

公告

申請日期	P0.11.30
案 號	P012P602
類 別	A61K 36/00, 31/00, 47/10, A61P 17/00, 14/00.

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	收斂組成物及其用法
	英 文	Astringent composition and method of use
二、發明 人	姓 名	瓦特森 (Geraldine Watson)
	國 籍	美國 (U.S.A.)
	住、居所	美國加州瑞斗都海灘法拉路 2115 號 2115 Farrell Avenue #E, Redondo Beach, CA90278, U.S.A
三、申請人	姓 名 (名稱)	美商紐卓那公司 Neutrogena Corporation
	國 籍	美國 (U.S.A.)
	住、居所 (事務所)	美國加州洛士安其市威斯特九十六街 5760 號 5760 West 96th Street, Los Angeles, CA 90045, U.S.A.
	代 表 人 姓 名	考比安祖拉 (ANDREA L. COLBY)

裝

訂

線

I286477

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
I P C分類：

A6

B6

本案已向：

美

國(地區) 申請專利，申請日期：

案號：

，☒有 ☐無主張優先權

西元二〇〇〇年十二月一日

09/728,012

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

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明 (1)

發明領域

本發明相關於一種收斂組成物。本發明亦相關於一種用於輸送皮膚局部活性劑之組成物之方法。

發明背景

收斂劑為習知用於緊縮或束縛柔軟組織，並可調理與濕潤肌膚。商業上可購得之收斂劑組成物通常含有相當大量之醇成分，如 35 至 45% 重量比，且為具低黏度之液體。由於其高醇含量，這些組成物會造成肌膚過度乾燥與刺激。此外，這些組成物的黏度與醇含量特性會造成塗抹的時候難以控制。例如，消費者若選擇只用手來塗抹收斂劑，便需要較特定肌膚面積更大且更多量之收斂劑，因為從包裝瓶倒至手上，再由手塗抹至臉上都造成收斂劑之損失。另一方面，若使用沐浴用具來塗抹收斂劑，例如用布或棉球，收斂劑的低濃稠度便會導致收斂劑被沐浴用具快速吸收。任何被吸收之收斂劑便無法再使用。少量收斂劑亦可能由於其高醇含量，而造成揮發散失。

本發明提供一種黏稠且低醇含量之收斂劑組成物，適用於輸送皮膚局部活性劑。

發明概要

本發明之一觀點為本發明提供了一種收斂劑組成物，包含約 0.1% 至約 20% 重之收斂劑，以及介於約

五、發明說明（2）

0.1% 至約 10% 重之醇；其中該組成物具至少約 5,000 厘泊之黏度。一具體例中，該組成物更包含一局部活性劑，例如一肌膚用之去角質劑（如水楊酸）。本發明之另一特徵為使用上述組成物之方法。

本發明之其他特徵與優點，亦揭露於本發明之其他詳細敘述與專利申請範圍中。

發明詳細敘述

此領域之習用技術，基於本發明之敘述，可應用本發明以使技術內容更臻完備。以下所述之特定實施例僅用以說明本發明，但不侷限其他可揭露之形式。

除非另有說明，於此所提及之任何技術性與科學性術語皆與本發明領域之習知技藝中所使用的相同。同時，所有刊物、專利申請、專利案與其它所提及參考資料皆附於參考資料中。

本發明相關於一種具低醇含量與高黏度數值之收斂劑組成物，一具體例中，用於輸送皮膚局部活性劑。在一具體例中，該組成物包含收斂劑與醇，其中該組成物之黏度至少約 5,000 厘泊。不局限於特殊理論，一般認為組成物之高黏度特性使皮膚閉塞，因而使組織物保留在皮膚上，而醇則將局部活性劑輸送至皮膚。組成物之黏度亦可助於使醇流失至塗抹部位之周圍環境達最小化，因此可加強活性劑之輸送。如以下實例 3 亦發現，

五、發明說明 (3)

與含有較高醇含量之組成物相較，較低量之醇可使活性物質由組成物中輸送至皮膚上之百分比提高。

收斂劑通常會包含在組成物中，以幫助促進緊縮或束縛柔軟組織，並可調理肌膚。任何習知之收斂劑皆可使用於本發明。天然或合成之收斂劑皆可使用。其代表之一為無限制之天然收斂劑，包括檸檬酸鋁鹽、乳酸鋁鹽、樺樹提取物、咖啡提取物、月見草提取物、葡萄提取物、散沫花提取物、長春藤提取物、檸檬提取物，以及金縷梅提取物。本發明收斂劑之使用量為約 0.1% 至 20% 重，相對於組成物總重量。一具體例中為收斂劑包含約組成物總重量 10% 重之金縷梅提取物。

