



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 109310610 B

(45) 授权公告日 2021.11.02

(21) 申请号 201780035451.0

赵蔚 杨晓霞 王晓丽

(22) 申请日 2017.05.22

(74) 专利代理机构 永新专利商标代理有限公司

72002

(65) 同一申请的已公布的文献号

代理人 柴丽敏

申请公布号 CN 109310610 A

(51) Int.CI.

A61K 8/58 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

A61K 8/895 (2006.01)

C08G 77/00 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

(43) 申请公布日 2019.02.05

(30) 优先权数据

16179928.3 2016.07.18 EP

(66) 本国优先权数据

PCT/CN2016/085386 2016.06.10 CN

(56) 对比文件

CN 101980749 A, 2011.02.23

CN 105491993 A, 2016.04.13

CN 103889509 A, 2014.06.25

US 2005244351 A1, 2005.11.03

WO 9818849 A1, 1998.05.07

US 2008206172 A1, 2008.08.28

(73) 专利权人 联合利华知识产权控股有限公司

审查员 蔡振和

地址 荷兰鹿特丹

(72) 发明人 孟晟 A·M·默里 宋文会 袁苏

权利要求书2页 说明书20页

(54) 发明名称

个人护理组合物

(57) 摘要

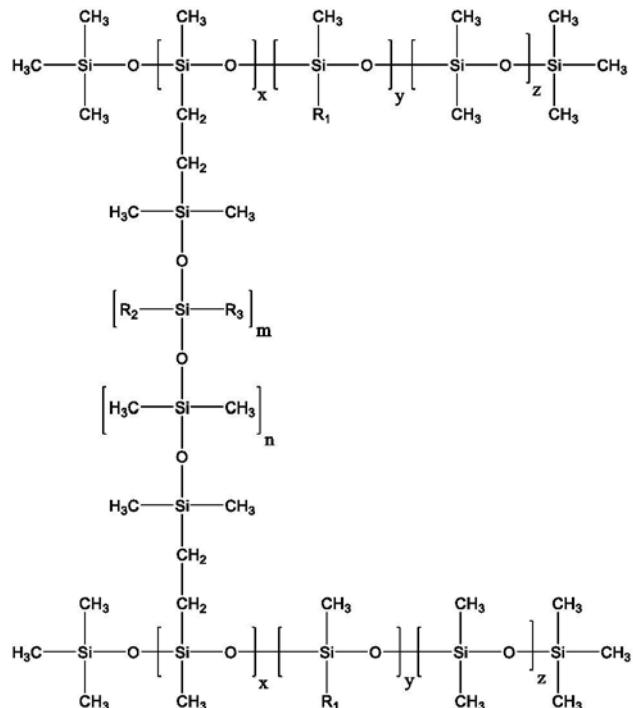
本发明公开了一种个人护理组合物，其包含硅酮弹性体和溶剂的共混物；和化妆品可接受的载体；其中所述溶剂是选自八甲基环四硅氧烷、十甲基环五硅氧烷、十二甲基环六硅氧烷、甲基三甲硅油和二甲硅油的共混物及它们的混合物的挥发性硅油；其中所述硅酮弹性体具有式I的化学结构。所述组合物可另外任选地包含有机防晒剂。本发明公开了提供皮肤护理益处特别是光防护的方法，其包括将所述组合物局部地施加至所述皮肤。

1. 防晒组合物, 其包含:

- (i) 硅酮弹性体和溶剂的共混物; 和
- (ii) 化妆品可接受的载体;

其中所述溶剂是选自八甲基环四硅氧烷、十甲基环五硅氧烷、十二甲基环六硅氧烷、甲基三甲硅油和二甲硅油的共混物以及它们的混合物的挥发性硅油; 和

其中所述硅酮弹性体具有式I的化学结构,



### 式 I 的化合物

其中:

每个R<sub>1</sub>独立地是C<sub>4-36</sub>烷基链;

每个R<sub>2</sub>独立地是苯基或CH<sub>3</sub>;

每个R<sub>3</sub>独立地是苯基; 和

每个x独立地是3至100的整数; 每个y独立地是1至100的整数; 每个z独立地是1至100的整数; 每个m独立地是1至100的整数; 和每个n独立地是4至1000的整数。

2. 如权利要求1所述的组合物, 其中在式I中, 每个R<sub>1</sub>独立地是C<sub>8-18</sub>烷基链。

3. 如权利要求1所述的组合物, 其中在式I中, 每个x独立地是3至20的整数; 每个y独立地是1至20的整数; 每个z独立地是6至50的整数; 每个m独立地是5至30的整数; 和每个n独立地是40至500的整数。

4. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物, 其包含0.1至30重量%的有机防晒剂。

5. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物, 其中所述组合物基本上不含有机防晒剂。

6. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物, 其包含0.1至10重量%的有机防晒剂, 其中所述防晒剂是UV-A防晒剂。

7. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物, 其包含0.1至20重量%的有机防晒剂,

其中所述防晒剂是UV-B防晒剂。

8. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述挥发性硅油是十甲基环五硅氧烷。

9. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述硅酮弹性体的R<sub>1</sub>是C<sub>12</sub>烷基。

10. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述硅酮弹性体的R<sub>2</sub>是苯基。

11. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述硅酮弹性体的烷基摩尔含量为0.01至0.99。

12. 如权利要求11所述的组合物,其中所述硅酮弹性体的烷基摩尔含量为0.02至0.20。

13. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述硅酮弹性体的苯基摩尔含量为0.01至0.50。

14. 如权利要求13所述的组合物,其中所述硅酮弹性体的苯基摩尔含量为0.03至0.34。

15. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述硅酮弹性体和溶剂的共混物包含量为所述共混物的1至70重量%的硅酮弹性体。

16. 如权利要求15所述的组合物,其中所述硅酮弹性体和溶剂的共混物包含量为所述共混物的5至50重量%的硅酮弹性体。

17. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述硅酮弹性体和溶剂的共混物包含重量比为1:20至2:1的硅酮弹性体和溶剂。

18. 如权利要求17所述的组合物,其中所述硅酮弹性体和溶剂的共混物包含重量比为1:15至1:1的硅酮弹性体和溶剂。

19. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述组合物包含其量为总组合物的0.1至60重量%的硅酮弹性体和溶剂的共混物。

20. 如权利要求19所述的组合物,其中所述组合物包含其量为总组合物的1至40重量%的硅酮弹性体和溶剂的共混物。

21. 如前述权利要求1-3中任一项所述的组合物,其中所述组合物还包含润肤油。

22. 提供皮肤护理益处的非治疗目的的方法,其包括将如权利要求1-21中任一项所述的个人护理组合物局部施加于有需要的个体的皮肤的步骤。

## 个人护理组合物

### 技术领域

[0001] 本发明涉及一种个人护理组合物,尤其是具有改善的稳定性和良好的感官特性的包含硅酮弹性体的个人护理组合物。

### 背景技术

[0002] 硅酮弹性体广泛用于个人护理产品,以提供所需的感官特性。如本文所用的,硅酮弹性体是指硅酮聚合物的交联颗粒,其在溶剂中显著溶胀,形成表现为粘弹性软固体的空间填充材料。通常,硅酮弹性体以硅酮弹性体和溶剂的共混物形式使用,其为硅酮弹性体在溶剂中的分散体。大多数常规的硅酮弹性体是既不含亲水部分也不含疏水部分的硅氧烷,这导致与许多有机油(包括有机防晒剂)的相容性差。大多数常规的硅酮弹性体可以与溶剂形成凝胶,但是当将其加入到组合物的油相中时,可能由于常规硅酮弹性体与有机油的相容性差,难以在不具有任何其他增稠剂的条件下制备稳定的组合物。硅酮弹性体和溶剂的共混物的结构可能崩塌,这使其在提供所需的感官特性方面失效。组合物的粘度会降低,最终会变得不稳定。

[0003] 本发明人现已出人意料地发现,功能性硅酮弹性体比常规硅酮弹性体具有更好的结构益处,所述功能性硅酮弹性体是通过将疏水和/或亲水基团接枝到弹性体的骨架上而改性的硅酮弹性体。用于本发明的功能性硅酮弹性体是烷基修饰的、苯基修饰的和/或双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体。特别地,双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体显示出最佳的结构化益处,提供具有增强的稳定性和所需的感官特性的个人护理组合物。

