



(10) 授权公告号 CN 112118825 B

(45) 授权公告日 2023. 03. 31

(21) 申请号 201980032719.4

(22) 申请日 2019.05.13

(65) 同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 112118825 A

(43) 申请公布日 2020.12.22

(30) 优先权数据
18173222.3 2018.05.18 EP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日
2020.11.16

(86) PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2019/062206 2019.05.13

(87) PCT国际申请的公布数据
W02019/219606 EN 2019.11.21

(73) 专利权人 帝斯曼知识产权资产管理有限公司
地址 荷兰海尔伦

(72) 发明人 克莉丝汀·门德洛克-艾丁格

(74) 专利代理机构 北京东方亿思知识产权代理
有限责任公司 11258
专利代理师 赵艳

(51) Int.Cl.
A61K 8/35 (2006.01)
A61K 8/42 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01)
A61Q 17/04 (2006.01)
A61Q 19/00 (2006.01)
A61K 8/06 (2006.01)

(56) 对比文件
EP 3228299 A1, 2017.10.11
EP 3260113 A1, 2017.12.27
WO 0145640 A2, 2001.06.28
DE 102014104257 A1, 2015.10.01
WO 2015165715 A1, 2015.11.05
EP 2921157 A1, 2015.09.23
EP 3269425 A1, 2018.01.17

审查员 余乐乐

权利要求书2页 说明书9页

(54) 发明名称
局部组合物

(57) 摘要

本发明涉及局部组合物,所述局部组合物包含特定重量比的D-泛醇、双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪 (BEMT) 和羟基苯乙酮 (HAP),所述局部组合物显示出较少的沾污。

1. 一种局部组合物,所述局部组合物包含双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比为至少1.25。

2. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的比率为至少1.5。

3. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的比率为至少1.75。

4. 根据权利要求1或2中任一项所述的局部组合物,其中对羟基苯乙酮与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比选自0.05至1的范围。

5. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物包含D-泛醇,所述D-泛醇的量选自基于所述组合物的总重量,0.45重量%至20重量%的范围。

6. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物包含D-泛醇,所述D-泛醇的量选自基于所述组合物的总重量,0.5重量%至8重量%的范围。

7. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物包含D-泛醇,所述D-泛醇的量选自基于所述组合物的总重量,0.5重量%至6重量%的范围。

8. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物包含D-泛醇,所述D-泛醇的量选自基于所述组合物的总重量,0.5重量%至5重量%的范围。

9. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物包含双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪,所述双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的量选自基于所述组合物的总重量,0.4重量%至10重量%的范围。

10. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物包含双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪,所述双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的量选自基于所述组合物的总重量,0.8重量%至6重量%的范围。

11. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物包含双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪,所述双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的量选自基于所述组合物的总重量,1重量%至3重量%的范围。

12. 根据权利要求1所述的局部组合物,所述局部组合物包含对羟基苯乙酮,所述对羟基苯乙酮的量为基于所述组合物的总重量,0.001重量%至5重量%的范围。

13. 根据权利要求1所述的局部组合物,所述局部组合物包含对羟基苯乙酮,所述对羟基苯乙酮的量为基于所述组合物的总重量,0.01重量%至4重量%的范围。

14. 根据权利要求1所述的局部组合物,所述局部组合物包含对羟基苯乙酮,所述对羟基苯乙酮的量为基于所述组合物的总重量,0.1重量%至3重量%的范围。

15. 根据权利要求1所述的局部组合物,所述局部组合物包含对羟基苯乙酮,所述对羟基苯乙酮的量为基于所述组合物的总重量,0.1重量%至1.5重量%的范围。

16. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物是化妆品组合物或药物组合物。

17. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物是防晒产品。

18. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物是O/W乳液,所述O/W乳液包含在O/W乳化剂存在下分散在水相中的油相。

19. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物是O/W乳液,所述O/W乳液包含

在鲸蜡基磷酸酯存在下分散在水相中的油相。

20. 根据权利要求1所述的局部组合物,其中所述组合物是O/W乳液,所述O/W乳液包含在鲸蜡基磷酸钾存在下分散在水相中的油相。

21. D-泛醇用于促进根据权利要求1至20中任一项所述的组合物从被所述组合物污染的纺织品中洗出的用途。

22. D-泛醇用于减少由双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪导致的纺织品沾污的用途。

23. 一种用于减少包含双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的局部组合物对纺织品的沾污的方法,所述方法包括将D-泛醇掺入所述组合物中。

24. 一种用于促进含有双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的局部组合物从纺织品中洗出的可洗性的方法,所述方法包括将D-泛醇添加到所述组合物中。

25. 根据权利要求21-24中任一项所述的用途或方法,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比为至少1。

26. 根据权利要求21-24中任一项所述的用途或方法,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比为至少1.1。

27. 根据权利要求21-24中任一项所述的用途或方法,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比为至少1.25。

28. 根据权利要求21-24中任一项所述的用途或方法,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比为至少1.75。

