



Spec-Chem Ind.

No. 90 East Zhongshan Road

Nanjing China

Zipcode: 210002

<http://www.specchemind.com>

南京斯拜科生化实业有限公司

Tel: +86 25 84523390 84523391

Fax: +86 25 84520790 84520791

Email: specchem@jlonline.com

德国PONTPHARM技术 合作生产

新型去屑止痒剂

P.O.

(吡啶酮乙醇胺盐)



化学名: 吡啶酮乙醇胺盐

INCI名: Piroctone Olamine (吡罗克酮乙醇胺盐)

CAS NO: 68890-66-4

EINECS NO: 272-574-2

功能: 去屑止痒剂

产品编号: SC-4707

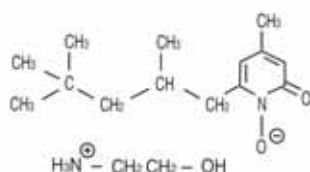


1. 应用综述:

吡啶酮乙醇胺盐(英文名称Piroctone Olamine 简写P.O.),其化学名称:

1-羟基-4-甲基-6-(2,2,4-三甲基戊基)-2(1H)-吡啶酮-2-氨基乙醇盐(1:1),

结构式:



该产品独特的性能主要表现在: a). 去屑止痒效果优于同类产品; b). 溶解性能、复配性能优良, 与化妆品原料混合不会发生沉淀或分层现象; c). 去屑机理独特, 刺激性极低, 不会引起脱发、断发, 安全性优于同类去屑止痒产品。到目前为止, 是唯一可用于免洗类发用品的去屑止痒剂。P.O. 的止痒效果极好, 还具有杀菌、除臭功能, 因此被用于浴液中, 取得良好的效果。P.O. 对真菌、霉菌有广谱杀灭作用, 对脚、手癣有良好的治疗功效。在化妆品中可作防腐剂, 在香皂中作杀菌剂, 并且有增稠性。因此P.O. 是一个多功能去屑止痒杀菌剂, 在洗发护发品、浴液、化妆品、洗涤用品中得到广泛应用。

2. P.O. 的作用机理

南京斯拜科生化实业有限公司引进德国PONTPHARM公司的先进化学合成技术, 合作生产出高纯度的P.O., 其去屑止痒机理是: 通过P.O. 的杀菌、抗氧化作用和分解过氧化物等方法, 从根本上阻断头屑产生的外部渠道, 从而有效根治头屑、止头痒, 而不是通过脱脂等方式从表象上暂时消除头屑, 这就是P.O. 去屑止痒性能优于同类产品的主要原因。