[0004] 太阳辐射包括紫外(UV)辐射。重要的紫外波长区域是320至400nm的UV-A区域和290至320nm的UV-B区域。已知UV-B辐射是高能量放射,其可以对活组织和细胞造成显著损害,尤其是在长期和累积的暴露下,它导致晒伤、黑素瘤和皱纹形成。近年来,发现UV-A辐射也会导致皮肤损伤。UV-A辐射比先前已知的辐射更深地渗透到皮肤中,其可以对位于皮肤深处的弹性蛋白纤维造成损害,从而加速皮肤老化。因此,人们希望保护他们的皮肤免受有害的UV-A和UV-B辐射。通常,UV-A和UV-B防晒剂都包含在防晒组合物中以提供对宽范围的UV辐射的保护。

[0005] 为了提供具有高防晒系数(SPF)和UV-A防护系数(UVAPF)的防晒组合物,一种方法是掺入高水平的UV-A和UV-B防晒剂。然而,当将高含量的防晒剂掺入包含硅酮弹性体的组合物中时,由于两者之间的相容性差,难以获得稳定的组合物。硅酮弹性体和溶剂的共混物的结构可能崩塌,这使其在提供所需的感官特性方面失效。

[0006] 另外,防晒组合物可进一步包含润肤油,如辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯,来充当共溶剂,以便更好地分散UV-A防晒剂。然而,辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯是硅酮弹性体的不良溶剂,其也将导致硅酮弹性体和溶剂的共混物的结构崩塌。

[0007] 开发了不同的方法来改善硅酮弹性体和有机油之间的相容性,包括优化溶剂/弹性体共混物、添加或改变溶剂和/或添加改性的聚二甲硅油聚合物。然而,这些方法不能提供令人满意的感觉并且成本效率低。

[0008] 开发使产生优异的感官益处的包含硅酮弹性体的防晒组合物稳定的方法越来越受到关注。

[0009] 本发明人现已出人意料地发现,通过使用功能性硅酮弹性体可以改善硅酮弹性体和有机油之间的相容性,所述功能性硅酮弹性体是通过将疏水和/或亲水基团接枝到弹性体的骨架上而改性的硅酮弹性体。用于本发明的功能性硅酮弹性体是烷基修饰的、苯基修饰的和/或双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体。已经发现,所述功能性硅酮弹性体显示出与有机防晒剂的改善的相容性。特别地,双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体显示出与有机防晒剂的最佳相容性,从而提供具有增强的稳定性和所需的感官特性的防晒组合物。另外,还出人意料地发现双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体也显示出与作为共溶剂的润肤油的优异相容性。

## 发明内容

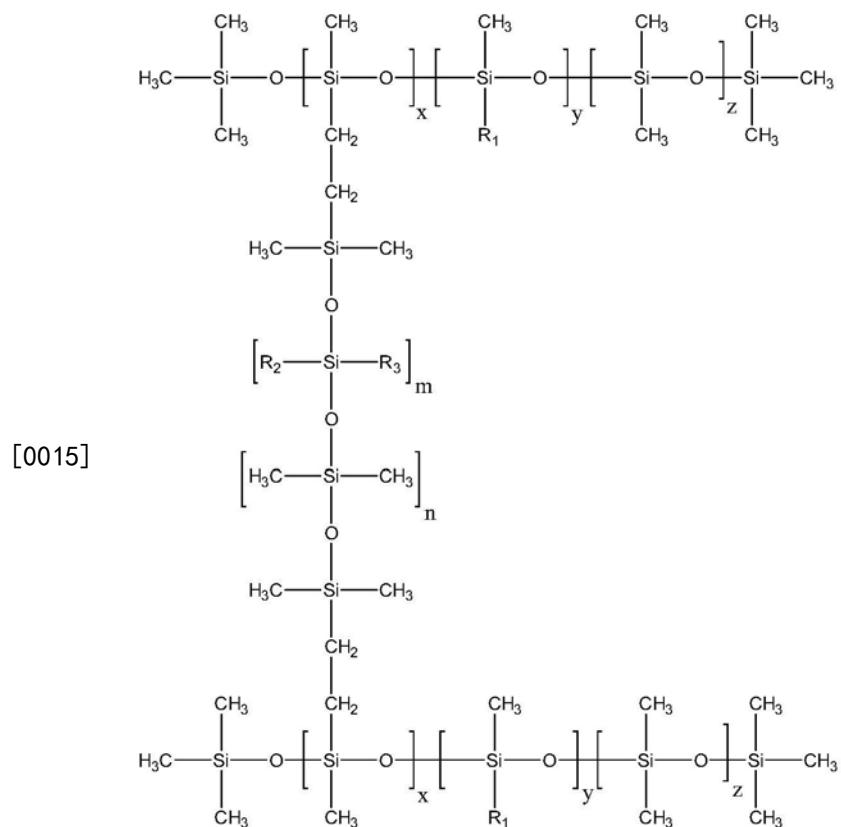
[0010] 在第一方面,本发明涉及一种个人护理组合物,其包含:

[0011] i) 硅酮弹性体和溶剂的共混物;和

[0012] ii) 化妆品可接受的载体;

[0013] 其中所述溶剂是选自八甲基环四硅氧烷、十甲基环五硅氧烷、十二甲基环六硅氧烷、甲基三甲硅油和二甲硅油的共混物以及它们的混合物的挥发性硅油;和

[0014] 其中所述硅酮弹性体具有式I的化学结构,



式 I 的化合物

[0016] 其中:

[0017] 每个R<sub>1</sub>独立地是C<sub>4-36</sub>烷基链,优选C<sub>8-18</sub>;

[0018] 每个R<sub>2</sub>独立地是苯基或CH<sub>3</sub>；

[0019] 每个R<sub>3</sub>独立地是苯基；和

[0020] 每个x独立地是3至100、优选3至20的整数；每个y独立地是1至100、优选1至20的整数；每个z独立地是1至100、优选6至50的整数；每个m独立地是1至100、优选5至30的整数；和每个n独立地是4至1000、优选40至500的整数。

[0021] 在第二方面，本发明涉及包装的个人护理产品，其包含本发明第一方面的个人护理组合物。

[0022] 在第三方面，本发明涉及使用本发明第一方面的任何实施方案的个人护理组合物来提供皮肤护理益处的方法。

[0023] 考虑到下面的详细描述和实施例，本发明的所有其他方面将更容易变得清楚。

[0024] 除了在实施例中或另外明确指出之外，本说明书中表示材料的量或反应条件、材料的物理性质和/或用途的所有数值可任选地理解为由“约”修饰。

[0025] 除非另有说明，否则所有量均以最终个人护理组合物的重量计。

[0026] 应当注意，在指定任何数值的范围时，任何特定的上限值可以与任何特定的下限值相关联。

[0027] 为避免疑义，“包含”一词旨在表示“包括”但不一定是“由……组成”或“由……构成”。换句话说，列出的步骤或选项不必是穷举的。

[0028] 在此发现的本发明的公开内容被认为涵盖相互多重引用的权利要求中存在的所有实施方案，而不论各权利要求可能不是相互多重引用的或冗余的情况。

[0029] 当针对本发明的特定方面（例如本发明的组合物）公开一项特征时，该公开内容也应被视为准用于适用于本发明的任何其他方面（例如本发明的方法）。

## 具体实施方式

[0030] 已经发现，被烷基、苯基或双（烷基和苯基）基团修饰的功能性硅酮弹性体显示出改进的结构化益处。特别地，双（烷基和苯基）修饰的硅酮弹性体显示出最佳的结构化，从而提供具有增强的稳定性和所需的感官特性的个人护理组合物。

[0031] 现在还发现，被烷基、苯基或双（烷基和苯基）基团修饰的功能性硅酮弹性体显示出与有机防晒剂的改善的相容性。特别地，双（烷基和苯基）修饰的硅酮弹性体显示出与有机防晒剂的最佳相容性，从而提供具有增强的稳定性和所需的感官特性的防晒组合物。另外，出乎意料地发现双（烷基和苯基）修饰的硅酮弹性体也显示出与作为共溶剂的润肤油的优异相容性。

[0032] 除非另有说明，本文所用的烷基摩尔含量是指每摩尔硅酮弹性体单元中烷基取代的二甲硅油单元的摩尔数与二甲硅油单元的总摩尔数之比。

[0033] 除非另有说明，本文所用的苯基摩尔含量是指每摩尔硅酮弹性体单元中苯基取代的二甲硅油单元的摩尔数与二甲硅油单元的总摩尔数之比。

[0034] 本文所用的“个人护理组合物”意指包括用于局部施用于哺乳动物、尤其是人类皮肤的组合物。这种组合物通常可分类为免洗型或冲洗型，但优选为免洗型。将该组合物配制成为用于人体的产品，该产品特别地用于改善外观，还可以提供清洁、气味控制或一般美学。本发明的组合物可以是液体、乳液、乳霜、泡沫剂、磨砂膏、凝胶或爽肤水的形式，或者用器