29. 根据权利要求21-24中任一项所述的用途或方法,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比选自1.1至5的范围。

30. 根据权利要求21-24中任一项所述的用途或方法,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比选自1.1至4的范围。

31. 根据权利要求21-24中任一项所述的用途或方法,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比选自1.1至3的范围。

32. 根据权利要求21-24中任一项所述的用途或方法,其中D-泛醇与双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪的重量比选自1.1至2.5的范围。

局部组合物

[0001] 本发明涉及局部组合物,所述局部组合物包含D-泛醇、双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪(BEMT)和对羟基苯乙酮(HAP)。

[0002] 多年来,防晒产品已经有了很大的发展。早期的配方旨在保护使用者免受UV-B辐射的伤害,因为曾经有人认为UV-B射线是导致皱纹、皮肤疾病和皮肤癌的最重要因素。然而,最近的研究已表明,UV-A辐射在日光伤害和皮肤疾病(例如红斑狼疮和黑素瘤和非黑素瘤皮肤癌)的发展中是同等或者甚至更重要的。因此,当今的重点是消除尽可能多的UVA(320-400nm)和/或UVB(280-320nm)光。因此,对表现出高SPF(防晒系数)和高UVA防护,同时又是光稳定的防晒产品的需求在不断增长。

[0003] 在这方面,防晒剂通常含有至少一种UVA滤光剂,例如BEMT、丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷和/或二乙氨基羟苯甲酰基己基苯甲酸酯。然而,已知UVA滤光剂会沾污织物。这是一个普遍的问题,因为消费者在使用防晒剂后其T恤衫上会有黄色污渍。为了防止这种情况,消费者倾向于使用较少的防晒霜,但与此同时他们受到的保护也较少。紫外线辐射对皮肤的不利影响是众所周知的。因此,对于行业而言重要的是提供针对此类问题的解决方案,以确保消费者施加足够的防晒剂来实现适当的保护。

[0004] 除此之外,消费者正越来越多地寻找不含防腐剂的制剂或具有替代保鲜体系的制剂。就此而言,羟基苯乙酮(即对羟基苯乙酮,HAP)被用作保鲜增效剂。

[0005] 因此,本发明的目的是改正现有技术的缺点并开发局部组合物,特别是包含至少一种UVA滤光剂(例如特别是BEMT)的防晒产品,所述防晒产品表现出减少的纺织品沾染或促进(即改善或易化)此类UVA滤光剂从被其污染的纺织品中的去除。

[0006] 令人惊讶地,已经发现向包含BEMT和对羟基苯乙酮的防晒剂中以特定量添加D-泛醇显著减少了所述组合物的纺织品沾污,并且进一步促进了通过洗涤对所述组合物的去除。

[0007] 因此,在一个方面中,本发明涉及局部组合物,所述局部组合物包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中D-泛醇与BEMT的重量比为至少1,优选地至少1.1,更优选地至少1.25,甚至更优选地至少1.5,例如最优选地至少1.75,例如至少2。这意味着如果局部用组合物含有按重量计1份的BEMT,则其含有至少1重量份,优选地至少1.1重量份,更优选地至少1.25重量份,例如甚至更优选地至少1.5重量份,例如最优选地至少1.75重量份,例如至少2重量份的D-泛醇。

[0008] 术语“局部”在本文中应理解是指对角蛋白质物质的外部施用,所述角蛋白质物质具体地是皮肤、头皮、睫毛、眉毛、指甲、粘膜和毛发,优选地是皮肤。

[0009] “BEMT”代表双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪(INCI)或Bemotrizinol(INN)(CAS编号187393-00-6)。BEMT充当吸收UVB射线和UVA射线的广谱UV滤光剂。它具有310nm和340nm两个吸收峰。建议将BEMT用于防晒、日常护理、例如BB霜等字母产品、美白产品、彩妆中。

[0010] 在本发明的所有实施方式中,BEMT有利地以基于所述组合物的总重量,选自0.4重量%至10重量%的范围、优选地0.4重量%至10重量%、0.4重量%至9重量%、0.4重量%至8重量%、0.4重量%至7重量%、0.4重量%至6重量%、0.4重量%至5重量%、0.4重量%至4

重量%、0.5重量%至3重量%、0.8重量%至9重量%、0.8重量%至8重量%、0.8重量%至7重量%、0.8重量%至6重量%、0.8重量%至5重量%、0.8重量%至4重量%、0.8重量%至3重量%的范围,例如1重量%至5重量%、2重量%至5重量%、或1重量%至3重量%的范围的量使用。

[0011] D-泛醇也被称为泛醇 (INCI)、右泛醇、前维生素B5或 (+) - (R) - 2,4-二羟基-N-(3-羟丙基)-3,3-二甲基丁酰胺。D-泛醇改善水合作用、减少皮肤瘙痒和炎症、改善皮肤弹性,并加速表皮创伤愈合。D-泛醇是商购可得的,并且例如由DSM Nutritional Products Europe Ltd.出售。

