



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101677913 B

(45) 授权公告日 2016.04.20

(21) 申请号 200880015421.4

(22) 申请日 2008.05.09

(30) 优先权数据

07107950.3 2007.05.10 EP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2009.11.09

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2008/055760 2008.05.09

(87) PCT国际申请的公布数据

W02008/138894 DE 2008.11.20

(73) 专利权人 诺伊堡皮肤护理两合公司

地址 德国格雷文

(72) 发明人 罗尔夫·丹尼尔斯

(74) 专利代理机构 北京集佳知识产权代理有限公司

11227

代理人 顾晋伟 赵中璋

(51) Int. Cl.

A61K 8/04(2006.01)

A61K 8/27(2006.01)

A61K 8/29(2006.01)

A61Q 19/00(2006.01)

A61K 8/06(2006.01)

(56) 对比文件

US 2005/0266055 A1, 2005.12.01,

WO 2004/060063 A1, 2004.07.22,

US 2005/0053634 A1, 2005.03.10,

Du Z.P., 等. Outstanding stability

of particle-stabilized bubbles.

《Langmuir》. 2003, 第19卷(第8期), 3106-3108.

Gonzenbach U.T., 等. Ultrastable

particle-stabilized foames. 《Angewandte

Chemie International Edition》. 2006, 第45卷

3526-3530.

审查员 崔传明

权利要求书2页 说明书9页

(54) 发明名称

无表面活性剂的泡沫制剂

(57) 摘要

本发明涉及包含基本无乳化剂的含有油相和水相的水包油型乳液的泡沫制剂。

1. 一种泡沫制剂,其通过喷雾包含含有油相和水相的水包油型乳液得到,其中所述乳液是 Pickering 乳液,并含有 10-50 重量%的油相,以及

其中所述乳液包含不超过 0.5 重量%的传统乳化剂,其中传统乳化剂是具有在空间上相互分离的亲水部分和亲油部分构成的分子结构的物质,其中该物质形成在油相与水相之间的界面中的界面膜并且具有小于 5000 的分子量。

2. 根据权利要求 1 的泡沫制剂,其中所述乳液包含不超过 0.3 重量%的传统乳化剂。

3. 根据权利要求 1 的泡沫制剂,其中所述乳液包含不超过 0.1 重量%的传统乳化剂。

4. 根据权利要求 1 或 2 的泡沫制剂,包含不含传统乳化剂的无乳化剂乳液。

5. 根据权利要求 1 的泡沫制剂,其中所述 Pickering 乳液含有至少一种选自二氧化钛、二氧化硅、 Fe_2O_3 、氧化锌、硅酸镁铝、膨润土和乙基纤维素、氧化铝、沉淀碳酸钙纳米颗粒、煤、氧化镁、三硅酸镁、结晶脂肪醇和脂肪酸、聚合物胶乳、和聚合物伪胶乳的微粒固体乳化剂或其混合物。

6. 根据权利要求 1 的泡沫制剂,其中所述聚合物胶乳是聚苯乙烯或聚甲基丙烯酸酯。

7. 根据权利要求 1 的泡沫制剂,其中所述 Pickering 乳液包含涂覆的二氧化钛或氧化锌。

8. 根据权利要求 1 或 2 的泡沫制剂,其中所述油相含有至少一种甘油三酯。

9. 根据权利要求 8 的泡沫制剂,其中所述甘油三酯包含辛酸 / 癸酸甘油三酯。

10. 根据权利要求 1 或 2 的泡沫制剂,其中所述乳液含有至少一种增稠剂。

11. 根据权利要求 10 的泡沫制剂,其中所述增稠剂包含羟丙基甲基纤维素。

12. 根据权利要求 1 或 2 的泡沫制剂,其中所述乳液含有至少一种活性剂。

13. 根据权利要求 12 的泡沫制剂,其中所述活性剂选自保湿因子、吡咯烷酮羧酸和其盐、乳酸和其盐、甘油、山梨糖醇、丙二醇、尿素、胶原、弹性蛋白、丝蛋白、透明质酸、汛维他、神经酰胺、泛醇、烟酸、 α -生育酚和其酯、维生素 A、维生素 C、没食子酸酯、多酚、甜没药萜醇、植物甾醇、抗生素、止痛剂、抗炎剂、抗风湿剂、抗过敏剂、抗寄生物剂、止痒剂、抗牛皮癣剂、类视黄醇、局部麻醉剂、静脉治疗剂、角质分解剂、充血化合物、冠状动脉治疗剂、病毒抑制剂、细胞抑制剂、激素、促进创面愈合的药剂、生长因子、酶制剂、杀虫剂和植物材料或其混合物。