按照Bonadeo(1975)和Lubke(1979)教授的理论, 头皮屑的形成机理可用图2来说明。

按照此机理, P.O. 的去头皮屑作用可归功于其抗微生物和抗氧化作用。

如图1所示, P.O. 有极高的抗马拉色氏霉菌属作用, 而这类霉菌被认为是引起头皮屑的主要原因。



图1 P.O.抗真菌皮屑芽胞菌(正圆瓶形酵母)的体外活性试验

不含P.O.的空白对照组

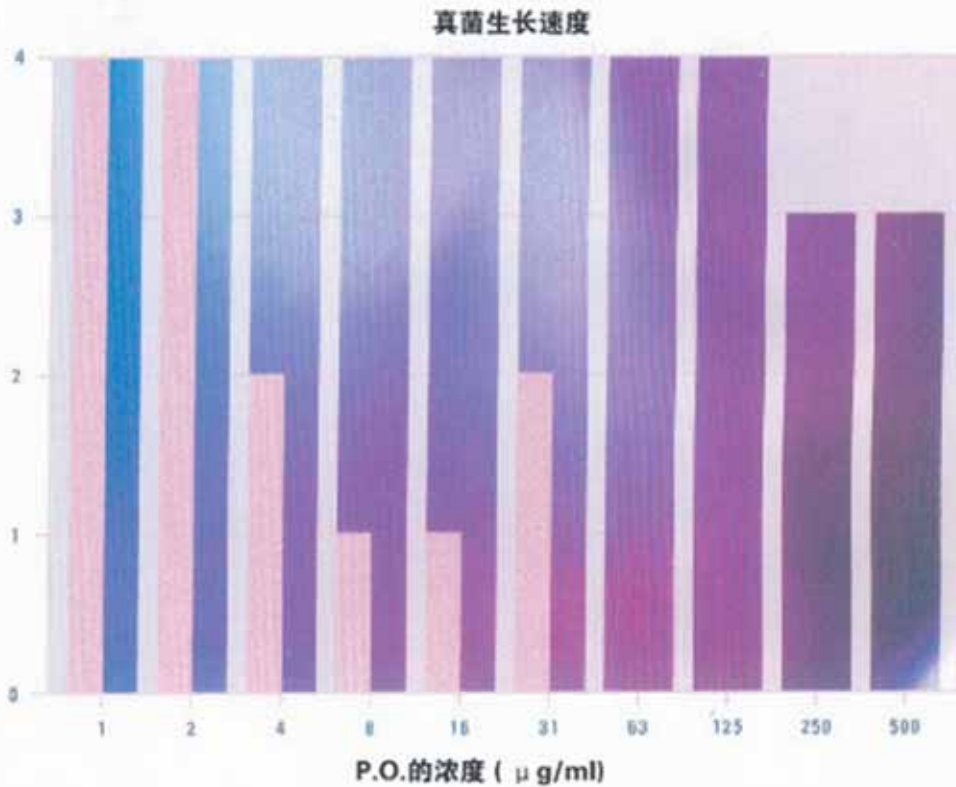
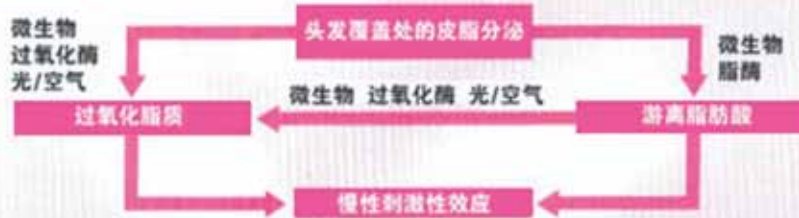


