

Винахід стосується косметичних композицій, що містять перспективні системи, які забезпечують нові шляхи нанесення дерматологічне активних агентів на косметично значущі зони рогового шару шкіри. Композиція згідно з винаходом особливо, але не виключно, корисна для покращення очей, що забезпечує косметичну перевагу таким зонам біля очей, як повіки, шкіра під очима, зовнішні очні кути, а також корисна при макіяжі губ та інших важливих ділянок.

Винахід включає нові плівкоутворювальні системи, що сприяють нанесенню активного агента. Ці плівкоутворювальні системи надають додаткове поліпшення і корисні незалежно від систем для нанесення.

Очі будь-якої особи самі по собі слугують центральним фактором її ідентифікації та персоніфікації, а також привертають увагу інших людей. При будь-якому контакті віч-на-віч саме очі є важливим засобом безмовного спілкування. Повіки та шкіра обличчя навкруг очей визначають їх вигляд, отже і враження від людини. Відповідно, композиції для макіяжу очей складають значну частину у виробництві косметичних засобів.

Очі - косметично чутлива, а іноді утруднена ділянка для макіяжу. Вони можуть мати природжені дефекти, вади та розлади, з віком, а також завдяки погоді, дієті і т.д., ділянки біля очей швидко погіршуються. Якісний макіяж очей може спричинити значний візуальний та косметичний виграш особі завдяки разючому поліпшенню їх вигляду.

Деякі загальні проблеми шкіри біля очей включають утворення зморшок, в т.ч. дрібних, розтріскування шкіри, прищі та її обезбарвлення. Такі проблеми можуть спричинюватися і вадами нижніх та верхніх повік, зокрема ділянок під очима, а також кутів очей, особливо їх зовнішніх кутів, відомих як "canthus", що схильний до появи тріщин та зморшок, які часто грубувато називають "воронячими лапками".

З огляду на ці проблеми косметична промисловість пропонує широкий вибір корегуючих засобів для приховування, заповнення, забарвлення або іншої обробки непривабливих ділянок шкіри біля очей. Рідка туш, олівці для очей та інші засоби обробки вій використовують для підсилення та підкреслення вигляду вій, брів та країв повік і вони можуть спричинювати вигідний і навіть надзвичайний вплив на очі. Більш значною метою даного винаходу є косметичні засоби, що використовують для макіяжу важливих ділянок шкіри поблизу очей, особливо повік, ділянок, розташованих під очима та біля зовнішніх кутів очей. Такими косметичними засобами є тіні, креми та олівці для очей. Хоч такі косметичні засоби загального користування, як ґрунтуючі основи та грим, можуть бути використані для макіяжу ділянок шкіри поблизу очей, потрібна обережність, оскільки є ризик псування очей пекучими компонентами або такими, що викликають алергію, а також за рахунок появи пухлин чи бактеріальної інфекції.

Широке коло косметичних засобів для макіяжу очей наявне в будь-якому косметичному торговому закладі, а патентна література насичена сотнями, якщо не тисячами пропозицій та рішень по різноманітним проблемам, що виникають при забезпеченні бажаного рівня косметичного поліпшення шкіри біля очей. Дивись, наприклад, Vercado U.S. Patent №4.783.333 & Giezendanner U.S. Patent 5.073.364, розкриття яких наведено у наданих далі посиланнях.

Однак, в цих наведених даних жодна з пропозицій або рішень не забезпечує цілком задовільного макіяжу очей для багатьох користувачів. Існуючі олівці для очей звичайно починають вицвітати вже через кілька годин після нанесення, при цьому на сприйнятливій шкірі обличчя можуть розвиватися чітко видимі зморшки, дефекти також можуть з'являтися під дією води, наприклад, сліз, дощу, потовиділення та інш. Основи під олівці для очей можуть полегшувати ці проблеми, але не гарантують безпечність шкіри.

Інші косметичні засоби для очей може бути важко наносити рівномірним або однорідним шаром, або вони неприємні або липкі на дотик, або ж мають низьку здатність до плівкоутворення (їх важко наносити), чи чинять великий опір при цьому, або їх важко видаляти. Кілька косметичних засобів для очей забезпечують тривале структурне поліпшення шкіри, за винятком кремів та зволожнювачів для очей спеціального призначення, які містять підживлюючи шкіру інгредієнти. Загалом, подібні креми для очей призначені для використання вночі і не можуть задовільно утримувати шар олівця для очей, так що вони не можуть бути використані вдень, оскільки не забезпечують суттєвого поліпшення виду.