[0012] 在本发明的所有实施方式中,D-泛醇有利地以基于所述组合物的总重量,选自0.45重量%至20重量%的范围,优选地0.45重量%至18重量%、0.45重量%至16重量%、0.45重量%至15重量%、0.5重量%至12.5重量%、0.5重量%至10重量%、0.5重量%至8重量%的范围,更优选地0.5重量%至6重量%的范围,例如0.5重量%至5重量%的范围的量使用。甚至更优选地,在根据本发明的制剂中泛醇的量选自0.75重量%至5重量%、1重量%至5重量%、或2重量%至5重量%的范围。

[0013] 对羟基苯乙酮,在本文中也称为羟基苯乙酮或HAP (CAS编号99-93-4) 是一种具有抗氧化和舒缓特性的多功能化妆品成分。它可以用作温和并且安全的保鲜增效剂。对羟基苯乙酮是商购可得的。

[0014] 在本发明的所有实施方式中,对羟基苯乙酮有利地以基于所述组合物的总重量,选自0.001重量%至5重量%的范围,优选地0.01重量%至4重量%、0.1重量%至3重量%的范围,更优选地0.1重量%至1.5重量%的范围的量使用。基于所述组合物的总重量,进一步优选的范围是0.005重量%至4.5重量%,0.05重量%至3重量%,0.1重量%至2重量%,以及0.25重量%至1.5重量%。

[0015] 在一个特别有利的实施方式中,本发明涉及局部组合物,所述局部组合物包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中D-泛醇与BEMT的重量比选自1.1至5 (即1重量份的BEMT比1.1重量份至5重量份的D-泛醇) 的范围,优选地1.1至4 (即1重量份的BEMT比1.1重量份至4重量份的D-泛醇) 的范围,最优选地1.1至3 (即1重量份的BEMT比1.1重量份至3重量份的D-泛醇) 的范围,例如特别是1.15至2 (即1重量份的BEMT比1.15重量份至2重量份的D-泛醇) 的范围。

[0016] 在本发明的所有实施方式中,优选地,所述局部用组合物包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中HAP与BEMT的重量比 (w/w) 选自0.01至1 (即1重量份的BEMT比0.01重量份至1重量份的HAP) 的范围。

[0017] 在另一个实施方式中,所述局部组合物包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中HAP与BEMT的重量比选自0.05至1 (即1重量份的BEMT比0.05重量份至1重量份的HAP) 的范围,优选地0.1至1 (即1重量份的BEMT比0.1重量份至1重量份的HAP) 的范围,更优选地0.2至1 (即1重量份的BEMT比0.2重量份至1重量份的HAP) 的范围,最优选地0.25至1 (即1重量份的BEMT比0.25重量份至1重量份的HAP) 的范围。

[0018] 在本发明的所有实施方式中,有利地,HAP的量低于BEMT的量。因此,在一个优选的实施方式中,根据本发明的组合物显示出HAP与BEMT的重量比小于1,例如在0.05至0.9的范围内,优选地在0.1至0.75的范围内,最优选地在0.25至0.5的范围内。

[0019] 因此,在本发明的所有实施方式中,所述局部组合物优选地包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中HAP与BEMT的重量比选自1重量份的BEMT比0.05重量份至0.9重量份的HAP;1重量份的BEMT比0.1重量份至0.8重量份的HAP、1重量份的BEMT比0.1重量份至0.75重量份的HAP、1重量份的BEMT比0.2重量份至0.6重量份的HAP、或1重量份的BEMT比0.25重量份至0.5重量份的HAP的范围。

[0020] 在另一个实施方式中,局部组合物包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中D-泛醇与BEMT的重量比为至少1.1,优选地至少1.2,并且HAP与BEMT的重量比选自0.05至0.9的范围。

[0021] 在另一个实施方式中,局部组合物包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中

[0022] -D-泛醇与BEMT的重量比为至少1.15;优选地至少1.2;例如选自1.15至5;1.15至4;1.15至3;1.15至2;1.15至2的范围;并且

[0023] -HAP与BEMT的重量比选自0.05至1的范围;优选地0.1至1的范围,最优选地0.2至1的范围,例如0.25至1的范围;例如1重量份的BEMT比0.05-0.9重量份的HAP;1重量份的BEMT比0.1-0.8重量份的HAP、1重量份的BEMT比0.1-0.75重量份的HAP、1重量份的BEMT比0.2-0.6重量份的HAP、1重量份的BEMT比0.25-0.5重量份的HAP的范围。

[0024] 根据本发明的特别优选的局部组合物包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮,其中D-泛醇与BEMT的重量比选自1.1至5的范围,优选地1.1至4的范围;更优选地1.1至3的范围;最优选地1.1至2.5的范围,并且HAP与BEMT的重量比选自0.1至0.75的范围。

[0025] 在本发明的另一个实施方式中,包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮的局部组合物是化妆品组合物或药物组合物。

