



[12] 发明专利申请公开说明书

[21]申请号 94116030.0

[51]Int.Cl⁶

A61K 47/00

[43]公开日 1995年10月11日

[22]申请日 94.9.30

[30]优先权

[32]93.10.4 [33]FR[31]9311802

[71]申请人 莱雅公司

地址 法国巴黎

[72]发明人 D·肯道 P·西蒙

[74]专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 田舍人 吴大建

A61K 9/107 A61K 7/48

A61K 7/06 A61K 7/04

说明书页数:

附图页数:

[54]发明名称 可用于化妆品和皮肤病学的凝胶状外观
不含胶凝剂的有机聚硅氧烷组合物

[57]摘要

本发明涉及一种凝胶状外观的组合物，它含有由至少75%有机聚硅氧烷组成的油相，用仅由至少一种蔗糖酯组成的乳化剂将上述油相分散于至少含25%水的水相中。

(BJ)第 1456 号

权 利 要 求 书

1. 一种具有凝胶状外观且不含胶凝剂的组合物，它含有至少由75%有机聚硅氧烷组成的油相，使用至少一种蔗糖酯组成的乳化剂将上述油相分散于至少含有25%水的水相中。

2. 根据权利要求1的组合物，其特征在于所述蔗糖酯选自饱和或不饱和的 C_7-C_{22} 直链或支链脂肪酸与蔗糖形成的酯。

3. 根据权利要求1的组合物，其特征在于所述蔗糖酯选自饱和或不饱和的 $C_{12}-C_{22}$ 直链或支链脂肪酸和蔗糖形成的酯。

4. 根据权利要求1的组合物，其特征在于所述酯选自一、二、三和四酯以及含占酯总重量30-95%单酯的聚酯。

5. 根据权利要求1的组合物，其特征在于它含有电解质。

6. 根据权利要求1的组合物，其特征在于它含有选自下列物质的电解质：

- 吡咯烷酮甲酸钠；

- 3, 3'-(1, 4-苯二亚甲基)双[7, 7-二甲基-2-氧代二
环[2.2.1]庚烷-1-甲磺]酸的钠盐；

- 水杨酸盐及其衍生物；

- α -羟基酸盐。

7. 根据权利要求1的组合物，其特征在于所述有机聚硅氧烷选自：环二甲基硅氧烷，聚二甲基硅氧烷，聚烷氧基硅氧烷，聚烷基硅氧烷，聚羟基硅氧烷以及聚苯基硅氧烷。

8. 根据权利要求1的组合物，其特征在于除了电解质外它还至少含有一种添加剂。

9. 根据权利要求8的组合物，其特征在于除电解质之外的添加剂选自助乳化剂，稳定剂，抗氧化剂，保藏剂，染料，颜料和香料。

10. 根据权利要求1的组合物，其特征在于它含有以下物质(重量)：

- 5-50%油相；
- 1-20%蔗糖酯；
- 30-94%水相；
- 0-5%添加剂。

11. 根据权利要求1的组合物，其特征在于它含有以下物质(重量)：

- 15-35%水相；
- 3-8%蔗糖酯；
- 54-81%水相；
- 0-5%添加剂。

12. 根据权利要求5组合物，其特征在于所述电解质用量为0.01-1%(重量)。

13. 根据权利要求8的组合物，其特征在于所述添加剂含有浓度为组合物总重量0.1-0.3%的天然的聚多糖。

14. 具有胶状外观且不含胶凝剂的组合物，它由下列物质组成(重量)：

- 5-50%油相，由至少75%有机聚硅氧烷组成，分散于水相中；
- 1-20%作为乳化剂的蔗糖酯；
- 30-93.9%水相；
- 0.1-1%由3, 3'-(1, 4-苯二亚甲基)双[7, 7-二甲基-2-氧代二环[2.2.1]庚烷-1-甲磺]酸的钠盐组成的电解质。