14. 根据权利要求 13 所述的泡沫制剂,其中冠状动脉治疗剂是硝酸盐 / 硝基化合物。

15. 根据权利要求 13 所述的泡沫制剂,其中植物材料为海藻、芦荟、山金车、胡须地衣、聚合草、白桦、荨麻、金盏花、橡木、常春藤,金缕梅,散沫花,蛇麻子、甘菊、假叶树、薄荷、万寿菊、迷迭香、鼠尾草、绿茶、茶树、马尾草、百里香和胡桃的植物提取物。

16. Pickering 乳液用于制备根据权利要求 1-15 中任何一项的泡沫制剂的用途。

17. 根据权利要求 1-15 中任何一项的泡沫制剂在制备活性剂的载体中的用途。

18. 根据权利要求 1-15 中任何一项的泡沫制剂在制备皮肤护理剂中的用途。

19. 根据权利要求 1-15 中任何一项的泡沫制剂在制备皮肤清洁剂中的用途。

20. 根据权利要求 1-15 中任何一项的泡沫制剂在制备防晒剂中的用途。

21. 根据权利要求 1-15 中任何一项的泡沫制剂在制备化妆品、医疗产品或药物组合物中的用途。

22. 一种生产基于 Pickering 乳液的泡沫制剂的方法,包括以下步骤:

a) 生产含有 10-50 重量%的油相的水包油型 Pickering 乳液，
b) 将所述 Pickering 乳液和抛射剂充入压力容器，或
c) 将所述 Pickering 乳液充入不同于压力容器的、通过放出所述 Pickering 乳液生成泡沫的容器。

23. 根据权利要求 22 的方法，用于生产根据权利要求 1-15 中任何一项的泡沫制剂。

24. 根据权利要求 23 的方法，其中生产所述 Pickering 乳液包括以下步骤：

- 1) 提供液体油相，
- 2) 将一种或多种固体乳化剂悬浮在所述油相中以得到固体乳化剂的悬浮体，
- 3) 提供水相，
- 4) 将所述水相和所述固体乳化剂的悬浮体匀化以得到 Pickering 乳液。

25. 根据权利要求 24 的方法，其中所述油相和所述水相在 50 ~ 90℃ 的温度下匀化。

26. 根据权利要求 24 或 25 的方法，其中所述 Pickering 乳液包含增稠剂，进一步包括以下步骤：

- 5) 提供增稠剂的水溶液，
- 6) 将所述增稠剂溶液与所述 Pickering 乳液混合。

27. 根据权利要求 22 至 24 中任何一项的方法，其中所述泡沫制剂含有 10 重量%的抛射剂。

无表面活性剂的泡沫制剂

技术领域

[0001] 本发明涉及基于无或基本无传统乳化剂的水包油型乳液的化妆品和皮肤病用泡沫制剂。特别地,本发明涉及用 Pickering 乳液制备泡沫的用途。

现有技术

[0002] 1、乳液

[0003] 通常“乳液”涉及由一般称作“相”的两种不混溶的或仅以有限程度混溶的液体组成的非均相体系。在乳液中,两种液体中的一种以微滴形式分散在另一种之中。

[0004] 在两种液体是水和油并且油滴细微地分散在水中的情况下,乳液是水包油乳液(O/W 乳液,例如乳)。O/W 乳液的基本性质由水决定。在油包水乳液(W/O 乳液,例如奶油)的情况下,应用相反的原理,其中油决定基本性质。

[0005] 为了使一种液体在另一种液体中持久分散,传统上乳液中需要添加表面活性剂(乳化剂)。乳化剂具有由分子的在空间上相互分离的极性(亲水)部分和非极性(亲油)部分组成的两亲分子结构。在简单乳液中,一相的乳化剂壳包住的细微分散的微滴存在于第二相中(W/O 乳液中的水滴或 O/W 乳液中的液囊泡)。由于乳化剂排列在两种液体间的界面处,所以乳化剂减小了各相之间的表面张力。乳化剂在油/水相的界面处形成对抗微滴不可逆结合的表面膜。经常使用乳化剂稳定乳液。

[0006] 术语“乳化剂”或“传统乳化剂”各自在现有技术中是已知的。例如,在公开出版物: Pflegekosmetik, 4th edition, Wissenschaftliche Verlagsgesellschaft mbH Stuttgart, 151 ~ 159 页和 FiedlerLexikon der Hilfsstoffe, 5th edition, Editio Cantor Verlag, Aulendorf, 97 ~ 121 页中描述了传统乳化剂。

