



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 102573781 A

(43) 申请公布日 2012. 07. 11

(21) 申请号 201080012605. 2

代理人 张钦

(22) 申请日 2010. 03. 19

(51) Int. Cl.

(30) 优先权数据

A61K 8/89 (2006. 01)

61/161, 953 2009. 03. 20 US

(85) PCT申请进入国家阶段日

2011. 09. 20

(86) PCT申请的申请数据

PCT/US2010/027955 2010. 03. 19

(87) PCT申请的公布数据

W02010/108085 EN 2010. 09. 23

(71) 申请人 宝洁公司

地址 美国俄亥俄

(72) 发明人 L·E·布雷福格尔 R·A·芬利

(74) 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专

利商标事务所 11038

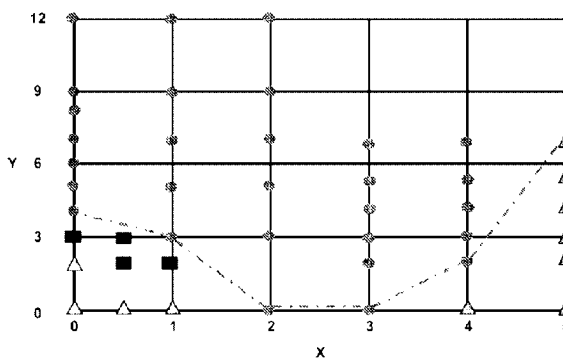
权利要求书 3 页 说明书 12 页 附图 1 页

(54) 发明名称

包含油溶性固体防晒剂的个人护理组合物

(57) 摘要

在一个实施方案中,一种油包水乳液形式的个人护理组合物包含至少约 10% 的非极性硅油、约 0.1% 至约 10% 的第一油溶性固体防晒剂和约 0.1% 至约 10% 的第二油溶性固体防晒剂。第一防晒剂与第二防晒剂的重量比可为约 0.8 至约 2.0, 或约 1.0 至约 1.5。第一防晒剂可为羟甲氧二苯酮。第二防晒剂可为阿伏苯宗。所述组合物还可包含护肤活性物质, 所述护肤活性物质选自下列组成的组: 维生素 B3 化合物、糖胺、肽、去氧苯比妥化合物、以及它们的组合。在另一个实施方案中, 本发明涉及一种改善第二油溶性固体防晒剂在油包水乳液的油相中的溶解度的方法。



1. 一种油包水乳液形式的个人护理组合物,所述组合物包含:

- a) 至少约 10%的非极性硅油;
- b) 约 0.1%至约 10%的第一油溶性固体防晒剂;和
- c) 约 0.1%至约 10%的第二油溶性固体防晒剂;

其中所述第一油溶性固体防晒剂与所述第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 0.8 至约 2.0,并且其中所述第一油溶性固体防晒剂为羟甲氧二苯酮。

2. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,其中所述非极性硅油选自由下列组成的组:环甲基硅氧烷、聚二甲基硅氧烷、以及它们的混合物。

3. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,所述组合物包含至少约 20%的非极性硅油。

4. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,所述组合物包含至少约 30%的非极性硅油。

5. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,所述组合物包含至少约 40%的非极性硅油。

6. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,所述组合物包含约 1%至约 6%的羟甲氧二苯酮。

7. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,所述组合物包含约 1%至约 5%的第一油溶性固体防晒剂,其中所述第一油溶性固体防晒剂为阿伏苯宗。

8. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,其中所述第一油溶性固体防晒剂与所述第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 1.0 至约 1.5。

9. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,其中所述第一油溶性固体防晒剂与所述第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 1.2 至约 1.4。

10. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,所述组合物还包含护肤活性物质,其中所述护肤活性物质选自由下列组成的组:维生素、肽、糖胺、控油剂、美黑活性物质、抗痤疮活性物质、脱屑活性物质、抗蜂窝炎活性物质、螯合剂、亮肤剂、类黄酮、蛋白酶抑制剂、非维生素类抗氧化剂和自由基清除剂、毛发生长调节剂、抗皱纹活性物质、抗萎缩活性物质、矿物质、植物甾醇和 / 或植物激素、酪氨酸酶抑制剂、抗炎剂、N- 酰基氨基酸化合物、抗微生物剂、抗真菌剂、以及它们的混合物。

11. 如权利要求 1 所述的个人护理组合物,所述组合物还包含护肤活性物质,其中所述护肤活性物质选自由下列组成的组:维生素 B₃ 化合物、糖胺、肽、去氧苯比妥化合物、以及它们的组合。

12. 一种油包水乳液形式的个人护理组合物,所述组合物包含:

- a) 至少约 10%的非极性硅油;
- b) 约 0.1%至约 10%的羟甲氧二苯酮;和
- c) 约 0.1%至约 10%的阿伏苯宗;

其中羟甲氧二苯酮与阿伏苯宗的重量比为约 0.8 至约 2.0。

13. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,其中所述非极性硅油选自由下列组成的组:环甲基硅氧烷、聚二甲基硅氧烷、以及它们的混合物。

14. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,所述组合物包含至少约 20%的非极性硅油。

15. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,所述组合物包含至少约 30%的非极性硅油。

16. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,所述组合物包含至少约 40%的非极性硅油。

17. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,所述组合物包含约 1%至约 6%的羟甲氧二苯酮。

18. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,所述组合物包含约 1%至约 5%的阿伏苯宗。

19. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,其中所述羟甲氧二苯酮与阿伏苯宗的重量比为约 1.0 至约 1.5。

20. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,其中所述羟甲氧二苯酮与阿伏苯宗的重量比为约 1.2 至约 1.4。

21. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,所述组合物还包含护肤活性物质,其中所述护肤活性物质选自由下列组成的组:维生素、肽、糖胺、控油剂、美黑活性物质、抗痤疮活性物质、脱屑活性物质、抗蜂窝炎活性物质、螯合剂、亮肤剂、类黄酮、蛋白酶抑制剂、非维生素类抗氧化剂和自由基清除剂、毛发生长调节剂、抗皱纹活性物质、抗萎缩活性物质、矿物质、植物甾醇和 / 或植物激素、酪氨酸酶抑制剂、抗炎剂、N- 酰基氨基酸化合物、抗微生物剂、抗真菌剂、以及它们的混合物。

22. 如权利要求 12 所述的个人护理组合物,所述组合物还包含护肤活性物质,其中所述护肤活性物质选自由下列组成的组:维生素 B₃ 化合物、糖胺、肽、去氧苯比妥化合物、以及它们的组合。