Теоретично було б бажано уникнути подання окремих заявок на

ефективні в косметичному плані та дерматологічно активні інгредієнти за рахунок прямого введення дерматологічно активного інгредієнта в косметичну композицію для очей. Однак, це важко зробити.

Терміном "дерматологічно активний" в даному випадку визначають матеріали, дія яких на шкіру забезпечує тривале поліпшення однієї чи іншої властивості, причому це поліпшення триває або починається після видалення косметичного гриму. Цим дерматологічна активність відрізняється від косметичних властивостей, які ефективні тільки тоді, коли косметика нанесена на шкіру.

Відомо багато хімічних сполук, які справляють глибокий фізіологічний вплив на шкіру. Однією з таких груп дерматологічно активних сполук є альфа-гідроксикарбонові кислоти відносно малої молекулярної маси, наприклад, з 10 і менше атомами карбону. Для цих, звичайно позначаємих як "альфа-гідроксикислоти", кислот відомий ряд корисних ефектів їх впливу на шкіру. Скорочення "АГК" для них є звичайним як у популярній пресі, так і в технічній літературі, альфа-гідроксикислоти можуть зволожувати суху шкіру та покращувати стан при хворобах, включаючи акне та псоріаз, а також інші аномалії шкіри. АГК також ефективні при підживленні шкіри. В залежності від концентрації та тривалості нанесення вони можуть викликати або стимулювати відшарування і злущення зовнішнього шару кератинових та рогових тканин шкіри, а також стимулювати відновлення нових шарів шкіри, що забезпечує значне поліпшення її зовнішнього вигляду.

Деякі АГК, що використовуються для даної мети, є простими альфа-гідроксикислотами, а саме - гліколева кислота, а також молочна, лимонна та яблучна кислоти. Ці кислоти відомі як "фруктові", бо знайдені вони у фруктах, а гліколева кислота - у цукровій тростині. Існує багато інших АГК, а також еквівалентних їм альфа-кето кислот та схожих на них, про які відомо або можна сподіватися, що вони придатні для підживлення шкіри та забезпечення іншої корисної для шкіри функції. Деякі бета-гідроксикислоти, наприклад, саліцилова кислота, також мають корисні для шкіри властивості. Деякі такі "шкіряні кислоти", наведені в Yu et al U.S. Patent №5.091.171, а також у наданих тут посиланнях.

Поганий косметичний стан ділянок шкіри біля очей багатьох осіб призводить до спроби зробити ці ділянки основною метою для використання таких корисних для шкіри агентів, як АГК. Корисність АГК звичайно обумовлена їх гідрофільністю, легкою розчинністю у воді, а у випадку молочної кислоти - і тим, що вона є рідкою при кімнатній температурі (вище 16,8°C). Ця гідрофільність, як правило, несумісна з такими звичайно гідрофобними косметичними засобами для очей, як олівці або основи. Відсутність води в таких косметичних композиціях для очей призводить до того, що невелика кількість активних гідрофільних речовин, наприклад АГК, можуть або втратити свою активність завдяки хімічним та фізико-хімічним взаємодіям, або їх неможливо нанести на шкіру в аналогічному гідрофільному або водному середовищі.

До того ж, переважними для таких агентів середовищами є дуже кислі, ці умови важко забезпечити на поверхні шкіри, яка оброблена безводними або суттєво гідрофобними косметичними препаратами. Критичною проблемою для будь-яких косметичних препаратів для очей є позбавлення їх подразнюючих або стимулюючих алергію та патогенні реакції очей властивостей. АГК можуть бути дуже кислими, відомо, що вони є сильними подразниками, навіть коли використовуються на малочутливих ділянках шкіри. Позбавлення подразнюючих властивостей має особливе значення для продуктів, що використовуються у денний час для обробки очей та інших чутливих ділянок шкіри.