[0007] 传统乳化剂可以根据分子的亲水部分而分为离子(阴离子、阳离子和两性)乳化剂和非离子乳化剂:

[0008] • 阴离子乳化剂最广为人知的例子是肥皂,其是水溶性饱和和不饱和高级脂肪酸的钠盐或钾盐的传统名称。

[0009] • 阳离子乳化剂的重要成员是季铵盐化合物。

[0010] • 非离子乳化剂分子的亲水部分经常由甘油、聚甘油、脱水山梨糖醇、糖类或聚氧乙烯二醇分别组成,并且最常通过酯或醚键连接至亲脂部分。亲脂部分通常由脂肪醇、脂肪酸或异脂肪酸组成。

[0011] 通过分子的极性和非极性部分结构和大小的变化,乳化剂的亲脂性和亲水性可以在很大范围内改变。

[0012] 正确选择乳化剂对乳液的稳定性是决定性的。对此,体系中所含的所有化合物的特性都必须考虑。例如,在皮肤护理乳液的情形中,极性的油成分例如 UV 滤光成分可能导致不稳定。除乳化剂之外,还另外使用其它稳定剂以便例如增加乳液粘度和/或作为保护胶体。

[0013] 在不同用途的化妆品和/或皮肤制剂领域中,乳液是一类重要产品。因此,诸如洗

剂和膏霜的各种产品可用于皮肤护理,尤其再滋润 (relubricating) 干性皮肤。皮肤护理的目的是补偿由日常清洗造成的脂和水的损失。

[0014] 另外,这种皮肤护理产品应当保护皮肤不受外界影响,特别是太阳和风的影响,并且应当延缓皮肤老化。

[0015] 化妆品乳液也用作除臭剂。这种制剂用于消除原本无味的新鲜汗液被微生物分解时形成的身体气味。

[0016] 清洁乳液形式的乳液也用于清洁皮肤和皮肤附属物。这些乳液最经常用于清洁面部,尤其是去除修饰用化妆品。与诸如肥皂的其他清洁制剂相反,这种清洁乳液的优点是对皮肤特别温和,因为它们可以在亲脂相中含有营养油和 / 或非极性活性剂例如维生素 E 等。

[0017] 2、无乳化剂乳液

[0018] 无乳化剂乳液是特殊形式的乳液。狭义上,这些乳液不含乳化剂,也就是说,不含在较高浓度下形成胶束和 / 或其他液晶集合体的低分子量两亲化合物 (分子量小于 5000)。在此使用的术语“乳化剂”具有本领域通常的含义。国际纯粹与应用化学联合会 (IUPAC) 定义乳化剂的性质如下:乳化剂是表面活性物质。乳化剂优选排列在油相和水相之间的界面,并因此减小表面张力。在低浓度下,乳化剂有利于乳液的形成。另外,这些物质减少聚集和聚结的速率,因此可以增加乳液的稳定性。

[0019] 为了稳定药物和化妆品乳液,普遍使用所谓的真乳化剂,即,在本说明书意义上而言的传统乳化剂,根据其结构和物理 - 化学行为属于表面活性剂类。它们的特征在于两亲结构和胶束联合 (micelleassociation) 的能力。

[0020] 术语“无乳化剂”在现有技术中已知。根据皮肤药理学学会 (the Society of Dermatopharmacie) 的药剂师、皮肤病学家和其他专家的跨学科共识的定义 (http://www.dermotopics.de/german/ausgabe_1_03_d/emulgatorfrei_1_2003_d.htm), 当制剂通过表面活性大分子 (分子量超过 5000) 而不是狭义上的乳化剂 (传统乳化剂) 稳定时,该制剂可以定义为“无乳化剂”制剂。

[0021] 3、Pickering 乳液

[0022] Pickering 乳液是特别形式的无乳化剂乳液。Pickering 乳液 (由固体稳定的乳液) 通过细微分散的固体颗粒来稳定,并且允许实质上弃用传统乳化剂。

[0023] 在 Pickering 乳液中,固体以层的形式积聚在油 / 水界面由此阻止了分散相的结合。在此方面,既可被亲水相湿润也可被亲脂相湿润的固体颗粒的湿润性质特别重要。