[0026] 在本发明的另一个实施方式中,包含BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮的局部组合物是防晒产品(即防晒剂)。

[0027] 本发明的另一个实施方式涉及如上所述的局部组合物用于减少BEMT的纺织品(布)沾污,特别是在洗涤后减少BEMT的纺织品(布)沾污的用途,和/或促进将根据本发明的局部组合物从被其污染的纺织品洗出的用途。优选地,所述组合物还包含对羟基苯乙酮。

[0028] 在另一个实施方式中,本发明涉及D-泛醇减少由UVA滤光剂(例如优选地BEMT或在对羟基苯乙酮的存在下的BEMT)引起的纺织品(布)沾污的用途。

[0029] 此外,本发明涉及D-泛醇在含有至少一种UVA滤光剂(例如优选地BEMT)的局部组合物中用于促进所述UVA滤光剂从被其污染的纺织品中洗出的可洗性的用途。所述组合物优选地还包含对羟基苯乙酮。

[0030] 本发明的另一个实施方式涉及一种用于特别是在洗涤后,减少包含至少一种UVA滤光剂(例如优选地BEMT)的局部组合物对纺织品(布)的沾污的方法,所述方法包括将D-泛醇掺入所述组合物中。所述组合物优选地还包含对羟基苯乙酮。

[0031] 在另一个实施方式中,本发明涉及用于促进含有至少一种UVA滤光剂(例如优选地BEMT)的局部组合物从纺织品中洗出的可洗性的方法和用途,所述方法包括向所述组合物中添加D-泛醇。所述组合物优选地还包含对羟基苯乙酮。

[0032] 如本文所用的术语“UVA滤光剂”尤其是指BEMT、丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷[PARSOL®1789,CAS:70356-09-1]和二乙氨基羟苯甲酰基己基苯甲酸酯[UVINUL®A Plus,CAS:302776-68-7],最优选地BEMT。

[0033] 众所周知的是,如本文关于D-泛醇和BEMT的比率或BEMT和对羟基苯乙酮的比率给出的所有偏好和定义也适用于根据本发明的所有用途和方法。这同样适用于BEMT、D-泛醇和对羟基苯乙酮的含量(量)。此外,针对BEMT给出的量和比率也适用于其他UVA滤光剂,即丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷和二乙氨基羟苯甲酰基己基苯甲酸酯。

[0034] 在一个特别有利的实施方式中,根据本发明的用途和方法包括以下项的使用:

[0035] -D-泛醇与BEMT的重量比为至少1.15;优选地至少1.2;例如选自1.15至5;1.15至4;1.15至3;1.15至2;1.15至2的范围;并且

[0036] -HAP与BEMT的重量比选自0.05至1的范围;优选地0.1至1的范围,最优选地0.2至1的范围,例如0.25至1的范围;例如1重量份的BEMT比0.05-0.9重量份的HAP;1重量份的BEMT比0.1-0.8重量份的HAP、1重量份的BEMT比0.1-0.75重量份的HAP、1重量份的BEMT比0.2-0.6重量份的HAP、1重量份的BEMT比0.25-0.5重量份的HAP的范围。

[0037] 在本发明的所有实施方式中优选的局部组合物是含有油相和水相的乳液,例如特别是O/W、W/O、Si/W、W/Si、O/W/O、W/O/W多重或皮克林乳液。存在于此类乳液中的油相(即,含有所有油脂的相)的量为基于组合物的总重量,优选地至少10重量%,例如在10重量%至60重量%的范围内,优选地在15重量%至50重量%的范围内,最优选地在15重量%至40重量%的范围内。

[0038] 根据一个优选的实施方式,根据本发明的局部组合物是O/W乳液,所述O/W乳液包含在O/W乳化剂存在下,优选地在鲸蜡基磷酸酯(例如最优选地鲸蜡基磷酸钾)存在下分散在水相中的油相。

[0039] 在另一个实施方式中,本发明涉及根据本文所述实施方式的局部组合物,所述局部组合物用作防晒剂,或者涉及根据本文所述实施方式的局部组合物作为防晒剂的用途。

[0040] 在又一实施方式中,本发明涉及D-泛醇用于促进根据上述组合物中的任一组合物的组合物从被所述组合物污染的纺织品洗出的用途。

[0041] 在又一实施方式中,本发明涉及D-泛醇用于减少由双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪或双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪和对羟基苯乙酮导致的纺织品沾污的用途。

[0042] 在又一实施方式中,本发明涉及一种用于减少包含双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪或双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪和对羟基苯乙酮的局部组合物对纺织品的沾污的方法,所述方法包括将D-泛醇掺入所述组合物中。

[0043] 在又一实施方式中,本发明涉及一种用于促进含有双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪或双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪和对羟基苯乙酮的局部组合物从纺织品中洗出的可洗性的方法,所述方法包括将D-泛醇添加到所述组合物中。

