

401306

申請日期	83. 10. 22
案 號	83109792
類 別	A61K 7/021, 31/40

公告本

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

401306

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	化粧組合物
	英 文	"COSMETIC COMPOSITIONS"
二、發明 創作人	姓 名	1. 布里斯，吉聯·史考特 2. 克洛克，泰莉莎·芭芭拉 3. 費雪，卡倫 (NMN) 4. 狄克納，喬治·安德爾
	國 籍	1.-3. 英國 4. 美國
	住、居所	1. 英國薩里郡伊格罕市克拉倫斯街73號 2. 英國薩里郡坎伯利市霍利山布倫斯貝里公路65號 3. 英國伯克夏郡布拉克尼爾市雷托利巷佛利爾吉普7號 4. 美國俄亥俄州辛辛那提市塔納格山大道10572號
三、申請人	姓 名 (名稱)	美商寶鹼公司
	國 籍	美國
	住、居所 (事務所)	美國俄亥俄州辛辛那提市寶鹼廣場1號
	代 表 人 姓 名	傑可巴斯·西·雷瑟

裝

訂

線

401306

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
I P C分類：

A6

B6

本案已向：

國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ，☐有 ☐無主張優先權
英 1993.8.6 9316323.6

有關微生物已寄存於： ，寄存日期： ，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明(1)

發明領域

本發明係有關化粧組合物且更特別者，有關具有抗痤瘡活性及配方和顏色安定性的著色打底化粧組合物。

發明背景

打底組合物可以塗在面部和身體的其他部份以平均皮膚色調和質地並遮蓋凹洞，缺陷，細線條等。此外，也用打底組合物來濕潤皮膚，平衡皮膚的油水平及提供保護以對抗日光，風和粗礫環境等的不利影響。

化粧組合物通常可為液體或乳霜懸浮液，乳液，凝膠，壓縮粉或無水油和蠟組合物等形式。

美國專利第3,444,291號揭示一種填充和掩飾皮膚腔洞的方法，其係用含65至75份重量的微晶蠟和約25至35份的礦油等之組合物塗在皮膚上。該組合物包含色料，較佳者，煤塔染料，例如，匹配使用者皮膚顏色的DIC紅色17號等。

美國專利第4,486,405號提及可散佈，流動和無脂的化粧覆蓋組合物。該組合物的特徵為含有第一和第二種大致相同濃度的烷氧化界面活性劑。

美國專利第4,804,532號述及使用比先前技藝組合物還較為低濃度的結晶氧化矽之面部化粧粉。該粉在用為腮或面部塗被時，據稱對於皮膚皺紋，線條和孔洞具有遮蓋效用。該組合物為色料相與稀釋劑相的混合物。其色料相係經由將結晶氧化矽和色料摻合而形成的。將所得色料相與

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

五、發明說明(2)

基本上由珍珠母物質，如滑石和雲母所形成的稀釋劑相混合即形成該組合物。

美國專利第3,978,207號提及具有相當高濃度珍珠母物質的打底組合物之用途。該組合物為一種壓縮粉組合物，其特徵為含有珍珠母物質，例如雲母，和摻合油，可提供霜似珍珠效果，亦即，明亮的表觀。該打底組合物的顏色係由珍珠母物質所提供。

美國專利第4,659,562號揭示一種化粧用化粧品組合物，其包含用於彼等的黏合劑，及含5至95重量%的細粉狀氧化矽混合物和約5至95重量%細粉狀聚乙烯纖維等的緊密混合物。該組合物據稱可保持其所塗佈皮膚部位的均勻性。亦即，據稱可“防皺”。該'562專利的組合物包含色料與珍珠母劑的混合物。

Nakamura et al.,在1986年，巴塞隆納(Barcelona)的第XIV屆I.F.S.C.C.會議報告複印本中提及利用球體狀氧化矽和聚二甲基矽氧烷的新穎化粧組合物。該組合據稱可以提供打底效果，其將皺紋可視度的減低程度大於其所比較的化粧打底組合物。該皺紋可見度的減低係由球體氧化矽和聚二甲基矽氧烷的新穎利用所增進的光學模糊效果促成的。

美國專利第5,143,722號揭示一種油包水乳液形式的化粧用化粧品組合物，其中包含用聚矽氧烷塗被的色素，矽酮相，水相和聚二有機矽氧烷-聚氧烯共聚物界面活性劑等。

五、發明說明(3.)

油包水乳液形式的打底物是熟知者，可提供良好的覆蓋和良好的皮膚感覺，著飾和表觀。同時，有需要提出一種具有局部抗痤瘡活性的打底組合物。有許多化合物是已知在局部塗佈於皮膚時具有抗痤瘡性質者。一種常用的具有抗痤瘡活性之角質分解劑為柳酸。柳酸實質上不溶於水，難以將其滲入乳液組合物的水相中。不過，要將柳酸從乳液打底組合物的含色素油相輸送出柳酸時可能會因為柳酸與色素，特別是氧化鐵類型的色素，之間的交互作用而導致組合物褪色。所以，有需要將柳酸以可溶形式從水相中輸送出。

聚乙基吡咯烷酮是已知可在各種組合物中用為增溶／複合劑者。

GB-A-2,041,963揭示一種用以清潔油性皮膚的含水清潔劑組合物，其中含有肌胺酸N-鹽基酯的水溶性鹽，聚乙基吡咯烷酮輔增溶劑，與蛋白質及／或蛋白質水解物。該組合物也可含有柳酸作為角質分解劑，及緩衝器，如檸檬酸／檸檬酸鹽等。不過，其中未揭示含有以如本發明所特指的完全質子化形式的增溶酸性抗痤瘡活性劑之化粧組合物。

由於酸性抗痤瘡劑在低pH時最有效（此時，溶液中含有高濃度的自由酸），因此有需要將該藥劑在其明顯存在的pH值下以質子化形式從水相輸送出。因此之故，本發明的一項主要目的為提出在低pH值含有抗痤瘡活性物水溶液的化粧組合物。

五、發明說明(4.)