23. 一种油包水乳液形式的个人护理组合物,所述组合物包含:

a) 至少约 10%的非极性硅油;

b) 约 1%至约 6%的羟甲氧二苯酮;

c) 约 1%至约 5%的阿伏苯宗;和

d) 护肤活性物质,所述护肤活性物质选自由下列组成的组:维生素 B₃ 化合物、糖胺、肽、去氧苯比妥化合物、以及它们的组合;

其中羟甲氧二苯酮与阿伏苯宗的重量比为约 1.0 至约 1.5。

24. 一种改善第二油溶性固体防晒剂在油包水乳液的油相中的溶解度的方法,所述方法包括将第一油溶性防晒剂与第二油溶性防晒剂混合的步骤,其中所述第一油溶性固体防晒剂与所述第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 1.0 至约 1.5,并且其中所述第一油溶性固体防晒剂为羟甲氧二苯酮。

25. 一种个人护理组合物,所述组合物包含:

a) 至少约 10%的非极性硅油;

b) 约 0.1%至约 10%的第一油溶性固体防晒剂;和

c) 约 0.1%至约 10%的第二油溶性固体防晒剂;

其中所述第一油溶性固体防晒剂与所述第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 0.8 至约 2.0。

26. 一种油包水乳液形式的个人护理组合物,所述组合物包含:

a) 至少约 10%的非极性硅油;

b) 约 0.1%至约 10%的第一油溶性固体防晒剂;和

c) 约 0.1%至约 10%的第二油溶性固体防晒剂；

其中所述第一油溶性固体防晒剂与所述第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 0.8 至约 2.0。

包含油溶性固体防晒剂的个人护理组合物

发明领域

[0001] 本发明涉及一种油包水乳液形式的个人护理组合物,所述组合物包含第一油溶性固体防晒剂、第二油溶性固体防晒剂、和非极性硅油。

[0002] 发明背景

[0003] 大多数高效的防晒剂是油质的或油溶性的。这些防晒剂对于紫外线阻挡是必需的,但是具有令人不悦的厚重、油腻的皮肤感觉,并且存在配制困难,如防晒剂稳定性以及与其它组分的相容性。为了消除与防晒剂组合物相关的厚重、油腻的皮肤感觉,通常将此类产品配制成乳液。大多数此类乳液是水包油乳液,其中水相(其在大多数情况下主要是水)是用聚合物增稠剂而增稠。水包油乳液具有的一个问题在于,由于它们是水基的,因此它们非常易于例如在出汗、游泳或洗手后从皮肤上洗去或擦去。存在非常少的反相乳液(油包水)形式的防晒剂组合物。反相乳液具有感觉油腻且厚重的趋势。期望提供一种具有愉悦皮肤感觉并且不太易于从皮肤上洗去或擦去的包含油包水乳液的防晒剂组合物。为了实现该要求,可将硅油作为主要的油相组分掺入到所述组合物中。

[0004] 然而,将硅油掺入到防晒剂组合物中,其它问题变得关键,如防晒剂溶解度。不良的防晒剂溶解度导致防晒剂在某些浓度或温度下从油相中沉淀出来,形成使用者可看见和感觉到的晶体,同时组合物具有降低或有限的紫外线防护有益效果。一般来讲,将液体防晒剂溶于硅油中,比将固体防晒剂溶于硅油中要更加容易。为了获得广谱紫外线防护,通常需要使用 UV-A 阻隔防晒剂和 UV-B 阻隔防晒剂的组合。虽然有效的 UV-B 阻隔防晒剂能够以液体和固体的形式获得,但是目前允许使用的几乎所有最有效的 UV-A 阻隔防晒剂均仅以固体形式获得。极性油溶剂可用于辅助溶解固体 UV-A 阻隔防晒剂,但是加入到组合物中的溶剂越多,组合物感觉越油腻、厚重和令人不悦。需要在不加入更多溶剂的情况下改善固体 UV-A 阻隔防晒剂在硅油中的溶解度,以便即使在高浓度或高温下,固体防晒剂也不会从油相中分离出来。此外,需要提供具有舒适皮肤感觉和充分紫外线阻隔作用的防晒剂组合物。

[0005] 发明概述

[0006] 将更多的固体防晒剂加入到油包水乳液的油相中,看上去将使得溶解度更加难以达到。但是令人惊奇地发现,当将更多的固体防晒剂加入到油相中时,溶解度得到改善。实际上,两种类型的固体防晒剂比仅仅一种类型的固体防晒剂能更好地溶于硅油中。例如,在包含两种固体防晒剂羟甲氧二苯酮和阿伏苯宗的组合物中,已发现,当增加羟甲氧二苯酮的量时,阿伏苯宗趋于越来越少地从硅油中沉淀出来。由于这些意料不到的知识,在组合物中可使用更多的羟甲氧二苯酮来替代防晒剂溶剂。该方法可提供较高的 UV-A 功效,并且具有更好的皮肤感觉,而没有结晶问题。

[0007] 在一个实施方案中,个人护理组合物为油包水乳液形式,包含至少约 10% 的非极性硅油、约 0.01% 至约 10% 的第一油溶性固体防晒剂和约 0.01% 至约 10% 的第二油溶性固体防晒剂。在该实施方案中,第一油溶性固体防晒剂与第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 0.8 至约 2.0,并且第一油溶性固体防晒剂为羟甲氧二苯酮。

[0008] 在另一个实施方案中,个人护理组合物为油包水乳液形式,包含至少约 10% 的非

极性硅油、约 0.1% 至约 10% 的羟甲氧二苯酮和约 0.1% 至约 10% 的阿伏苯宗。在该实施方案中,羟甲氧二苯酮与阿伏苯宗的重量比为约 0.8 至约 2.0。

[0009] 在另一个实施方案中,个人护理组合物为油包水乳液形式,包含至少约 10% 的非极性硅油、约 1% 至约 6% 的羟甲氧二苯酮、约 1% 至约 5% 的阿伏苯宗、和护肤活性物质,所述护肤活性物质选自由下列组成的组:维生素 B₃ 化合物、糖胺、肽、去氧苯比妥化合物、以及它们的组合。在该实施方案中,羟甲氧二苯酮与阿伏苯宗的重量比为约 1.0 至约 1.5。

[0010] 在另一个实施方案中,本发明涉及一种改善第二油溶性固体防晒剂在油包水乳液的油相中的溶解度的方法,所述方法包括使第一油溶性防晒剂与第二油溶性防晒剂混合的步骤。在该实施方案中,第一油溶性固体防晒剂与第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 1.0 至约 1.5,并且第一油溶性固体防晒剂为羟甲氧二苯酮。

[0011] 在另一个实施方案中,个人护理组合物包含至少约 10% 的非极性硅油、约 0.01% 至约 10% 的第一油溶性固体防晒剂和约 0.01% 至约 10% 的第二油溶性固体防晒剂。在该实施方案中,第一油溶性固体防晒剂与第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 0.8 至约 2.0。