Один шлях нанесення дерматологічно та косметично активних агентів у косметичному препараті полягає у вміщенні активного агента в або на придатні частки носіїв. Особливе значення як носії мають маленькі пористі частки або мікросфери. При цьому підході проблема полягає в наявності спорідненості між середовищем, що містить активний продукт, та мікросферами, що утримують активний агент, яким насичені ці мікросфери, в цьому випадку необхідно подолати цю спорідненість, щоб звільнити активний агент. Також важливо, щоб нанесена основа не мала більшої спорідненості до дерматологічно активної речовини, ніж має носій, бо інакше активний агент може вивільнитися з пор носія до основи передчасно і розсіятися.

Shaefer et al. U.S. Patent 5.292.512 розкриває косметичну композицію для місцевого застосування, в якій такі дерматологічно активні агенти, як засоби проти акне, наприклад, ретиноїди, пероксид бензоїла, гормони, антифунгіциди, антибіотики і т.п. для нанесення на шкіру, абсорбовані на

частках носія. Типовими частками носія є мікросфери з органічних полімерів. Активний продукт вводять до мікросфер розчиненням його у придатних розчинниках, наприклад, воді, гліцерині та подібних. (Див. графа 4, строки 47 - 54).

Метою Shaefer et al в введення активних продуктів до сальних сумок для того, щоб ці продукти вивільнялися під епідермісом. Для цього Shaefer et al використовують дуже маленькі мікросфери, з яких 80% мають діаметр між 3 та 10µм, які придатні за розміром, щоб потрапити у сумки під епідерміс. (Див. графа 1, строка 45 і до графи 2, строки 40). Shaefer et al не пропонують ні засобів доставки дерматологічне активних агентів на зовнішню поверхню рогового шару шкіри, ані засобів контрольованого вивільнення активних агентів, особливо гідрофільне активних агентів з безводної косметичної композиції на цю поверхню. Shaefer et al забезпечують підшкірне проникнення без вивільнення на поверхні.

Shaefer et al.'s насичені мікросфери вводять в різноманітні гідрофільні або гідрофобні гелеподібні композиції, які, як сказано, забезпечують чудові властивості супроти акме, що головним чином обумовлено проникненням активних інгредієнтів у сальні мішечки. Shaefer et al.'s композиції ясно спрямовані на одиничний випадок препаратів, що забезпечують кращу доставку специфічно активних агентів і не мають незалежних косметичних переваг. Якщо користувачі бажають мати косметичні переваги на додаток до лікування акме та інших захворювань, необхідно окремо застосовувати косметичний препарат, який може виявитися несумісним з засобом лікування акме. Shaefer et al. не намагаються ввести мікросфери, насичені активним агентом. в косметичну основу або братися за проблеми, що можуть виникнути при цьому. Більш конкретно, Shaefer et al. не беруться за проблему доставки до поверхні шкіри гідрофільних агентів з косметичної композиції на гідрофобній основі, яка повинна мати власні корисні косметичні властивості, незалежні або додаткові до косметичних властивостей, обумовлених доставкою активного агента.

Заявлений винахід призначений забезпечити лікувальний засіб.

Він вирішує проблему, як ввести дерматологічно активний гідрофільний агент для очей та інших чутливих ділянок поверхні шкіри до гідрофобної косметичної композиції.

Для вирішення цієї проблеми винахід пропонує косметичну композицію, в якій дерматологічно активний гідрофільний агент, що є складовою частиною рідкого гідрофільного середовища, адсорбується або абсорбується в або на частках придатного носія. Ця система носій - активний агент може бути включена в практично безводну косметичну основу, наприклад, крем-суспензію. Безводна основа переважно включає один або більше плівкоутворювальних агентів, що забезпечують нову косметичну композицію, яка може бути використана для доставки гідрофільного агента на окремі ділянки шкіри. Переважне втілення винаходу забезпечує розв'язання проблеми створення корисної косметичної композиції, що містить ефективну концентрацію дерматологічне активного агента і забезпечує кероване вивільнення дерматологічне активного агента на шкіру.

Косметична композиція згідно з винаходом може бути створена в рамках широкого кола косметичних продуктів, наприклад, пігментованих олівців для очей, непігментованих основ під олівці для очей, губних помад, уволожнювачів, ліків для губ, основ і т.п. Ці нові косметичні продукти на додаток до цінних косметичних властивостей мають дерматологічну активність і забезпечують тривалу корисну дію. Так, наприклад, олівці для очей можуть бути створені разом з підживлюючими шкіру агентами, наприклад, альфа-гідроксикислотами, при цьому забезпечується і негайний, і довготривалий позитивний вплив на повіки очей.