[0044] 除了双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪(BEMT)以外,在根据本发明的局部组合物中还可以存在另外的UV滤光剂。这些UV滤光剂都是商购可得的UV滤光剂物质,例如特别是(INCI名称)聚硅酮-15、亚甲基双-苯并三唑基四甲基丁基酚、三联苯三嗪、苯基苯并咪唑磺酸、3-亚苄基樟脑、奥克立林、甲氧基肉桂酸乙基己酯、水杨酸乙基己酯、胡莫柳酯、乙基己基三嗪酮、氧化锌、二乙基己基丁酰胺基三嗪酮、二苯甲酮-3、二氧化钛、丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷、苯基二苯并咪唑四磺酸二钠和二乙氨基羟苯甲酰基己基苯甲酸酯,但不限于此。

[0045] 此外,局部组合物还可包含基于聚硅氧烷的UV滤光剂。优选地,基于聚硅氧烷的UV滤光剂具有苯亚甲基丙二酸酯类型的发色团残基。最优选的基于聚硅氧烷的UV滤光剂是聚

硅酮-15 (INCI), 其为以商品名 **PARSOL®SLX** 在 DSM Nutritional Products Ltd. 商购可得的。

[0046] 在根据本发明的组合中, 基于聚硅氧烷的UV滤光剂, 优选地具有苯亚甲基丙二酸酯 (benzalmalonate) 类型的发色团残基, 例如聚硅酮-15 的量优选地基于所述组合物的总重量, 选自0.1重量%至10重量%的范围, 例如0.5重量%至8重量%的范围, 例如最优选地1重量%至5重量%的范围。另外的范围将是0.2-10重量%、0.3-9重量%或0.4-8重量%。

[0047] 然而, 在根据本发明的所有实施方式中优选的是, 所述组合物不含有任何聚硅酮-15, 因为即使在洗涤之后沾污被显著减少但这增加了BEMT的初始沾污特性 (在洗涤之前)。

[0048] 由于根据本发明的局部组合物旨在用于局部应用, 所以它们包含生理学上可接受的介质, 即与角蛋白质 (例如皮肤、粘膜和角蛋白纤维) 相容的介质。具体地, 生理上可接受的介质是美容上可接受的载体。

[0049] 术语美容上可接受的载体是指美容组合物中常规使用的所有载体和/或赋形剂和/或稀释剂。

[0050] 根据本发明的优选的局部组合物是皮肤护理制品、装饰性制品和功能制品。

[0051] 皮肤护理制品的示例特别是防光制品、抗衰老制品、用于治疗光衰老的制品、身体油、身体乳、身体凝胶、护理霜、护肤软膏、美肌粉 (skin powder)、保湿凝胶、保湿喷雾剂、面部和/或身体保湿剂、皮肤美黑制品 (即用于人类皮肤的人工/免晒型美黑和/或棕色化的组合物), 例如防晒霜, 以及亮肤制品。

[0052] 装饰性制品的示例特别是口红、眼影、睫毛膏、干燥和湿润的化妆制剂, 胭脂和/或散粉。

[0053] 功能制品的示例是含有活性成分的美容组合物或药物组合物, 诸如但不限于激素制品、维生素制品、植物提取物制品、抗衰老制品, 和/或抗微生物 (抗细菌或抗真菌) 制品。

[0054] 在一个特定的实施方式中, 根据本发明的局部组合物是防光制剂 (防晒产品), 例如防晒乳 (sun protection milks)、防晒乳液、防晒霜、防晒油、防晒乳 (sun blocks) 或具有SPF (防晒系数) 的日霜。特别令人感兴趣的是防晒霜、防晒乳液、防晒乳 (sun protection milks) 和防晒制品。

[0055] 根据本发明的局部组合物可以是溶剂或脂肪物质中的悬浮液或分散体的形式, 或者乳液或微乳液 (特别是水包油 (O/W) 或油包水 (W/O) 型、水包硅氧烷 (Si/W) 或硅氧烷包水 (W/Si) 型、PIT乳液、多重乳液 (例如油包水包油 (O/W/O) 或水包油包水 (W/O/W) 型)、皮克林乳液、水凝胶、醇凝胶、脂凝胶、单相或多相溶液或囊状分散体的形式或其他常用形式, 所述形式也可以用笔型器作为面膜或喷剂施加。

[0056] 根据本发明的局部组合物有利地为水包油 (O/W) 乳液的形式, 所述水包油 (O/W) 乳液包含在O/W乳化剂存在下分散于水相中的油相。此类O/W乳液的制备是本领域技术人员熟知的并且在实施例中说明的。