本發明的另一目的為提出具有改良抗痤瘡活性和安定性的化粧組合物。

本發明的另一目的為具有改良顏色安定性和色素／抗痤瘡活性物相容性的水包油或油包水乳液形式之化粧組合物。

發明概述

根據本發明的一部份，提出乳液，凝膠或洗液等形式的化粧組合物，其包含酸性抗痤瘡活性物的水／醇溶液及用於彼等的吡咯烷酮基質複合劑，且其中該水／醇溶液具有低於約 pK_a+1 的 pH 值，此處 pK_a 為完全質子化抗痤瘡活性物的酸度常數對數值。

本發明化粧組合物提供抗痤瘡效率加上改良的產品和顏色安定性。

根據本發明的另一部份，提出油包水或水包油乳液形式的化粧組合物，其中包含溶油水相中的酸性抗痤瘡活性物及分散於油相中的色素或色素混合物。

除非另外指出，否則所有的水平和比例皆為以總組合物重量計算者。鏈長度和烷氧化程度也皆以重量平均基礎表出。

發明之詳細說明

本發明一部份的化粧組合物包含酸性抗痤瘡活性物的水／醇溶液，及吡咯烷酮基質複合劑。該組合物為乳液，凝

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

五、發明說明(5.)

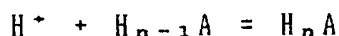
膠或洗液等形式。

本發明該第一部份的第一種必要成份為抗痤瘡活性物的水／醇溶液。可用於本發明的適當抗痤瘡活性物包括柳酸，視黃酸和其衍生物，壬二酸和其衍生物，乳酸，乙醇酸，丙酮酸，類黃酮，及上述之混合物等。

用於本發明組合物中的抗痤瘡活性物較佳者為選自柳酸和壬二酸，及其混合物等之中者，更佳者為柳酸。該抗痤瘡活性物的含量為以組合物重量計的約0.1%至約10%，較佳者為約0.1%至約5%，更佳者為約0.5%至約3%。

該抗痤瘡活性物係溶解在水或醇溶液內，例如，以C₂-C₈醇，二醇和多元醇為基質之溶液，較適用的醇為選自乙醇，二丙二醇，丁二醇，己二醇，和其混合物等之中者。醇在本發明組合物中的含量較佳者為約1%至約20%之水平。該最後水／醇抗痤瘡活性物溶液較佳者在周溫（25℃）的pH值為低於約pK_a+1，此處pK_a+1為完全質子化的抗痤瘡活性物之酸性常數對數值。於較佳實施例中，最後溶液的pH值為小於約pK_a。

酸常數對數值係參考下列平衡式予以定義者



其中H_nA為完全質子化的酸，n為完全質子化酸中的質子數目且H_{n-1}A為該酸對應於失去一個質子的共軛鹼。

如此，該平衡的酸常數為

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

錄

五、發明說明(6.)

$$K_n = \frac{[H_nA]}{[H^+][H_{n-1}A]}$$

$$\text{而 } pK_a = \log_{10} K_n$$

基於本說明書之目的，將酸常數定義在25℃和零離子強度。文獻值是取自可能之處（參看Stability Constants of Metal-Ion Complexes, Special Publication No. 25, The Chemical Society, London）；於有疑問時，是用玻璃電極以電位測定測定之。

本發明所用酸性抗痤瘡活性物的pKa值較佳者是在約1到約6的範圍，更佳者約1到約4.5，特別者約1.5至約4.0之範圍。

最後水／醇抗痤瘡活性物溶液的pH較佳者是在約1至約7，更佳者約2至約5，特別者約2至約4之範圍內。於低於約5以下的pH值時，該水相較佳者不含酸不穩性物種，例如丙烯酸／丙烯酸乙酯共聚物和聚甲基丙烯酸甘油酯等。

本發明第一部份組合物的第二種必需成份為吡咯烷酮基質複合劑。

吡咯烷酮基質複合劑是從輔助該抗痤瘡活性物的增溶之觀點用於本發明者。本發明所用吡咯烷酮基質複合劑較佳者為選自聚乙烯基吡咯烷酮複合劑或C₁-C₄烷基聚乙烯基吡咯烷酮複合劑等之中，其具有約1500至約1,500,000，較佳者約3000至約700,000，更佳者約5000至約100,000

五、發明說明(7.)

範圍內之分子量(黏度平均)。適用的吡咯烷酮基質複合劑例子為聚乙烯基吡咯烷酮(PVP、或 povidone)和丁基化聚乙烯基吡咯烷酮。最適用於本發明的吡咯烷酮基質複合劑為聚乙烯基吡咯烷酮複合劑。PVP 在市面上可得自 BASF，其商品名為 Luviskol (RTM)。較適於本發明的 PVP 複合劑為 Luviskol K17，其具有約 9,000 之黏度平均分子量。可用本發明用的其他吡咯烷酮系複合劑包括 C_1-C_{18} 烷基或環烷基吡咯烷酮，例如月桂基吡咯烷酮。

該吡咯烷酮基質複合劑在本發明組合物中的含量水平為組合物重量的約 0.1% 至約 10%，較佳者約 0.1% 至約 5%。抗痤瘡活性物：吡咯烷酮基質複合劑的重量比例係在約 10:1 至約 1:10，較佳者約 5:1 至約 1:5。

本發明較佳實施例另外包含約 0.01% 至約 5 重量%，可在低於或等於對應酸 pKa 值的 pH 值下溶解於水中的酸或其鹽，例如，選自檸檬酸，硼酸，和鹽，及其混合物等的酸。這些物質可在本發明中從幫助抗痤瘡活性物的增溶之觀點與該吡咯烷酮基質複合劑配合使用。從該觀點來看，特別較佳者為檸檬酸鈉鹽。於較佳實施例中，該酸或其鹽在 25℃ 的溶解水平為至少 5% w/w。

本發明組合物可為乳液(w/o 或 o/w)，凝膠或洗液形式，不過較佳者為油包水乳液形式，其中，於較佳實施例中，其油相包含著揮發性矽酮和非揮發性矽酮的混合物。該矽酮油的含量為約 1 至約 50 重量%。適用的揮發性矽酮油包括環狀和線型揮發性聚有機基矽氧烷(本文所用“揮發性

五、發明說明(8.)