[0012] 在另一个实施方案中,个人护理组合物为油包水乳液形式,包含至少约 10% 的非极性硅油、约 0.01% 至约 10% 的第一油溶性固体防晒剂和约 0.01% 至约 10% 的第二油溶性固体防晒剂。在该实施方案中,第一油溶性固体防晒剂与第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 0.8 至约 2.0。

[0013] 附图简述

[0014] 虽然本说明书通过特别指出并清楚地要求保护本发明的权利要求书要求作出结论,但据信结合附图阅读以下说明可更好地理解本发明,其中:

[0015] 图 1 为溶解度研究 A 结果的图示。

[0016] 图 2 为溶解度研究 B 结果的图示。

[0017] 发明详述

[0018] 除非另外指明,所有百分比均按所述个人护理组合物的重量计。除非另外特别说明,所有比率均为重量比率。有效位数的数字既不限指示的量也不限制测量精度。所有测量均被理解为是在约 25°C 和环境条件下进行的,其中“环境条件”是指在约一个大气压和约 50% 相对湿度下的条件。所有范围是包括端值在内的并且是可组合的;因此,在本说明书全文中给出的每个范围将包括包含在该较宽范围内的每个较窄范围,就像此类较窄范围在本文中均被明确地写出一样。

[0019] 如本文所用,“个人护理组合物”是指适于局部施用到哺乳动物角质组织上的组合物。本发明的组合物可用于护肤品、化妆品和毛发护理产品中;其非限制性用途包括止汗剂、除臭剂、洗剂(例如润手乳液和爽身水)、护肤产品(例如脸部和颈部洗剂、乳浆、喷剂)、防晒美黑剂、化妆品(例如粉底、遮瑕物、腮红、唇膏、润唇膏)、脱毛剂、洗发剂、调理洗发剂、毛发调理剂、毛发染料、沐浴露、保湿沐浴露、沐浴凝胶、皮肤清洁剂、清洁乳、洗发沐浴剂、沐浴保湿剂、宠物香波、剃刮制剂、须后水、剃须保湿/润滑条、剃刮凝胶棒、条皂、清洁产品、女性护理产品、口腔护理产品、和婴儿护理产品。

[0020] 如本文所用的“角质组织”是指作为哺乳动物的最外层保护覆盖物而设置的含角蛋白的层,其包括但不限于皮肤、毛发和指/趾甲。

[0021] 如本文所用的“可溶解的”和“溶解性”是指组合物在 -7 摄氏度至 25 摄氏度范围

内的温度下储存至多一个月时不发生组分沉淀或结晶。

[0022] 如本文所用的“衍生物”是指相关化合物的酯、醚、酰胺和 / 或盐衍生物。

[0023] 如本文用于描述油的“极性”是指具有大于或等于 $7.4(\text{卡路里}/\text{cm}^3)^{0.5}$ 至约 $11(\text{卡路里}/\text{cm}^3)^{0.5}$ 溶解度参数的物质。如本文所用的“非极性”是指具有小于 $7.4(\text{卡路里}/\text{cm}^3)^{0.5}$ 溶解度参数的物质。溶解度参数更详细地描述于 C. D. Vaughan 的“The Solubility Parameter: What is it?” (Cosmetics & Toiletries, 第 106 卷, 1991 年 11 月, 第 69-72 页) 中。溶解度参数可根据 Barton, AFM(1991) 的“Handbook of Solubility Parameters and Other Cohesion Parameters”第 2 版 (CRC Press) 中所论述的方法来测定或计算。

[0024] I. 个人护理组合物

[0025] 在一个实施方案中, 本发明的个人护理组合物为油包水乳液。在某些实施方案中, 所述个人护理组合物可具有约 5,000cps (厘泊) 至约 1,000,000cps、或约 10,000cps 至约 500,000cps、或约 15,000cps 至约 200,000cps 的粘度。

[0026] 在一个实施方案中, 所述个人护理组合物包含至少约 5% 的水相。在某些实施方案中, 所述个人护理组合物可包含按所述组合物的重量计约 10% 至约 80%、或约 10% 至约 60% 的水相。在所述乳液中, 水相可为内相或不连续相。

[0027] 所述水相通常包含水。在一个实施方案中, 水相可仅包含水。在其它实施方案中, 水相可包含不是水的组分 (即非水组分), 其包括但不限于水溶性保湿剂、调理剂、盐、抗微生物剂、湿润剂和 / 或其它水溶性护肤活性物质, 以向角质组织赋予增强的有益效果。在一个实施方案中, 所述个人护理组合物的水相包含湿润剂如甘油和 / 或其它多元醇。水相可基本上不含水至完全不含水。

[0028] 在一个实施方案中, 所述个人护理组合物包含至少约 15% 的油相。在某些实施方案中, 所述个人护理组合物包含按所述组合物的重量计约 20% 至约 90%、或约 40% 至约 80% 的油相。在所述乳液中, 油相可为外相或连续相。

[0029] 所述油相可包含硅油、如烃油、酯、醚等非硅油、以及它们的混合物。在一个优选的实施方案中, 油相包含硅油。

[0030] A. 非极性硅油

[0031] 所述个人护理组合物可包含非极性硅油。在某些实施方案中, 非极性硅油可具有小于 $7.4(\text{卡路里}/\text{cm}^3)^{0.5}$ 的溶解度参数。在某些实施方案中, 个人护理组合物可包含按所述组合物的重量计至少约 10%、或至少约 20%、或至少约 30%、或至少约 40% 的非极性硅油。

[0032] 适宜非极性硅油的非限制性实例包括直链和环状的聚二甲基硅氧烷, 包括环甲基硅氧烷 (环四硅氧烷、环戊硅氧烷、环己硅氧烷)、聚二甲基硅氧烷、以及它们的混合物。这些类型硅氧烷的可商购获得的实例包括 Dow Corning 200 系列、Dow Corning 344、和 Dow Corning 345 (均得自 Dow Corning™ Corp.); 以及 SF1202、SF1204、和 Viscasil™ 系列 (均得自 G. E. Silicones™)。附加的非极性硅油包括烷基 (例如 2 个碳至 30 个碳) 和芳基 (例如苯基或苯乙烯基) 取代的硅氧烷, 包括但不限于苯基聚甲基硅氧烷、苯基聚二甲基硅氧烷、苯基聚三甲基硅氧烷、二苯基聚二甲基硅氧烷、苯乙基聚二甲基硅氧烷、己基聚二甲基硅氧烷、月桂基聚二甲基硅氧烷、鲸蜡基聚二甲基硅氧烷、硬脂基聚二甲基硅氧烷、二硬脂基聚二甲基硅氧烷、以及它们的混合物。在一个实施方案中, 非极性硅油是低粘度的, 这是指