[0057] 在一个有利的实施方式中, 该组合物还含有磷酸酯乳化剂。在优选的磷酸酯乳化剂中有C₈₋₁₀烷基乙基磷酸酯、C₉₋₁₅烷基磷酸酯、鲸蜡硬脂醇聚醚-2磷酸酯、鲸蜡硬脂醇聚醚-5磷酸酯、鲸蜡醇聚醚-8磷酸酯、鲸蜡醇聚醚-10磷酸酯、鲸蜡基磷酸酯、C6-10链烷醇聚醚-4磷酸酯、C₁₂₋₁₅链烷醇聚醚-2磷酸酯、C₁₂₋₁₅链烷醇聚醚-3磷酸酯、DEA-鲸蜡硬脂醇聚醚-2磷酸酯、DEA-鲸蜡基磷酸酯、DEA-油醇聚醚-3磷酸酯、鲸蜡基磷酸钾、癸醇聚醚-4磷酸酯、癸醇

聚醚-6磷酸酯和三月桂醇聚醚-4磷酸酯。根据本发明的具体磷酸酯乳化剂是鲸蜡基磷酸钾,例如可作为 **Amphisol[®]** K在DSM Nutritional Products Ltd Kaiseraugst商购获得。

[0058] 如果根据本发明的局部组合物是O/W乳液,则其优选地含有选自以下项的列表的至少一种O/W乳化剂或Si/W乳化剂:PEG-30二聚羟基硬脂酸酯、PEG-4二月桂酸酯、PEG-8二油酸酯、PEG-40失水山梨醇全油酸酯、PEG-7甘油椰油酸酯、PEG-20杏仁油甘油酯、PEG-25氢化蓖麻油、甘油硬脂酸酯(和)PEG-100硬脂酸酯、PEG-7棕榈仁酸酯、PEG-8油酸酯、PEG-8月桂酸酯、PEG-60杏仁油甘油酯、PEG-20甲基葡萄糖倍半硬脂酸酯、PEG-40硬脂酸酯、PEG-100硬脂酸酯、PEG-80失水山梨醇月桂酸酯、硬脂醇聚醚-2、硬脂醇聚醚-12、油醇聚醚-2、鲸蜡醇聚醚-2、月桂醇聚醚-4、油醇聚醚-10、油醇聚醚-10/聚乙二醇10油烯基醚、鲸蜡醇聚醚-10、异硬脂醇聚醚-20、鲸蜡硬脂醇聚醚-20、油醇聚醚-20、硬脂醇聚醚-20、硬脂醇聚醚-21、鲸蜡醇聚醚-20、异鲸蜡醇聚醚-20、月桂醇聚醚-23、硬脂醇聚醚-100、甘油基硬脂酸酯柠檬酸酯、硬脂酸甘油酯(自乳化)、硬脂酸、硬脂酸的盐、聚甘油-3-甲基葡萄糖二硬脂酸酯。其他合适的乳化剂为脱水山梨糖醇油酸酯、脱水山梨糖醇倍半油酸酯、脱水山梨糖醇异硬脂酸酯、脱水山梨糖醇三油酸酯、月桂基葡萄糖苷、癸基葡萄糖苷、硬脂酰谷氨酸钠、蔗糖多硬脂酸酯和水合聚异丁烯。此外,可以使用一种或多种合成聚合物作为乳化剂,例如PVP二十碳烯共聚物、丙烯酸酯/丙烯酸C₁₀₋₃₀烷基酯交联聚合物、丙烯酸酯/硬脂醇聚醚-20甲基丙烯酸酯共聚物、PEG-22/十二烷基二醇共聚物、PEG-45/十二烷基二醇共聚物,以及它们的混合物。

[0059] 另一类特别合适的O/W乳化剂是衍生自橄榄油的非离子自乳化体系,例如以商品名OLIVEM 1000出售的被称为(INCI名称)橄榄油鲸蜡醇酯和脱水山梨糖醇橄榄油酸酯(化学组成:橄榄油脂肪酸的脱水山梨醇酯和鲸蜡硬脂醇酯)。

[0060] 另外合适的是商购可得的聚合物乳化剂,例如疏水改性的聚丙烯酸,例如丙烯酸酯/丙烯酸C₁₀₋₃₀烷基酯交联聚合物,其是以商品名 **Pemulen[®]** TR-1和TR-2由Noveon公司商购可得的。

[0061] 另一类特别合适的乳化剂是聚甘油酯或脂肪酸二酯,也称为聚甘油酯/二酯(即其中一个或多个脂肪酸通过酯化与聚甘油结合的聚合物),例如在Evonik作为Isolan GPS [INCI名称为聚甘油-4二异硬脂酸酯/聚羟基硬脂酸酯/癸二酸酯(即,异硬脂酸、聚羟基硬脂酸和癸二酸的混合物与聚甘油-4的二酯)]商购可得的,或作为Dehymuls PGPH在Cognis商购可得的(INCI聚甘油-2-2二聚羟基硬脂酸酯)。

[0062] 同样合适的是聚亚烷基二醇醚,例如Brij 72(聚氧乙烯(2)硬脂基醚)或Brij 721(聚氧乙烯(21)硬脂基醚,例如可在Croda购得的)。

[0063] 所述至少一种O/W或Si/W乳化剂优选以基于组合物的总重量,0.5重量%至10重量%,例如特别地在0.5重量%至5重量%的范围内,例如最特别地在0.5重量%至4重量%的范围内的量使用。