”一詞指的是在周圍條件下具有可測得的蒸氣壓之物質。
)。

各種揮發性矽酮的說明可參看 Todd, et al.,
"Volatile Silicone Fluids for Cosmetics", 91
Cosmetics and Toiletries 27-32 (1976)。

較佳的環狀矽酮包含具有約3至約9個矽原子，較佳者具有約4至約5個矽原子之聚二甲基矽氧烷。較佳的線型矽酮油包括具有約3至約9個矽原子的聚二甲基矽氧烷。線型揮發性矽酮通常具有在25℃下低於約5厘史的黏度，而環狀物則具有低於約10厘史的黏度。可用於本發明的矽酮油例子包括：Dow Corning 344, Dow Corning 21330, Dow Corning 345, 和 Dow Corning 200 (皆為 the Dow Corning Corporation 所製者)；Silicone 7207 和 Silicone 7158 (the Union Carbide Corporation 的產品)；SF:202 (General Electric 的產品) 及 SWS-03314 (Stauffer Chemical 的產品)等。

適用的非揮發性矽酮較佳者具有在25℃的平均黏度值為約1,000至約2,000,000 $\text{mm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ ，更佳者為約10,000至約1,800,000 $\text{mm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ ，甚至更佳者為約100,000至約1,500,000 $\text{mm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ 。不過，也可以使用較低黏度的非揮發性矽酮調理劑。黏度可以利用如 Dow Corning Corporate Test Method CTM 0004, July 20, 1970中所述的玻璃毛細管黏度計來測量。供本發明所用的適當非揮發性矽酮流體包括聚烷基矽氧烷，聚芳基矽氧烷，聚烷基芳基矽氧烷，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

五、發明說明(9.)

具有胺官能取代基的聚矽氧烷，聚醚矽氧烷共聚物，及上述之混合物等。可用於本發明中的矽氧烷可以用任何數目的部份體予以封端，包括，例如，甲基，經基，環氧乙烷，環氧丙烷，胺基和羧基等。不過，也可以用具有皮膚調理性質的其他矽酮流體。可以用於本發明中的非揮發性聚烷基矽氧烷流體包括，例如，聚二甲基矽氧烷。這類矽氧烷有，例如，可得自 the General Electric Company 的 Viscasil RTM) 系列和得自 Dow Corning 的 the Dow Corning 200 系列。較佳者，其在 25℃ 的黏度範圍為約 $10 \text{ mm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ 至約 $100,000 \text{ mm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ 。可以使用的聚烷基芳基矽氧烷流體也包括，例如，聚甲基苯基矽氧烷。這類矽氧烷可為，例如，得自 the General Electric Company 的 SF 1075 甲基苯基流體或得自 Dow Corning 的 556 化粧品級流體。可以使用的聚醚矽氧烷共聚物包括，例如，聚環氧丙烷改質二甲基聚矽氧烷（如，Dow Corning DC-1248），不過，也可以使用環氧乙烷或環氧乙烷／環氧丙烷混合物。

揭示適當矽酮流體的參考文獻包括 Green 的 US-A-2,826,551，1976年6月22日核發給 Drakoff 的 US-A-3,964,500；Pader 的 USA-4,364,837；及 Woolston 的 GB-A-849,433 等。此外，1984年 Petrarch Systems Inc. 發行的 "Silcione Compounds" 提出一份適用矽酮流體的充分（但並未完全）之表列。

可供本發明所用的較佳非揮發性矽酮包括含有至少一個聚二有機基矽氧烷節段和至少一個聚氧烯節段的聚二有機

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

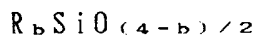
裝

訂

線

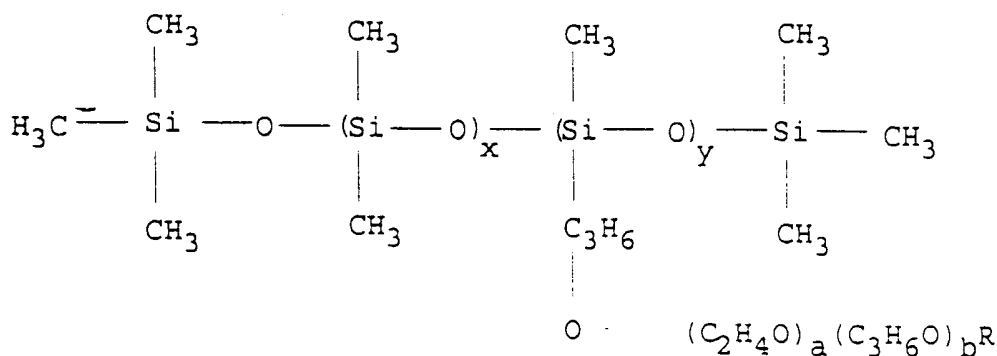
五、發明說明(10.)

基矽氧烷 - 聚氧烯共聚物，該聚二有機基矽氧烷節段基本上包含



矽氧烷單位，式中 b 具有約 0 至約 3 之值（包括 0 和 3），於該共聚物的所有矽氧烷單位中每個矽平均有約 2 個 R 基，且 R 表選自甲基，乙基，乙烯基，苯基和將該聚氧烯節段鏈結到該聚二有機基矽氧烷節段的二價基等之中的基，全部 R 基中至少有約 95% 為甲基；且該聚氧烷節段具有至少約 1000 的平均分子量且包含約 0 至約 50 莫耳 % 的聚氧丙烯單位和約 50 至約 100 莫耳 % 的聚氧乙烯單位，該聚氧烯節段的至少一個末端部份係鏈結到該聚二有機基矽氧烷節段者，而未鏈結到該聚二有機基矽氧烷節段的該聚氧烯節段所具任何終端部份則加上一終端基；該共聚物中的聚二有機基矽氧烷節段對聚氧烯節段之重量比例值為約 2 至約 8。這種聚合物載於 US-A-4,268,499 之中。

最適用於本發明中的聚二有機基矽氧烷 - 聚氧烯共聚物為具有下式通式者：



五、發明說明(11)

式中 x 和 y 係選擇得使聚二有機基矽氧烷節段對聚氧烯節段之重量比例值為約 2 至約 8 ; $a:(a+b)$ 的莫耳比例為約 0.5 至約 1 ; 且 R 為鏈終端基，特別是選自氫；羥基；烷基，如甲基，乙基，丙基，丁基，苯甲基；芳基，如苯基；烷氧基，如甲氧基，乙氧基，丙氧基，丁氧基；苯甲氧基；芳氧基，如苯氧基；烯氧基，如乙烯氧基和烯丙氧基；醯氧基，如乙醯氧基，丙烯醯氧基和丙醯氧基；及胺基，如二甲胺基等之中者。