Досліди та випробування, що наведені нижче, показують, що такі косметичні композиції, які містять мікросфери, насичені дерматологічне активними агентами, наприклад АГК, згідно з винаходом можуть ефективно доставляти АГК в її активній формі до поверхні шкіри з практично безводного розчинника, в якому дисперговані плівкоутворювальні агенти або системи. Наведені тут дані показують, що АГК, що включена до композиції згідно з винаходом, ефективно переходить до шкіри і забезпечує цінний вплив на неї, наприклад її підживлення, на що вказує значне зростання вологості шкіри після чотирьох або більше днів використання. Несподівано було виявлено, що дерматологічне активні агенти успішно видаляються з мікросферичних

носіїв, несумісних з чужорідним гідрофобним оточуючим середовищем пасто- або желеподібної основи, в якій вони сформовані для проведення випробувань. Гідрофобність середовища повинна заважати виходу гідрофільно активного засоба з мікросфер. За браком скільки-небудь детальної теорії концепція винаходу полягає в тому, що розтирання та масаж, що звичайно супроводжують місцеве застосування продукту, призводять до контакту мікросфер, що містять АГК, зі шкірою, при цьому волога шкіра витягує з мікросфер гідрофільний розчин, який містить АГК. При місцевому використанні косметичних композицій згідно з винаходом, скажімо, навкруги очей або на губах, вони постійно перемішуються, оскільки віки блимають, а губи рухаються або витираються, забезпечуючи постійний кругообіг мікросфер, що контактують з поверхнею шкіри, за рахунок чого гідрофільний розчин, який містить АГК, весь час поступає на цю поверхню.

Далі, відповідно теорії, це проявляється в тому, що плівкоутворювальні властивості гідрофобної основи утворюють бар'єр, який зменшує втрати вологи з поверхні шкіри. Це зменшення втрат води призводить до підвищення вмісту води у шкірі, у зв'язку з чим полегшується вихід дерматологічно активного агента на поверхню шкіри. На додаток, вода, або будь-який інший розчинник, придатний для дерматологічного активних агентів, які введені для подальшого використання у вторинних продуктах, для яких композиція згідно з винаходом використовується як основа, також можуть допомагати переходу активного агента з носія на шкіру.

Мікросфери з органічних полімерів мають тенденцію злипатися між собою і не прилипати до шкіри. Сильні адгезивні властивості мікросферам можуть бути забезпечені їх введенням в безводні косметичні композиції, які містять придатні для цього плівкоутворювальні агенти, включаючи нові плівкоутворювальні системи згідно з винаходом. Коли такі плівкові системи використовуються у косметичних композиціях, що містять мікросфери, може бути отримана гарна безводна плівка, що прекрасно наноситься на шкіру, не змінюється і не відстає.

Інші корисні косметичні властивості теж можна одержати на базі композицій згідно з винаходом. Чіткі зморшки на шкірі можуть бути косметично замасковані або приховані їх заповненням та поглинанням світла мікросферами з одночасним дерматологічним відновленням шкіри за рахунок її підживлення дією АГК.

Переважно, композиції можуть також розсіювати світло, завдяки чому приховуються темні кола під очима і забезпечується гарний вигляд. Переважно, втілення винаходу може також підвищувати бар'єрні властивості поверхні шкіри, на яку вони нанесені, щодо води і тим посилювати дію дерматологічного активного гідрофільного агента, що переходить з косметичного препарату, і підвищувати тривалість дії косметичних препаратів, що включають продукти винаходу.

Багато з наведених далі властивостей можуть бути скомбіновані в одному поліфункціональному косметичному препараті, що одночасно забезпечує і безпосередній, і тривалий позитивний вплив на споживача.

Деякі втілення винаходу, а також один або більше шляхів його практичного застосування, включаючи найкращі методи виготовлення, розглянуті винахідником, що пропонує винахід, будуть нижче описані більш детально. Також будуть наведені декілька ілюстративних, але не лімітуючих прикладів найкращого втілення винаходу.