[0064] 合适的W/O乳化剂或W/Si乳化剂为:聚甘油-2-二聚羟基硬脂酸酯、PEG-30二聚羟基硬脂酸酯、鲸蜡基聚二甲基硅氧烷共聚醇、油酸/异硬脂酸的聚甘油-3二异硬脂酸酯聚甘油酯、聚甘油-6-六蓖麻醇酸酯(hexaricinolate)、聚甘油基-4-油酸酯、聚甘油基-4-油酸酯/PEG-8丙二醇椰油酸酯、硬脂酸镁、硬脂酸钠、月桂酸钾、蓖麻酸钾(potassium ricinoleate)、椰油酸钠、牛脂酸钠、蓖麻油酸钾(potassium castorate)、油酸钠,以及它

们的混合物。其他合适的W/Si乳化剂是月桂基聚甘油-3、聚二甲基硅氧乙基二甲聚硅氧烷和/或PEG-9聚二甲基硅氧乙基二甲聚硅氧烷和/或鲸蜡基PEG/PPG-10/1二甲聚硅氧烷和/或PEG-12二甲聚硅氧烷交联聚合物和/或PEG/PPG-18/18二甲聚硅氧烷。该至少一种W/O乳化剂优选以相对于组合物的总重量约0.001重量%至10重量%的量,更优选地0.2重量%至7重量%的量使用。

[0065] 此外,根据本发明的局部组合物还有利地含有至少一种助表面活性剂,例如选自由甘油单酯和甘油二酯和/或脂肪醇组成的组。助表面活性剂通常以选自基于组合物的总重量,0.1重量%至10重量%的范围,例如特别是0.5重量%至6重量%的范围,例如最特别地1重量%至5重量%的范围的量使用。特别合适的助表面活性剂选自以下列表:烷基醇,例如鲸蜡醇(Lorol C16、Lanette 16)、鲸蜡硬脂醇(Lanette 0)、硬脂醇(Lanette 18)、山嵛醇(Lanette 22)、硬脂酸甘油酯、甘油肉豆蔻酸酯(Estol 3650)、氢化椰油甘油酯(Lipocire Na10)以及它们的混合物。

[0066] 根据本发明的O/W乳液形式的组合物可以例如以O/W乳液的所有制剂形式提供,例如以精华液、乳剂或乳膏剂的形式提供,并且它们是根据常用方法制备的。作为本发明主题的组合物旨在用于局部应用,并且可以特别地构成皮肤病学或美容组合物,所述皮肤病学或美容组合物例如旨在用于保护人皮肤免受紫外线辐射的不利影响(抗皱、抗衰老、保湿、防晒等)。

[0067] 根据本发明的一个有利的实施方式,所述组合物构成美容组合物,并且旨在局部施加至皮肤。

[0068] 最后,本发明的主题是一种用于角蛋白物质,例如特别是皮肤的美容治疗的方法,其中将如上文所定义的组合物施加至所述角蛋白物质,例如特别是皮肤。该方法特别适合于保护皮肤免受紫外线辐射的不利影响,例如特别是晒伤和/或光老化。

[0069] 根据本发明,根据本发明的组合物可包含其他成分,例如用于亮肤;防止晒黑;治疗色素沉着过度;预防或减少痤疮、皱纹、细纹、萎缩和/或炎症;螯合剂和/或螯合物;消脂和纤体(例如植烷酸)、紧致、保湿和活肤、防晒、舒缓的成分,以及用于改善弹性和皮肤屏障的试剂,和/或传统上用于局部组合物中的另外的紫外线过滤物质、蓝光防护剂和载体和/或赋形剂或稀释剂。如果没有其他说明,则以下提及的赋形剂、添加剂、稀释剂等适用于根据本发明的局部组合物。美容和皮肤病学助剂和添加剂的必要量可以基于所需产品,由技术人员容易地确定。可以视情况将附加成分加入油相中、水相中或单独加入。本领域技术人员可以容易地调适添加方式。

[0070] 在一些情况下,可用于本发明的美容活性成分可提供多于一种益处或通过多于一种作用方式起作用。

[0071] 本发明的局部美容组合物还可含有常用的美容助剂和添加剂,例如防腐剂/抗氧化剂、脂肪物质/油、水、有机溶剂、硅氧烷、增稠剂、软化剂、乳化剂、防晒物质、消泡剂、保湿剂、美学组分(例如香料)、表面活性剂、填充剂、螯合剂、阴离子聚合物、阳离子聚合物、非离子聚合物或两性聚合物或它们的混合物、推进剂、酸化剂或碱化剂、染料、着色物质/着色剂、磨料、吸收剂、精油、皮肤感觉剂、收敛剂、消泡剂、颜料或纳米颜料(例如适合于通过物理阻挡紫外线辐射来提供光保护效应的颜料或纳米颜料),或通常配制成美容组合物的任何其他成分。适合在本发明的组合物中使用的此类在皮肤护理行业中常用的美容成分例如

