

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷
A61K 7/48
A61K 35/84
A61K 7/42



[12] 发 明 专 利 说 明 书

专利号 ZL 01816953.8

[45] 授权公告日 2005 年 7 月 20 日

[11] 授权公告号 CN 1211068C

[22] 申请日 2001.10.5 [21] 申请号 01816953.8
[30] 优先权
[32] 2000.10.13 [33] DE [31] 10053051.6
[86] 国际申请 PCT/DE2001/003871 2001.10.5
[87] 国际公布 WO2002/030384 德 2002.4.18
[85] 进入国家阶段日期 2003.4.7
[71] 专利权人 科蒂股份有限公司
地址 荷兰哈勒姆
[72] 发明人 卡琳·戈兹－贝尔纳
莱昂哈德·察斯特罗
审查员 张志聪

[74] 专利代理机构 中原信达知识产权代理有限责
任公司
代理人 丁业平 王维玉

权利要求书 2 页 说明书 10 页

[54] 发明名称 含有植物提取物的化妆品制剂
[57] 摘要

本发明涉及一种含有由植物提取物组成的活性复合物的化妆品制剂。所述活性复合物含有至少一种起始物质，其作为水提取物从真松露(块菌科)中提取，并且在化妆品可接受的凝胶中提供并同时被稳定化。优选所述活性复合物还含有香槟产品。含有这种活性复合物的化妆品制剂能改善对免疫系统的刺激、改善再生效果，并且因而改善皮肤生态系的平衡。

I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

1. 一种含有植物提取物的化妆品制剂，该制剂含有活性复合物，
所述活性复合物由至少一种作为水提物从真松露即块菌科提取的基础
5 物质以及喷雾干燥的香槟组成，其中的活性复合物在化妆品可接受的
凝胶中提供并同时被稳定化。

2. 权利要求 1 的制剂，其中块菌科选自钩块菌 (*Tuber*
uncinatum)、黑孢块菌(*Tuber melanosporum* Vitt.)、巨大块菌(*Tuber*
10 *magnatum* Pico Vitt.)、夏眠块菌 (*Tuber aestivum*)、白色松露
(*Choiromyces maeandriiformis*)、冬眠块菌(*Tuber brumale* Vitt.)以及
其混合物。

3. 权利要求 1 的制剂，其中活性复合物中所含的块菌科提取物
15 和香槟产品的比例相对于试剂的干重为 25: 75-75: 25。

4. 权利要求 1-3 任一项的制剂，其中在凝胶中提供同时被稳定化
的活性复合物的含量相对于该制剂总组成为 0.05-25 重量%，块菌科
提取物和香槟的量总计占所述活性复合物的 1-15 重量%。

20 5. 权利要求 1 的制剂，其中稳定剂含有磷脂。

6. 权利要求 1 的制剂，其中凝胶选自卡波姆、黄原胶、角叉菜
胶、阿拉伯胶、瓜尔胶、琼脂、海藻酸盐、羧甲基纤维素、羟乙基纤
25 维素及其混合物。

7. 权利要求 1-3、5、6 任一项的制剂，其中活性复合物还含有至
少一种防紫外线辐射的保护剂。

30 8. 权利要求 4 的制剂，其中活性复合物还含有至少一种防紫外

线辐射的保护剂。

5

9. 权利要求 7 的制剂，其中以霜；润肤液；妆饰品；眼用化妆品；洗发香波；淋浴凝胶的形式提供所述制剂。

10. 权利要求 9 的制剂，其中所述的霜选自日霜、晚霜、防晒霜。

11. 权利要求 9 的制剂，其中所述的眼用化妆品选自特效眼霜、眼影。

10

12. 制备含植物提取物的化妆品制剂的方法，该方法包括以下步骤：

- 15
- a) 将块菌科菌片与水混合 1.5-12 小时，
 - b) 使混合物浸泡 0.5-12 小时，
 - c) 分离水相、移取其液态组分并杀菌，
 - d) 在转速为至少 10000rpm 下将杀菌过的粉末和喷雾干燥的香
槟分散在磷脂水溶液中，
 - e) 将悬浮液以均匀方式分布到化妆品可接受的凝胶中，并将其
中和，
 - 20 f) 使凝胶与其它化妆品助剂、载体物质或活性剂或其混合物接
触，并配成化妆品制剂。