Найкращі втілення винаходу відносяться до нових косметичних композицій, що містять ефективну кількість полярного дерматологічного активного агента, необхідну кількість придатного адсорбуючого чи абсорбуючого носія, що утримує цей агент, а також один або більше плівкоутворювальні компонентів в практично безводному розчиннику чи основі, підібраних з метою доставки дерматологічного активного агента до поверхні рогового шару шкіри.

Ця композиція забезпечує властивості, що дозволяють споживачу або носію мати задоволення від її вживання, допомагаючи в косметичному плані, забезпечуючи принадність, і в той же час, маючи одну чи більше корисну для шкіри властивість, дія якої продовжується і після видалення косметики.

Практично безводна основа забезпечує середовище або розчинник для дисперсії нанесеного на частки носія активного агента, це середовище може бути рідким або напівтвердим, наприклад, дисперсантом або розчинником для інших косметичних інгредієнтів, що надають композиції бажані косметичні властивості. Безводна основа може містити в собі більше або менше летючих безводних косметичних

розчинників, в яких загущуючі компоненти довільно диспергуються для досягнення потрібної консистенції.

Абсорбуючі носії. Згідно з винаходом придатними для транспортування дерматологічне активних інгредієнтів або агентів, наприклад, альфа-гідроксикислот в їх активній формі, до шкіри, можуть бути найрізноманітніші матеріали, що захищають активний препарат від впливу інших косметичних інгредієнтів, які можуть його дезактивувати. Придатні для носіїв матеріали включають, але необмеженим, мікросфери з органічних полімерів, а також частки неорганічного походження. Деякі мікросферичні порошкові матеріали, що є у продажу і використовуються при виготовленні косметичних матеріалів згідно з винаходом, включають органічні полімери, наприклад, поліетилен, поліпропілен та їх співполімери, поліуретан, поліефіри, поліаміди, поліметилметакрилат, найлон, етиленакрилатні та полівініліденові співполімери. В основному можуть бути використані будь-які нетоксичні, не дратуючі, косметично сумісні органічні полімерні матеріали, що можуть бути застосованими у формі, яка забезпечує задовільні для мети цього винаходу адсорбційні чи абсорбційні властивості, і які сумісні з безводною основою.

Кілька прикладів неорганічних часток включають тальк, глини, в т.ч. модифіковані органічними речовинами, каолін, слюду, саліцилат кальцію і різноманітні карбонати різних металів, наприклад, кальцію та магнію.

Частки носія не можуть бути настільки великими, щоб їх присутність у композиції була помічена користувачем як шорсткі частки або пісок, краще, коли косметика відчувається гладенькою. Тому щонайменше вісімдесят процентів часток за розміром не повинні перевищувати 50, а краще 20 мікрон. Частки не повинні бути і такими маленькими, щоб вони могли потрапити у сальні мішечки, що небажано, а також забезпечували тільки малий об'єм сховища для нанесеного дерматологічно активного агента. В межах, які забезпечують задовільні почуття при нанесенні косметики, частки носія повинні бути відносно великими, щоб бути спроможними виділити активний наповнювач з поверхні або крізь отвори на поверхні з внутрішнього об'єму часток. Краще, щоб щонайменше вісімдесят процентів часток носіїв мали діаметр не менше 10 мікрон. Ще кращі межі для якнайменше восьмидесяти процентів часток - від 10 до 20 мікрон, а найкращі - від 10 до 15 мікрон. Середній розмір використаних часток знаходиться в межах 12 - 20 мікрон.

Пористим часткам носіїв надається особлива перевага, оскільки рідка фаза може бути абсорбованою всередині частки, займаючи, наприклад, від 10 до 90 процентів її об'єма, що краще, ніж коли вона розташована просто на поверхні частки.

Абсорбуючі порошки як носії для місцевого виділення дерматологічно активних агентів або розчинів можуть включати мікросфери з пористих органічних полімерних матеріалів, наприклад, такого косметичне придатного поліаміду, як найлон-12 в пропорції приблизно від 0,1 до 40 процентів, краще від 5,0 до 20 процентів, ще краще від 6,5 до 10 процентів по масі від косметичної композиції. На додаток до перенесення АГК або інших дерматологічно активних агентів мікросфери з органічних матеріалів надають бажане при нанесенні крему та пудри відчуття шовковистості готової до вживання композиції та властивість розсіювати світло. Після позбавленні АГК або іншого дерматологічно активного агента мікросфери з органічного полімера набувають властивостей абсорбувати шкіряний жир, допомагаючи боротися з розривами косметичного шару за рахунок прориву жиру.