術語“醇”指的是乙醇或異丙醇。局部的收斂劑組成物之醇含量為約 35-45% 重量比。本發明組成物之醇含量為約 0.1-10% 重量比，較佳為小於組成物之 5% 重量比。令人意外地，如此低含量之醇成分被發現可更有效地將活性劑傳送至皮膚。如實施例 3 所示，含有約 5% 乙醇之收斂劑組成物，與含有約 10% 醇含量之收斂組成物相較，可傳送更大比例之活性劑至皮膚中。

本發明之組成物之黏度值為至少約 5,000 厘泊，較佳為至少約 10,000 厘泊。本發明之實例之一為具黏度值約 12,500 厘泊。增加上述黏度值的方法之一為添加黏度增加劑於組成物中，如聚乙烯基甲基丙烯酸酯/甲基丙烯酸酯交聯共聚物。其他黏度增加劑包括，但不僅限於

五、發明說明（4）

此，膨潤土、carbomer、角叉菜膠、地蠟、環糊精、明膠以及纖維素樹脂如黃原膠(xanthane gum)。此外，黏度增加劑已列於國際化妝品成分辭典及手冊，Wenninger 與 McEwen 編著，pp.1693-1697(The Cosmetic Toiletry, and Fragrance Assoc., Washington, D.C.,第 7 版，1997 年發行，以下稱之為“ICI 手冊”)。實例之一為黏度增加劑之量為組成物重量之約 0.02%至約 5%。

本發明之組成物更包含局部活性劑。“局部活性劑”指的是一種對肌膚具有化妝、病變預防以及療效等功用之化合物，如隔離紫外線、治療皺紋及/或痤瘡，或是使肌膚更明亮。於一具體例中，該劑選自於，但不侷限於，由羧基酸、過氧化二苯甲醯、間-苯二酚硫、抗壞血酸、D-泛醇、羧基醯、遮光劑、去角質劑、抗發炎劑、皮膚明亮劑、抗細菌或抗黴菌劑、雌激素、二甲基胺基乙醇、硫辛酸、胺基酸如脯胺酸與酪胺酸、乳酸、乙醯輔酶 A、菸鹼酸、核黃素、硫胺素、核糖、電子傳遞劑如 NADH 與 FADH_2 、植物性萃取物如蘆薈與大豆、以及上述物質之衍生物與混合物組成之群組。本發明組成物中所含局部活性物質之含量介於約 0.01%至約 20%組成物重。

羧基酸之範例包括，但不侷限於，(i) α -羧基酸如乙醇酸、乳酸、蘋果酸、檸檬酸與酒石酸；(ii) β -羧基

五、發明說明 (5)

酸如水楊酸，及/或；(iii)多羥基酸。請參考歐洲專利號 273,202。

抗壞血酸衍生物之範例包括，但不侷限於，抗壞血酸基棕櫚酸鹽、抗壞血酸基磷酸鎂、抗壞血酸基磷酸鈉、抗壞血酸基磷酸鋅、抗壞血酸基葡萄糖、抗壞血酸鈉鹽，以及抗壞血酸基多肽。羥基醌之代表範例包括，但不侷限於，熊果苷(arbutin)。

較佳具體例中，局部活性劑為去角質劑。示範性之去角質劑為水楊酸、硼酸以及甲基水楊酸鹽。本發明組成物所含去角質劑之含量為約 0.1% 至 5% 重，較佳為約 0.5% 至 2% 組成物重。

助溶劑(solubilizer)亦可使用於局部活性劑中。較佳為不含油、可與醇互溶，且不會使活性劑結晶析出之助溶劑。助溶劑之範例包括，但不侷限於，聚乙二醇、脂肪族醇類之乙二醇醚類，以及上述之混合物。助溶劑之量為足夠溶解活性劑之量。

一具體例中，組成物中更包含一肌膚舒緩劑。示範性的肌膚舒緩劑為蘆薈與洋甘菊之抽取物，及其混合物。通常肌膚舒緩劑之含量為約 0.1% 至約 5% 組成物重。

較佳具體例中，組成物更包含低於 1% 重之油，或是不含任何油脂。術語“油”指的是動物性(如脂肪酸酯)、礦物性(如石蠟油)、植物性(如植物油)，或在室溫

五、發明說明(6)