粘度小于 50cst。

[0033] B. 油溶性固体防晒剂

[0034] 所述个人护理组合物可包含至少两种油溶性固体防晒剂。如本文所用的“油溶性固体防晒剂”是指如下的防晒剂,可商购获得的纯化形式的所述防晒剂为有可能溶解于极性油中的晶体和/或固体化合物。在一个实施方案中,所述油溶性固体防晒剂可具有约 $7.4(\text{卡路里}/\text{cm}^3)^{0.5}$ 至约 $11(\text{卡路里}/\text{cm}^3)^{0.5}$ 的溶解度参数。为了提供最大的紫外线防护作用,所述油溶性固体防晒剂优选在最终个人护理组合物中为基本上溶解的 - 并因此不保持固体形式。

[0035] 适宜的油溶性固体防晒剂包括但不限于阿伏苯宗(丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷;可以商品名 Parsol 1789 从 DSM Nutritional Products, Inc. 商购获得)、羟甲氧二苯酮(二苯甲酮-3;可以商品名 Neo Heliopan BB 从 Symrise 商购获得)、和双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪(双-乙基己氧苯酚甲氧苯基三嗪;可以商品名 Tinosorb S 从 Ciba Corp. 商购获得)、二乙氨基羟苯甲酰基己基苯甲酸酯(可以商品名 Uvinul A Plus 从 BASF 商购获得)、乙基己基三嗪酮(可以商品名 Uvinul T150 从 BASF 商购获得)、4-甲基亚苄基樟脑(可以商品名 Parsol 5000 从 DSM Nutritional Products, Inc. 商购获得)、以及它们的衍生物和混合物。适宜油溶性固体防晒剂的其它非限制性实例公开于 The Cosmetic, Toiletry, and Fragrance Association 的“The International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook”第 10 版(Gottschalck, T.E. 和 McEwen, Jr. 编辑(2004))第 2267 页和第 2292-93 页。

[0036] 在某些实施方案中,所述个人护理组合物包含按所述组合物的重量计约 0.1% 至约 10%、或约 1% 至约 6%、或约 1.5% 至约 4% 的第一油溶性固体防晒剂。在特定实施方案中,所述第一油溶性固体防晒剂为 UV-B 阻隔防晒剂。在其它实施方案中,所述第一油溶性固体防晒剂为 UV-A 阻隔防晒剂。示例性第一油溶性固体防晒剂为羟甲氧二苯酮。在某些实施方案中,所述个人护理组合物包含按所述组合物的重量计约 0.1% 至约 10%、或约 1% 至约 5%、或约 1.5% 至约 3% 的第二油溶性固体防晒剂。在特定实施方案中,所述第二油溶性固体防晒剂为 UV-A 阻隔防晒剂。示例性第二油溶性固体防晒剂为阿伏苯宗。

[0037] 令人惊奇地发现,在特定的第一油溶性固体防晒剂与第二油溶性固体防晒剂的重量比内,加入所述第一油溶性固体防晒剂会改善第二油溶性固体防晒剂的溶解度。据信这与溶解度领域所知的(加入更多的固体防晒剂似乎将使溶解度变差)背道而驰。实际上,如果第一油溶性固体防晒剂与第二油溶性固体防晒剂的重量比在特定重量比之外,则第二油溶性固体防晒剂将沉淀出来或结晶。在某些实施方案中,第一油溶性固体防晒剂与第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 0.8 至约 2.0、或约 1.0 至约 1.5、或约 1.2 至约 1.4。

[0038] C. 极性油

[0039] 所述个人护理组合物可包含极性油。在某些实施方案中,所述组合物可包含按所述组合物的重量计大于约 2%、或大于约 5%、或大于约 10% 的极性油。在一些实施方案中,所述极性油可具有约 $7.4(\text{卡路里}/\text{cm}^3)^{0.5}$ 至约 $11(\text{卡路里}/\text{cm}^3)^{0.5}$ 的溶解度参数。

[0040] 合适的极性油包括醚、酯、酰胺、丙氧基化物、以及它们的混合物。上述油可以是饱和的、不饱和的、脂族的(直链或支链的)、脂环族的、或芳族的。

[0041] 适宜的非防晒剂类极性油包括但不限于丁基邻苯二甲酰亚胺和异丙基邻苯二甲

酰亚胺 (Pelemol™ BIP)、苯甲酸苯乙酯 (X-tend™ 226)、碳酸二辛酯 (Tegosoft™ DEC)、月桂酰肌氨酸异丙酯 (Eldew™ SL 205)、辛基水杨酸丁酯 (Hallbrite™ BHB)、苹果酸二辛酯、马来酸二辛酯 (Hallbrite™ DCM)、己二酸二异丙酯、己二酸二丁酯 (Cetiol B)、异壬酸异壬酯、异硬脂酸异丙酯、二癸酸丙二醇酯、苯甲酸 C12-15 醇酯 (Finsolv TN)、PPG-11 硬脂基醚、以及它们的衍生物和混合物。在某些实施方案中,所述组合物可包含按所述组合物的重量计不超过约 10%、或不超过约 5%、或不超过约 2% 的非防晒剂类极性油。

[0042] 适宜的防晒剂类极性油包括但不限于甲氧基肉桂酸乙基己酯 (奥西诺酯)、水杨酸乙基己酯 (水杨酸辛酯)、氰双苯丙烯酸辛酯、胡莫柳酯、邻氨基苯甲酸薄荷酯 (美拉地酯)、以及它们的混合物。为被认为是极性油,防晒剂应为液体形式。在一个实施方案中,所述组合物包含一种以上的防晒剂极性油。

[0043] D. 非乳化性硅氧烷弹性体

[0044] 个人护理组合物可包含非乳化性硅氧烷弹性体。“非乳化性硅氧烷弹性体”是指硅氧烷弹性体不包含聚氧化烯基团。这些非乳化性硅氧烷弹性体通常以溶胀于非极性硅油中和 / 或与非极性硅油共混的形式提供。

[0045] 适宜的非乳化性硅氧烷弹性体包括 CTFA (Cosmetic, Toiletry, and Fragrance Association International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook, 第 11 版) 命名的聚二甲基硅氧烷 / 乙烯基聚二甲基硅氧烷交联聚合物,如由 General Electric™ (SFE 839) 和 Shin Etsu™ (KSG 15 和 16) 所提供的;和聚二甲基硅氧烷 / 苯基乙烯基聚二甲基硅氧烷交联聚合物,如得自 Shin Etsu™ 的 KSG 18。其它示例性的硅氧烷弹性体包括 CTFA 命名的聚二甲基硅氧烷交联聚合物,包括 Dow Corning™ (DC 9040、DC 9041、DC 9045)。