Дерматологічне активні агенти. Приклади придатних дерматологічно активних агентів, що можуть бути доставлені на шкіру композиціями згідно з винаходом включають, але не обмежені ними, такі:

анестезуючі препарати, наприклад, бензиловий спирт, лідокаїн та ментол;

в'яжучі засоби, наприклад, гамамеліс (*Hamamelis virginiana*), алюмінійові або алюміній-цирконійові солі бензойної кислоти;

злушуючі препарати, наприклад, резорцин, саліцилова, аскорбінова та оцтова кислоти;

відшаровуючі препарати, наприклад, молочну, гліколеву та інші альфа-та бета-гідроксикислоти;

судинозвужуючі, наприклад, гідрохлорид фенілепінефіну;

зовнішні знеболюючі, наприклад, гідрохлорид трипеленаміну та камфору;

антизапалювальні, наприклад, солі солодкової кислоти, альфа-бісаболол;

похідні саліцилової кислоти та ібупрофен;

антиподразнюючі, наприклад, аллантаїн, протеїни, триметилгліцин, гліцин, аскорбінової та ферулової кислоти, лактат натрію; відбілюючі, наприклад, аскорбілфосфат магнію, пероксид водню, койєву кислот та гідрокінон;

ліполітичні засоби, наприклад, кофеїн, амінофіллін та інші ксантинові основи;

підсилювачі пігментації, наприклад, дигідроксіацетон;

препарати, що захищають від сонця, наприклад, параметоксиціанамат діетаноламіну, амінобензоат гліцерилу, 2-гідрокси-4-метокси-бензофенон-5-сульфонову кислоту, 2-фенілбензімідазолсульфонову кислоту.

Зволожувачі та пом'якшувачі, наприклад, пантенол, хлорид лактамідпропіл-тримонію (lactamiodopropyl trimonium), солі піролідонкарбонової кислоти та поліетиленгліколь з молекулярною масою від 40 до 10.000 дальтон, співполімер пропіленгліколь/етиленгліколь, гліцерин, полігліцерильні полімери, моно-, ді-, три- та полісахариди або відновлені моно-, ді-, три- та полісахариди та їх похідні, пропіленгліколь, поліпропіленгліколь з молекулярною масою від 100 до 10.000 дальтон, гігроскопічні амінокислоти, пептиди та поліпептиди або їх похідні, глікозаміноглікани; аміді або естери альфа-чи бета-гідроксикислот, етоксилатні похідні гліцерину, пропіленгліколь, бутанол чи пентанол, інозит та холінхлорид;

живильні добавки, наприклад, вітаміни С, В, фолієву кислоту та мінеральні добавки, наприклад, сполуки кальцію, магнію, феруму, цинку, мanganу, селену та фосфору.

Еквіваленти вищенаведених прикладів та інших вказівок підказують інші дерматологічне активні агенти, придатні для використання в композиціях згідно з винаходом. Деякі такі агенти наведені в OTC Monographs & Phisician DeskReferense, що включають додаткові посилання. Деякі з цих та інших агентів розкриті у Patent № 5.292.512 Shaefer et al., який також включений у посилання. Вказані у Shaefer et al., косметичні носії зовсім не схожі на ті, що відповідають винаходу, що пропонується. Shaefer et al., пропонують настільки малі ультрамікроскопічні частки носіїв, щоб забезпечити підшкірну інтрузію або перенесення насичених активними агентами часток безпосередньо в отвори сальних мішечків чи фолікулярні отвори шкіри. Пропонуємі Shaefer et al., частки носіїв обов'язково повинні бути менше 10 мікрон в діаметрі з тим, щоб мати змогу надійно та постійно потрапляти у отвори сальних мішечків. Оскільки активні матеріали адсорбовані на, чи абсорбовані в частках носія, який диспергований у практично безводній косметичній основі або розчиннику, краще, щоб дерматологічно активний агент або інгредієнт був полярним і мав невелику, або взагалі не мав спорідненості до компонентів практично безводної основи.