含有植物提取物的化妆品制剂

5 本发明涉及含有由植物提取物组成的活性复合物的化妆品制剂。

对于大量含有植物或植物部分的化妆品已有描述，所述植物或植物部分被直接或以提取物的形式加入前述产品中。这些植物包括，例如藻类，各种被称为药用植物的药草，谷类，茶、咖啡和水果的提取物，树皮提取物以及酵母提取物等。使用这些植物是为了将它们的活性剂用于化妆目的，特别是为了使前述试剂在皮肤表层变得有效。至今，除了前述酵母提取物外几乎没有任何真菌提取物被用于此目的，这主要是因为在该领域还没有发现什么物质对皮肤有作用。

15 从 EP 279392 已知，在化妆品组合物中使用约 50-60 重量%的液态香槟，任选与动物源细胞提取物一起使用。在 JP 06-40933A（摘要）中描述了使用松露提取物。

20 本发明的目的是获得用于化妆的其它植物基活性剂，特别是要将得自不同植物的不同活性剂组合成新的活性复合物。

根据本发明，提供了一种含有植物提取物的化妆品制剂，该制剂含有活性复合物，所述活性复合物由至少一种作为水提取物从真松露（common truffles）（块菌科，Tuberaceae）提取的起始物质组成，并且其在化妆品可接受的凝胶中提供，同时被稳定化。

真松露包括，例如伯根第松露（钩块菌（*Tuber uncinatum*））、贝利高松露（黑孢块菌（*Tuber melanosporum* Vitt.））、卡拉哈里松露（*Terfezia pfeilii* Hennings）、皮德蒙特松露（巨大块菌（*Tuber magnatum* Pico Vitt.））、非洲松露（Lion's truffles）（*Terfezia leonis* Tul.）、夏季松露（夏眠块菌（*Tuber aestivum*））、冬季松露（冬眠块菌（*Tuber brumale* Vitt.））以及白色松露（*Choiromyces macandriiformis*）。特别优选的松露种类是钩块菌、黑孢块菌、巨大块菌、夏眠块菌、白色松露、冬眠块菌以及其混合物，特别是黑孢块菌。

许多世纪以来，属于子囊菌类、块菌目的真松露作为优秀的食用真菌而受到欢迎，其因具有特殊的香气而具有突出的重要性。松露是地下真菌，与橡树根共生，形成块状的果实体。

5

从松露提取过程中，释放出数种活性剂。已经发现，由于化妆品中的含水松露提取物含必需氨基酸、维生素 B1、B2 和 B3、多糖如香菇多糖(lerinan)和香菇嘌呤，并且由于化妆品中前述活性剂的稳定化，可能对免疫系统产生非特异性刺激并改善了身体的抗病毒防御机能。对皮肤而言，这产生了优越的再生效果，另外产生了防脱发效果。

10

通过结合香槟酒产品，例如将各液体组分通过例如喷雾干燥除去的香槟酒来制备特定的活性复合物。基于对法国香槟葡萄酒进行特定的瓶发酵，得到起沫的葡萄酒，其除了含类黄酮、前儿茶精（pro-cyanidolic）低聚物（P.C.O.）和丹宁酸，还含高含量的多糖。将前述

15

香槟酒产品加入含松露提取物的活性复合物中，能显著改善皮肤的生态系平衡，因而加强了皮肤的天然保护屏障，并激发了存在的传递质的活性，所述传递质即白细胞三烯、前列腺素、白细胞介素和其它细胞分裂素，特别是在对皮肤施加压力的情况下。