[0046] E. 乳化剂

[0047] 所述个人护理组合物可包含一种或多种乳化剂,所述乳化剂可以是直链的、支链的、和 / 或交联的。在某些实施方案中,所述个人护理组合物可包含按所述组合物的重量计约 0.05% 至约 20%、或约 0.1% 至约 10% 的总乳化剂。乳化剂的非限制性实例公开于美国专利 3,755,560、美国专利 4,421,769、和 McCutcheon 的“Detergents and Emulsifiers”北美版和国际版第 235-246 页 (1993) 中。

[0048] 乳化剂可包括乳化性硅氧烷弹性体。合适的乳化性硅氧烷弹性体包括具有至少一个聚烷基醚或聚甘油酯化单元的交联的有机聚硅氧烷弹性体。还可将这些交联的弹性体共改性以包含烷基取代基。尤其可用的乳化性聚氧乙烯交联弹性体包括 Shin Etsu 的 KSG-21、KSG-210、KSG-24、KSG-240、KSG-31、KSG-310、KSG-32、KSG-320、KSG-33、KSG-330、KSG-34、和 KSG-340。

[0049] 直链或支链型的硅氧烷乳化剂在该应用中也是有用的。尤其可用的聚醚改性的弹性体包括 Shin Etsu 的 KF-6011、KF-6012、KF-6013、KF-6015、KF-6016、KF-6017、KF-6043、KF-6028 和 KF-6038。

[0050] F. 任选成分

[0051] 1. 颗粒物质

[0052] 在特定实施方案中,所述个人护理组合物包含按所述组合物的重量计约 0.1% 至约 40%、或约 1% 至约 30%、或约 5% 至约 20% 的一种或多种颗粒物质。适宜粉末的非限制

性实例包括无机粉末（例如氧化铁、二氧化钛、氧化锌、二氧化硅）、有机粉末、复合粉末、光学增白剂颗粒、以及上述任何的混合物。这些颗粒可以是例如片状的、球状的、细长的或针状的、或不规则形状的；表面被涂覆或未被涂覆的；多孔或无孔的；带电荷或不带电荷的；并且可作为粉末或预分散体被加入到本发明组合中。在一个实施方案中，所述颗粒物质被疏水性地涂覆。

[0053] 适宜的有机粉末颗粒物质包括但不限于选自以下的聚合物颗粒：甲基倍半硅氧烷树脂微球体，例如 Tospearl™ 145A (Toshiba Silicone)；聚甲基丙烯酸甲酯微球体，例如 Micropearl™ M 100 (Seppic)；交联聚二甲基硅氧烷的球状颗粒，例如 Trefil™ E 506C 或 Trefil™ E 505C (Dow Corning Toray Silicone)；聚酰胺球状颗粒，例如尼龙-12 和 Orgasol™ 2002D Nat C05 (Atochem)；聚苯乙烯微球体，例如以名称 Dynospheres™ 出售的 Dyno Particles，和以名称 FloBead™ EA209 出售的乙烯-丙烯酸酯共聚物 (Kobo)；淀粉辛烯基琥珀酸铝，例如 Dry Flo™ (National Starch)；聚乙烯颗粒，例如 Microthene™ FN510-00 (Equistar) 和 **Micropoly**® 220L (Micro Powders, Inc.)；聚丙烯微球体，例如 Mattewax™ 511 (Micro Powders, Inc.)；硅氧烷树脂；由 L-月桂酰赖氨酸制得的片状粉末；以及它们的混合物。

[0054] 在一个实施方案中，所述组合物包含干涉颜料，所述干涉颜料包括疏水改性的干涉颜料在内。本文中的“干涉颜料”是指具有可调厚度的两层或更多层的薄板层状颗粒。所述层具有可产生特征性反射色的不同折射指数，所述特征性反射色由典型两种但有时多种光反射的干涉作用而产生，所述光反射来自板状颗粒的不同层。干涉颜料的一个实例是具有约 50-300nm 的 TiO₂、Fe₂O₃、二氧化硅、氧化锡、和 / 或 Cr₂O₃ 薄膜层的云母，并且包括珠光颜料。干涉颜料可从众多供应商处商购获得，例如 Rona (Timiron™ 和 Dichrona™)、Presperse (Flonac™)、Englehard (Duochrome™)、Kobo (Interfine、Interval、SK-45-R、和 SK-45-G)、BASF (Sicopearls™) 和 Eckart (Prestige™)。在一个实施方案中，干涉颜料中单独颗粒的最长侧面的平均直径小于约 75 微米，可供选择地小于约 50 微米。

[0055] 颗粒还可包括着色剂。适宜着色剂的非限制性实例包括氧化铁、氰亚铁酸铵铁、锰紫、群青蓝、和氧化铬、酞菁蓝和酞菁绿颜料、胶囊包封染料、无机白色颜料（例如 TiO₂、ZnO 或 ZrO₂）、以及它们的混合物。

[0056] 2. 不溶性防晒剂

[0057] 在一个实施方案中，所述个人护理组合物包含按所述组合物的重量计约 0.001% 至约 10%、或约 0.1% 至约 5% 的不溶性防晒剂。适宜的不溶性防晒剂的非限制性实例包括亚甲基-双-苯并三唑基四甲基丁基苯酚 (Tinosorb M)、二氧化钛、氧化铈、氧化锌、以及它们的衍生物和混合物。

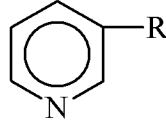
[0058] 3. 护肤活性物质

[0059] 所述个人护理组合物的某些实施方案包含一种或多种护肤活性物质。适宜的护肤活性物质包括但不限于维生素、肽、糖胺、控油剂、美黑活性物质、抗痤疮活性物质、脱屑活性物质、抗蜂窝炎活性物质、螯合剂、亮肤剂、类黄酮、蛋白酶抑制剂、非维生素类抗氧化剂和自由基清除剂、毛发生长调节剂、抗皱纹活性物质、抗萎缩活性物质、矿物质、植物甾醇和 / 或植物激素、酪氨酸酶抑制剂、抗炎剂、N-酰基氨基酸化合物、抗微生物剂和抗真菌剂。美国专利申请公布号 US2006/0275237A1、US2004/0175347A1 和 US2006/0263309A1 中更详细