具或通过面膜或棉片施用。所述组合物的非限制性实例包括免洗型皮肤乳液、乳霜、止汗剂、除臭剂、唇膏、粉底、睫毛膏、免晒美黑霜和防晒乳液。本发明的组合物优选为免洗型组合物。如本文所用的“皮肤”意指包括面部和身体上(例如,颈部、胸部、背部、手臂、腋下、手、腿、臀部和头皮)的皮肤,尤其是指其暴露于阳光的部分。

[0035] 如本文所用的,“防晒组合物”意指包括用于局部施用于哺乳动物、尤其是人类的皮肤和/或毛发的暴露于阳光的区域的组合物。这种组合物通常可分类为免洗型或冲洗型,并且包括施用于人体的还用于改善外观、清洁、气味控制或一般美学的任何产品。它优选是免洗型产品。本发明的组合物可以是液体、精华素、乳液、乳霜、凝胶或爽肤水的形式,并且可以用器具或通过面膜、棉片或贴剂施用。优选地,该组合物是乳液或乳霜的形式。这种组合物的特别优选的实例是免洗型乳霜。如本文所用的,“皮肤”意指包括面部和身体上(例如,颈部、胸部、背部、手臂、腋下、手、腿、臀部和头皮)的皮肤,尤其是指其暴露于阳光的部分。本发明的组合物还与除皮肤之外的人体任何其他角质基质的应用有关,例如毛发,在那里产品可以特别为了提供光保护而配制。

#### [0036] UV防晒剂

[0037] 本发明的组合物包含选自二苯甲酰甲烷衍生物、三嗪衍生物、二苯甲酮衍生物及其混合物的UV-A防晒剂。在优选的实施方案中,UV-A防晒剂包含或者是二苯甲酰甲烷衍生物,例如丁基甲氧基二苯甲酰甲烷(以商品名Parsol 1789出售)。

[0038] 根据本发明的一个优选方面,所述组合物包含0.1至30重量%的有机防晒剂。通常,基于防晒组合物的总重量,本发明的防晒组合物包含0.1至15重量%的UV-A防晒剂,更优选0.1至10%,最优选1至5%,并且包括其中包含的所有范围。

[0039] 本发明的组合物还包含UV-B防晒剂。本发明的合适的UV-B防晒剂选自二苯甲酮、邻氨基苯甲酸酯、水杨酸酯、肉桂酸酯、樟脑、亚苄基丙二酸酯、三嗪酮及其衍生物。在优选的实施方案中,UV-B防晒剂包含或者是肉桂酸酯衍生物,例如甲氧基肉桂酸乙基己酯(以商品名Parsol MCX出售)。

[0040] 通常,基于防晒组合物的总重量,本发明的防晒组合物包含0.1至20重量%的UV-B防晒剂,更优选0.5至18%,最优选1至15%,并且包括其中包含的所有范围。

[0041] 根据本发明的另一方面,所述组合物基本上不含有机防晒剂。

#### [0042] 硅酮弹性体和溶剂的共混物

[0043] 如本文所用的,硅酮弹性体是指硅酮聚合物的交联颗粒,其在溶剂中显著溶胀,形成表现为粘弹性软固体的空间填充材料。通常,硅酮弹性体以硅酮弹性体和溶剂的共混物形式使用,其为硅酮弹性体在溶剂中的分散体。硅酮弹性体和溶剂的共混物是可以通过氢化硅烷化反应制备的交联凝胶。该反应涉及低水平的催化剂,通常是铂衍生物,并且通常进入足够的溶剂中。含有硅-氢键(SiH)(silicone-hydride)的硅酮聚合物与二乙烯基材料反应以连接独立的硅酮链。

[0044] 适用于分散硅酮弹性体的溶剂是低分子量线性或环状硅油。弹性体可以在剪切力下用低分子量硅油溶胀。低分子量硅油优选是挥发性油,但也可以使用非挥发性油。根据本发明的挥发性硅油在25°C下的蒸气压值为2.6-1400Pa。特别优选的挥发性油是含有3-9个硅原子的线性硅氧烷和具有4-6个硅原子的环状硅氧烷,如环戊硅氧烷。

[0045] 在优选的实施方案中,溶剂是挥发性硅油。可用于本发明作为硅酮弹性体溶剂的

挥发性硅油类型的说明性但非限制性实例包括例如六甲基环三硅氧烷、八甲基环四硅氧烷、十甲基环五硅氧烷、十二甲基环六硅氧烷、甲基三甲硅油和二甲硅油的共混物以及它们的混合物等。市售挥发性硅油的实例包括Dow Corning Corporation的等级名称为344、345、244、245和246的油。在优选的实施方案中，挥发性硅油是十甲基环五硅氧烷，其可以商购获得，例如从供应商如Dow Corning Corporation以商品名DC245商购获得。

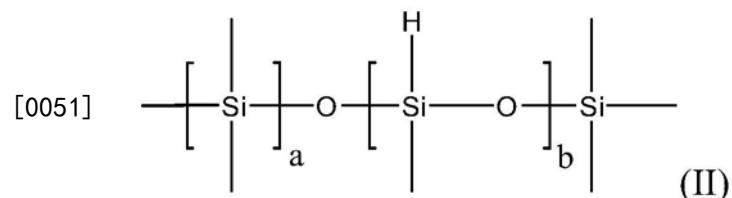
[0046] 在优选的实施方案中，硅酮弹性体和溶剂的共混物是硅酮弹性体和挥发性硅油的共混物。

[0047] 通常，硅酮弹性体和溶剂的共混物包含30%至96重量%的溶剂，更优选50%至94%，最优选67%至92%。

[0048] 适用于本发明的硅酮弹性体是功能性硅酮弹性体，其通过将官能团接枝到弹性体的骨架上进行修饰。在特别优选的实施方案中，用于本发明的功能性硅酮弹性体是烷基修饰的、苯基修饰的和/或双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体。

[0049] 烷基修饰的功能性硅酮弹性体可以通过使用氢化硅烷化催化剂从a)含有硅-氢键的聚硅氧烷；b)烯烃；和c)乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷的反应制备。

[0050] 含有硅-氢键的聚硅氧烷具有通式：



[0052] 其中：

[0053] 每个a独立地是0至300、优选5至50的整数；和每个b独立地是2至300、优选5至30的整数；

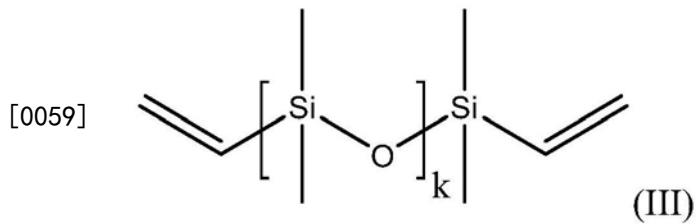
[0054] 本文所用的硅-氢键含量是指每克聚硅氧烷的硅-氢基团的摩尔数。通常，基于聚硅氧烷的总重量，聚硅氧烷的硅-氢键含量为0.016至16.6mM/g，更优选1至10mM/g，最优选3至8mM/g，并且包括包含在其中的所有范围。

[0055] 另外地或备选地，含有硅-氢键的聚硅氧烷的粘度为10至1000厘沱(cSt)，优选20至500cSt，更优选25至150cSt，最优选30至80cSt。

[0056] 可商购的合适的含硅-氢键的聚硅氧烷包括来自AB Specialty Silicones的Andisil XL-10、Andisil XL-11、Andisil XL-15。

[0057] 烯烃是含有至少一个碳-碳双键的不饱和烃。烯烃比相应烷烃(具有相同碳原子数)少两个氢原子，具有通式C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>。优选地，适用于该反应的烯烃具有C<sub>8</sub>至C<sub>18</sub>的碳链长度。可用于该反应的烯烃的说明性但非限制性实例包括例如辛烯、壬烯、癸烯、十一烯、十二烯、十三烯、十四烯、十五烯、十六烯、十七烯、十八烯或其混合物。优选地，烯烃是辛烯、十二烯、十六烯或其混合物。

[0058] 乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷具有通式：



[0060] 其中：

[0061] 每个k独立地是4至1000、优选40至500的整数。

[0062] 乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷含有可用于与含有硅-氢键的聚硅氧烷反应的乙烯基侧基。

[0063] 本文所用的乙烯基含量是指每克乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷的乙烯基摩尔数。通常，基于乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷的总重量，乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷的乙烯基含量为0.05至3mM/g，更优选0.1至1mM/g，最优选0.2至0.8mM/g，并且包括其中包含的所有范围。