該共聚物中諸節段的數目和平均分子量皆為可使該共聚物所含聚二有機基矽氧烷節段對聚氧烯節段的重量比例較佳地為約 2.5 至約 4.0 。

適用的共聚物在市面上可得自 Wacker-Chemit GmbH, Geschäftsbereich S, Postfach D-8000 Munich 22, 商品名為 Belsil (RTM) ; 及得自 Th. Goldschmidt Ltd. Tego House, Victoria Road, Ruislip, Middlesex, HA4 0YL 的 Abil(RTM) 。特別適用於本發明者為 Belsil (RTM) 6031, Abil(RTM) B88183 和 DC3225C 。較適用於本發明的矽酮為 CTFA 命名為二甲基矽酮共多元醇 (dimethicone copolyol) 者。

矽酮油相較佳地含有以組合物重量計約 2% 至約 25% , 更佳者約 5% 至約 15% 的非揮發性矽酮。

本發明組合物的一高度較佳成份為濕潤劑或濕潤劑混合物。本發明濕潤劑或濕潤劑混合物的含量為組合物重量的

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

五、發明說明(12)

約 0.1% 至約 30% , 較佳者為約 5% 至約 25% , 且更佳者為約 10% 至約 20% 。適用的濕潤劑為選自甘油和聚甲基丙烯酸甘油酯潤滑劑之中者, 其在 25℃ 的黏度為 300,000 至 1,100,000 cps ; 在 25℃ 的比重為 1 至 1.2 克/毫升; 其 pH 值為 5.0 至 5.5 ; 結合水含量為 33 至 58% ; 且, 其自由水含量為 5 至 20% 。

該濕潤劑可以至少部份地摻加到油包水乳液的油相中以形成多相水包油包濕潤劑分散液。該油相較佳地含有以組合物基礎計約 0.1% 至約 10% , 更佳者約 0.1 至約 3 重量% 的濕潤劑。該濕潤劑可以用與粒狀親油性或疏水性載體物料的混合物或摻加在其內的形式導到油相內。

具有所欲性質的聚甲基丙烯酸甘油酯潤滑劑有 Guardian Chemical Corporation 以註冊商標 "Lubrajel" 銷售的產品。其中以編為 "Lubrajel DV", "Lubrajel MS" 和 "Lubrajel CG" 等的 "Lubrajels" 較適用於本發明中。在這些註冊商標下銷售的膠凝劑含有約 1% 丙二醇。

其他適用的濕潤劑包括山梨糖醇, 泛醇, 丙二醇, 丁二醇, 己二醇, 烷氧化葡萄糖衍生物, 例 2 如 Glucam (RTM) E-20, 己三醇, 和葡萄糖醚, 及上述之混合物等。脲也可以加在內水相中作為濕潤劑。

泛醇濕潤劑可以選自 D-泛醇 ([R]-2,4-N-二羥基-N-[3-羥丙基])-3,3-二甲基丁醯胺), DL-泛醇, 泛酸鈣, 蜂王膠, 泛西汀 (pantherine), 泛醯巯基乙胺, 泛醯乙醚, 潘蓋米酸 (pangamic acid), 吡哆醇, 泛醯乳糖和綜合維生

五、發明說明(13)

素 B 等。

較適用於本發明的濕潤劑為甘油。化學上，甘油為 1,2,3-丙三醇且為商業產品。

本發明較佳實施例包含色素或色素混合物。適用於本發明中的色素可為無機物及／或有機物。此外，色素一詞亦包括具有低顏色或光澤的物質，例如，無光修飾劑，以及光散射劑等。適用色素的例子有氧化鐵，醯基穀胺酸氧化鐵，群青藍，D&C 染料，胭脂紅，及上述之混合物等，依照化粧組合物的類型，如打底或腮紅等，通常採用色素混合物。

本發明組合物的一項特點為該色素和抗痤瘡活性物具有優良的整體相容性和顏色安定性。依此，根據本發明的另一部份，提出油包水或水包油乳液形式的化粧組合物，包含溶解在水相中的酸性抗痤瘡活性物及分散在油相中的色素或色素混合物。

打底組合物也包括至少一種無光修飾劑。無光修飾劑的功能為遮蔽皮膚缺陷和減少油光。這種化粧品可接受的無機藥劑，亦即，載於 CTFA Cosmetic Ingredient Dictionary，第三版之中者，如氧化矽，水合氧化矽，經矽酮處理過的氧化矽珠粒，雲母，滑石，聚乙烯，二氧化鈦，皂土，水輝石，高嶺土，白堊，矽藻土，活性白土，氧化鋅等都可以使用。特別可用為無光修飾劑者為低光澤色素，如用硫酸鋇塗被過的鈦酸化雲母（用二氧化鈦塗被過的雲母）。於可用為無光修飾劑的無機成份中，以低光

五、發明說明 (14)

澤色素，滑石，聚乙烯，水合氧化矽，高嶺土，二氧化鈦及上述的混合物等為特別較適用者。適合用於本發明作為光散射劑的物質可概括地描述為具有高達約100微米，較佳者約5至約50微米的粒度之球形無機物質，例如球形氧化矽粒子等。

色素的總濃度可為總組合物重量的約0.1至約25重量%，較佳者為約1至約10重量%，其正確濃度在某些程度上決定於選用於打底化粧或腮紅之中以達到所欲色調的特殊色素混合物。較佳的組合物含有約2至約20重量%的二氧化鈦且更佳者，約5至約10重量%的二氧化鈦。

從濕潤化，皮膚感，皮膚外觀和乳液相容性等觀點來看，較適用於本發明的色素為經處理過的色素。色素可以用例如胺基酸，如離胺酸；矽酮，月桂醯，膠原，聚乙烯，卵磷脂和酯油等予以處理。更適用的色素為矽酮（聚矽氧烷）處理過的色素。

本發明組合物的其餘部份為去離子水。該組合物較佳為者含有約30至約95，更佳者約40至約80重量%的油相，和約5至約70，更佳者約20至約60重量%的水相。

本發明化粧組合物也可以包含粒狀交聯疏水性丙烯酸酯或甲基丙烯酸酯共聚物。該共聚物特別可用以減低閃光並控制油，同時幫助提供有效的濕潤效益。該交聯疏水性聚合物較佳者為共聚物乳膠形式，有至少一種活性成份均勻地分散在其整體且包在該共聚物乳膠之內。另外，該疏水性聚合物可為具有約50至500，較佳者100至300米²/克

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

錄

五、發明說明(15.)