15. 根据权利要求1的组合物用于头发、指甲、头皮和/或睫毛的美容处理。

16. 使用权利要求15的组合物以得到对皮肤和头皮进行皮肤病学

有治疗效果的乳剂。

可用于化妆品和皮肤病学的凝胶状外观不含 胶凝剂的有机聚硅氧烷组合物

本发明涉及一种有光泽、凝胶状外观且不含胶凝剂的有机聚硅氧烷组合物。

该组合物构成一可选赋形剂，使往常用于凝胶外观生产中不能与胶凝剂并存的物质结合在一起。

该组合物可作为乳剂生产的主要组成成分，应用于许多领域，特别是在美容学、皮肤病学、制药学等领域。

本发明尤其着重用于皮肤，面部和身体，一般包括指甲、头皮和睫毛的护理和美容乳剂。

已经有既是化妆品和皮肤用品的又是药物的产品，它们都是水包油(O/W)乳胶。根据原料(乳化剂、脂肪质、多元醇聚合物以及其它亲水性原料等等)选择的不同，这些分散体系可以是不同特性的乳剂的形式：较稠或较稀，较有光泽或较暗淡，较胶凝或较稀散。

为了获得一种从感官(其“感觉”)和视觉(其外观)上都舒适的乳剂，更多的是寻找有光泽和凝胶状的外观而不是软粘和暗淡的外观。为了做到这一点，习惯上用胶凝剂(也称为增稠剂)，使之并入乳胶的连续水相中，将其稠性传给乳脂。传统使用的大多数胶凝剂为Carbomers(CTFA)型的羧乙烯聚合物，用碱(氢氧化钠或三乙醇胺)中和。

然而在这些乳剂组合物中必须含有不可缺少的某些特定原料，由于不相容的缘故而不能使用上述胶凝剂。

例如我们知道电解质(无机和有机盐)与中和的羧乙烯聚合物性

质相反，因为电解质“破坏”了乳胶甚至使之液化。

如今，大量用于凝胶状外观O/W型乳胶的原料全部都是电解质或可包括大量电解质的不同化合物的混合物。

因此，含有羧乙烯聚合物和电解质的配方缺乏粘性，而且其外观致使它们不适宜用于上述领域中。

同样的问题也出现在除了电解质外的其它化合物上，显示了与这些羧乙烯聚合物胶凝剂的不相容性。

一个解决办法包括用多糖类型的胶凝剂如纤维素、瓜尔豆和合成生物聚合物的自然树脂以代替羧乙烯聚合物胶凝剂。

然而为了获得与羧乙烯聚合物类型的胶凝剂相等的稠度，必须加入大量的胶凝剂以提高乳胶的粘性，而这一点在上述应用中是令人讨厌的事，因为当凝胶状外观的乳脂用于皮肤、头发等时会变得很粘。

另外，根据文献US-A-5013715还知道，为了生产化妆膏必须生产一种面团状和暗淡外观的无水基体，该基体由单独使用或与环状聚二甲基硅氧烷(PDMS)和/或链状PDMS混合的甲基苯基聚硅氧烷型的有机聚硅氧烷液体油和蔗糖酯组成。据称该酯具有亲脂性因为为了与液体有机聚硅氧烷相容其羟基数少于200。