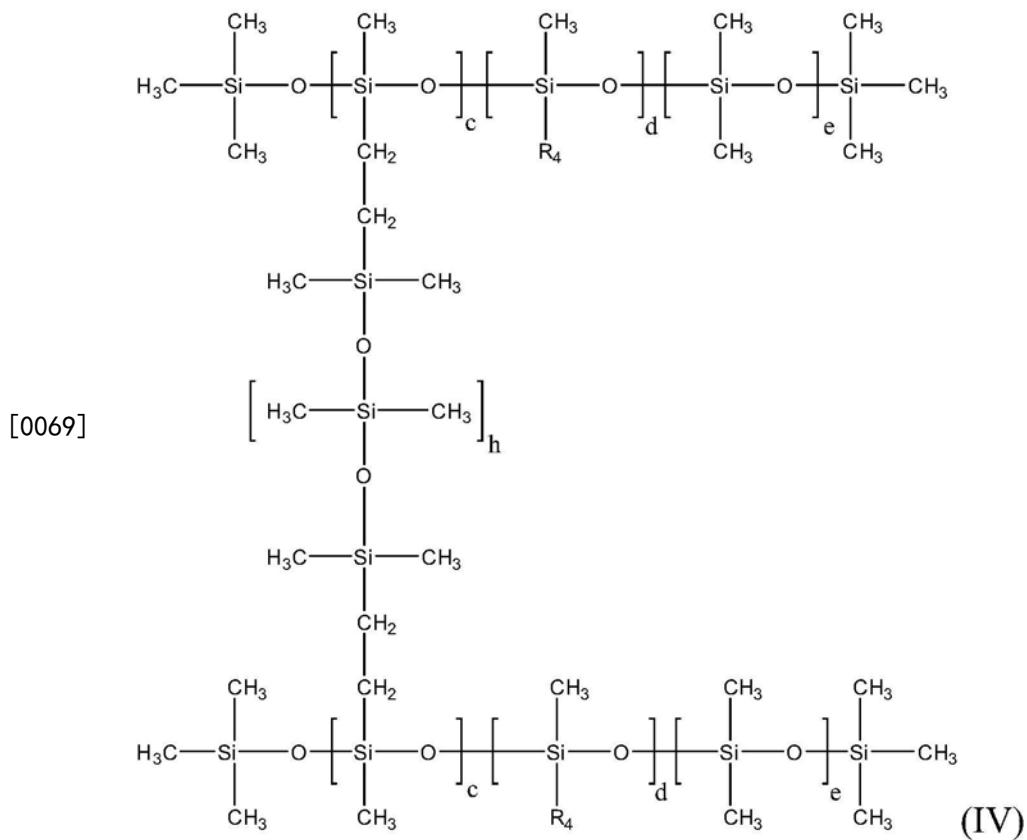
[0064] 另外地或备选地，乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷的粘度为10至1000cSt，优选20至500cSt，更优选50至400cSt，最优选100至250cSt。

[0065] 可商购的合适的乙烯基封端的二甲基硅氧烷包括来自AB Specialty Silicones的Andisil VS-200。

[0066] 在该反应中，烯烃与含有硅-氢键的聚硅氧烷反应形成烷基修饰的聚硅氧烷，其与乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷反应形成烷基修饰的硅酮弹性体。

[0067] 烷基修饰的硅酮弹性体的烷基摩尔含量通常为0.01至0.99，更优选0.02至0.20。

[0068] 在优选的实施方案中，烷基修饰的功能性硅酮弹性体具有通式：



[0070] 其中：

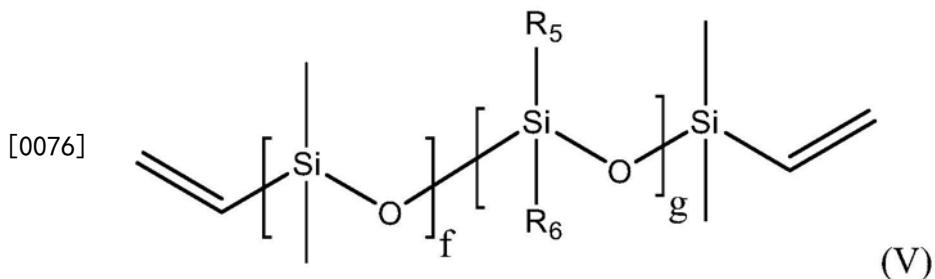
[0071] 每个R<sub>4</sub>独立地是C<sub>4-36</sub>烷基链，优选C<sub>8-18</sub>；和

[0072] 每个c独立地是3至100、优选3至20的整数；每个d独立地是1至100、优选1至20的整数；每个e独立地是1至100、优选6至50的整数；和每个h独立地是4至1000、优选40至500的整数。

[0073] 苯基修饰的功能性硅酮弹性体可以通过使用氢化硅烷化催化剂从a)含有硅-氢键的聚硅氧烷；和b)乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷的反应制备。

[0074] 含有硅-氢键的聚硅氧烷与上述相同。

[0075] 乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷具有通式：



[0077] 其中：

[0078] 每个R<sub>5</sub>独立地是苯基或CH<sub>3</sub>；

[0079] 每个R<sub>6</sub>独立地是苯基；和

[0080] 每个f独立地是4至1000、优选40至500的整数；和每个g独立地是1至100、优选5至30的整数。

[0081] 乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷含有可用于与含有硅-氢键的聚硅氧烷反应的乙烯基侧基。

[0082] 本文所用的苯基摩尔含量是指苯基取代的二甲硅油单元的摩尔数与乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷的二甲硅油单元的总摩尔数之比。通常，乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷的苯基摩尔含量为1-50%，更优选3-30%，最优选7-15%。

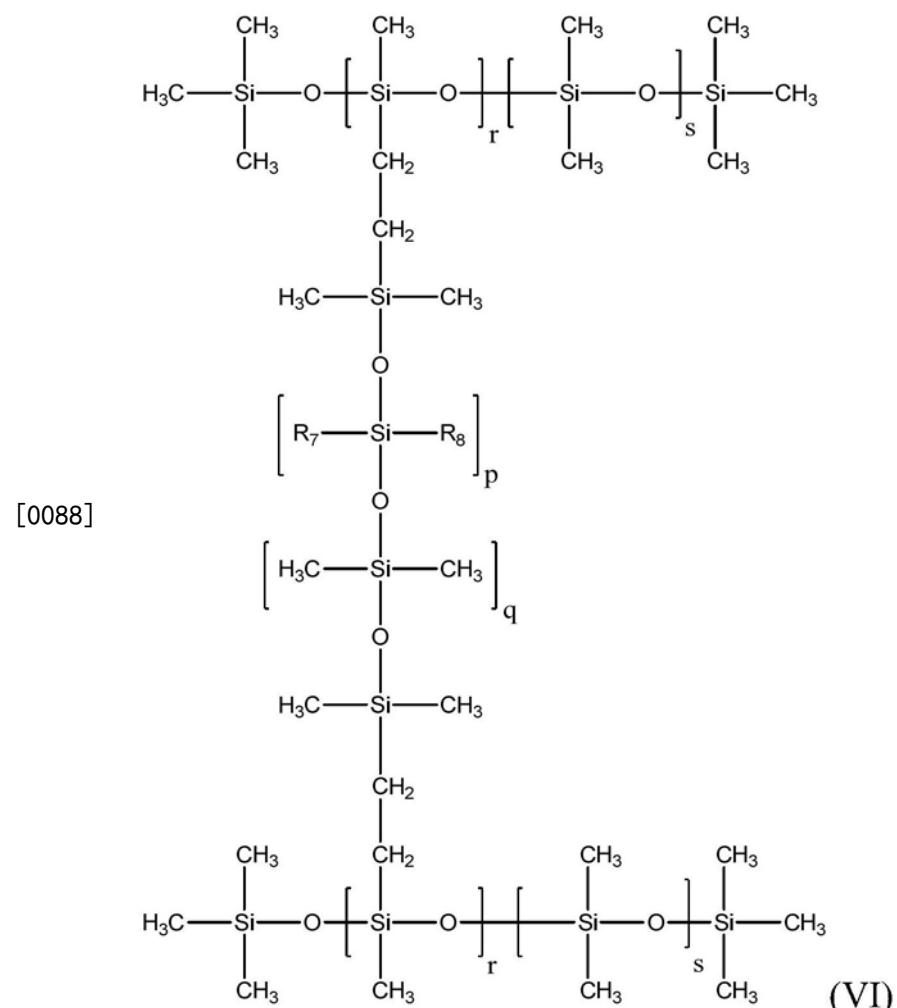
[0083] 另外地或备选地，乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷的粘度为100至10000cSt，优选为500至8000cSt，更优选为800-5000cSt，最优选为1000至2000cSt。