的表面積(N_2 -BET)且其內吸收著活性成份之孔洞狀粒子。

該交聯疏水性聚合物在本發明的用量為約0.1至約10重量%且較佳者是摻加在外部含矽酮油相之中者。該活性成份可為一或多種皮膚相容性油，皮膚相容性濕潤劑，潤滑劑，加濕劑，和防晒劑等或其混合物。該聚合物材料為粉末形式，該粉末為粒子的組合系統。該粉末粒子系統形成乳膠，其中包含平均直徑小於約一微米的單位粒子，尺寸在約20到100微米平均直徑範圍內的稠合單位粒子黏聚物以及尺寸在約200至1,200微米平均直徑範圍內的稠合黏聚物團塊凝集體等。

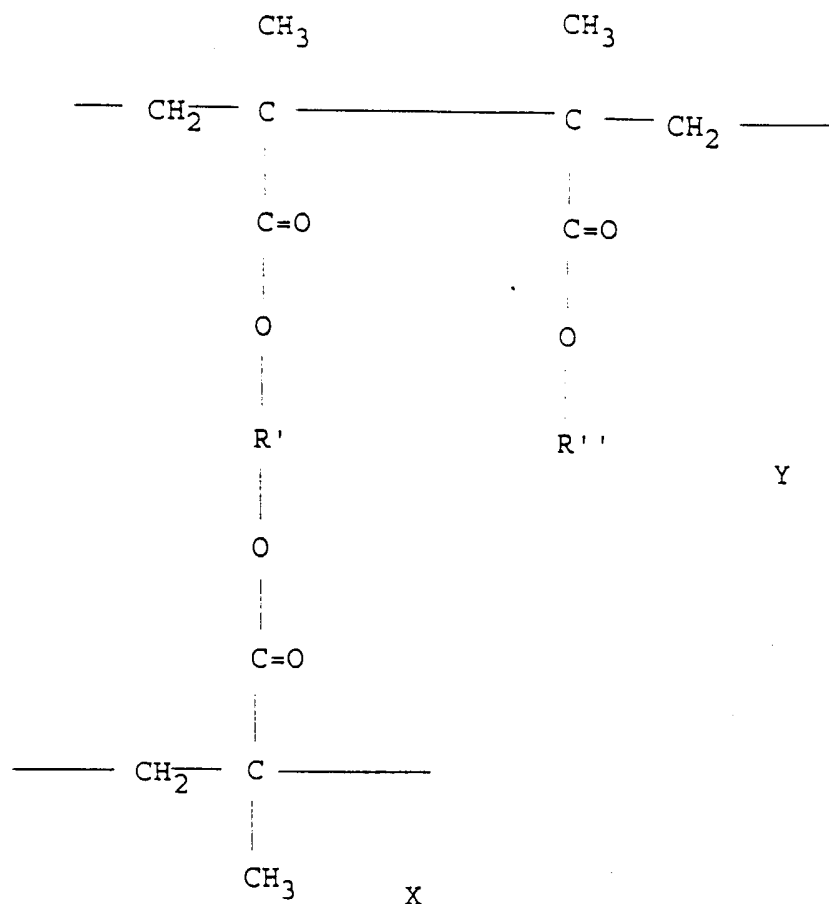
可用於本發明作為活性成份載體的粉末物質可以廣義地描述為經交聯的“後吸收”疏水性聚合物孔膠。該粉末較佳者具有包覆和分散在其內的可為固體，液體或氣體等形式的活性物。該乳膠為粒狀形式且於裝載活性物質時，構成自由流動性個別固體粒子。該乳膠可包含預定量的活性物質。該聚合物具有下示構造式：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (16)



式中 x 對 y 的比例為 80:20，R' 為 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 且 R'' 為 $(\text{CH}_2)_{11}\text{CH}_3$ 。

疏水性聚合物為高度交聯聚合物，更特別者高度交聯的聚甲基丙烯酸酯共聚物。該物質為美國，密西根州，米蘭 (Midland) 的 the Dow Corning Corporation 所製並以註冊商標 POLYTRAP (RTM) 銷售。其為超輕的自由流動性白粉且該粒子能夠吸收高水平的親脂性液體和某些親水性液體，同時仍然保持自由流動粉末特性。該粉末結構係由單位

五、發明說明 (17)

粒子小於一微米的乳膠稠合成20至100微米的黏聚物且該黏聚物鬆散地集簇成約200至約1200微米尺寸的巨粒子或凝集物所構成者。該聚合物粉能夠包含多達四倍其重量的流體，乳液，分散液或溶化固體。

活性物對聚合物粉的吸附可以用不銹鋼混合鉢和匙來完成，其中包括將活性物加到粉末並用匙均勻地將活性物包圍到聚合物粉內。低黏度流體可以經由將流體加到裝著該聚合物的可密封容器內，然後將該物質鼓轉到達到一稠密度為止而被吸附掉。也可以採用更精巧的摻合設備，例如，螺條或雙錐摻合器等。較適用於本發明中的活性成份為甘油。較佳者，濕潤劑：載體重量比例為約1:4至約3:1。

另有適用為高密度交聯聚甲基丙烯酸酯共聚物者為Microsponges 5647。其為大體為球形的交聯疏水性聚合物粒子形式，具有約0.01至約0.05微米的孔徑及200-300平方米/克之表面積。同樣地，其較佳者也是裝載著上述水平的濕潤劑。

本發明組合物也可以含有親水性膠凝劑，其水平較佳者為約0.01%至約10%，更佳者為約0.02%至約2%，且特別者為約0.02%至約0.5%。該膠凝劑較佳者具有至少約4000 mPa.S，更佳者至少約10,000 mPa.S且特別者至少50,000 mPa.S的黏度（%水溶液，20℃，Brookfield RVT）。

適合的親水性膠凝劑可概括地描述為水溶性或膠體狀水

五、發明說明(18.)