[0024] 4、泡沫制剂

[0025] 化妆品和 / 或皮肤病用乳液的特别应用形式是用作泡沫。泡沫制剂的优点是能容易地分布在皮肤上。泡沫的稠度感觉为舒适并且产品通常留下良好的皮肤感觉。特别地,泡沫的物理结构对皮肤的保护起积极作用。泡沫是复杂的物理结构,需要构成泡沫的成分的特别平衡。通常,通过喷射乳液制剂或水性表面活性剂 (稳定剂) 溶液得到泡沫。例如,含有抛射剂的乳液从压力容器中放出 (这样的系统在文献和专利文献中也被描述成气溶胶泡沫)。在这种情况下,加压的乳液和抛射剂的混合物膨胀并形成小的泡沫气泡。特别地,溶有油溶性气体的分散的油相膨胀。然而,泡沫也能通过其他系统例如泵式喷雾器形成。

[0026] 应用上,平衡的泡沫制剂具有稳定的两相或更多相的多分散结构,其在皮肤上形成相当于膜的网络结构。这样的网络结构的优点是其发挥保护作用,例如防止与水接触,但

允许与环境进行不受阻碍的气体交换。在这样的泡沫中,特别不妨碍不显汗,并且没有相应的热积累。因此,保护和营养作用的积极性质与不变的排汗相结合。

[0027] 迄今已知的泡沫制剂包含用于乳液稳定和导致泡沫稳定的传统表面活性剂/乳化剂。

[0028] 然而,传统乳化剂和表面活性剂各自被反复确认会在皮肤护理产品的使用中引起刺激,例如皮肤屏障功能异常或痤疮。但是,不能完全放弃添加合适的稳定剂,因为上述被分散的系统例如乳液是热力学不稳定的。

[0029] 上述 Pickering 乳液是避免乳化剂的一种选择。EP 1 352 639 A1 或 DE 101 62 840 各自描述了 Pickering 乳液,但其是用作洗剂、乳膏和凝胶剂形式的乳剂。

[0030] WO 2004/017930 也描述了 Pickering 乳剂,其特征特别在于低粘度并因此适合于皮肤病用布料。这样的稀流体 Pickering 乳液甚至可以被喷射成雾。

[0031] 然而,上述文献都没有公开基于无乳化剂的 Pickering 乳液的泡沫制剂。

发明内容

[0032] 申请人发现 Pickering 乳液适合作为泡沫制剂的基础。因此,泡沫制剂的积极性质与 Pickering 乳液的那些性质结合。特别地,泡沫制剂可以在没有传统乳化剂或仅有极低量传统乳化剂的条件下制备,将泡沫的积极性质,即物理结构和易于应用与良好的皮肤相容性结合。这样的性质的结合使得泡沫特别适用于敏感型皮肤的化妆品和皮肤病用制剂。因此,皮肤相容性和应用的方便性有利地相互结合。

[0033] 在此方面,首先须考虑稳定的泡沫产品并非必须发泡由固体稳定的 Pickering 乳液来获得。已经提到,通过在 O/W 乳液体系掺入抛射剂得到了泡沫。在溶于分散油相中的抛射剂由于发泡而蒸发时形成泡沫(气体在液体中的分散体)。溶于分散油相的抛射剂的发泡或膨胀各自导致所述分散油相的膨胀。在此方面,令人惊奇的是在界面处的固体网络能够经受膨胀应力并且在发泡时没有制剂的破坏发生。

[0034] 因此,本发明涉及泡沫制剂,包含含有油相和水相和任选的抛射剂的水包油型 Pickering 乳液。特别地,本发明涉及泡沫制剂,包含不超过 0.5 重量%的传统乳化剂,优选不超过 0.3 重量%,更优选不超过 0.1 重量%,甚至更优选不含传统乳化剂。以上数据各自基于没有抛射剂的乳液的总重量。

[0035] 此外,本发明涉及 Pickering 乳液,特别是基本上不含或完全不含传统乳化剂的 Pickering 乳液在制备泡沫制剂中的用途。

[0036] 另外,本发明涉及基于 Pickering 乳液的泡沫制剂作为活性剂载体、作为皮肤护理剂、作为皮肤清洁剂或作为防晒剂的用途。所述泡沫制剂因此可以用作化妆品、医疗产品或药物组合物。

[0037] 本发明还涉及制备基于 Pickering 乳液的泡沫制剂的方法。该方法包括以下步骤:

[0038] a) 制备水包油型 Pickering 乳液;