地提供了这些护肤活性物质以及其它物质。

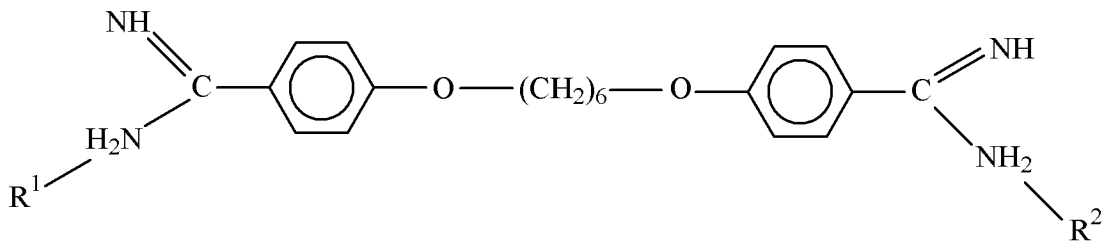
[0060] 尤其适宜的护肤活性物质包括维生素 B₃ 化合物、糖胺、肽、去氧苯比妥化合物、以及它们的组合。如本文所用的“维生素 B₃ 化合物”是指具有下式的化合物：

[0061]



[0062] 其中 R 为 $-\text{CONH}_2$ (即烟酰胺)、 $-\text{COOH}$ (即烟酸) 或 $-\text{CH}_2\text{OH}$ (即烟醇) ; 其衍生物 ; 和任何前述化合物的盐。如本文所用的“糖胺”包括此类物质的异构体和互变异构体, 以及它的盐 (例如 HCl 盐) 和它的衍生物。糖胺的实例包括葡糖胺、N-乙酰基葡糖胺、甘露糖胺、N-乙酰基甘露糖胺、半乳糖胺、N-乙酰基半乳糖胺、它们的异构体 (例如立体异构体)、和它们的盐 (例如 HCl 盐)。如本文所用的“肽”是指包含十个或更少氨基酸的肽和它们的衍生物、异构体、以及与其它物质如金属离子 (例如, 铜、锌、锰、镁等) 的络合物。如本文所用的“去氧苯比妥化合物”是指具有下式的化合物以及它的盐和衍生物：

[0063]



[0064] 其中 R^1 和 R^2 是任选的或为有机酸 (例如磺酸等)。

[0065] 其它适宜的护肤活性物质包括白茶提取物、绿茶提取物、人参、以及其它天然或植物性化合物。

[0066] 4. 附加任选成分

[0067] 在特定实施方案中, 本发明的组合物可包含多种附加成分。CTFA (Cosmetic, Toiletry, and Fragrance Association International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook, 第 11 版) 描述了多种通常用于皮肤护理行业的、适用于本发明中的非限制性化妆品和药物成分。示例性功能类别包括但不限于研磨剂、吸收剂、美观组分 (如芳香剂、颜料、染色 / 着色剂、精油、皮肤增感剂、收敛剂等 (例如丁香油、薄荷醇、樟脑、桉树油、丁子香酚、乳酸薄荷酯、金缕梅馏出液))、抗痤疮剂、抗结块剂、消泡剂、抗微生物剂、抗氧化剂、基料、生物添加剂、缓冲剂、增量剂、螯合剂、化学添加剂、着色剂、美容收敛剂、化妆品杀虫剂、变性剂、药物收敛剂、润肤剂、外部镇痛剂、成膜剂或物质、乳浊剂、pH 调节剂、推进剂、还原剂、多价螯合剂、皮肤漂白和亮白剂、皮肤调理剂 (例如, 湿润剂, 包括各种湿润剂和吸留剂)、皮肤抚慰和 / 或康复剂 (例如, 泛醇及其衍生物 (如乙基泛醇)、芦荟、泛酸及其衍生物、尿囊素、红没药醇和甘草酸二钾盐)、皮肤处理剂、增稠剂和维生素及其衍生物。在一个实施方案中, 本发明的组合物可包含非极性烃油。适宜的非极性烃油

的非限制性实例包括矿物油和支链烃（例如 Permethyl™ (Permethyl Corporation™) 和 Isopar™ (Exxon™)）。

[0068] II. 方法

[0069] 本发明还涉及一种改善油溶性固体防晒剂在油包水乳液的油相中的溶解度的方法。在一个实施方案中,通过将第一油溶性防晒剂和第二油溶性防晒剂混合来改善第二油溶性固体防晒剂在油包水乳液的油相中的溶解度,其中第一油溶性固体防晒剂与第二油溶性固体防晒剂的重量比为约 1.0 至约 1.5。在特定实施方案中,第一油溶性固体防晒剂为羟甲氧二苯酮,而第二油溶性固体防晒剂为阿伏苯宗。

[0070] 本发明还涉及通过将任何前述个人护理组合物施用到角质组织上来保护角质组织免受紫外线辐射的有害影响的方法。此类方法一般涉及减弱或降低到达角质组织的紫外线辐射的量。在某些实施方案中,本文所述的个人护理组合物适用作防晒剂,以对角质组织提供保护,避免紫外线辐射的有害影响,如晒斑、干燥或受损毛发、和皮肤过早老化。

[0071] 在另一个方面中,所述个人护理组合物可用于改善或调节角质组织的状况。待改善或调节的状况包括增加皮肤的亮度或“红光”,减少皱纹和粗糙的深纹、细纹、裂缝、肿块、以及粗大毛孔的出现;使角质组织增厚(例如构建皮肤的表皮和/或真皮和/或皮下层,以及指/趾甲和毛干的角质层(如果适用的话)以缓解皮肤、毛发或指/趾甲萎缩);增加真皮-表皮边缘的盘旋结构(也被称为网缘);防止例如由于功能性皮肤弹性蛋白的丧失、损伤和/或失活而造成皮肤或毛发弹性丧失,导致诸如弹性组织变性、松垂、皮肤或毛发变形回复功能的丧失等状况;减少脂肪团;改变皮肤、毛发或指/趾甲的着色,例如黑眼圈、疹斑(如由于例如红斑痤疮而造成的红色不均匀着色)、灰黄、由于毛细管扩张或蛛形血管而造成的变色、干燥、脆化和毛发泛灰。

[0072] III. 实施例

[0073] 以下描述所述个人护理组合物的非限制性实施例。所报道的百分比表示表达成个人护理组合物的总重量百分比的组分重量。每个实施例可包含如本文所公开的量的一种或多种任选成分。可如下制备实施例。

[0074] 在一个适宜的容器中,在温和搅拌下混合水相成分,并且加热至 90°C。在单独的容器中,在搅拌下混合防晒剂(例如水杨酸辛酯、胡莫柳酯、氰双苯丙烯酸辛酯、阿伏苯宗、羟甲氧二苯酮)、极性油(例如月桂酰肌氨酸异丙酯)和蜡(例如 Cirebelle 303、Accumelt 72、Accumelt 82、或 Accumelt 90),并且加热至 90°C。当两种溶液均是半透明的并且不含肉眼可见颗粒时,将热的水相倒入到防晒剂混合物中,然后立即将剩余的硅氧烷相成分加入到同一容器中。剧烈搅拌直至匀和并且均匀,同时保持产物温度高于蜡的熔点。将产物从热源上取下,并且在恒定搅拌下冷却至 33°C。频繁刮擦容器的侧面以确保产物被均匀剪切。将产物倒入合适的容器中。