Один або більше дерматологічно активних агентів в межах від 0,01 до 10% від маси композиції можуть бути введені в її варіант, що вважається кращим. Ще краще, щоб вміст агента складав від 0,5 до 8,0%, а найкраще - від 1,0 до 5,0%. Інші активні агенти можна використовувати в еквівалентних пропорціях, що залежать від їх активності, однак вказані пропорції є кращими для чутливих ділянок біля очей.

Кращими дерматологічно активними агентами є ті, що належать до класу відшаровуючих, а саме альфа- та бета-гідроксикислоти. Ці речовини можна використовувати як при зволоженні, так і при підживленні шкіри для надання їй кращих структурних властивостей та зовнішнього вигляду. Ці переваги можуть бути досягнуті тільки після тривалого користування косметичним препаратом згідно з винаходом при правильному, наприклад, щоденному, його використанні впродовж днів або діб, починаючи від чотирнадцяти або двадцяти одного дня і продовжуючи від трьох до шести місяців, наносячи раз чи двічі на день, або навіть продовжуючи використання його необмежено.

На закінчення цього, нові, практично безводні косметичні композиції для очей та губ відповідно цьому втіленню винаходу містять як дерматологічне активні гідрофільні агенти щонайменше одну альфа-гідроксикислоту (АГК), наприклад, молочну, лимонну, яблучну, змішані фруктової кислоти або їх суміш, яка утримується на матриці або на пористих частках носія. АГК краще утримується на частках носія коли вона знаходиться на поверхні пор часток носія, а також всередині внутрішніх пор, що сполучаються з зовнішніми порами, завдяки чому АГК, розподілена у гідрофільному середовищі, може виходити на поверхню частки носія і переходити з неї на вологу шкіру завдяки капілярним взаємодіям.

Деякі інші альфа-гідроксикислоти, які можна практично використовувати згідно з цим винаходом, включають аліфатичні кислоти з лінійним або розгалуженим ланцюгом з не більш ніж трьома замісниками в аліфатичному ланцюзі, вказані замісники не повинні бути основними і повинні бути вибраними з групи, що містить гідроксильну, альдегідну, кетонну, карбоксильну, нітрогрупу та хлор. Кислотність та розчинність у воді та водноспиртових розчинах є бажаною характеристикою альфа-гідроксикислот, що використовують згідно з винаходом, що пропонується.

Деякі більш придатні альфа-гідроксикислоти містять щонайменше одне гідрофобне угруповання, що є атомом карбону, який утворює чотири суттєво неполярних зв'язки, наприклад, з атомами карбону або водню. Така гідрофобність, можна гадати, є корисною для збалансування негативно заряджених гідроксильної та карбоксильної груп з метою збільшення біологічної сумісності та ефективності препарату.

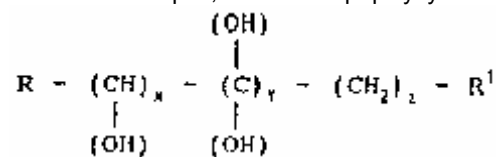
Деякі інші альфа-гідроксикислоти є переважно монокарбоновими, вибраними з групи, що містить 2-гідрокси-п-бутанову, 2-гідроксіізобутанову, 2-гідрокси-п-пентанову, 2-гідроксіізопентанову, 2-гідрокси-п-гексанову, 2-гідроксіізогексанову кислоту. Можна використовувати також їх ді- або полігідроксильні аналоги, наприклад, 2,Х-гідроксоаналоги, в яких "Х" може бути від 3 до 6 в залежності від вибраної моногідроксикислоти, вказуючи номер (крім першого та другого) атома карбону, до якого приєднаний другий гідроксильний замісник. Краще збалансувати додаткові електронегативні властивості такої дігідроксикислоти гідрофобним угрупованням, що описане вище.

В той час, як деякі дерматологічне активні агенти мають властивості, наприклад, достатньо низьку температуру плавлення, які дають їм змогу адсорбуватися чи абсорбуватися на або в матрицю носія безпосередньо, інші при кімнатній температурі знаходяться у кристалічному стані і їх краще розчиняти у придатному для цього гідрофільному розчиннику. Також краще, щоб розчинник не мав або мав малу спорідненість до практично безводної основи препарату. Важливо, щоб носій утримував і розчинник, і розчинений в ньому дерматологічно активний агент для збереження потрібного функціонування дерматологічне активного агента.