[0039] b) 将所述 Pickering 乳液和抛射剂充入压力容器;或

[0040] c) 将所述 Pickering 乳液充入不同于压力容器的、在放出所述 Pickering 乳液时生产泡沫的容器。

[0041] 发明详述

[0042] 1、定义

[0043] 根据本发明,泡沫制剂是适合形成泡沫的制剂,尤其是乳液。特别地,所述制剂可以或者与抛射剂一起充入压力容器,或者在没有抛射剂的情况下充入不同于压力容器的允许在放出所述 Pickering 乳液时形成泡沫的容器中。例如,可以使用泵式喷雾容器。

[0044] 根据本发明,基本上无乳化剂的乳液是不含超过 0.5 重量%,优选不超过 0.3 重量%,更优选不超过 0.1 重量%的传统乳化剂的乳液。根据本发明,无乳化剂乳液是不含传统乳化剂的乳液。

[0045] 根据本发明,Pickering 乳液是通过固体稳定的乳液。特别地,本发明尤其涉及通过固体稳定的水包油型乳液 (O/W 乳液)。特别地,根据本发明的通过固体稳定的乳液包含不超过 0.5 重量%,优选不超过 0.3 重量%,更优选不超过 0.1 重量%的传统乳化剂。尤其优选不含传统乳化剂的根据本发明的 Pickering 乳液。

[0046] 根据再一个方面,根据本发明的传统乳化剂是阴离子、阳离子、两性和非离子表面活性剂。典型的阴离子表面活性剂是中和的、支化和 / 或非支化的、饱和或不饱和的、具有 10-40 个碳原子链长的脂肪酸。典型的阳离子乳化剂是铵化合物。典型的非离子乳化剂具有分子的亲水性部分,例如甘油、聚甘油、脱水山梨糖醇、糖类或聚氧乙烯二醇,各自通过酯键和 / 或醚键与分子的典型地由脂肪醇、脂肪酸或异脂肪酸构成的亲脂性部分键合。例如,具有 10-40 个碳原子和乙氧基化度为 5-100 的聚氧乙烯化脂肪酸酯属于此类。此外,饱和和 / 或不饱和的、支化和 / 或非支化的具有 10-40 个碳原子链长的脂肪醇属于非离子乳化剂类。传统乳化剂经常组合使用。本说明书意义上的传统乳化剂具体说明于以下公开文献 :Pflegetkosmetik,第四版,WissenschaftlicheVerlagsgesellschaft mbH Stuttgart,151 ~ 159 页和 Fiedler Lexikonder Hilfsstoffe,第五版,Editio Cantor Verlag,Aulendorf,97 ~ 121 页。

[0047] 根据本发明的再另一个方面,本发明意义上的传统乳化剂是所有在较高浓度下可形成胶束和 / 或其他液晶聚集体的分子量小于 5000 的两亲化合物。根据甚至再另一个方面,传统乳化剂都是不以固体或聚合物形式存在的,尤其在储存和应用的温度例如室温下不以固体或聚合物形式存在的表面活性物质。

[0048] 根据本发明,固体乳化剂是既可被亲脂性液体湿润也可被亲水性液体湿润的颗粒状物质。在此方面,无机或有机固体是可能的。此外,颗粒可以是未处理的或是涂覆的。颗粒尺寸优选在 1nm 和 200nm 之间,更优选在 5nm 和 100nm 之间。

[0049] 2、Pickering 乳液组合物

[0050] 固体乳化剂:

[0051] 合适的固体乳化剂是既可被亲脂性液体湿润也可被亲水性液体湿润的无机或有机固体微粒。合适的例子是例如二氧化钛尤其是涂覆的二氧化钛(例如可从 Merck KGaA 获得的 **Eusolex®** T-2000)、氧化锡(例如可从 BASF AG 获得的 Z-Cote Max)、二氧化硅尤其是高分散二氧化硅、 Fe_2O_3 、硅酸镁铝、膨润土和乙基纤维素。另外,可以使用氧化铝、沉淀碳酸钙纳米颗粒、煤、氧化镁、三硅酸镁、结晶脂肪醇和脂肪酸、聚合物乳液例如聚苯乙烯或聚甲基丙烯酸酯和聚合物伪乳液 (polymer-pseudolatices)。再者,还可以使用上述固体乳化剂的混合物。优选涂覆的二氧化钛或氧化锡。

[0052] 本发明的乳液包含超过 1 重量%的固体乳化剂,优选超过 2 重量%的固体乳化剂,尤其 2-7 重量%的固体乳化剂。在尤其优选的实施方案中,本发明的乳液包含 3-4 重量%的固体乳化剂。这些数据各自基于不含抛射剂的乳液的总重量。

