60	-	-	-	-
月桂基葡糖苷	-	-	-	4	-	-
椰油酰基羟乙基磺酸钠	-	-	-	-	14	-
甘油	-	5	-	-	-	5
鲸蜡硬脂醇	1.5	-	-	-	2	-
聚二甲基硅氧烷	-	-	-	-	0.1	-
聚季铵盐 7 (PQ-7)	-	-	-	0.2	-	-
瓜尔羟丙基三甲基氯化铵	-	-	0.3	-	-	-
水解蛋白	-	-	-	0.1	-	-
香精	1	0.2	0.1	-	0.8	0.7
NaCl	1.5	-	0.5	0.3	-	2.5
水	QSP	QSP	QSP	QSP	QSP	QSP
总计	100%	100%	100%	100%	100%	100%
pH	6.5	4.5	7	6.5	8.5	9.5
粘度 (mPa.s)	3000	3000	1000	5500	10000	2500

[0382] 注释:

[0383] 1=参见上表2;

[0384] 2=参见上表1;

[0385] 使用制剂的方法实施例:

[0386] 表3的实施例1为洗发剂制剂。将本发明的洗发剂制剂以常规的方式用于清洁和调理毛发和皮肤。例如,将有效量的用于清洁和调理毛发或皮肤的组合物施加至优选已经用水润湿的毛发或皮肤,然后冲洗。这样的有效量通常在约1克至约50克,优选约1克至约20克

的范围内。施加至毛发典型地包括使组合物处理毛发,使得大多数或全部毛发与组合物接触。例如,为了清洁和调理毛发和皮肤包括以下步骤:a)用水润湿毛发或皮肤,b)将有效量的洗发剂组合物施加至毛发或皮肤,和c)用水冲洗皮肤或毛发的经施加的区域。这些步骤可以重复实现期望的清洁和/或调理益处所需要的那么多的次数。

[0387] 实验1

[0388] 为了测试细菌的抑制作用,将上表1中的组合物6稀释在丁基聚乙二醇中,并在50℃以不同浓度添加至液体Caso琼脂中并且缓冲至pH7 (+/-0.2)。为了测试酵母和霉菌的抑制作用,将组合物6在丁基聚乙二醇中稀释,并在50℃以不同浓度添加至液体Sabouraud-4%葡萄糖-琼脂中,并缓冲至pH 5.6 (+/-0.2)。将每种溶液倒入培养皿中并且分别用相同量的细菌、酵母或霉菌接种。最小抑制浓度(MIC)是抑制相应微生物生长的组合物6的最低浓度,其中下一个最低稀释度不能抑制所述微生物的生长。

[0389] 实验在科学合理的条件下进行,以便进行适当的比较并得出结论。

[0390] 表4:MIC数据的表

[0391]

生物; 细菌(B)、酵母(Y)和霉菌(M)	失水山梨醇辛酸酯的 MIC [ppm]	组合物 6 的 MIC [ppm]
金黄色葡萄球菌 (<i>Staphylococcus aureus</i>) (B)	800	600
铜绿假单胞菌 (<i>Pseudomonas aeruginosa</i>) (B)	10000	10000

[0392]

大肠杆菌(<i>Escherichia coli</i>) (B)	10000	10000
产气肠杆菌 (<i>Enterobacter aerogenes</i>) (B)	10000	10000
肺炎克雷伯杆菌 (<i>Klebsiella pneumoniae</i>) (B)	800	800
日勾维肠杆菌 (<i>Enterobacter gergovia</i>) (B)	10000	10000
弗氏柠檬酸杆菌 (<i>Citrobacter freundii</i>) (B)	10000	10000
杰氏杆菌 (<i>Cornyeibacterium jeikeium</i>) (B)	4000	4000
<i>Cornyeibacterium xerosis</i> (B)	2000	2000
<i>Brevibacterium linens</i> (B)	4000	4000
表皮葡萄球菌 (<i>Staph. Epidermis</i>) (B)	10000	8000
变形链球菌 (<i>Streptococcus mutans</i>) (B)	2000	2000
白假丝酵母菌 (<i>Candida albicans</i>) (Y)	800	10000
巴西曲霉 (<i>Aspergillus brasiliensis</i>) (M)	800	600
朱黄青霉 (<i>Penicillium minioluteum</i>) (M)	400	400
土曲霉 (<i>Aspergillus terreus</i>) (M)	800	8000
腐皮镰孢 (<i>Fusarium solani</i>) (M)	800	400
<i>Penicillium funiculosium</i> (M)	400	2000
酿酒酵母	600	2000

[0393]