描述于可通过在线INFO BASE (<http://online.personalcarecouncil.org/jsp/Home.jsp>) 访问的由个人护理产品委员会提供的《国际美容成份字典和手册 (International Cosmetic Ingredient Dictionary&Handbook by Personal Care)》(<http://www.personalcarecouncil.org/>) 中,但不限于此。

[0072] 美容和皮肤病学佐剂和添加剂的必要量可以一基于所需产品一由本领域技术人员容易地选择,并且将在实施例中说明,但不限于此。

[0073] 当然,本领域技术人员将注意选择上述任选的一种或多种附加化合物和/或它们的量,使得与根据本发明的组合本质上相关的有利性质不受或实质上不受所设想的一种或多种加入的不利影响。

[0074] 根据本发明的局部组合物的pH通常在3至10的范围内,优选地pH在4至8的范围内,并且最优选地pH在4至7的范围内。可以根据本领域的标准方法,用合适的酸(例如柠檬酸)或碱(例如NaOH)容易地根据需要调节pH。

[0075] 根据本发明的局部用组合物还可含有一种或多种舒缓和软化皮肤的润肤剂。例如,润肤剂可以是碳酸二辛酯或苯甲酸C₁₂₋₁₅烷基酯。其他润肤剂是硅氧烷(聚二甲基硅氧烷、环甲硅油)、植物油(葡萄籽油、芝麻籽油、荷荷巴油等)、黄油(可可脂、乳木果油)、醇类(硬脂醇、鲸蜡醇),以及凡士林衍生物(石油膏、矿物油)。

[0076] 根据本发明的美容组合物有利地包含防腐剂或保鲜增效剂。优选地,附加的防腐剂或保鲜增效剂选自由以下项组成的组:苯氧乙醇、乙基己基甘油、辛酸甘油酯、辛甘醇、1,2-己二醇、丙二醇(propanediol)、丙二醇(propylene glycol),以及它们的混合物。防腐剂或防腐促进剂当存在时优选地以基于组合物的总重量,0.01重量%至2重量%的量,更优选地0.05重量%至1.5重量%的量,最优选地0.1重量%至1.0重量%的量使用。特别优选的是,根据本发明的化妆品组合物不含有任何另外的/其他防腐剂,例如对羟基苯甲酸酯类和/或甲基异噻唑啉酮。

[0077] 提供以下实施例以进一步说明本发明的组合物和效果。这些实施例仅是说明性的,并不意图以任何方式限制本发明的范围。

[0078] 实验部分

[0079] 已经制备了表1中概述的乳膏制剂。然后,使用以下工序将乳膏剂施加到棉织物上:将纺织品(A5大小的棉纺织品裁切片)使用弹性带固定在塑料瓶的顶部上。将带有固定纺织品的瓶子放在天平上。在织物上称量0.36g(+/-0.1g)的防晒制剂,并均匀分布在直径为5cm的区域上。然后将织物干燥15分钟,之后测量斑点的L、a、b值。

[0080] 然后,将织物在烧杯中用300ml的水和1g洗涤剂在40℃在搅拌下洗涤1小时,之后将织物在300ml淡水中冲洗15分钟。在织物已经干燥15分钟之后,再次测量斑点的L、a、b值。对于每次试验,使用3个单独的织物,因此每个结果均为3个织物的平均值。

[0081] B值的解释:b值越高,则织物的黄色越多;数值越偏负,则织物越白/蓝。

[0082] 表1:

成分	参考 1	参考 2	发明 1	发明 2
	重量%			
鲸蜡基磷酸钾	1.5	1.5	1.5	1.5
硬脂醇	3.0	3.0	3.0	3.0
[0083] 水杨酸十三烷基酯	11.0	11.0	11.0	11.0
苯甲酸 C12-15 烷基酯	11.0	11.0	11.0	11.0
双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪 (BEMT)	2.5	2.5	2.5	2.5
羟基苯乙酮 (HAP)	0.7	0.7	0.7	0.7
水	适量	适量	适量	适量
甘油	3.0	3.0	3.0	3.0
[0084] 黄原胶	0.3	0.3	0.3	0.3
苯氧乙醇, 乙基己基甘油	0.5	0.5	0.5	0.5
D-泛醇	/	1.0	3.0	5.0

[0085] 表2:

	参考 1	参考 2	发明 1	发明 2
洗涤前的 b 值	4.48	4.50	4.32	3.97
[0086] 与参考 1 相比, 洗涤后黄色沾污减少		未减少	-4%	-11%
洗涤后的 b 值	-1.05	-1.02	-1.42	-2.07
与参考 1 相比, 洗涤后黄色沾污减少		未减少	-35%	-97%

[0087] 如从表2可以得出的, 向包含BEMT的局部组合物中添加大量的D-泛醇显著降低了其沾污。