图2 Prof. Bonadeo和Lubke对头皮屑产生机理的解释

外源性因素



内源性因素





3. P. O. 的去屑止痒作用

P. O. 是一种有效的, 几乎无任何毒性的去屑止痒活性成分, 特别适用于生产去屑止痒香波和具有去屑作用的发用护理产品如生发水 (hair tonics) 和 cream rinses (膏霜类染发剂)。

P. O. 在产品中的添加量依产品类型不同而有变化, 一般在 0.1—1.0%。免洗型产品中的添加量可进一步降低, 一般在 0.05—0.1%。由于 P. O. 可溶于含表面活性剂的水溶液或醇水混合溶剂中, 使其特别适用于制造透明产品。

含有 P. O. 的产品的去屑止痒效果, 特别是在去屑香波和生发水中的作用已有大量的研究和报道, 它们卓越的功效已在大量的临床研究中得到证实。

3.1 头屑指数与使用时间的关系

图3和图4显示每周使用一次, 头屑指数与使用时间的关系。

图3 显示含 0.75% P. O. 的香波与不含 P. O. 的香波的效果比较。

图4显示含 0.1% P. O. 生发水的使用效果。

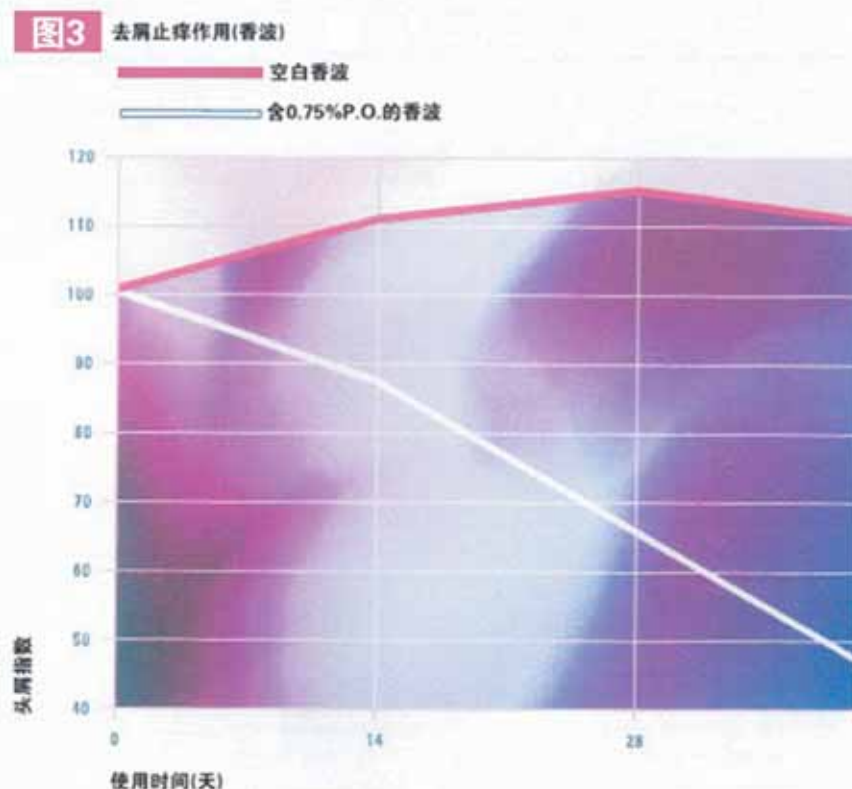
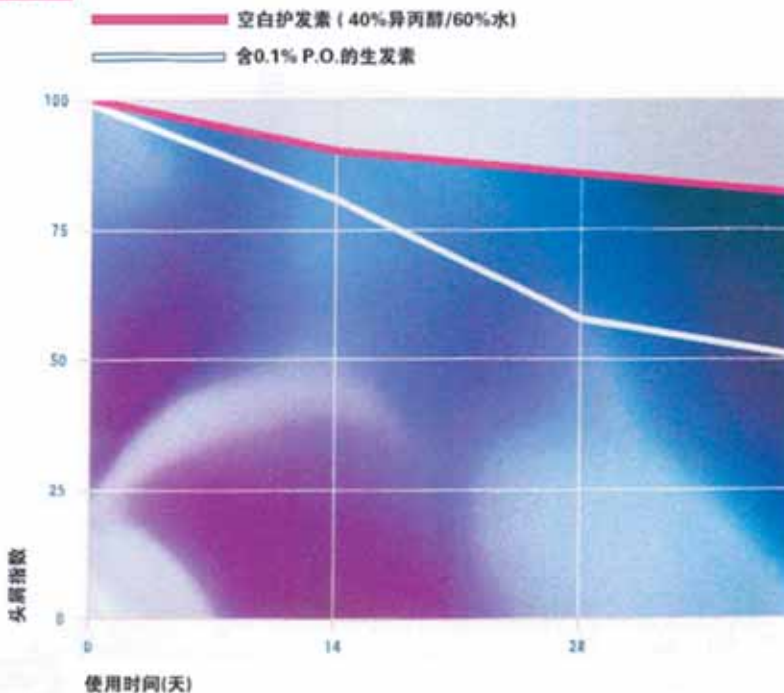




图4 去屑止痒作用 (hair tonic)



3.2 含相同Z. P. T或P. O. 量的香波去屑效果比较

图5表示, 加入0.5%Z. P. T或0.5% P. O. 香波, 经过六周八次使用后, 发现P. O. 的头屑减少81.7%, Z. P. T减少68.6%。