[0075] 作为另外一种选择,可在冷却期间不进行剪切的情况下制得产物。在该情况下,从热源上取下后,立即将热乳液倒入到适宜的容器中,并且使其达到室温。

[0076]

成分	实施例 1	实施例 2	实施例 3	实施例 4	实施例 5
油相					

水杨酸辛酯	5.00	5.00	5.00	5.00	5.00
胡莫柳酯	3.50	10.00	10.00	10.00	10.00
氰双苯丙烯酸辛酯	1.30	1.30	1.70	2.60	2.60
阿伏苯宗	1.50	1.50	2.00	3.00	3.00
羟甲氧二苯酮	1.50	2.50	2.50	4.00	4.00
月桂酰肌氨酸异丙酯	3.00	3.00	---	2.00	4.00
Dow Corning™ 9045 ¹	适量	47.55	46.05	41.65	25.75
KSG-310 ²	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00
Tospearl™ 145A ³	16.00	6.00	6.00	6.00	6.00
Mattewax 511 ⁴	4.00	---	---	---	4.00
Micropoly 220L ⁵	---	4.00	4.00	4.00	---
Cab-O-Sil T720 ⁶	0.10	---	---	---	---
Dry Flow PC ⁷	1.00	---	---	---	---
Cirebelle 303 ⁸	5.00	---	---	---	---
Accumelt 72 ⁹	---	---	7.00	---	---
Accumelt 82 ⁹	---	---	---	5.00	---
Accumelt 90 ⁹	---	3.00	---	---	5.00
KF-6105 ¹⁰	---	0.50	0.50	0.50	0.50
KF-6038 ¹¹	0.50	---	---	---	---
香料	0.25	0.15	0.25	0.25	0.15
水相					
丙二醇	-	3.20	3.20	3.20	3.20
纯化水	-	适量	适量	适量	适量
甘油	-	2.00	2.00	2.00	2.00

白茶提取物 ¹²	-	1.00	1.00	1.00	1.00
人参 ¹³	-	0.50	0.50	0.50	0.50
烟酰胺	-	2.00	2.00	2.00	2.00
Palestrina ¹⁴	-	0.58	0.58	0.58	0.58
泛醇	-	0.20	0.22	0.22	0.25
二羟乙基磺酸己氧苯醚	-	0.10	0.10	0.10	0.10
乙二胺四乙酸二钠	-	0.01	0.01	0.01	0.01
总计	100.00	100.00	100.00	100.00	100.00

[0077] 1 聚二甲基硅氧烷交联聚合物 (约 12%) 和环戊硅氧烷 (约 88%), 得自 Dow Corning™ (Midland, MI)。

[0078] 2 PEG-15/ 月桂基聚二甲基硅氧烷交联聚合物和矿物油, 得自 Shin-Etsu™ (Newark, CA)。

[0079] 3 聚甲基倍半硅氧烷, 得自 Momentive™ Performance Materials, Inc. (Albany, NY)。

[0080] 4 聚丙烯, 得自 Micro Powders, Inc. (Tarrytown, NY)。

[0081] 5 聚乙烯, 得自 Micro Powders, Inc. (Tarrytown, NY)。

[0082] 6 热解法二氧化硅, 得自 Cabot Corp.。

[0083] 7 Dry-Flo PC, 得自 National Starch & Chemical Company (Bridgewater, NJ)。

[0084] 8 聚乙烯蜡, 得自 Arch Chemicals, Inc. (South Plainfield, NJ)。

[0085] 9 合成蜡, 得自 The International Group Inc. (Toronto, Ontario)。

[0086] 10 月桂基聚甘油基-3 聚二甲基甲硅烷氧基乙基聚二甲基硅氧烷, 得自 Shin-Etsu™ (Newark, CA)。

[0087] 11 月桂基 PEG-9 聚二甲基甲硅烷氧基乙基聚二甲基硅氧烷, 得自 Shin-Etsu™ (Newark, CA)。

[0088] 12 白茶提取物, 得自 Carrubba, Inc. (Milford, CT)。

[0089] 13 人参, 得自 Symrise (Teterboro, NJ)。

[0090] 14 抗衰老肽溶液, 得自 Sederma, Inc. (Edison, NJ)。

[0091] IV. 比较实施例

[0092] 下列两个溶解度研究展示了由受权利要求书保护的两种油性固体防晒剂的组合而得到的意料不到的溶解度改善。为进行这些溶解度研究, 通过在适宜的器皿中混合成分、在搅拌下加热至 90°C、并然后在搅拌下冷却至室温, 来形成油包水乳液中的油相。示于下表中的每个研究的油相组合物均由以下物质的组合组成: 非极性硅油、矿物油、液体防晒活性物质、油性固体防晒剂阿伏苯宗、和各种含量的极性油月桂酰肌氨酸异丙酯和油性固体防晒剂羟甲氧二苯酮。

材料类型	材料	重量份	
		研究 A	研究 B
非极性硅油	环戊硅氧烷	44.0	44.0
润肤剂	矿物油	2.1	2.1
液体防晒剂	胡莫柳酯	9.0	9.0
液体防晒剂	水杨酸辛酯	4.5	4.5
液体防晒剂	氰双苯丙烯酸辛酯	1.7	1.7
油溶性固体防晒剂	阿伏苯宗	2.0	3.0
油溶性固体防晒剂	羟甲氧二苯酮	0.0 – 5.0	0.0 – 5.0
极性油	月桂酰肌氨酸异丙酯	0.0 – 12.0	0.0 – 12.0

[0093] 当上述研究中的每个油相达到室温时,将它们填充到玻璃小瓶中并且储存于三个不同的条件下:室温(RT;约 22°C)、5°C和 -7°C。在储存约一个月后,使所有小瓶在室温下平衡,然后目视检查油溶性固体防晒剂的任何结晶或沉淀迹象。