[0053] 油相:

[0054] 形成油相的合适成分可以选自极性油和非极性油或其混合物。

[0055] 本发明制剂的油相有利地选自卵磷脂和脂肪酸甘油三酯,选自丙二醇或丁二醇脂肪酸酯,选自源自动物或植物的天然蜡,选自酯油,选自二烷基醚和二烷基碳酸酯,选自支化和非支化的烃和蜡,以及选自环硅油或线性硅油。

[0056] 尤其优选的是甘油三酯,特别是得自 Sasol 公司的名为 Miglyol812 的辛酸 / 癸酸甘油三酯以及其与别的油和蜡成分的混合物。

[0057] 另外,尤其优选的是甘油三酯,特别是得自 Sasol 公司的名为 Miglyol812 的辛酸 / 癸酸甘油三酯 / 得自 Cognis 公司的名为 Myritol312 的辛酸 / 癸酸甘油三酯。

[0058] 本发明的乳液优选含有 10-50 重量%的油相,尤其优选 25-35 重量%的油相。这些数据各自基于不含抛射剂的乳液的总重量。

[0059] 水相:

[0060] 水相可以含化妆品辅料,例如低级醇(如乙醇、异丙醇)、低级二醇或多醇以及其醚(如丙二醇、甘油、丁二醇、己二醇和乙二醇)、泡沫稳定剂和增稠剂。

[0061] 合适的增稠剂是部分可溶于水或至少可分散于水并形成水性凝胶体系或粘性溶液的聚合物增稠剂。这些增稠剂或者与水分子键合(水化)或者在另一方面在其能降低水的运动性的缠结的分子内部包含或包封水,从而增加水的粘度。

[0062] 合适的聚合物是:

[0063] - 改性的天然材料,例如纤维素醚(如羟丙基纤维素醚、羟乙基纤维素醚和羟丙基甲基纤维素醚);

[0064] - 天然化合物,例如琼脂、角叉菜胶、多糖、淀粉、糊精、明胶、酪蛋白;

[0065] - 合成化合物,例如乙烯基聚合物、聚醚、聚亚胺、聚酰胺和聚丙烯酸衍生物;和

[0066] - 无机化合物,例如聚硅酸和粘土矿物。

[0067] 优选地,含有纤维素醚。尤其优选的是羟丙基甲基纤维素醚。

[0068] 本发明的乳液优选含有 0.2-1.5 重量%的增稠剂(基于增稠剂的干重和不含抛射剂的乳液的总重量)。尤其优选的是 0.5-0.8 重量%的增稠剂。

[0069] 活性剂:

[0070] 所含的活性剂可以选自能用于皮肤表面的所有活性剂和其混合物。活性剂能够起到化妆品或药物的作用。由此获得化妆品或皮肤用药(用作医药品或药物组合物)的泡沫制剂。此外,该制剂可以用于保护皮肤免受环境影响。活性剂可以完全源自植物或者可以是合成的。活性剂可以与其他成分,例如油成分、增稠剂或固体乳化剂重叠。例如,一些油成分也可以起到活性剂的作用,如具有多不饱和脂肪酸的油或固体乳化剂,如可以用作紫外线过滤剂的微粒二氧化钛。基于各种特性,这些物质可以归入不同的类别。

[0071] 本发明的活性剂有利地选自具有保湿和阻挡增强性质的物质例如保湿因子(Hydroviton)(一种天然保湿因子(NMF)的模仿物)、吡咯烷酮羧酸和其盐、乳酸和其盐、甘油、山梨糖醇、丙二醇和尿素,蛋白质和蛋白质水解物类物质例如胶原、弹性蛋白以及丝蛋

白,葡萄糖氨基葡萄糖类物质例如透明质酸,碳水化合物类物质例如其组成相当于人皮下碳水化合物混合物的汎维他 (pentavitin),和脂质和脂质前体类物质例如神经酰胺。在本发明中更有利的活性剂可以选自维生素例如泛醇、烟酸、 α -生育酚和其酯、维生素 A 以及维生素 C。此外,可以用选自抗氧化剂例如没食子酸酯 (Galate) 和多酚的活性剂。尿素、透明质酸和汎维他是优选的物质。