[0084] 可商购的合适的乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷包括来自ABSpecialty Silicones的Andisil SF-2430。

[0085] 优选地，含有硅-氢键的聚硅氧烷和乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷以1:200至200:1，更优选1:50至50:1，最优选1:30至30:1的重量比存在于反应混合物中。

[0086] 苯基修饰的硅酮弹性体的苯基摩尔含量通常为0.01至0.50，优选0.03至0.34。

[0087] 在优选的实施方案中，苯基修饰的功能性硅酮弹性体具有通式：



[0089] 其中：

[0090] 每个R<sub>7</sub>独立地是苯基或CH<sub>3</sub>；

[0091] 每个R<sub>8</sub>独立地是苯基；和

[0092] 每个r独立地是3至100、优选3至20的整数；每个s独立地是2至200、优选7至70的整数；每个p独立地是1至100、优选5至30的整数；和每个q独立地是4至1000、优选40至500的整数。

[0093] 双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体可以通过使用氢化硅烷化催化剂从a)含有硅-氢键的聚硅氧烷；b)烯烃；c)乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷的反应制备。

[0094] 含有硅-氢键的聚硅氧烷、烯烃和乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷与上述相同。

[0095] 双修饰的硅酮弹性体可以通过组合反应物经由两步合成来制备。在第一步中，烯烃与含有硅-氢键的聚硅氧烷反应形成烷基修饰的聚硅氧烷。在第二步中，烷基修饰的聚硅氧烷上的左侧未取代的硅-氢基团与乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷上的乙烯基侧基反应，形成双修饰的硅酮弹性体。

[0096] 对于第一步，反应混合物的温度可以是含有硅-氢键的聚硅氧烷和烯烃可以反应形成烷基修饰的聚硅氧烷的任何合适的温度。优选地，反应混合物的温度为5°C至100°C，更优选10°C至80°C，最优选20°C至60°C。

[0097] 第一步的反应时间为至少5分钟，更优选至少10分钟，最优选20-60分钟。

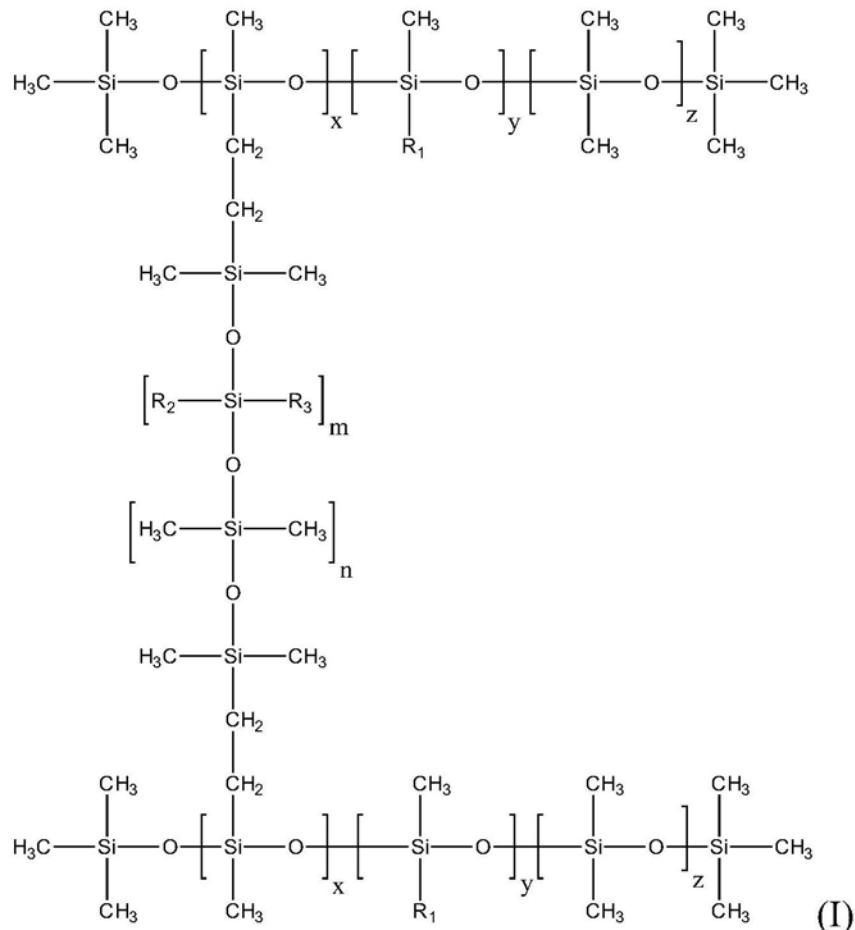
[0098] 对于第二步,反应混合物的温度可以是烷基修饰的聚硅氧烷和乙烯基封端的二甲基苯基聚硅氧烷可以反应形成双修饰的硅酮弹性体的任何合适的温度。优选地,反应混合物的温度为10°C至120°C,更优选20°C至100°C,最优选40°C至80°C。

[0099] 第二步的反应时间为至少1小时,更优选至少2小时,最优选3小时至6小时。

[0100] 双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体的烷基摩尔含量通常为0.01至0.99,更优选0.02至0.20。

[0101] 双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体的苯基摩尔含量通常为0.01至0.50,优选0.03至0.34。

[0102] 在优选的实施方案中,双(烷基和苯基)修饰的硅酮弹性体具有通式:



[0104] 其中:

[0105] 每个R<sub>1</sub>独立地是C<sub>4-36</sub>烷基链,优选C<sub>8-18</sub>;

[0106] 每个R<sub>2</sub>独立地是苯基或CH<sub>3</sub>;

[0107] 每个R<sub>3</sub>独立地是苯基;和

[0108] 每个x独立地是3至100、优选3至20的整数;每个y独立地是1至100、优选1至20的整数;每个z独立地是1至100、优选6至50的整数;每个m独立地是1至100、优选5至30的整数;和每个n独立地是4至1000、优选40至500的整数。

[0109] 通常,硅酮弹性体和溶剂的共混物优选包含1至70重量%的硅酮弹性体,更优选5至50%,最优选8至30%。

[0110] 硅酮弹性体和溶剂的共混物优选包含重量比为1:20至2:1,更优选1:15至1:1,最

优选1:11至1:2的硅酮弹性体和溶剂。

[0111] 通常,基于个人护理组合物总重量,本发明的个人护理组合物包含其量为0.1至60%,更优选1至40%,最优选5至30%的硅酮弹性体和溶剂的共混物,并且包括其中包含的所有范围。

[0112] 其他成分

[0113] 本发明的个人护理组合物可进一步包含充当共溶剂的润肤油。合适的润肤油包括例如烷氧基化芳族醇与脂肪羧酸的酯、聚乙二醇或二醇与脂肪羧酸的酯(如辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯)、脂肪醇和脂肪酸的酯、苄醇的烷氧基化衍生物以及它们的混合物。优选地,润肤油是辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯。

[0114] 通常,基于个人护理组合物总重量,本发明的个人护理组合物包含其量为0.01至10%,更优选0.1至8%,最优选1至6%的助溶剂,并且包括其中包含的所有范围。

[0115] 本发明的个人护理组合物包含化妆品可接受的载体。载体可以是液体或固体材料。通常,载体的存在量为个人护理组合物总重量的10-99.9%,更优选20-95%,最优选40-85%,并且包括其中包含的所有范围。特别优选的是,化妆品可接受的载体包括水。水的含量优选为个人护理组合物总重量的30-90%,更优选30-85%,最优选30-80%。除水外,合适的载体类别还包括硅酮、多元醇、烃、甘油三酯和增稠粉末。

[0116] 本发明的个人护理组合物可以是适合局部施用于皮肤的任何形式,包括爽肤水、乳液、乳霜、摩丝、磨砂膏、精华素或凝胶。个人护理组合物可以是免洗型产品,如润肤乳液、乳霜、止汗剂、除臭剂、唇膏、粉底、睫毛膏、免晒美黑霜和防晒乳液,或冲洗型产品,如洗发剂、护发素、沐浴露和洗手皂。个人护理组合物优选为润肤乳液或乳霜。

[0117] 个人护理组合物可另外包含其他防晒剂,如无机防晒剂。例如,氧化锌、二氧化钛、氧化铁、二氧化硅(如热解法二氧化硅)。这种防晒剂的掺入量优选为个人护理组合物总重量的0.1-5%。