20

另外，所述活性复合物具有调色和激活效果，以及稳定化和软化效果，同时能抵消刺激。

25

活性复合物在凝胶中提供，同时被稳定化。例如，借助于磷脂达到稳定化效果，在磷脂中分散着所述活性复合物的粉末化的基本组分，即块菌科提取物和（如果需要的）香槟产品，然后该磷脂以均匀方式分布在凝胶中。由于前述在凝胶中的均匀分布，得到了所述活性复合物的形式，该形式一方面是稳定的所述活性剂的液体形式，另一方面为进一步将其加工成各种化妆品提供了优异的基础。

30

可以使用的磷脂包括，例如卵磷脂、磷脂酰乙醇胺、磷脂酰肌醇、磷脂酰丝氨酸、磷脂酸和溶血卵磷脂及其混合物。已知的产品是例如 Phoslipon®或 NAT®。

5 化妆品制剂中可含的所述活性复合物的量为 0.05-25 重量%，块菌科提取物和（如果需要的）香槟产品的量总计占所述活性复合物的 1-15 重量%。

10 对所述活性复合物所含的块菌科提取物和香槟产品的比例没有限制。优选，相对于试剂的干重，该比例为 25：75-75：25。

15 可以用作凝胶的成胶剂包括，例如卡波姆（Carbomer）、黄原胶、角叉菜胶、阿拉伯胶、瓜尔胶、琼脂、海藻酸盐和泰乐森(tylosen)、羧甲基纤维素、羟乙基纤维素、某些聚丙烯酸酯、聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮、蒙脱石。特别优选的物质是卡波姆、黄原胶、角叉菜胶、阿拉伯胶、瓜尔胶、琼脂、海藻酸、羧甲基纤维素、羟乙基纤维素及其混合物。

20 本发明的制剂还含有各种化妆品助剂和载体物质，如同它们通常用于这类制剂中一样，例如水、防腐剂、维生素、着色剂、具有着色效果的颜料、净化剂、增稠剂、润肤剂、保湿物质、香料、醇、多元醇、酯、虫胶、电解质、极性和非极性油、聚合物、共聚物、乳化剂、蜡、稳定剂。

25 所述化妆品组合物中所含的其它添加剂或活性剂可以是维生素，如维生素 A 或其衍生物；着色的植物提取物； β -胡萝卜素；有机的水溶性或油溶性防晒剂，如甲氧基桂皮酸辛酯；无机防晒剂，如 TiO_2 、 ZnO 、 SiO_2 。

30 有利地，所述制剂所含的其它活性剂可以是 WO96/17588 的高岭

土，该高岭土已用球形 TiO_2 或 SiO_2 颗粒改性，其粒径 $<5\mu\text{m}$ ，前述球形颗粒占所述高岭土混合物的 0.5-10 重量%。这样，该制剂令皮肤感到很柔软，另外还具有防发炎的效果。相对于制剂总重，含有的所述改性高岭土的量为 0.1-6 重量%。

5

其它化妆品活性剂包括，例如乳化剂、净化剂、保湿物质、酶、其它的植物基活性剂、聚合物、黑色素、抗氧化剂、防发炎的天然活性剂、WO94/00109 所述的负载了氧的不对称层状聚集体，或者利用 WO94/13783 所述的温和超声波分解法产生的酵母、海藻或其它植物性物质的分解产物。

10

可提供 O/W 乳液、W/O 乳液或凝胶形式的含本发明活性复合物的化妆品制剂。

15

用于 O/W 乳液的适合的乳化剂包括，例如 2-30 摩尔环氧乙烷与直链 $\text{C}_8\text{-C}_{22}$ 脂肪醇的加成物、与 $\text{C}_{12}\text{-C}_{22}$ 脂肪酸的加成物，以及与 $\text{C}_8\text{-C}_{15}$ 烷基酚的加成物；1-30 摩尔环氧乙烷与甘油的加成物的 $\text{C}_{12}\text{-C}_{22}$ 脂肪酸单酯和二酯。

20

用于 W/O 乳液的适合的乳化剂包括，例如 2-15 摩尔环氧乙烷与蓖麻油的加成物； $\text{C}_{12}\text{-C}_{22}$ 脂肪酸与甘油、多甘油、季戊四醇、糖醇（例如山梨糖醇）、多糖苷（例如纤维素）的酯；聚亚烷基二醇；羊毛蜡醇；聚硅氧烷和多烷基聚醚的共聚物。