溶性聚合物，包括纖維素醚（如，經乙基纖維素，甲基纖維素，經丙基甲基纖維素），聚乙烯醇，polyquarternium-10，苦阿爾膠(guar gum)，經丙基苦阿爾膠及黃蘭膠(xanthan gum)等。

適用的親水性膠凝劑包括B.F. Goodrich Company所售在註冊商標為Carbopol樹脂之下的丙烯酸／丙烯酸乙酯共聚物和羧乙烯基聚合物。這些樹脂基本上係用丙烯酸與0.75%至2.00%交聯劑，如多烯丙基蔗糖或多烯丙基季戊四醇等交聯所得膠體樣水溶性聚烯聚醚交聯聚合物。其例子包括：Carbopol 934，Carbopol 940，Carbopol 950，Carbopol 980，Carbopol 951和Carbopol 981等。Carbopol 934為丙烯酸與約1%，每蔗糖分子平均具有約5.8 烯丙基的蔗糖多烯丙基醚經交聯而得之水溶性聚合物。另外，適用於本發明者為可在商品名為Carbopol 1382，Carbopol 1342 和 Pemulen TR-1等之下得到的具有兩親媒性性質的經疏水改質交聯丙烯酸聚合物（CTFA名稱：丙烯酸酯／丙烯酸10-30 烷基酯交錯聚合物）。聚烯聚醚交聯丙烯酸聚合物和疏水改質交聯丙烯酸聚合物的組合也適用於本發明中。適用於本發明的其他膠凝劑為油凝膠，例如三羥基硬脂和羥基硬脂酸鋁鎂。本發明所用膠凝劑特別可用以提供在常溫 and 增溫下的優異安定性特性。

適合用於中和本發明所用含酸基親水性膠凝劑的中和劑包括氫氧化鈉，氫氧化鉀，氫氧化銨，一乙醇胺，二乙醇胺和三乙醇胺。

五、發明說明 (19)

本發明化粧組合物可另外包含潤滑劑。適合本發明組合物所用的潤滑劑包括選自礦油，植物油和動物油，脂肪和蠟，脂肪酸酯，脂肪醇，烷二醇和聚烷二醇醚和酯，脂肪酸，與上述之混合物等之中的天然和合成油。

適合用於本發明的潤滑劑包括，例如，視需要經經基取代的 C_8-C_{50} 不飽和脂肪酸及其酯， C_8-C_{30} 飽和脂肪酸的 C_1-C_{24} 酯，如肉豆蔻酸異丙酯，棕櫚酸鯨蠟酯及肉豆蔻酸辛酯十二烷酯 (Wickenol 142)，蜜蠟，飽和及不飽和脂肪醇，如二十二烷醇和鯨蠟醇；烴，如礦油，石蠟脂和角鯊烷；脂肪酸山梨糖醇酯（參看 US-A-3988255，1976年10月26日核發給 Seiden 者），羊毛脂和羊毛脂衍生物，如羊毛脂醇，乙氧化，經基化和乙醯化羊毛脂；膽固醇及其衍生物；動物和植物甘油三酸酯，例如，杏仁油，花生油，麥芽油，亞麻仁油，荷荷芭油 (jojoba oil)，以及杏果，核桃，棕櫚堅果，乳香，芝麻仁及菜籽等的油，杜松油，玉米油，桃果油，罌粟子油，松油，蓖麻油，大豆油，鰐梨油，紅花油，椰子油，榛子油，橄欖油，葡萄子油，及葵花油等，以及二體酸和三體酸的 C_1-C_{24} 酯，例如，二體酸二異丙酯，蘋果酸二異硬脂酯，二體酸二異硬脂酯和三體酸三異硬脂酯等。

較佳的潤滑劑為選自烴，如異十六烷，礦油，石蠟脂和角鯊烷等；羊毛脂醇，和硬脂醇等之中者。這些潤滑劑可獨立地使用或混合使用，且其在本發明組合物中的含量可為總組合物重量的約 1% 到約 30%，且較佳者約 5 到約 15 重

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

五、發明說明(20)

量 %。

本發明組合物也可以含有另外的物質，例如，香料；填充料，如尼龍，防晒劑，防腐劑，電解質，如氯化鈉；蛋白質，抗氧化劑，鉗合劑及適當的油包水乳化劑等。

本發明化粧組合物的另一選用成份為一或多種紫外光吸收劑。常稱為防晒劑的紫外光吸收劑之濃度可為以組合物總重量計之約1至約12重量%。更佳者，該UV吸收劑在組合物中的濃度可為約4至約6重量%。於適合本發明所用的紫外光吸收劑中，以二苯甲酮-3，辛基二甲基PABA (Padimate 0)及其混合物等為等別較適用者。

另一適用但較適用於本發明的成份為一或多種加添的鉗合劑，其含量較佳者為以組合物總重量計之約0.02至約0.10重量%。較佳者，該鉗合劑的濃度為以組合物總重量計之約0.03至約0.07重量%。於可加在本發明組合物內的鉗合劑中包括EDTA四鈉鹽。

打底組合物的另一選用但較佳成份為一或多種防腐劑。打底組合物中的防腐劑濃度為以該組合物總重量計之約0.05至約0.8重量%，較佳者為約0.1至約0.3重量%。適用於本發明的防腐劑包括苯甲酸鈉和對羥基苯甲酸丙酯，及其混合物等。

本發明化粧組合物可為打底，腮紅，掩飾，壓縮粉等，較佳者為打底和掩飾。

提出下面的表以闡明本發明化粧組合物。

五、發明說明 (21)