向这个无水软膏添加水的结果是所得组合物很难用于皮肤。

根据文献EP-A-158108我们也知道，通过将水加到含有油相、洗涤乳化剂以及蔗糖酯的洗涤剂的无水组合物中可以生产O/W乳胶。

这些乳胶为低粘度的乳状膏，很难用于皮肤和头发。

因而仍要求凝胶状组合物没有已知配制品所遇到的缺陷，特别是软粘的粘性，不稳定，暗淡外观，触觉上的不舒适，粘性的效果，令人不满意的扩散以及与特定化合物的不相容。

本发明人现已发现一种凝胶状外观、不含胶凝剂且可克服上述缺陷的组合物。

该组合物含有由至少75%有机聚硅氧烷组成的油相，使用至少由一种蔗糖酯组成的乳化剂将上述油相分散于至少含有25%水的相中。

本发明中“凝胶状外观”组合物意指任何有特定粘度、在自重下不流动以及粘性大于或等于1 Pa.s的乳剂产品。

该水包油组合物的优点在于将一种或多种在化妆和/或皮肤病学和/或制药学角度有着活性性能的亲水型添加剂引入相中，而不改变其凝胶状特性。

这些亲水型活性剂主要是电解质。

“电解质”意指有机或无机酸与有机或无机碱形成的有机或无机盐。

因此本发明的组合物优点在于它含有以下物质(重量)：

—5—50%油相；

—1—20%蔗糖酯；

—30—94%水相；

—0—5%添加剂。

更优选地，该组合物含有(重量)：

—15—35%油相；

—3—8%蔗糖酯；

—54—81%水相；

—0—5%添加剂。

根据本发明，所采用的电解质或电解质混合物的量为组合物总重量的0.01-1%。

令人惊异的是，本发明组合物的凝胶状外观不会因电解质或任何与传统羧乙烯型胶凝剂如铵盐和咪唑啉盐以及特定保护剂如二(4-脒基苯氧基)-1,6-正己烷二羟乙基磺酸盐之类不相容的物质的导入而受到干扰。

所述亲水型活性剂如电解质选自：水合剂，抗UV-A、抗UV-B和抗UV-C滤料，角蛋白溶解剂，抗老化剂，防皱剂，抗氧化剂，脱色剂，脂调节剂，消炎剂，清凉剂，瘢痕剂，抗菌剂，抗真菌剂，防汗剂，消除头皮屑剂，永久波(Permanent wave)减少剂，洗发剂，营养剂和成膜剂(重组剂，拉紧剂以及增塑剂)。

所述电解质优选选自钠盐如用作水合剂的吡咯烷酮甲酸钠，用作抗UV-A阳光过滤剂的3,3'-(1,4-苯二亚甲基)双[7,7-二甲基-2-氧代二环[2.2.1]庚烷-1-甲磺]酸的钠盐、咪唑啉或镁盐，水杨酸盐以及如那些在文献EP-A-378936所述的用作抗老化剂的衍生物盐，和 α -羟基酸盐如那些见述于文献US-A-4380549或WO 92/18116中用作干枯皮肤护理或延迟其老化如铵盐。

根据本发明一优选方面所述有机聚硅氧烷选自：环二甲基硅氧烷如环五二甲基硅氧烷，不同粘度的聚二甲基硅氧烷如Dow Corning公司所售的DC液体200-12500cSt(2×10^{-2} -1.2 m²/s)或Goldschmidt公司所售的Abil 10，聚烷氧基硅氧烷如Goldschmidt公司所售的聚硬脂氧基二甲基硅氧烷Abil Wax 2434，聚烷基硅氧烷如Goldschmidt公司所售的聚鲸蜡基甲基硅氧烷Abil Wax 9801，聚羟基硅氧烷如Dow Corning公司的Q2-1403液体，聚苯基硅氧烷如Rhône-Poulenc公司所售的聚苯基甲基硅氧烷Silbione 70641 V200或Goldschmidt公司的聚苯基三甲基硅氧烷Abil AV 20。

所述有机聚硅氧烷的烷基或烷氧基团一般含有12-22个碳原子。

油相剩余部分含有任何类型的无机、有机、植物或合成油。所用的油为本领域技术人员所公知，如烛果油(参见文献US-A-4661343)，扁桃油，杏油合成全氢化角鲨烯和脂肪酸与C₇-C₃₀醇形成的酯如软脂酸2-乙基己酯和肉豆蔻酸异丙酯。