25

适用于形成本发明的 O/W 乳液或 W/O 乳液的油相的油和脂包括，例如矿物油、脂肪酸甘油三酯、硅油，以及植物油，如金盏花油、西蒙得木油、鳄梨油、澳洲坚果油、蓖麻油、小麦胚芽油、巴巴苏仁油、葡萄籽油、夏威夷核油(Kukui Nut Oil)、蓟油、夜樱草油、红花油或其几种的混合物。

30

另外可以使用酯或醚，例如二季戊四醇六辛酸酯/六癸酸酯/十三烷醇偏苯三酸酯/十三烷醇硬脂酸酯/辛戊二醇二辛酸酯二癸酸酯，丙二醇二辛酸酯 5，丙二醇二辛酸酯 2，30 二癸酸酯，十三烷醇硬脂酸酯/辛戊二醇二辛酸酯二癸酸酯/十三烷醇偏苯三酸酯，辛戊二醇二辛酸酯，肉豆蔻酸异丙酯，二异丙基二聚二亚油酸酯，三甲基丙烷三异硬脂酸酯，肉豆蔻醚，硬脂醚，丁醚，二辛酰基醚，PPG1-PEG9 月桂酰二醇醚，PPG15 硬脂醚，PPG14 丁醚，Fomblin HC25。

使用的其它润肤剂包括以下化合物，如硬脂醇、单蓖麻油酸甘油酯、单硬脂酸甘油酯、丙-1,2-二醇、丁-1,3-二醇、鲸蜡醇、异硬脂酸异丙酯、硬脂酸、棕榈酸异丁酯、油醇、月桂酸异丙酯、油酸癸酯、十八烷-2-醇、异鲸蜡醇、棕榈酸鲸蜡酯、硅油如二甲基聚硅氧烷、肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、聚乙二醇、羊毛脂、椰子脂、植物油如玉米油、棉籽油、橄榄油、矿物油、肉豆蔻酸丁酯、棕榈酸等。

本发明的化妆品制剂可用于防晒霜、防晒凝胶、晒后产品、日霜、晚霜、保湿霜、面膜、润肤液、洗面奶、妆饰品（make-ups）、唇膏、睫毛油、润唇膏、爽身粉、眼用化妆品、发膜、护发素、洗发香波、美发乳、淋浴凝胶、皂、压型粉末。上述产品用本领域技术人员公知的方法制备。

根据本发明制备含植物提取物的化妆品制剂的方法包括以下步骤：

- a) 将块菌科菌片与水混合 1.5-12 小时，
- b) 使混合物浸泡 0.5-12 小时，
- c) 分离水相、移取其液态组分并杀菌，
- d) 在转速为至少 10000 至约 15000rpm 下将杀菌过的粉末分散在磷脂水溶液中，
- e) 将悬浮液以均匀方式分布到化妆品可接受的凝胶中，并进行中和，

f) 使凝胶与其它化妆品助剂、载体物质或活性剂或其混合物接触，并配成化妆品制剂。

5 提取物可通过过滤分离，并根据需要同时脱色（例如使用活性炭）。

在下文中通过实施例更详细地解释本发明。除非另有说明，所有量以重量%给出。

10 实施例 1-4

活性复合物的制备

a) 将 1 kg 的贝利高（Perigord）松露（黑孢块菌）切片，并在至少 1000rpm 下与 5 升水混合 5 小时。使溶液浸泡一夜，随后过滤。将澄清的滤液用到喷雾干燥器上，随后对获得的粉末杀菌。

15 b) 将 10 瓶白香槟喷雾干燥。随后对所得的白色粉末杀菌。

20 为了制备活性复合物，将松露提取物和根据需要存在的相同量香槟提取物加入水中，将混合物与磷脂（NAT80®）水溶液混合，在室温下在至少 10000rpm 下搅拌并形成悬浮液。随后，将悬浮液与含水凝胶接触、搅拌并中和。可以将甘油和乙醇作为额外物质搅入，以便改善混合物的可加工性。获得了具有非常好的储存性能的稳定活性复合物。