3.3 含不同Z. P. T和P. O. 量的去屑效果比较

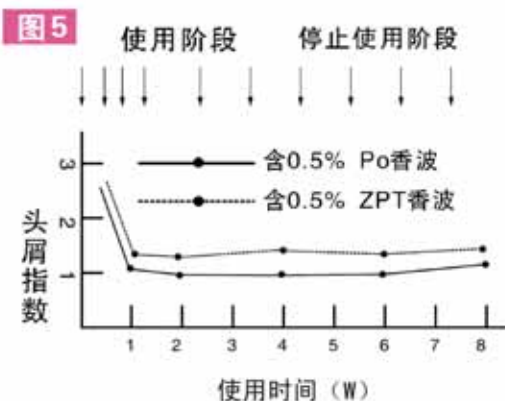


图5 P. O. 与Z. P. T去屑效果的比较

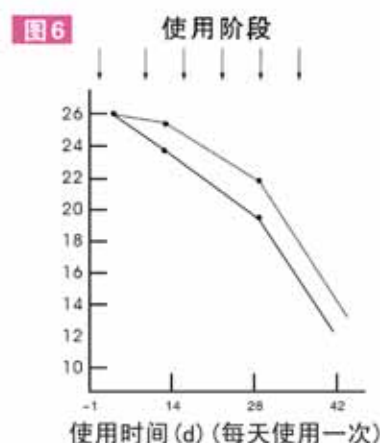


图6 P. O. 与甘宝素 (CLM) 去屑效果的比较



表1 Z. P. T和P. O. 去屑效果比较 (使用二周后)

表1 Z. P. T和P. O. 去屑效果比较 (使用二周后)

品 种	P.O	Z.P.T	占总实验人数百分比	
	%	%	Z.P.T>P.O.	P.O.>Z.P.T
护发素	0.3	0.3	9	29
	0.5	1.0	8	33
香 波	0.75	1.0	7	47
	1.0	1.0	8	49

表1表示, 0.5%, 0.75%, 1% P. O. 含量的香波去屑性能明显优于1%加入量的Z. P. T香波。

3.4 P. O. 与甘宝素 (CLM) 去屑效果的比较

从图6可以看到: 使用0.75% P. O. 六周后头屑减少了51.4%, 同时应指出在使用第二周和第四周时, 去屑效果已非常明显, 分别为9.1%和23.5%; 使用含1% Climbazol香波, 六周后头屑减少44.2%, 而在第二周和第四周时, 其头屑减少4.8%和18.1%。

另外, 我们还可以从表2中看到含0.75% P. O. 香波和1% CLM香波去屑效果的比较。

表2 Z. P. T和P. O. 止痒效果比较

项目	使用时间 (d)											
	-1			14			28			42		
	B	C	N=32	B	C	△	B	C	△	B	C	△
平均头屑指数	24.9	24.3		23.7	22.1		20.4	18.6		13.9	11.8	
头屑减少量和去屑效果差别				1.2	2.2	1.0	4.5	5.7	1.2	11.0	12.5	1.5
头屑减少率 (%)				4.8	9.1		18.1	23.5		44.2	51.4	

注: B-1% Climbazole香波, C-0.75% P. O. 香波。

3.5 止痒性能比较

表3为P. O. 与在香波和护发中止痒效果比较



表3 P.O.与 Z.P.T 在香波和护发中止痒效果比较

品种	P.O.	Z.P.T	占总实验人数百分比	
	%	%	Z.P.T>P.O.	P.O.>Z.P.T
	0.15	0.3	10	30
护发素	0.3	0.3	20	31
	0.5	1.0	10	25
	0.75	1.0	16	33
香波	1.0	160	15	34

注：“>”表示去屑效果好于

表3表明，不同加入量下 P. O. 的止痒效果均优于 Z. P. T.

3.6 P. O. 对皮脂的影响

P. O. 在去屑止痒的同时，是否也会损伤头皮呢？为此我们采用半头对比实验比较含0.2% P. O. 去屑香波与其基质香波（含50%异丙醇）的脱脂性。表4的实验结果，从中我们发现10位试验者，每天二次连续使用含0.2% P. O. 的去屑香波四周后，表皮类脂分泌总量仅从40.7减少到36.8，即减少了3.9。而采用同样方法使用基质香波后，皮脂分泌量减少了3.0，两者差别只有0.9。由此可见，P. O. 的加入没有明显增加香波的脱脂作用。其次我们还应指出，使用含P. O. 的香波后，皮脂分泌的减少率为9.6%，小于10%，而通常人们皮脂日正常变化率也在此范围内。由此说明P. O. 没有脱脂作用，它在去屑止痒的同时，不会损伤头皮。

表4 0.2% P.O.香波(A)与其基质香波(50%异丙醇水溶液)(B)脱脂效果比较(每日二次连续使用四周)