[0072] 更优选将具有皮肤舒缓和再生作用的物质作为活性剂,例如泛醇、甜没药萜醇和植物甾醇。

[0073] 本发明中有利的活性剂也可以是植物和植物提取物。例如,海藻、芦荟、山金车、胡须地衣、聚合草、白桦、荨麻、金盏花、橡木、常春藤,金缕梅,散沫花,蛇麻子、甘菊、假叶树、薄荷、万寿菊、迷迭香、鼠尾草、绿茶、茶树、马尾草、百里香和胡桃以及其提取物。

[0074] 本发明的制剂还可以包含合成或天然来源的抗真菌剂和抗菌剂 / 消毒剂作为活性剂。

[0075] 此外的活性剂是糖皮质激素、抗生素、止痛剂、抗炎剂、抗风湿剂、抗过敏剂、抗寄生物剂、止痒剂、抗牛皮癣剂、类视黄醇、局部麻醉剂、静脉治疗剂、角质分解剂、充血物质、冠状动脉治疗剂 (硝酸盐 / 硝基化合物)、病毒抑制剂、细胞抑制剂、激素、促进创面愈合的药剂例如生长因子、酶制剂和杀虫剂。

[0076] Pickering 乳液的其他成分 :

[0077] 制剂可以包含着色剂、珠光颜料、芳香剂 / 香料、防晒剂物质、防腐剂、螯合剂、抗氧化剂和防护剂。

[0078] 应当这样理解 Pickering 乳液的单个组分的上述列表,即举例的单个成分可以根据其不同性质归入不同的类别。

[0079] 抛射剂 :

[0080] 合适的抛射剂是例如 N_2O 、丙烷、丁烷和异丁烷。完成的泡沫制剂含有 5-15 重量%,优选约 10 重量%的抛射剂。

[0081] 3. 制造方法

[0082] 通过分别提供水包油型乳液或 Pickering 乳液和分别将所述乳液或 Pickering 乳液和任选的抛射剂充入任选加压的容器制备根据本发明的泡沫制剂。作为抛射剂和加压容器的替代, Pickering 乳液也可以充入适合将 Pickering 乳液甚至在没有抛射剂的情况下放出成泡沫的不同容器。

[0083] 特别地,按以下步骤制备 Pickering 乳液 :

[0084] 1) 提供液体油相,

[0085] 2) 将固体乳化剂悬浮在油相中以便得到固体乳化剂的悬浮体,

[0086] 3) 提供水相,

[0087] 4) 将水相和固体乳化剂的悬浮体一起匀化以便得到 Pickering 乳液。

[0088] 优选地,油相和水相在 50-90 $^{\circ}C$,优选 50-70 $^{\circ}C$ 以及尤其优选约 60 $^{\circ}C$ 的温度下匀化。

[0089] 在 Pickering 乳液包含增稠剂的情况下,有利地加上以下步骤 :

[0090] 5) 提供增稠剂的水溶液 ;

[0091] 6) 将增稠剂溶液与 Pickering 乳液混合。

[0092] 优选地,在 Pickering 乳液中加入 10 重量%的抛射剂生成泡沫制剂。

[0093] 4. 应用

[0094] 本发明的泡沫制剂可以用于所有化妆品和皮肤用药(作为医疗产品或药物组合物)的用途。例如,该制剂可以用作皮肤护理剂或皮肤清洁剂。此外,该制剂可以用作活性剂的载体以及可以用在医疗性皮肤用药领域。特别地,该制剂可以用作防晒剂。许多固体乳化剂例如二氧化钛是有效的 UVA 和 UVB 滤光剂。

[0095] 优选的示例性实施方案的说明

5. 实施例

[0096] 5.1 实施例 1

[0097] 初始 Pickering 乳液的组成:

[0098] 10.00g Merck KGaA 公司的 Eusolex T 2000(氧化铝/二甲基硅油涂覆的二氧化钛)

[0099] 95.00g Sasol 公司的 Miglyol 812(辛酸/癸酸甘油三酯)

[0100] 95.00g 水

[0101] 泡沫制剂的组成:

[0102] 60.00g 初始 Pickering 乳液

[0103] 30.00g 羟丙基甲基纤维素水溶液(2%)

[0104] 10.00g 抛射剂

[0105] 初始 Pickering 乳液的制造:

[0106] 将 Eusolex T2000 称重并转移到实验室用匀化器中,与 Miglyol 812 混合,在 1 分钟内加热到 60°C 并在 5 分钟内匀化。将水加热到 60°C 并在 1 分钟内在 1000 转/分钟下加入。混合物在 3000 转/分钟下匀化 5 分钟。

[0107] 泡沫制剂的制造:

[0108] 将 30.00g 羟丙基甲基纤维素在搅拌下加到 60.00g 初始 Pickering 乳液中。然后将含有羟丙基甲基纤维素的 Pickering 乳液与 10.00g 抛射剂加入铝单片罐中。

[0109] 泡沫的形成:

[0110] 通过合适的带有泡沫涂布器的阀将泡沫制剂从加压容器放出形成稳定的具有微小气泡的膏霜状泡沫。该膏霜状泡沫的结构维持足够的持续时间以便将泡沫均匀分布在皮肤上。

[0111] 5.2 实施例 2

[0112] 初始 Pickering 乳液的组成:

[0113] 10.00g Merck KGaA 公司的 Eusolex T 2000(氧化铝/二甲基硅油涂覆的二氧化钛)

[0114] 30.00g Cognis 公司的 Cetiol V(油酸癸酯)

[0115] 30.00g Cognis 公司的 Myritol 318(辛酸/癸酸甘油三酯)

[0116] 30.00g 杏仁油

[0117] 100.00g 水

[0118] 黄原胶溶液(1%)的组成:

- [0119] 1.0g 黄原胶
- [0120] 99.00g 水
- [0121] 泡沫制剂的组成：
- [0122] 60.00g 初始 Pickering 乳液
- [0123] 30.00g 水性黄原胶溶液（1%）
- [0124] 10.00g 抛射剂
- [0125] 初始 Pickering 乳液的制造：
- [0126] 将 Eusolex T2000 称重并转移到实验室用匀化器中，与 Cetiol V、Miglyol 318 和杏仁油的混合物混合，在 1 分钟内加热到 60℃ 并在 5 分钟内匀化。将水加热到 60℃ 并在 1 分钟内在 1000 转 / 分钟下加入。混合物在 3000 转 / 分钟下匀化 5 分钟。
- [0127] 泡沫制剂的制造：
- [0128] 将 30.00g 黄原胶溶液在搅拌下加到 60.00g 初始 Pickering 乳液中。将含有黄原胶溶液的 Pickering 乳液与 10.00g 抛射剂加入铝单片罐中。
- [0129] 泡沫的形成：
- [0130] 通过合适的带有泡沫涂布器的阀将泡沫制剂从加压容器放出形成稳定的具有微小气泡的膏霜状泡沫。该膏霜状泡沫的结构维持足够的持续时间以便将泡沫均匀分布在皮肤上。
- [0131] 5.3 实施例 3
- [0132] 初始 Pickering 乳液的组成：
- [0133] 10.00g BASF 公司的 ZCote（氧化锡）
- [0134] 20.00g Cognis 公司的 Myritol 318（辛酸 / 癸酸甘油三酯）
- [0135] 10.00g Cognis 公司的 Cetiol V（油酸癸酯）
- [0136] 20.00g Cognis 公司的 Cetiol SN（硬脂酰异壬酸鲸蜡酯）
- [0137] 20.00g 杏仁油
- [0138] 120.00g 水
- [0139] 羟丙基甲基纤维素溶液（2%）的组成：
- [0140] 2.00g 羟丙基甲基纤维素
- [0141] 5.00g 甘油
- [0142] 5.00g 尿素
- [0143] 88.00g 水
- [0144] 泡沫制剂的组成
- [0145] 40.00g 初始 Pickering 乳液
- [0146] 52.00g 水性羟丙基甲基纤维素溶液（2%）
- [0147] 8.00g 抛射剂
- [0148] 初始 Pickering 乳液的制造：
- [0149] 将 ZCote 称重并转移到实验室用匀化器中，与 Cetiol V、Miglyol318、Cetiol SN 和杏仁油的混合物在 1 分钟内混合并在 5 分钟内匀化。将水在 1 分钟内在 1000 转 / 分钟下加入。混合物在 3000 转 / 分钟下匀化 5 分钟。
- [0150] 泡沫制剂的制造：

[0151] 将 52.00g 羟丙基甲基纤维素溶液在搅拌下加到 40.00g 初始 Pickering 乳液中。然后将含有羟丙基甲基纤维素溶液的 Pickering 乳液与 8.00g 抛射剂加入铝单片罐中。

[0152] 泡沫的形成：

[0153] 通过合适的带有泡沫涂布器的阀将泡沫制剂从加压容器放出形成稳定的具有微小气泡的膏霜状泡沫。该膏霜状泡沫的结构维持足够的持续时间以便将泡沫均匀分布在皮肤上。