<i>(Saccharomyces cerevisiae) (Y)</i>		
近平滑假丝酵母菌 <i>(Candida parapsilosis) (Y)</i>	800	8000
糠秕马拉色菌 <i>(Malassezia furfur) (Y)</i>	600	400
厚皮鳞斑霉 <i>(Malassezia pachydermatis) (Y)</i>	400	600
<i>Malassezia sympiodalis (Y)</i>	400	400

[0394] 结论:

[0395] 数据显示了组合物6对广泛的微生物的优异性能。MIC值对金黄色葡萄球菌、肺炎克雷伯杆菌和cornyebacteria非常强烈。后者见于人体上产生大量汗液的区域中,因此结论是组合物6的气味减少。组合物6强烈针对真菌,特别是在人类头皮上发现的马拉色菌(Malassezia)物种,以及见于人头皮上(头皮屑的来源)。因此,结论是针对人头皮上的头皮屑的活性。

[0396] 相对于高/低pH,化合物X的结构比相当的市场标准品(失水山梨醇辛酸酯、辛酸甘油酯)在化学上更稳定,因为酰胺键比酯键更稳定。这使得能够在整个应用领域中使用更广泛的制剂,而不会影响性能。

[0397] 化合物X的增加的水溶性是一个特征,其未见于相当的市场标准品中。配制者高度赞赏这一点,因为它使成分更容易配制在所有类型的含水制剂中。化合物X在相应的制剂中不太可能沉淀/乳化,不仅有助于微生物稳定性,而且还确保制剂稳定性。

[0398] 化合物X具有相对高的亲水亲油平衡HLB值(组合物6=HLB为10.2)并且这允许其用作乳液中的非离子乳化剂和所有类型的制剂中的添加剂的增溶剂。

[0399] 实验2

[0400] 与实验1相比进行了类似的实验。在该第二实验中使用的组合物在组成上与上表1中的组合物6几乎相同,仅组分的确切含量略有不同。组合物6a为根据本发明的第一方面。在此,与单独的苯氧乙醇和与组合物6a组合的苯氧乙醇的效力进行比较。

[0401] 表5:MIC数据的表:

[0402]

有机体; 细菌(B)、酵母(Y)和霉菌(M)	组合物 6a 的 MIC [ppm]	苯氧乙醇 的 MIC [ppm]	组合物 6a 与苯氧乙醇 (1:1)的 MIC [ppm]
金黄色葡萄球菌 (<i>Staphylococcus aureus</i>) (B)	<500	5000	<500
铜绿假单胞菌 (<i>Pseudomonas aeruginosa</i>) (B)	>10000	4000	3000
大肠杆菌 (<i>Escherichia coli</i>) (B)	>10000	4000	3000
产气肠杆菌 (<i>Enterobacter aerogenes</i>) (B)	>10000	4000	3000
肺炎克雷伯杆菌 (<i>Klebsiella pneumoniae</i>) (B)	>10000	4000	1000
洋葱伯克霍尔德菌 (<i>Burkholderia cepacia</i>) (B)	5000	1500	1000
日勾维肠杆菌 (<i>Enterobacter gergovia</i>) (B)	>10000	4000	3000
弗氏柠檬酸杆菌 (<i>Citrobacter freundii</i>) (B)	>10000	4000	3000
白假丝酵母菌(<i>Candida albicans</i>) (Y)	4000	3000	1500
巴西曲霉 (<i>Aspergillus brasiliensis</i>) (M)	6000	2000	1500
<i>Penicillium minioluteum</i> (M)	1000	1000	<500

[0403]

土曲霉 (<i>Aspergillus terreus</i>) (M)	6000	3000	2000
腐皮镰孢 (<i>Fusarium solani</i>) (M)	2000	2000	1000
<i>Penicillium funiculosium</i> (M)	1000	1000	<500
酿酒酵母 (<i>Saccharomyces cerevisiae</i>) (Y)	1500	4000	1000
近平滑假丝酵母菌 (<i>Candida parapsilosis</i>) (Y)	>10000	3000	1500

[0404] 结论：

[0405] 数据显示了针对所列微生物的组合物6a的MIC，苯氧乙醇的MIC和两种成分的1:1混合物的MIC。MIC测试由稀释实验组成，直到各生物的生长受到抑制，因此MIC越低越好。没有任何协同效应，混合物应当在两种纯产品的值之间给出线性插值。在表5中，可以看出，相对于所有生物的值令人惊讶地低于散装材料。这是一种协同效应，因为混合物比预期的插值更有效。这种协同作用有利于保存防腐剂并用减少量的防腐剂保护制剂，并且可以获得在没有协同防腐增效剂的情况下太弱而不能使用的防腐剂。