根据本发明的另一个优选的方面，所述蔗糖酯选自：饱和或不饱

和的直链或支链的 C_7-C_{22} 最好是 $C_{12}-C_{22}$ 的脂肪酸与蔗糖形成的酯，所述脂肪酸，例如附于果糖残基的 C_2 和/或 C_3 和/或 C_5 和/或 C_6 位置上的蔗糖单元上，和/或葡萄糖残基的 C_2 和/或 C_3 和/或 C_4 和/或 C_6 位置上的蔗糖单元上。

这些酯优选自一、二、三和四酯以及含有占酯总重量30-95%的单酯的聚酯。

所述蔗糖酯优点在于它具有的羟基数足以赋予它明显的亲水性质。

根据本发明的蔗糖酯，例如那些Crodesta公司所售的F160，F140，F90，F70和SL40，分别指由下列比例组成的蔗糖硬脂酸酯：73%单酯和27%二、三酯；61%单酯和39%二、三、四酯；52%单酯和48%二、三、四酯；45%单酯和55%二、三、四酯、39%单酯和61%二、三、四酯和蔗糖月桂酸酯。为获得所需的稠度也可以不同百分比混合这些不同的产品。

也可以使用那些Mitsubishi公司所售的Ryoto糖酯，例如B370，对应于由20%单酯和80%二三酯—聚酯组成的蔗糖山俞酸酯。优选该化合物与上述蔗糖酯组合。

根据本发明的组合物除了电解质外还可包含一种或多种添加剂。

该添加剂可以选自本领域技术人员公知的试剂，例如助乳化剂如 $C_{12}-C_{22}$ 脂肪醇或甘油一酸酯或甘油二酸酯，乳化稳定剂如聚糖聚合物，低剂量(0.1-0.3%)，抗氧化剂(维生素或其酯)，保藏剂，染料，颜料，香料，水合剂如多元醇(甘油或山梨醇)以及二元醇(丁二醇或己二醇)，氨基酸和其衍生物等等。

这些添加剂通常在每种添加剂允许的浓度下使用，特别取决于其溶解度。一般所述添加剂的用量为0.05-5%。

根据本发明一特别优选的方面，所述凝胶状外观的不含胶凝剂的组合物由以下物质组成(按重量计)：

- 5—50%油相，由至少75%分散于水相中的有机聚硅氧烷组成；
- 1—20%用作乳化剂的蔗糖酯；
- 30—93.9%水相；
- 0.1—1%由3, 3'-(1, 4-苯二亚甲基)双[7, 7-二甲基-2-氧代二环[2.2.1]庚烷-1-甲磺酸]的钠盐组成的电解质。

本发明也涉及上述组合物用于皮肤、指甲、头皮以及睫毛的美容处理。

本发明的另一主题是用该组合物获取用来对皮肤和头皮进行皮肤处理的乳剂。

本发明现将通过下面实施例和相反例来充分描述其目标和特征，但不意味有任何局限性。

在实施例中，采用以下的实验程序：首先将所述蔗糖酯引入可能含有亲水性添加剂（例如电解质）的水中，接着在60—70℃中速搅拌15—45分钟。当酯完全溶解后，通过引入预先加热到60℃并可能含有亲脂性添加剂油相的水相中，然后用一台“Moritz”型混合机强烈搅拌、剪切5—15分钟，同时还保持加热而得到乳剂。最后了为使乳液脱气，在中速搅拌（用一台装有螺旋桨叶的混合器）下使之降到室温。

结果我们得到了一种有光泽的、凝胶状外观且粘度大于1Pa.s的乳剂。

下面以重量百分数给出所述的组合物的组成。

实施例1

| | |
|------------------------|-------|
| 蔗糖棕榈酸硬脂酸酯—CRODESTA F70 | : 6 |
| (45%单酯, 55%二三酯) | |
| 山箭醇(助乳化剂) | : 2.5 |

| | |
|--|---------|
| 聚二甲基硅氧烷(Dow Corning 的Fluid 200-10 cSt) | : 25 |
| BHA, BHT(抗氧化剂) | : 0.8 |
| 对羟基苯甲酸甲酯 (保藏剂) | : 0.4 |
| 水 | : 加至100 |