试验者号码 及性别	表皮类脂总量 ($\mu\text{g}/\text{cm}^2$)				皮脂减少情况及比较			
	A		B		A	B	Δ	P
	使用前	使用后	使用前	使用后				
1 ♂	50	34	43	34	↓↓↓	↓↓↓		
2 ♂	46	40	43	33	↓↓	↓↓↓		
3 ♀	46	46	43	47	→	↑		
4 ♀	30	30	30	32	→	↑		
5 ♀	43	47	43	40	↑	↓		
6 ♂	43	30	37	32	↓↓↓	↓↓		
7 ♂	31	29	32	28	↓	↓		
8 ♀	39	34	42	36	↓↓	↓↓		
9 ♀	39	32	40	37	↓↓	↓		
10 ♂	40	46	38	42	↑↑	↑		
平均值:	40.7	36.8	39.1	36.1	-3.9 ≤-9.6%	-3.0 ≤-7.7%	-0.9	不显著



4. 广谱抗细菌、霉菌性

P. O. 具有广谱杀菌抑菌性质，它不仅能有效地杀死产生头屑的两种主要细菌：平型酵母菌和正圆形酵母菌，同时还能有效地抑制革兰氏阳性、阴性菌以及各种真菌和霉菌。对金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、大肠杆菌、痤疮丙酸杆菌有良好的杀菌效果。对形成皮肤病的菌类：红色毛癣菌、须癣毛癣菌、犬小孢子菌、絮状表皮癣菌、糠秕孢子菌、及白念珠菌、热带念珠菌均有良好抗菌效果。抑菌浓度MIC在6.25~25mg/L之间。因此目前已有很多化妆品生产厂家将P. O. 用于溶液肥皂和膏霜制成杀菌止痒浴液、去体臭肥皂、治痤疮和手脚癣的膏霜等。同时还有许多厂家用它取代防腐剂，相继向市场推出了“无防腐剂去屑香波”、“无防腐剂去屑发乳”和无防腐剂去体臭肥皂/膏霜等产品，从而迎合了人们日益增长的对化妆品“高效、低刺激、无防腐剂”的要求。

5. 毒理和安全使用性

用户对去屑剂的使用安全性极为重视，检测也极为严格，一般包括急性毒性、亚急性毒性、慢性毒性、致癌性、胚胎毒性、及畸胎毒性、诱变性、皮肤吸收性和皮肤刺激性。P. O. 与其它去屑剂相比较，所有毒性指标是同类去屑剂中最低的，所以P. O. 的使用安全性最高，是目前世界上唯一可用于免洗护发用品，可保留在头皮头发上的去屑止痒剂，而且从用户的反馈，我们知道在这类产品中P. O. 去屑止痒效果更好，可显著地延长用户的洗发周期，从而使用用户的发型发式保留时间更长。

P. O. 经药物检验部门鉴定对眼睛、皮肤的安全性非常可靠，在实际使用中不会损伤头皮，不会出现脱发、断发现象。

去屑止痒剂的安全性一直是人们关注的问题。根据有关技术资料介绍，常用去屑止痒剂的安全性能对比如下：



5.1 急性毒性

表 5 急性毒性对比表

	口服 (鼠, LTD50) (mg/kg 体重)
SeS2	138
Z.P.T	170
Climbazol	400
P.O.	8100

注: 根据Hodge和Sterner毒性分类标准, 我们可以将SeS2和Z. P. T纳入“中等急性毒性类”, P. O. 纳入: “无急性毒性类”。

5.2 亚急性毒性

表 6 亚急性毒性对比表

去屑剂	实验方法	最高无反应量 NOEL
Z.P.T	喂养	15 ppm/diet
Climbazol	口服	15mg/kgb.w/d
P.O.	口服	100mg/kgb.w/d

去屑剂亚急性毒性对比实验周期为三个月, 由表6可以看到Z. P. T的亚急性毒性明显大于Climbazol和P. O., 其NOEL (无明显反应量) 只有15ppm/每餐。

5.3 慢性毒性和致癌毒性

根据长时期的口服和皮肤涂敷实验, 同时也积累了大量的临床应用报告, 在实验中发现除了SeS2可能有致癌毒性外, 其他常用的去屑剂, 如Z. P. T、CLM、P. O. 都没有慢性毒性