[0118] 皮肤增白剂也可以掺入本发明的组合物中。合适的皮肤增白剂包括维生素B3及其衍生物(例如尼克酸、烟酸、烟酰胺)、曲酸、熊果苷、氨甲环酸、胎盘提取物、抗坏血酸及其衍生物(例如抗坏血酸磷酸镁、抗坏血酸磷酸钠、抗坏血酸葡萄糖苷和抗坏血酸四异棕榈酸酯)、芦荟提取物、乳酸铵、壬二酸、柠檬酸酯、鞣花酸、乙醇酸、绿茶提取物、氢醌、柠檬提取物、亚油酸、维生素(如维生素B6、维生素B12、维生素C、维生素A)、二羧酸、间苯二酚衍生物、羟基羧酸(如乳酸)及其盐(例如乳酸钠)或其混合物。最优选的是烟酰胺。通常,皮肤增白剂的存在量为个人护理组合物总重量的0.1至10%,更优选0.2至5%,最优选0.3至3%,并且包括其中包含的所有范围。

[0119] 个人护理组合物还可包含本领域常用以增强物理性质和性能的其他成分。合适的成分包括但不限于保湿剂、增稠剂、遮光剂、粘合剂、着色剂和颜料、pH调节剂、防腐剂、光学试剂、香料、粘度调节剂、生物添加剂、缓冲剂、调理剂、天然提取物、精油和皮肤有益试剂,包括抗炎剂、清涼剂、止汗剂、抗衰老剂、抗痤疮剂、抗微生物剂和抗氧化剂。

[0120] 本发明还涉及使用所述个人护理组合物来提供增强的皮肤护理益处的方法。

[0121] 提供以下实施例以便于理解本发明。提供这些实施例不意欲限制权利要求的范围。

[0122] 实施例

[0123] 实施例1

[0124] 本实施例证明了功能性硅酮弹性体的结构化益处。所用的基础制剂列于表1中。所有成分均以总制剂的重量百分比表示，并以活性成分的含量表示。

[0125] 表1

[0126]

成分	重量百分比
DC245 <sup>a</sup>	余量
硅酮弹性体/DC245共混物 <sup>b</sup>	表2
PEG-10二甲硅油	1.19
胆固醇	0.20
硬脂酸	0.25
十六醇	0.01
蔗糖二硬脂酸酯	0.13
增稠剂	表2
水	46.38
甘油	7.25
EDTA二钠	0.05
氯化钾	1.00
硫酸镁,七水合物	0.50
烟酰胺	3.00
辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯/E	8.5

[0127] a. DC245是来自Dow Corning的商业十甲基环五硅氧烷。

[0128] b. 硅酮弹性体/DC245共混物选自内部制备的非功能性硅酮弹性体 (NSE) /DC245共混物和双修饰(烷基和苯基)的硅酮弹性体 (DSE) /DC245共混物。

[0129] 硅酮弹性体和溶剂的共混物的制备

[0130] 材料

[0131] 含有硅-氢键的聚硅氧烷 (Andisil XL-10)、乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷 (Andisil VS-200)、乙烯基封端的二甲基二苯基聚硅氧烷 (Andisil SF-2430) 购自AB Specialty Silicones。十甲基环五硅氧烷 (DC245) 购自Dow Corning Corporation。铂催化剂是来自Sigma Aldrich的铂 (0)-1,3-二乙烯基-1,1,3,3-四甲基二硅氧烷络合物在二甲苯中的溶液。所有化学品均未经进一步纯化直接使用。

[0132] 如本文所用的，固体含量是指硅酮弹性体在硅酮弹性体和溶剂的共混物中的重量百分比。

[0133] 非功能性硅酮弹性体/DC245共混物

[0134] 将0.382g Andisil XL-10、12g Andisil VS-200和70g DC245在烧瓶中混合。加入25μL铂络合物催化剂，将反应混合物用回流水保持在45°C，并以200rpm搅拌5小时。在反应完成后，凝胶化的混合物可在45°C下稀释至不同的固体含量。

[0135] 双修饰的硅酮弹性体/DC245共混物

[0136] 将1.02g Andisil XL-10、0.94g十二烯和4g DC245混合并在小瓶中搅拌，然后加入2μL铂络合物催化剂。将混合物在60°C下搅拌30分钟。然后将反应混合物转移到烧瓶中。

向混合物中加入40g DC245、20g Andisil SF-2430和6 $\mu$ L铂络合物催化剂，并将混合物用回流水保持在60℃，并以200rpm搅拌4小时。在反应完成后，凝胶化的混合物可在60℃下稀释至不同的固体含量。

[0137] 方法

[0138] 将凝胶化的混合物(硅酮弹性体和溶剂的共混物)稀释至固体含量为14.5%。通过在基础制剂中添加具有相同量和不同量的增稠剂的硅酮弹性体和溶剂的不同共混物来制备样品。

[0139] 粘度测试

[0140] 使用DV-II+PRO数字粘度计(来自Brookfield Ltd)以TD的针在5rpm的持续剪切速率下测量样品的粘度。该粘度计与PC连接，其中自动程序可以控制测量。使用在25℃的温度下30秒后测量的值。除非另有说明，以厘泊( $cP=mPa \cdot S$ )引用数值。

[0141] 稳定性测试

[0142] 如本文所用的，稳定性是指组合物保持其外观、气味和主要结构，而没有相分离。将样品倒入塑料瓶中并填充至瓶子的2/3。然后将样品在50℃储存于烘箱中。对于稳定性测试，每天检查样品。观察并记录样品的外观。当样品仍然温热时进行观察，然后将样品在烘箱中放置24小时，然后进行另一次观察。

[0143] 幅度扫描流变分析

[0144] 在幅度扫描流变测试中，储能模量和损耗模量代表粘弹性。通常，储能模量(初始G')代表弹性。通常，对于内部的硅酮弹性体，在个人护理应用中，储能模量(初始G')的可接受范围为800Pa至4000Pa。

[0145] 粘度、流变性和稳定性的结果列于表2中。

[0146] 表2

[0147]	样品	硅酮弹性体/DC245 共混物		增稠剂 锂 蒙 脱 石	粘度/cP	G'	稳定性 在 50℃, 4 周
		NSE (12.5%)	DSE (14.5%)				
	1	26.5%		0.27%	51760	1870	稳定
	2		12.7%	0.27%	44240	1270	稳定
	3		15.9%	0.27%	61440	1600	稳定

[0148] 结果

[0149] 可以看出，为了获得具有相似的粘度、弹性和稳定性的制剂，与双功能性弹性体相比，必须添加更多的非功能性硅酮弹性体。因此，双修饰的硅酮弹性体显示出更好的结构化益处。

[0150] 实施例2

[0151] 本实施例证明了在存在有机防晒剂的情况下功能性硅酮弹性体的结构化益处。所用的基础制剂列于表3中。所有成分均以总制剂的重量百分比表示，并以活性成分的含量表示。

[0152] 表3

成分	重量百分比
DC245 <sup>a</sup>	余量
硅酮弹性体/DC245 共混物 <sup>b</sup>	表 4
PEG-10 二甲硅油	1.19
Parsol MCX <sup>c</sup>	6
胆固醇	0.20
二氧化钛	2
云母和二氧化钛	0.5
硬脂酸	0.25
十六醇	0.01
蔗糖二硬脂酸酯	0.13
增稠剂	表 4
水	46.38
甘油	7.25
EDTA 二钠	0.05
氯化钾	1.00
硫酸镁, 七水合物	0.50
烟酰胺	3.00
DMDM 乙内酰脲(和)丁基氨基甲酸碘代丙炔酯	0.2

[0153] [0154] a.DC245是来自Dow Corning的商业十甲基环五硅氧烷。

[0155] b. 硅酮弹性体/DC245共混物选自内部制备的非功能性硅酮弹性体 (NSE) /DC245共混物和双修饰 (烷基和苯基) 的硅酮弹性体 (DSE) /DC245共混物。

[0156] c.Parsol MCX是甲氧基肉桂酸乙基己酯。

#### [0157] 方法

[0158] 使用与实施例1中所述的相同方案测量组合物的粘度和稳定性。结果报告于表4中。

[0159] 表4

样品	硅酮弹性体/DC245 共混物		增稠剂 锂蒙脱石	粘度/cP	稳定性 在 50°C, 4 周
	NSE (12.5%)	DSE (14.5%)			
4	26.5%		0.27%	62400	稳定
5		12.7%	0.27%	60560	稳定
6		15.9%		68880	稳定

#### [0160] [0161] 结果

[0162] 可以看出,为了获得具有相似的粘度、弹性和稳定性的制剂,与双功能性弹性体相比,必须添加更多的非功能性硅酮弹性体。因此,双修饰的硅酮弹性体在存在有机防晒剂的条件下显示出更好的结构化益处。