實施例	I	II	III	IV	V	VI	VII
	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt
	%	%	%	%	%	%	%
A.							
辛酸鯨蠟酯	2.00	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	2.0
環甲矽酮	8.57	12.25	12.25	15.0	12.0	8.57	8.57
環甲矽酮/二甲矽酮							
共多元醇(90:10)	17.16	20.0	20.0	5.0	8.0	10.0	17.16
Propylparaben (33%) in laureth-7	0.75	0.75	0.0	0.75	0.0	0.75	0.75
二甲矽酮流體	2.0	0.0	2.0	3.0	5.0	10.0	0.0
二苯甲酮-3	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	2.0	0.0
丙二醇二癸酸酯/二 辛酸酯	0.0	0.0	0.0	5.0	0.0	10.0	0.0
B.							
二氧化鈦 (水合鋁·環脂酸) 處理過的二氧化鈦	8.25	6.0	1.5	6.0	8.0	20.0	8.25
鈦酸化雲母	0.25	0.5	3.0	0.25	0.25	0.0	0.25
滑石	0.1	0.1	0.1	0.25	1.0	0.0	0.1
氧化矽	3.38	4.5	6.0	0.7	0.7	0.7	3.38
尼龍	0.6	4.25	6.0	4.25	0.6	0.6	0.6
	0.0	0.0	0.0	0.0	0.5	0.0	0.0

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (22)

實施例	I	II	III	IV	V	VI	VII
	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt
	%	%	%	%	%	%	%
C.							
環甲矽酮/二甲矽酮 共多元醇(90:10)	1.85	1.5	1.85	5.0	1.0	1.0	1.85
D.							
黃色氧化鐵	1.2	1.2	0.6	0.4	1.2	1.2	1.2
紅色氧化鐵	0.49	0.6	0.6	0.49	0.49	0.2	0.6
黑色氧化鐵	0.16	0.1	0.24	0.1	0.1	0.24	0.24
群青藍	0.0	0.0	0.0	0.1	0.0	0.0	0.0
環甲矽酮	0.0	0.0	0.0	0.0	0.68	0.0	0.0
E.							
合成蠟	0.1	0.5	0.5	0.1	0.0	0.0	0.0
二十二烷酸花生酯	0.3	0.0	0.0	0.3	0.5	0.3	0.3
硬脂酸	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	2.5
棕櫚酸	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	2.5	0.0
氧化矽(spheron P1500)	6.0	0.0	6.0	0.0	0.0	0.0	0.0
F.							
三羥硬脂	0.3	0.3	1.5	1.5	0.0	0.0	0.0
環甲矽酮	1.0	4.0	0.0	0.0	4.0	4.0	4.0
蜜蠟	1.5	1.2	0.0	0.0	1.3	0.0	0.0
Abil WED9	0.0	3.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (23)

實施例	I	II	III	IV	V	VI	VII
	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt	Wt
	%	%	%	%	%	%	%
G.							
巴西酸乙烯酯	0.05	0.0	0.0	0.0	0.0	0.05	0.05
BHT	0.05	0.0	0.0	0.0	0.0	0.05	0.05
H.							
去離子水	-----	-----	-----to	100--	-----	-----	-----
乙醇	6	5.5	4.0	7	6.0	8.0	6.0
柳酸	1	1	1	2	2	2	0.0
壬二酸	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	5
丙二醇	2.37	2.37	1.37	2.37	0.0	2.37	0.0
二丙二醇	6.0	5.0	6.5	7.00	8.0	6.0	5.0
氯化鈉	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	1.0
甘油	4.5	5.0	10.0	5.0	5.0	10.0	15.0
BDTA四鈉	0.05	0.05	0.05	0.1	0.1	0.1	0.01
三乙醇胺	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.75
尿囊素	0.0	0.0	0.1	0.0	0.0	0.0	0.0
防晒劑	0.0	0.0	0.0	0.2	0.2	0.0	0.0
聚乙基吡咯烷酮- (Luviskol K17)	1	2	1.5	1	1	1	2
檸檬酸鈉	0.3	0.3	0.0	0.2	0.4	0.3	0.4
四硼酸鈉	0.0	0.0	0.1	0.4	0.0	0.2	0.0
水相pH值	2.9	2.8	2.9	3.2	3.0	2.9	3.1
I.							
去離子水	0.0	0.0	0.0	0.0	10.0	0.0	0.0

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (24)

實施例		I Wt %	II Wt %	III Wt %	IV Wt %	V Wt %	VI Wt %	VII Wt %
J.								
丙二醇	1	0.0	0.0	0.0	2.0	0.0	0.0	0.0
黃菌膠		0.0	0.0	0.0	0.08	0.0	0.0	0.0
K.								
精油		0.0	0.0	0.0	0.20	0.0	0.0	0.0
香油		0.0	0.25	0.0	0.20	0.0	0.0	0.0
維生素A								
棕櫚酸酯		0.0	0.05	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0
L.								
蘆薈膠		0.0	0.0	3.0	0.0	0.0	0.0	0.0
洋甘菊萃取物		0.0	0.0	0.1	0.0	0.0	0.0	0.0

*含約1%的丙二醇

表中所列各種成份已分成數組，根據下面所述程序，將各組的構成份先混合後，才加到其他組的成份內。

於第一步驟中，將A相的成份混合物用剪切混合器攪拌約5分鐘到均勻為止。在高速剪切混合之下，將B相的物

五、發明說明 (25)

質逐漸地加到 A 中並將該批料混合 20 分鐘直到分散為止。

接著，將 C 相的成份，然後 D 相成份慢慢地加到 A 相和 B 相的混合物中並用高剪切混合到分散為止。於此時，加入氧化矽並分散到混合物內。

將所得批料加熱到 90℃ 後，加入 E 相成份。將容器冷卻到 55℃ 並加入預混合好的 F 相。將該批料混合到均勻為止。之後，將混合物冷卻到 30℃，再加入 G 相。

將 H 相的所有成份混合到完全溶解而製備成 H 相預混料。於 30℃ 下，將 H 相預混料以高剪切加到該批料混合物內，但要確定表面上沒有超量的水。然後將混合物研磨 15 分鐘。

最後，將 I，J，K，和 L 等相加入作為稀釋劑。

所得化粧組合物即可進行包裝。

該等實施例的化粧組合物展現出抗痤瘡活性及改良的調配物和顏色安定性。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

錄

四、中文發明摘要 (發明之名稱： 化粧組合物)

一種乳液、凝膠或洗液形式的化粧組合物，其包含酸性抗痤瘡活性之水／醇溶液及用於彼等的吡咯烷酮基複合劑，其中該水／醇溶液具有低於 $pK_a + 1$ 之 pH 值，此處 pK_a 為完全質子化的抗痤瘡活性劑所具酸性常數之對數。該化粧組合物顯示出抗痤瘡效用及產品和顏色安定性。

英文發明摘要 (發明之名稱： "COSMETIC COMPOSITIONS")

A cosmetic composition in the form of an emulsion, gel or lotion comprising an aqueous/alcoholic solution of an acidic anti-acne active and a pyrrolidone-based complexing agent therefor, wherein the aqueous/alcoholic solution has a pH of less than $pK_a + 1$, where pK_a is the logarithmic acidity constant for the fully protonated anti-acne active. The cosmetic composition exhibits anti-acne effectiveness and product and colour stability.