5.4 胚胎致毒性和畸胎致毒性

表 7 哺乳动物胚胎致毒性和畸胎致毒性实验

去屑剂	实验动物	最高无反应量 NOEL		
		口服	皮肤涂敷	极限用量
Z.P.T	鼠	7.5	15.0**	-
	兔	1.0	100.0**	-
Climbazol	鼠	30.0	-	-
P.O.	鼠	-	-	2000.**
	兔	63.0**	-	-

由表 (7) 可知, P.O.对胚胎毒性最小



5.5 诱变性

通过AMES检测法、微原子分析法和DNA结构分析法等不同的实验手段对生物体作大量的活体检测，发现现有的去屑剂都没有诱变性。

5.6 对皮肤和粘膜的刺激性

现在人们普遍认为在常用的去屑产品中以SeS₂的刺激性最大，国外含SeS₂去屑剂的香波，通常都要标明“请勿接触眼睛”。刺激性居第二位的是Z. P. T。Z. P. T不慎进入眼睛10S内冲洗无刺激感，若时间较长会引起结膜炎、粘膜灼热痛和眼睛红肿等不适反应。与上述去屑剂相比，活性甘宝素无明显刺激性，P. O. 的刺激性非常小。

可以认为，与常用的去屑剂相比，P. O. 的毒性和刺激性都最低，亦即使用安全性最高。

6. P. O. 的理化性质及使用说明 (Quality Analysis)

表8 P.O.的理化性质

项 目	指 标
外观	白色结晶性粉末
气味	很淡的特征性气味
含量, %	≥ 98
pH (1%水溶液)	8.5-10.0
熔点, °C	130-135
干燥失重, %	≤ 0.2
灰分 (以SO ₃ 计), %	≤ 0.2

6.1 溶解性

P. O. 能溶于表面活性剂体系, 是其区别于同类去屑产品如Z. P. T的一个显著优点。易溶于乙醇 (10%), 可溶于含表面活性剂的水溶液或乙醇/水混和液 (1%-10%), 微溶于水 (0.05%) 和油 (0.05%-0.1%), 溶解度与PH值有很大关系, 一般而言, 在中性或弱碱性水溶液中溶解度较大。



6.2 与化妆品原料的复配

P. O. 与多种化妆品原料的复配性良好, 这里尤其应指出阴离子活性组份P. O. 可与多种阳离子表面活性剂(季胺盐)和阳离子活性组份混合, 并且在某些情况, 这种复配还能增加P. O. 的溶解度, 这也是P. O. 复配性优于其它去屑止痒剂如Z. P. T, MDS, CLM等的一个重要标志。

在0.5%以下的加入量, 除甲醛, P. O. 可与含醛酮的香精香料复配, P. O. 虽然遇到铜铁等金属会变色, 但颜色为浅黄, 且对P. O. 的疗效没有影响, 在实际生产中可用去离子水, 尽量防止重金属离子和采用色素调色掩盖等方法加以克服。

6.3 PH值影响

P. O. 在PH值3-9内可以稳定存在, 在中性条件下, P. O. 以游离酸形式存在, PKa为7.4。

6.4 热稳定性

P. O. 有很好的热稳定性, 在生产过程中, 如温度偶尔超过80℃不会影响P. O. 的性能, 另外, 含P. O. 的香波 (PH5.5和H7.0) 可在40℃贮存一年。

6.5 光稳定性

在紫外线直射下, P. O. 的活性组份会分解, 因此在P. O. 贮存时要注意尽量避光。

6.6 对粘度影响

P. O. 的加入可以使许多表面活性剂体系的粘度增加。



7. 参考配方 (Formulation Examples)