#### [0163] 感官测试

[0164] 在QDA (定性描述性分析) 测试中,将由本发明的组合物递送的感受与非本发明的组合物递送的感受进行比较。评估由具有良好敏感性的受训的女性受访者完成。

- [0165] 在样品测试的各个阶段对以下属性进行评分:
- [0166] 使用前-外观和指尖:形状的完整性、坚实性、延性、成峰性、粘性。
- [0167] 在使用中/使用后立即 (IMD): 扩延性、厚度、油性、阻力IMD和油性IMD
- [0168] 使用后IMD/5min:丝般光滑IMD、发粘IMD, 阻力5min, 油性5min, 丝般光滑5min, 发粘5min
- [0169] 当将样品4的QDA测试与样品5和6进行比较时, 发现在上述所有不同阶段中, 在所有上述属性中两个样品之间没有显著差异。来自QDA测试的数据表明, 具有较低剂量的本发明双功能弹性体的组合物(样品5和6)在使用时的感受与具有较高剂量的非功能性硅酮弹性体的常规组合物(样品4)相当。
- [0170] 实施例3
- [0171] 本实施例证明了硅酮弹性体和有机防晒剂的相容性。所用的基础制剂列于表5中。所有成分均以总制剂的重量百分比表示, 并以活性成分的含量表示。
- [0172] 表5

成分	重量百分比
DC245 <sup>a</sup>	余量
硅酮弹性体/DC245 共混物 <sup>b</sup>	26.5
PEG-10 二甲硅油	1.19
Parsol MCX <sup>c</sup>	变量
胆固醇	0.20
硬脂酸	0.25
十六醇	0.01
蔗糖二硬脂酸酯	0.13
水	46.38
甘油	7.25
EDTA 二钠	0.05
氯化钾	1.00
硫酸镁, 七水合物	0.50
烟酰胺	3.00
DMDM 乙内酰脲(和)丁基氨基甲酸碘代丙炔酯	0.20

- [0173]
- [0174] a. DC245是来自Dow Corning的商业十甲基环五硅氧烷。
- [0175] b. 硅酮弹性体/DC245共混物选自内部制备的非功能性硅酮弹性体 (NSE) /DC245共混物、烷基修饰的硅酮弹性体 (ASE) /DC245共混物、苯基修饰的硅酮弹性体 (PSE) /DC245共混物和双修饰 (烷基和苯基) 的硅酮弹性体 (DSE) /DC245共混物。
- [0176] c. Parsol MCX是甲氧基肉桂酸乙基己酯。
- [0177] 硅酮弹性体和溶剂的共混物的制备
- [0178] 材料
- [0179] 含有硅-氢键的聚硅氧烷 (Andisil XL-10)、乙烯基封端的二甲基聚硅氧烷 (Andisil VS-200)、乙烯基封端的二甲基二苯基聚硅氧烷 (Andisil SF-2430) 购自AB Specialty Silicones。十甲基环五硅氧烷 (DC245) 购自Dow Corning Corporation。铂催化

剂是来自Sigma Aldrich的铂(0)-1,3-二乙烯基-1,1,3,3-四甲基二硅氧烷络合物在二甲苯中的溶液。所有化学品均未经进一步纯化直接使用。

[0180] 如本文所用的，固体含量是指硅酮弹性体和溶剂的共混物中硅酮弹性体的重量百分比。

[0181] 非功能性硅酮弹性体/DC245共混物

[0182] 将0.382g Andisil XL-10、12g Andisil VS-200和70g DC245在烧瓶中混合。加入25μL铂络合物催化剂，将反应混合物用回流水保持在45°C，并以200rpm搅拌5小时。在反应完成后，凝胶化的混合物可在45°C下稀释至不同的固体含量。

[0183] 烷基修饰的硅酮弹性体/DC245共混物

[0184] 将1.068g Andisil XL-10和23g DC245混合并在小瓶中搅拌。向混合物中加入1.1g异辛烯，然后加入10μL铂络合物催化剂。将混合物在室温下搅拌30分钟。然后将反应混合物转移到烧瓶中。将23g DC245和20g Andisil VS-200加入混合物中，然后将混合物用回流水保持在45°C，并以200rpm搅拌。加入15μL铂络合物催化剂并将反应混合物在45°C下搅拌5小时。在反应完成后，凝胶化的混合物可在45°C下稀释至不同的固体含量。

[0185] 苯基修饰的硅酮弹性体/DC245共混物

[0186] 将0.6g Andisil XL-15、14g Andisil SF-2430和70g DC245混合并在小瓶中搅拌，然后加入25μL铂络合物催化剂。将混合物用回流水保持在60°C，并以200rpm搅拌4小时。在反应完成后，凝胶化的混合物可在60°C下稀释至不同的固体含量。

[0187] 双修饰的硅酮弹性体/DC245共混物

[0188] 将1.02g Andisil XL-10、0.94g十二烯和4g DC245混合并在小瓶中搅拌，然后加入2μL铂络合物催化剂。将混合物在60°C下搅拌30分钟。然后将反应混合物转移到烧瓶中。向混合物中加入40g DC245、20g Andisil SF-2430和6μL铂络合物催化剂，并将混合物用回流水保持在60°C下，并以200rpm搅拌4小时。在反应完成后，凝胶化的混合物可在60°C下稀释至不同的固体含量。

[0189] 方法

[0190] 将凝胶化的混合物(硅酮弹性体和溶剂的共混物)稀释至固体含量为14.5%。通过在基础制剂中添加具有相同量和不同量的防晒剂Parasol MCX的硅酮弹性体和溶剂的不同共混物来制备样品。样品1包含非功能性硅酮弹性体(NSE)。样品2包含烷基修饰的硅酮弹性体(ASE)。样品3包含苯基修饰的硅酮弹性体(PSE)。样品4包含双修饰(烷基和苯基)的硅酮弹性体(DSE)。

[0191] 粘度测试

[0192] 使用DV-II PRO数字粘度计(来自Brookfield Ltd)以10rpm的持续剪切速率测量上辊样品的粘度。该粘度计与PC连接，其中自动程序可以控制测量。使用在25°C的温度下1分钟后测量的值。除非另有说明，否则以厘泊( $cP=mPa \cdot S$ )引用数值。

[0193] 稳定性测试

[0194] 如本文所用的，稳定性是指组合物保持其外观、气味和主要结构，而没有相分离。将样品倒入塑料瓶中并填充至瓶子的2/3。然后将样品在50°C储存于烘箱中。对于稳定性测试，每天检查样品。观察并记录样品的外观。在样品仍然温热时进行观察，然后将样品在烘箱中放置24小时，然后进行另一次观察。

[0195] 粘度和稳定性结果报告在表6中。

[0196] 表6

总制剂中的% Parsol MCX		样品			
		7 (NSE)	8 (PSE)	9 (ASE)	10 (DSE)
10	粘度/cP	3280	15440	3760	19280
	稳定性	良好稳定性至少四周			
12	粘度/cP	3680	16320	3600	12560
	稳定性	三周后不稳定	良好稳定性至少四周		
15	粘度/cP	NM <sup>d</sup>	1440	2400	1760
	稳定性	NM <sup>d</sup>	三周后不稳定	三周后不稳定	良好稳定性至少四周

[0198] d.NM表示数据未测量。

[0199] 结果

[0200] 可以看出,包含非功能性硅酮弹性体的样品7显示出与防晒剂的不良相容性。当防晒剂的加入量高于10wt%时,制剂变得不稳定,略有渗油。包含双修饰的硅酮弹性体的样品10在所有样品中显示出与防晒剂的最佳相容性。即使加入15wt%的防晒剂时,该制剂仍保持良好的稳定性。

[0201] 实施例4

[0202] 本实施例证明了组合物的防晒性能。这里使用的样品是实施例3中列出的样品7至10。

[0203] 方法

[0204] 体外SPF试验

[0205] 使用LabSphere UV-2000S SPF仪进行薄膜透光率测量。聚(甲基丙烯酸甲酯)(PMMA)板用作基材。将样品均匀地施加到PMMA基材上,密度为2mg/cm<sup>2</sup>。干燥15分钟后,将样板暴露于标准UV灯下,并对样板进行透光率扫描。每个样板扫描九个不同的点位。将相同的样板测试三次。使用以1.3mg/cm<sup>2</sup>的密度涂抹甘油的空白PMMA板获得参考透光率。使用随仪器提供的LabSphere软件将透光率值转换为SPF值。