所得无油乳剂为不粘连的、舒适的、可用于润滑皮肤的类型。

实施例2:

| | |
|---|---------|
| 蔗糖棕榈酸硬脂酸酯CRODESTA F70 (45%单酯, 55%二三酯) | : 8 |
| 聚二甲基硅氧烷(Dow Corning 的Fluid 200-200cSt) | : 7 |
| 环五二甲基硅氧烷(Dow Corning 的Fluid 245) | : 5 |
| 聚硬脂氧基二甲基硅氧烷 (Abil Wax 2434-Goldschmidt 公司产) | : 3 |
| 液体烛果油(油状) | : 3 |
| BHA, BHT | : 0.4 |
| 咪唑烷基脲 | : 0.05 |
| 水 | : 加至100 |

所得乳剂具有光泽和凝胶状外观, 很易用于皮肤上并可用于干性皮肤的护理。

实施例3：

| | |
|---|---------|
| 蔗糖棕榈酸硬脂酸酯CRODESTA F50 | : 4 |
| (20%单酯, 80%二三聚酯) | |
| 蔗糖月桂酸酯SL 40 CRODESTA | : 4 |
| 十六烷基醇(助乳化剂) | : 0.5 |
| 13%聚二甲基硅氧烷醇- 87% | : 4 |
| 聚乙甲基硅氧烷5cSt (Dow Corning 公司的Q2-1403 Fluid) | |
| 聚苯基甲基硅氧烷 | : 15 |
| (Silbione 70641 V200-Rhone Poulenc公司) | |
| 环五二甲基硅氧烷 | : 20 |
| BHA, BHT | : 0.2 |
| 对羟基苯甲酸甲酯 | : 0.1 |
| 水 | : 加至100 |

这种乳剂具有光泽和凝胶状外观，可作干性皮肤类型的护理。

实施例4：

| | |
|--|-------|
| 蔗糖山萘酸酯(Mitsubishi公司 的Ryoto糖酯 B370) | : 2 |
| (20%单酯, 80%二三聚酯) | |
| 蔗糖硬脂酸酯CRODESTA F160 | : 2.5 |
| (73%单酯, 27%二三酯) | |
| 67%聚二甲基硅氧烷- 33% | : 3 |
| 三甲基甲硅烷氧基硅酸酯 (Dow Corning公司的Fluid 200-100cSt) | |

| | |
|----------------------------------|---------|
| 聚二甲基硅氧烷 | : 10 |
| (Dow Corning公司的Fluid 200-100cSt) | |
| 棕榈酸2-乙基己酯(油状) | : 5 |
| 羟丙基铵瓜尔胶氯化物 | : 0.1 |
| (稳定剂) | |
| BHA, BHT | : 0.4 |
| 咪唑烷基脲 | : 0.25 |
| 水 | : 加至100 |

实施例5:

将由含量为组合物总重量1%的吡咯烷酮甲酸钠组成的电解质加到实施例1的组合物中。得到一种凝胶状外观、可用于滋润皮肤的乳剂。

对照例:

以相同的比例将NaCl或实施例5的电解质加到含0.5% Goodrich公司所售的“Carbopol”羧乙烯聚合物的水凝胶中，用氢氧化钠中和。可观察到整个组合物全部流体化且其粘度接近水的粘度。结果它不再是我们所寻找的那一类乳剂。

实施例6:

将0.7%抗UV-A滤料，即3, 3'-(1, 4-苯二亚甲基)双[7, 7-二甲基-2-氧代二环[2.2.1]庚烷-1-甲磺]酸的钠盐加到实施例1的组合物中。

因此而得到一种有光泽和凝胶状外观的防晒乳剂。

实施例7:

用二(4-脒基苯氧基)-1,6-己烷二羟基乙磺酸盐代替用于实施例2组合物中的保藏剂。乳剂的外观保持不变。