公告本

六、申請專利範圍

修正
年 月 日
86.6.11 補充

1. 一種乳液、凝膠或洗液形式的化粧組合物，其選自重量自0.5%到3%之水楊酸或重量0.5到3%之壬二酸或此等混合物和重量自0.1%到5%之吡咯烷酮基質複合劑，且其中該水／醇溶液具有低於 pK_a+1 的pH值，此處 pK_a 為完全質子化的抗痤瘡活性物所具酸性常數之對數值。
2. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其中該吡咯烷酮基質複合劑為聚乙烯基吡咯烷酮複合劑。
3. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其另包含0.01重量%至5重量%的檸檬酸或其鹽。
4. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其為油包水乳液形式。
5. 根據申請專利範圍第4項之化粧組合物，其包含1重量%至50重量%矽酮油，選自揮發性矽酮，非揮發性矽酮，及其混合物。
6. 根據申請專利範圍第5項之化粧組合物，其中該揮發性矽酮油係選自具有在25℃下低於10厘史黏度之環狀聚有機基矽氧烷及在25℃下黏度低於5厘史的線型聚有機基矽氧烷。
7. 根據申請專利範圍第6項之化粧組合物，其中該揮發性矽酮油係選自具有3至9個矽原子，較佳具有4至5個矽原子的環狀聚二甲基矽氧烷及具有3至9個矽原子的線型聚二甲基矽氧烷。
8. 根據申請專利範圍第7項之化粧組合物，其中該非揮發性矽酮油包含具有至少一個聚二有機基矽氧烷節段和至

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

泉

公告本

六、申請專利範圍

修正
年 月 日
86.6.11 補充

1. 一種乳液、凝膠或洗液形式的化粧組合物，其選自重量自0.5%到3%之水楊酸或重量0.5到3%之壬二酸或此等混合物和重量自0.1%到5%之吡咯烷酮基質複合劑，且其中該水／醇溶液具有低於 pK_a+1 的pH值，此處 pK_a 為完全質子化的抗痤瘡活性物所具酸性常數之對數值。
2. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其中該吡咯烷酮基質複合劑為聚乙烷基吡咯烷酮複合劑。
3. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其另包含0.01重量%至5重量%的檸檬酸或其鹽。
4. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其為油包水乳液形式。
5. 根據申請專利範圍第4項之化粧組合物，其包含1重量%至50重量%矽酮油，選自揮發性矽酮，非揮發性矽酮，及其混合物。
6. 根據申請專利範圍第5項之化粧組合物，其中該揮發性矽酮油係選自具有在25℃下低於10厘史黏度之環狀聚有機基矽氧烷及在25℃下黏度低於5厘史的線型聚有機基矽氧烷。
7. 根據申請專利範圍第6項之化粧組合物，其中該揮發性矽酮油係選自具有3至9個矽原子，較佳具有4至5個矽原子的環狀聚二甲基矽氧烷及具有3至9個矽原子的線型聚二甲基矽氧烷。
8. 根據申請專利範圍第7項之化粧組合物，其中該非揮發性矽酮油包含具有至少一個聚二有機基矽氧烷節段和至

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

泉

六、申請專利範圍

- 少一個聚氧烯節段之聚二有機基矽氧烷 - 聚氧烯共聚物。
9. 根據申請專利範圍第8項之化粧組合物，其中該聚二有機基矽氧烷 - 聚氧烯共聚物為二甲矽酮(dimethicone)共多元醇。
10. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其另包含0.1重量%至30重量%的濕潤劑。
11. 根據申請專利範圍第10項之化粧組合物，其中該濕潤劑係選自甘油，及在25℃的黏度為300,000至1,100,000cps的聚甲基丙烯酸甘油酯潤滑劑，及其混合物。
12. 根據申請專利範圍第11項之化粧組合物，其中該濕潤劑為甘油。
13. 根據申請專利範圍第5項之化粧組合物，其中該矽酮油包含以組合物重量計2%至25%，較佳5%至15%之非揮發性矽酮。
14. 根據申請專利範圍第10項之化粧組合物，其包含以組合物重量計5%至25%的濕潤劑。
15. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其另包含0.1重量%至10重量%的交聯疏水性丙烯酸酯或甲基丙烯酸酯共聚物。
16. 根據申請專利範圍第15項之化粧組合物，其中該交聯疏水性共聚物為乳膠形式，且其中至少一種活性成份係均勻地分散並包覆在該共聚物格子之內，該活性成份係選

六、申請專利範圍

- 自皮膚相容性油，皮膚相容性濕潤劑，潤滑劑，加濕劑及防晒劑。
17. 根據申請專利範圍第16項之化粧組合物，其中該活性成份係選自濕潤劑，較佳為甘油。
18. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其另包含1重量%至15重量%的潤滑劑，其為天然或合成油，選自礦油，植物油和動物油，脂肪和蠟，脂肪酸酯，脂肪醇，烷二醇，聚烷二醇醚和酯，脂肪酸，及其混合物。
19. 根據申請專利範圍第18項之化粧組合物，其中該潤滑劑係選自棕櫚酸異丙酯，異硬脂酸異丙酯，順丁烯二酸二辛酯，丙二醇二（癸酸酯）／丙二醇二（辛酸酯），甘油三（癸酸酯）／甘油三（辛酸酯），角鯊烷，礦油，異壬酸鯨蠟硬脂酯，羊毛脂醇，及其混合物。
20. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其中該油相含有以組合物為基計算0.1至10重量%，較佳0.1至3重量%的濕潤劑。
21. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其包含30至95重量%，較佳40至80重量%的油相，及5至70重量%，較佳20至60重量%的水相。
22. 根據申請專利範圍第1項之化粧組合物，其另包含一或多種紫外光吸收劑。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

長