表9 去屑柔顺洗发香波

配方编号: 08060101B

原料名称	百分含量	作用
纯水	To 100	填充剂
EDTA-2Na	0.10	螯合剂
AESA (70%)	8	清洁剂
K ₁₂ A(70%)	8	清洁剂
TC-8025	5	调理剂
TC-14-S	0.15	调理剂
十六、十八醇	0.5	头发滋润剂
珠光片	1.0	令外观亮丽
CMEA	1	增稠、稳泡
TC-23	0.5	悬浮稳定
TC-SHD	3	增稠、稳泡、温和清洁剂
CAB-35	2	增稠、温和清洁剂
TC-1352	2	头发滋润、调理剂
卡松	0.05	防腐剂
P.O.	0.5	去屑止痒剂
柠檬酸	适量调节 pH 至 6.0-6.2	调节 pH
香精	适量	

操作工艺:

- 1、将TC-14-S、分散于水中;
- 2、将TC-8025加入水中, 加入EDTA-2Na;
- 3、将AESA、K12A加入锅中, 加热至75-80℃溶解;
- 4、将珠光片、CMEA、十六十八醇加热至80℃, 在搅拌状态下加入锅中, 混合15-20分钟;
- 5、降温至50℃, 依次加入TC-1352乳化硅油、TC-SHD、CAB-35;
- 6、取适量去离子水分散P.O.后, 加入体系中;
- 7、搅拌均匀后用柠檬酸调节pH, 调整至合格后出料。



表10 护发素

配方编号: 08101502A

原料名称		百分含量(%)	作用
油相:	十八醇	6.0	增稠、成型剂
	二十二烷基三甲基氯化铵	1.0	
	TC-1214	1.5	头发光泽、柔顺剂
	二甲基硅油 (100cst)		
	TC-1233	1.5	头发光泽、柔顺剂
水相:	甘油	3.0	保湿剂
	HEC (羟乙基纤维素)	0.5	增稠、稳定剂
	TC-POLYQUAT 200L	0.3	头发柔软、抗静电剂
	纯水	To 100	填充剂
	P.O.	0.3	去屑止痒剂
	防腐剂	适量	防腐剂
	香精	适量	

操作工艺:

- 1、将油相成分 (除TC-1214及TC-1233之外) 加热至75℃备用。
- 2、将TC-POLYQUAT 200L、HEC加入水相锅中搅拌分散均匀, 加热至70-75℃。
- 3、当水相加热至70-75℃时, 在搅拌状态下将油相加入乳化锅中。待油相加完后, 开始均质乳化。
- 4、降温冷却至55-60℃, 将TC-1214与TC-1233的均匀混合物加入乳化锅中, 可均质3分钟。
- 5、继续降温至40-45℃, 加入预先用去离子水分散过的P.O.、防腐剂及香精, 搅拌10-15分钟即可出料。

为保护您的权益, 敬请留意:

本手册中的信息和介绍是可信的, 有关使用或应用的建议是本公司的意见。建议配方是基于本公司原料及实验室客观环境下所完成, 若贵方有意采用, 请依据贵方所采用的原材料及具体生产环境进行稳定性测试, 本公司对此建议配方并不负任何责任, 仅供参考!



8. 使用指南 (Usage)

8.1 建议添加量:

去屑香波:	0.2-0.8%	去屑护发素:	0.1-0.3%
去屑定型剂:	0.05-0.2%	浴液:	0.2-0.5%
去屑养发液:	0.05-0.1%	防腐剂:	0.2-0.5%
除臭剂:	0.2-0.5%	去臭香皂:	0.2-0.5%
去屑发胶发乳:	0.1-0.3%		

8.2 注意事项

在实际生产中使用去离子水, 温度低于60°C时添加于配方产品中(预先用适量去离子水分散P.O.), 尽量避免遇到铜和铁离子。采用色素调色掩盖等方法加以克服可能发生的变色现象。

9. 包装 (Package)

包装规格: 1kg/袋, 5kg/袋, 25kg/箱(内用铝箔袋包装)。

10. 贮存性 (Storage)

10.1 保存方式

存放于干燥、阴凉处, 封闭、避光的容器中。

10.2 保存期限

保质期2年。

以上信息由南京斯拜科生化实业有限公司提供, 主要目的是为了便于化妆品产品研发专业技术人员的使用。使用者应根据自己的学识和能力对该资料的可靠程度作出判断, 并可在合理的范围内作出相应的修改、补充, 对此发生的一切后果, 南京斯拜科生化实业有限公司不承担任何责任。