[0206] 测量硅酮弹性体和防晒剂的不同组合的样品的SPF值并总结于表7中。

[0207] 表7

体外 SPF	总制剂中的% Parsol MCX	样品		
		7 (NSE)	9 (ASE)	10 (DSE)
	10	10.00	NM <sup>d</sup>	11.19
	12	10.64	11.08	14.00
	15	NM <sup>d</sup>	14.04	17.24

[0209] 表8

[0210]	样品 4 (DSE)	总制剂中的% Parsol MCX	体外 SPF
	6	7.40	
	8	8.81	
	10	11.19	
	12	14.00	
	15	17.24	
	20	19.55	

[0211] 结果

[0212] 证明了即使使用相同量的防晒剂,包含双修饰的硅酮弹性体的样品10也提供比样品7和9更高的SPF值。表4进一步显示样品10的SPF值随着制剂中防晒剂量的增加而增加。

[0213] 实施例5

[0214] 本实施例证明了包含双修饰(烷基和苯基)的硅酮弹性体的组合物的光稳定性。所有成分均以总制剂的重量百分比表示,并以活性成分的含量表示。

[0215] 表9

成分	样品	
	11	12
DC245 <sup>a</sup>	余量	余量
非功能性硅酮弹性体/DC245 共混物	26.5	--
双修饰的硅酮弹性体/DC245 共混物	--	26.5
PEG-10 二甲硅油	1.19	1.19
Parsol MCX <sup>c</sup>	5	5
Parsol 1789 <sup>e</sup>	1	1
胆固醇	0.20	0.20
硬脂酸	0.25	0.25
十六醇	0.01	0.01
蔗糖二硬脂酸酯	0.13	0.13
水	46.38	46.38
甘油	7.25	7.25
EDTA 二钠	0.05	0.05
氯化钾	1.00	1.00
硫酸镁, 七水合物	0.50	0.50
烟酰胺	3.00	3.00
DMDM 乙内酰脲(和)丁基氨基甲酸碘代丙炔酯	0.20	0.20
体外 SPF	1 日储存	5.25
	24 日储存	3.65
		5.44

[0217] e.Parsol 1789是丁基甲氧基二苯甲酰甲烷。

[0218] 方法

[0219] 通过在制剂中加入相同量的硅酮弹性体和溶剂的不同共混物(固体含量为14.5%)来制备样品。使用与实施例4中所述相同的方案测量组合物的体外SPF值。

[0220] 结果

[0221] 结果表明,包含双修饰的硅酮弹性体的样品12即使在储存24天后仍保持SPF值,而

样品11的SPF值随时间降低。

[0222] 实施例6

[0223] 本实施例证明了组合物中双修饰的硅酮弹性体和溶剂共混物的浓度对防晒性能的影响。所有成分均以总制剂的重量百分比表示，并以活性成分的含量表示。

[0224] 表10

成分	样品			
	12	13	14	15
DC245 <sup>a</sup>	余量	余量	余量	余量
双修饰的硅酮弹性体/DC245共混物	26.5	20.5	18.5	10.5
PEG-10二甲硅油	1.19	1.19	1.19	1.19
Parsol MCX <sup>c</sup>	5	5	5	5
Parsol 1789 <sup>e</sup>	1	1	1	1
胆固醇	0.20	0.20	0.20	0.20
硬脂酸	0.25	0.25	0.25	0.25
十六醇	0.01	0.01	0.01	0.01
蔗糖二硬脂酸酯	0.13	0.13	0.13	0.13
水	46.38	46.38	46.38	46.38
甘油	7.25	7.25	7.25	7.25
EDTA二钠	0.05	0.05	0.05	0.05
氯化钾	1.00	1.00	1.00	1.00
硫酸镁，七水合物	0.50	0.50	0.50	0.50
烟酰胺	3.00	3.00	3.00	3.00
DMDM乙内酰脲(和)丁基氨基甲酸碘代丙炔酯	0.20	0.20	0.20	0.20
粘度/cP	280000	129000	120000	NM <sup>d</sup>
体外 SPF   1 日储存	5.57	5.90	6.31	11.51

[0226] 方法

[0227] 通过在制剂中加入双修饰的硅酮弹性体和溶剂的不同量的共混物(固体含量为14.5%)来制备样品。使用与实施例3和4中所述的相同方案测量组合物的粘度和体外SPF值。

[0228] 结果

[0229] 可以看出，包含双修饰的硅酮弹性体和溶剂的较低量的共混物的样品显示出较高的SPF值。包含10.5重量%的双修饰的硅酮弹性体和溶剂的共混物的样品15显示出优于其他样品的防晒性能。

[0230] 实施例7

[0231] 本实施例证明了硅酮弹性体和共溶剂辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯(GTCC)的相容性。所有成分均以总制剂的重量百分比表示，并以活性成分的含量表示。

[0232] 表11

[0233]

成分	样品							
	16	17	18	19	20	21	22	23
DC245 <sup>a</sup>	0.27	0.27	0.84	0.84	2.84	2.84	4.84	4.84
双修饰的硅酮弹性体 /DC245 共混物	26.5	--	26.5	--	26.5	--	26.5	--
非功能性硅酮弹性体 /DC245 共混物	--	26.5	--	26.5	--	26.5	--	26.5
辛酸甘油三酯/癸酸甘油 三酯	5.07	5.07	4.0	4.0	2.0	2.0	--	--
辛甲基聚硅氧烷	--	--	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
PEG-10 二甲硅油	1.19	1.19	1.19	1.19	1.19	1.19	1.19	1.19
Parsol MCX <sup>c</sup>	6	6	6	6	6	6	6	6
Parsol 1789 <sup>c</sup>	2	2	2	2	2	2	2	2
胆固醇	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20
硬脂酸	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
十六醇	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01
蔗糖二硬脂酸酯	0.13	0.13	0.13	0.13	0.13	0.13	0.13	0.13
水	46.38	46.38	46.38	46.38	46.38	46.38	46.38	46.38
甘油	7.25	7.25	7.25	7.25	7.25	7.25	7.25	7.25
EDTA 二钠	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05
氯化钾	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00
硫酸镁, 七水合物	0.50	0.50	0.50	0.50	0.50	0.50	0.50	0.50
烟酰胺	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00
DMDM 乙内酰脲(和)丁 基氨基甲酸碘代丙炔酯	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20
粘度/cP	130000	83000	130000	88000	160000	129000	200000	166000

[0234] 表12

成分	样品					
	24	25	26	27	28	29
DC245 <sup>a</sup>	3.34	3.34	1.34	1.34	1.34	1.34
双修饰的硅酮弹性体/DC245 共混物	26.5	--	26.5	--	26.5	--
非功能性硅酮弹性体/DC245 共混物	--	26.5	--	26.5	--	26.5
辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯	2.0	2.0	4.0	4.0	2.0	2.0
PEG-10 二甲硅油	1.19	1.19	1.19	1.19	1.19	1.19
Parsol MCX <sup>c</sup>	6	6	6	6	7.5	7.5
Parsol 1789 <sup>e</sup>	2	2	2	2	2.5	2.5
胆固醇	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20
硬脂酸	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
十六醇	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01
蔗糖二硬脂酸酯	0.13	0.13	0.13	0.13	0.13	0.13
水	46.38	46.38	46.38	46.38	46.38	46.38
甘油	7.25	7.25	7.25	7.25	7.25	7.25
EDTA 二钠	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05
氯化钾	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00
硫酸镁, 七水合物	0.50	0.50	0.50	0.50	0.50	0.50
烟酰胺	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00
DMDM 乙内酰脲(和)丁基氨基甲酸碘代丙炔酯	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20
稳定性	稳定 21 天	稳定 14 天	稳定 21 天	稳定 14 天	稳定 67 天	稳定 2 小时

[0235]

**[0236] 方法**

[0237] 通过在制剂中加入相同量的硅酮弹性体和溶剂的不同共混物(固体含量为14.5%)来制备样品。使用与实施例3中所述的相同方案测量组合物的粘度和稳定性。

**[0238] 结果**

[0239] 可以看出,包含双修饰的硅酮弹性体的样品与包含非功能性硅酮弹性体的那些相比,显示出与共溶剂辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯好得多的相容性。包含高于5wt%的量的GTCC的样品16仍保持良好的粘度,表明硅酮弹性体和溶剂的共混物保持其结构。

[0240] 当向组合物中加入更高量的防晒剂时,包含双修饰的硅酮弹性体的样品与包含非功能性硅酮弹性体的那些相比,显示出与共溶剂辛酸甘油三酯/癸酸甘油三酯好得多的相容性。样品28稳定67天,而样品29在2小时后变得不稳定。