下呈現液狀之合成性碳氫化合物，其可溶於有機溶劑中，且完全不溶於水中(如在 25℃ 下之溶解度小於 0.1 mg/ml)。油之範例包括，但不侷限於，礦物油如石蠟油、合成碳氫化合物如聚丁烯與聚異丁烯、植物油如蓖麻油、芝麻油，與花生油，以及動物油與脂肪如三酸甘油酯與奶油。其他脂肪、油脂或碳氫化合物之範例已揭露於國際化妝品成分辭典及手冊，Wenninger 與 McEwen 編，1565-67 頁，以及 ICI Handbook 之 1574-75 頁。

本發明之新穎組成物亦可包含其他化妝品成分如濕潤劑、軟化劑、皮膚調理劑、皮膚保護劑、色素、香料及其類似物。亦可參照 ICI 手冊第 1628-1630、1639-1640、1650-1651、1656-1670 頁。

本發明之組成物可塗抹於皮膚上(如人體臉部)。一具體例中，組成物可一天塗抹一次或兩次。一具體例中，組成物塗抹於皮膚上時，可先塗於手上再於特定肌膚上抹開。另一具體例中，組成物先倒至沐浴用品，如棉球或棉布上，再塗抹於特定肌膚上。

下列為收斂組成物製造與測試方法之詳細說明。本發明之其他組成物亦可由熟習此技術領域者以類似方式製備。

範例 1

完全不含油之組成物(配方 A)係以下列成分與含量

五、發明說明(7)

製得。

成分	重量百分比
純水	補至 100
聚乙醯基甲基丙烯酸酯/甲基 丙烯酸酯共聚物	1.8
尿囊素	0.08
Chloeth-24 與 Ceteth-24 (50:50)	0.2
水楊酸	2
Glycereth-7	2
聚乙二醇-4	1
矽氧烷共聚多醇 (Dimethiocne copolyol)	1
己二醇	2
金縷梅	10
二苯甲酮-4(Benzophenone- 4)	0.03
氫氧化鈉(50%)	1.5
PCA 鈉鹽	1
甲醇	0.05
蘆薈提取物	0.2
洋甘菊提取物	0.2

五、發明說明(8)

乙醇混合物(95%乙醇)	5
色素	q.s.
香料	q.s.

配方 A 係依下列方法製備。將純水之約 80-90%量加熱至 75°C，之後加入尿囊素，以及聚乙醯基甲基丙烯酸酯/甲基丙烯酸酯共聚物。將這些成分混合約 30 分鐘，之後加入 Chloeth-24 與 Cetheh-24，混合至固體完全溶解。隨後，將反應冷卻至 50-55°C。接著將水楊酸、glycereth-7、PEG-4 以及矽氧烷共聚多醇(Dimethiocne copolyol)加入，持續充分混合至水楊酸完全溶解。之後加入己二醇以降低反應溫度，直到溫度約 40-45°C 時，加入金縷梅(Manarmelis Viginiana (含 14%乙醇)，EE Dickinson 公司，Essex，美國康乃迪克州)。二苯甲酮-4、氫氧化鈉以及剩餘純水以混合方式間隔 3 分鐘加入；反應混合至呈現均勻混合狀態。當反應達 40°C 時，PCA 鈉鹽、甲醇、以及蘆薈與洋甘菊之天然抽取物便可加入。最後，將色素與香料以混合方式間隔 5 分鐘加入。

範例 2

第二種收斂組成物(配方 B)不同於上述配方 A 之處為，約 5% 重之乙醇混合物改為添加約 10% 重之乙醇

五、發明說明(9)

混合物。

範例 3

八位參與者進行滲透試驗，以決定水楊酸滲透肌膚所須之量。水楊酸量係以裝置有光纖探頭之 Perking Elmer 螢光光譜儀(Norwalk，美國康乃迪克州)測得。受測者之特定面積皮膚分別於塗抹後 0、3、6 小時監測，之後再拭去所塗抹之產品。令人意外地，水楊酸穿透比例較大者，其醇含量反而較低，如下表所示。

產品	穿透率%	穿透率%
	配方 A，3 小時後	配方 A，6 小時後
配方 A (5% 醇)	100	100
配方 B (10% 醇)	86	93

範例 4

本發明之組成物黏度值至少為約 5,000 厘泊。配方 A 之黏度測量值示於下表中。以 Brookfield RVT Spindle TB 黏度計(Stoughton，美國麻州)測量樣品黏度值。樣品置於 25°C 之水浴環境中。以 Helipath 動力馬達轉動每一樣品表面上方之 T 形桿。Helipath 馬達一開始往下轉，每轉一次便會有一讀數。在紀錄 6 次讀數後，