[0094] 两个溶解度研究的结果示于图 1 和图 2 中,图 1 描述了溶解度研究 A 结果(2%阿伏苯宗),图 2 描述了溶解度研究 B 结果(3%阿伏苯宗)。x 轴 X 表示羟甲氧二苯酮%,即 0%至 5%的羟甲氧二苯酮。y 轴 Y 表示月桂酰肌氨酸异丙酯%,即 0%至 12%的月桂酰肌氨酸异丙酯。圆形数据图表示在所有测试条件(RT、5°C、和 -7°C)下均可溶。正方形数据图表示近似可溶(仅在 -7°C 下有一个或几个晶体)。三角形数据图表示在一个或多个测试条件下不可溶。图 1 和 2 示出当以介于 0.8 和 2.0 之间的羟甲氧二苯酮与阿伏苯宗比率加入羟甲氧二苯酮时,阿伏苯宗溶解度的意料不到的改善,并且在介于 1 和 1.5 之间的比率处获得最大溶解度。位于虚线上或高于虚线,阿伏苯宗完全溶解。在虚线之下,阿伏苯宗近似可溶或根本不溶。图 1 和 2 示出,当不存在羟甲氧二苯酮时,需要显著量的非防晒剂类极性油月桂酰肌氨酸异丙酯以保持阿伏苯宗可溶于油相中。具体地讲,图 1 示出,当不存在羟甲氧二苯酮时,需要大于约 4%的月桂酰肌氨酸异丙酯以保持阿伏苯宗可溶于油相中;图 2 示出,当不存在羟甲氧二苯酮时,需要大于约 10%的月桂酰肌氨酸异丙酯以保持阿伏苯宗可溶于油相中。然而,当加入低含量的油溶性固体防晒剂羟甲氧二苯酮时,需要较少的极性油以保持防晒剂可溶。最后,由于加入甚至更高含量的羟甲氧二苯酮,防晒剂的溶解度再次变得较差。所述图展示了在第一油溶性固体防晒剂羟甲氧二苯酮与第二油溶性固体防晒剂阿伏苯宗的指定重量比范围内的意料不到的溶解度有益效果。令人惊奇的是,加入较多的第一油溶性固体防晒剂会改善第二油溶性固体防晒剂的溶解度。

[0095] 不应将本文所公开的量纲和值理解为对所引用精确值的严格限制。相反,除非另外指明,每个这样的量纲旨在表示所引用的值和围绕该值功能上等同的范围。例如,所公开的量纲“40mm”旨在表示“约 40mm”。

[0096] 除非明确排除或换句话讲有所限制,本文中引用的每一个文件,包括任何交叉引用或相关专利或专利申请,均据此以引用方式全文并入本文。对任何文献的引用均不是承认其为本文公开的或受权利要求书保护的发明的现有技术、或承认其独立地或以与任何其它一个或多个参考文献的任何组合的方式提出、建议或公开任何此类发明。此外,如果此文献中术语的任何含义或定义与任何以引用方式并入本文的文献中相同术语的任何含义或定义相冲突,将以此文献中赋予那个术语的含义或定义为准。

[0098] 尽管举例说明和描述了本发明的特定实施方案,但是对那些本领域的技术人员显而易见的是,在不背离本发明的实质和范围的情况下可作出许多其它的改变和变型。因此,所附权利要求旨在涵盖处于本发明范围内的所有这些改变和变型。

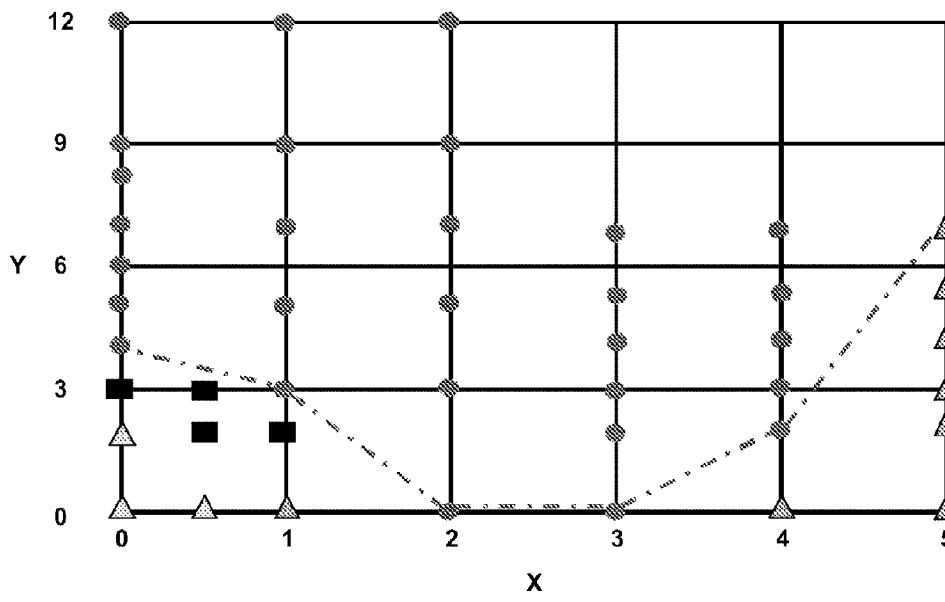


图 1

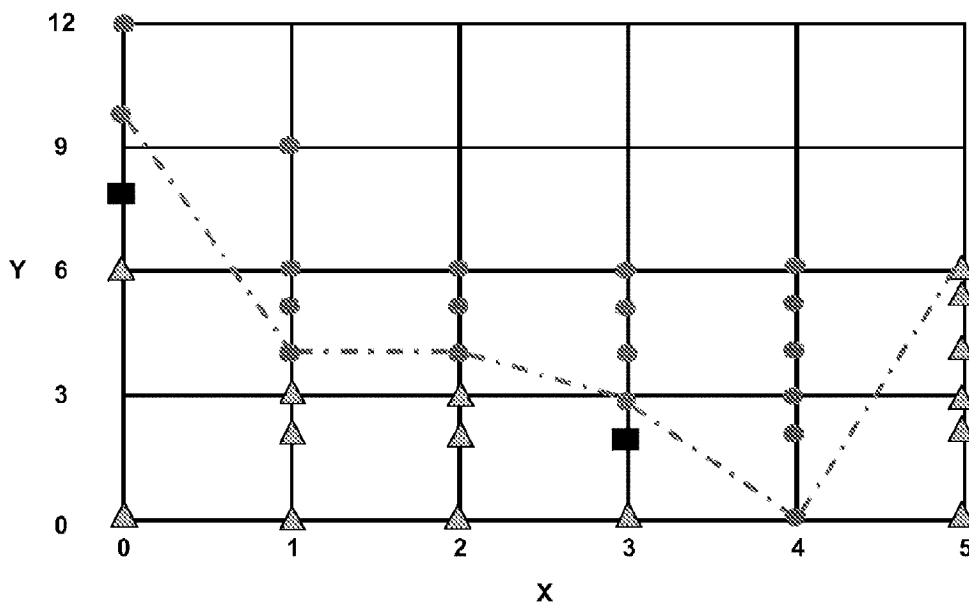


图 2