	实施例 1	实施例 2	实施例 3	实施例 4
活性复合物的组分				
蒸馏水	加至 100	加至 100	加至 100	加至 100
卡波姆	0.5	0.5	0.5	0.2
甘油	6.0	6.0	6.0	-
防腐剂	0.9	0.9	0.9	1.0
三乙醇胺	0.5	0.5	0.5	0.5
乙醇	6.0	3.0	1.0	-
黑孢块菌（干提取物）	2.0	3.8	3.5	-
夏眠块菌（干提取物）	-	-	-	4.0
香槟产品（喷雾干燥）	2.0	5.0	1.5	-
磷脂	8.0	8.0	8.0	5.0

实施例 1a

使用如实施例 1 相同的组成, 除了其含有 6 重量%从黑孢块菌获得的干提取物以及 5 重量%干燥的香槟产品。

5

实施例 4a

使用如实施例 4 相同的组成, 除了其含有 8 重量%从夏眠块菌获得的干提取物以及 5 重量%干燥的香槟产品。

10 实施例 5 霜 I

A 相

水 加至 100

甘油 5.0

交联聚合物 0.2

15 B 相

鲸蜡硬脂醇(Cetearyl Alcohol) 1.5

异十六烷 3.5

硬脂酸辛酯 3.0

C 相

20 三乙醇胺 (TEA) 0.2

D 相

实施例 1 的活性复合物 2.0

防腐剂 0.5

芳香油 0.3

25

将 A 相和 B 相在搅拌下分别加热至高达 65°C, 并在搅拌下彼此混合。将温度降至约 50°C, 加入 C 相。在约 35°C 下搅拌加入 D 相。

实施例 6 霜 II

30 A 相

	水	加至 100
	聚丙烯酰胺	1.5
	C13-C14 异链烷烃	2.0
	Laureth 7	2.0
5	B 相	
	巴巴苏仁油	2.5
	芝麻油	7.0
	WO96/17588 实施例 1 的高岭土	5.0
	C 相	
10	实施例 2 的活性复合物	5.0
	芳香油	0.5

分别制备 A 相和 B 相，然后在 40℃搅拌下彼此混合。一旦混合物冷却至 35℃，则搅拌加入 C 相。

15

实施例 7 防晒霜

	A 相	
	水	加至 100
	丙二醇	3.0
20	PVM/MA 癸二烯交联聚合物	0.5
	二苯甲酮-3	2.5
	B 相	
	硬脂酸辛酯	5.0
	异十六烷	3.5
25	二甲聚硅氧烷	1.0
	C 相	
	水黄皮(Pongamina)提取物	
	(Pongamina pinnata)	1.0
	虫胶	1.0
30	甲氧基桂皮酸辛酯	7.5

	丁基甲氧基二苯甲酰基甲烷	2.0
	D 相	
	实施例 3 的活性复合物	8.0
	真芦荟	0.5
5	防腐剂	0.5
	芳香油	0.5

将 A 相和 B 相分别加热至高达 65℃，并在搅拌下彼此混合。将温度降至约 60℃，加入 C 相。在约 35℃下搅拌加入 D 相。

10

实施例 8 霜 III

	A 相	
	水	加至 100
	甘油	5.5
15	交联聚合物	0.2
	B 相	
	鲸蜡硬脂醇	1.8
	异十六烷	3.2
	硬脂酸辛酯	3.0
20	C 相	
	TEA	0.2
	D 相	
	实施例 4 的活性复合物	10.0
	防腐剂	0.5
25	芳香油	0.3

实施例 9

根据实施例 5 制备一种霜，其含有占整个组合物 10% 的实施例 1a 的活性复合物。

30

实施例 10

根据实施例 7 制备一种防晒霜，其含有占整个组合物 12% 的实施例 4a 的活性复合物。