五、發明說明（10）

Helipath 便會往反方向轉動，再紀錄 6 次讀數；如此便完成紡錘的一次轉動。下表所列之數值為 12 次讀數之平均值。組成物本身就會有些搖溶現象(thixotropic)，導致隨著時間延長而逐漸黏稠之現象。

衰退度，樣品製備完成後 之時間	黏度，cps
1 小時	11,960
18 小時	11,993
24 小時	12,120
2 天	12,120
3 天	12,133
4 天	12,446
7 天	12,580

本發明以上述說明與實例作詳盡闡述，但該實例僅作為說明用，並不侷限本發明之範疇，其範圍皆依專利申請範圍中所示。其他可推知之設計、優點與修飾，皆為本發明所申請之保護範圍。

四、中文發明摘要（發明之名稱： 收斂組成物及其用法)

本發明提供了一種收斂劑組成物，包含約 0.1% 至約 20% 重之收斂劑，以及介於約 0.1% 至約 10% 重之醇。該組成物具至少約 5,000 厘泊之黏度。本發明亦提供一種方法，以此種組成物輸送一局部活性劑，如水楊酸至肌膚上。

英文發明摘要（發明之名稱： ASTRINGENT COMPOSITION AND METHOD OF USE)

The invention provides for astringent composition comprising from about 0.1% to about 20% by weight of an astringent and between about 0.1% to 10% by weight of alcohol. The composition have viscosity values of at least about 5,000 centipoise. The invention also provides for a method of using such composition for delivering a topically active agent, such as salicylic acid, into skin.

六、申請專利範圍

專利申請案第 90129602 號
ROC Patent Application No.90129602
修正後無劃線之申請專利範圍中文本 - 附件(一)
Amended Claims in Chinese - Encl.(1)
(民國 92 年 12 月 21 日送呈)
(Submitted on December 21, 2003)

1. 一種收斂劑組成物，包含：
 - (a) 0.1% 至 20% 重之收斂劑；以及
 - (b) 介於 0.1% 至 10% 重之醇；及
 - (c) 水楊酸；其中該組成物具至少 5,000 厘泊之黏度。
2. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其中該收斂劑選自於由檸檬酸鋁鹽、乳酸鋁鹽、樺樹(birch)抽取物、咖啡抽取物、月見草(evening primrose)抽取物、葡萄抽取物、散沫花(henna)抽取物、長春藤(ivy)抽取物、檸檬抽取物，及其混合物組成之群組。
3. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅(witch hazel)萃取物。
4. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其中該組成物包含 0.02%至 5% 重之黏度增加劑。
5. 如專利申請範圍第 4 項之組成物，其中該黏度增加劑為聚乙基基甲基丙烯酸酯/甲基丙烯酸酯交聯共聚物。
6. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其黏度值為至少 10,000 厘泊。
7. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其中該醇為乙醇。
8. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其中該醇為乙醇，

六、申請專利範圍

- 其含量為小於組成物之 5% 重。
9. 如專利申請範圍第 6 項之組成物，其中該醇為乙醇，其含量為小於組成物之 5% 重。
10. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其中該水楊酸之含量為組成物之 0.5% 至 2% 重。
11. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其更包含一助溶劑，其含量為足以溶解該水楊酸之量。
12. 如專利申請範圍第 11 項之組成物，其中該助溶劑選自由聚乙二醇、脂肪族醇類之乙二醇醚類，以及上述之混合物組成之群組。
13. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其更包含一 0.1% 至 5% 組成物重之肌膚舒緩劑，其中該肌膚舒緩劑選自由蘆薈抽取物、洋甘菊抽取物，及上述之混合物組成之群組。
14. 如專利申請範圍第 1 項之組成物，其中該組成物包含小於 1% 重之油。
15. 如申請專利範圍第 6 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅萃取物。
16. 如申請專利範圍第 7 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅萃取物。
17. 如申請專利範圍第 8 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅萃取物。
18. 如申請專利範圍第 9 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅萃取物。

六、申請專利範圍

19. 如申請專利範圍第 9 項之組成物，其中水楊酸之量佔組成物之 0.5%至 2%重量比。
20. 如申請專利範圍第 11 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅萃取物。
21. 如申請專利範圍第 10 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅萃取物。
22. 如申請專利範圍第 5 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅萃取物。
23. 如申請專利範圍第 19 項之組成物，其中該收斂劑為金縷梅萃取物。

裝

訂

線