На додаток, розчинник повинен мати відповідну в'язкість, щоб в подальшому забезпечити уповільнену міграцію з носія дерматологічно активного агента. Розчинник також повинен бути інертним або неактивним, або, щонайменше, не впливати негативно на функціональні властивості дерматологічне активного агента.

Гідрофільні розчинники. Деякі класи рідких гідрофільних розчинників або фазодиспергуючих середовищ, що можуть бути використані поодиночі або у комбінації, щоб допомогти наситити поверхню або об'єм часток носія дерматологічно активним агентом, включають, не обмежуючись цим, воду, спирти та етери.

Придатний для цього клас спиртів включає одно-, дво-, трьох- або поліатомні спирти, які мають формулу:



в якій R=H, CH<sub>3</sub> або насичений, ненасичений, циклічний або розгалужений радикал, який містить від 1 до 20 атомів карбону; X = 0 - 1.000.000; Y = 0 - 100; Z = 1 - 10; а R<sub>1</sub> - H, CH<sub>3</sub>, O-CH<sub>3</sub>, O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>.

Придатні етери включають заміщені та незаміщені етери, наприклад, такі розчинники від Union Carbide, як UCON (торгова марка) флюїд, Union Carbide Corp. or DOWANOL (торгова марка) флюїди, Dow Chemical Company or CARBITOL (торгова марка) та Cellosolve (торгова марка).

Загалом, гідрофільні розчинники та їх суміші потрібної в'язкості можуть бути використані разом з дерматологічне активними агентами в пропорції від 99 : 1 до 1 : 99.

Однак, потрібні пропорції вибирають з урахуванням фізичних або фізико-хімічних характеристик розчинника, потрібного для переходу дерматологічне активного агента в рідку фазу в активній формі з подальшою його абсорбцією частками носія. При досягненні цього мала пропорція розчинника в деяких обставинах може бути корисною, але більш бажаним є великий вміст розчинника, наприклад, при відношенні агента та розчинника по масі від 1 : 1 до 1 : 20. В той час, як такі пропорції можуть бути ефективними у випадку міжклітинноактивного агента, більш

дієздатні внутрішньоклітинноактивні агенти, наприклад, гідрофільні або водорозчинні гормони, як кортикостероїди, які можна використовувати у відносно менших пропорціях, наприклад, при відношенні агента та розчинника від 1 : 999 до 1 : 20. Більш бажаним розчинником для дерматологічне активних речовин, наприклад, альфа-гідроксикислот (АГК), є гліцерин. В'язкість розчинника дозволяє утримувати АГК всередині або на поверхні часток носія, в той час як гідрофільність дозволяє волозі шкіри забирати розчинену АГК від мікрочасток.

Плівкоутворювальні агенти. Згідно з винаходом бажано, щоб плівкоутворювальні агенти сприяли адгезії насичених часток носія до шкіри та допомагали утворювати непроникний бар'єр, щоб збільшити вміст води на або поблизу поверхні шкіри. Під плівкоутворювальними розуміють такі, що утворюють бездоганно суцільний шар продукту на поверхні шкіри. Під непроникністю розуміють те, що бар'єр, розташований на поверхні шкіри, суттєво блокує втрати летючих речовин з поверхні шкіри та залишає їх у її верхніх шарах. Згідно меті цього винаходу бар'єрна плівка, бажано, є гідрофобною.

Деякі класи придатних для використання у косметиці плівкоутворювальних агентів, що можуть бути використаними поодиночі або у комбінації, включають, не обмежуючись цим, мила металів, віск та плівкоутворювальні пом'якшувачі. Деякі нелімітовані приклади кожного з цих класів косметичних плівкоутворювальних агентів ми наводимо нижче. Інші добре відомі спеціалістам.

Мила металів є корисними матеріалами для забезпечення адгезії та сприяння утворенню гідрофобної плівки. Желеподібні мила металів можуть бути алканоатами лужноземельних металів або алюмінія, ланцюжки яких містять від шести до двадцяти атомів карбону, наприклад, лауратами, олеатами або стеаратами кальцію, магнію, алюмінію, цинку або літію, або їх сумішшю. Косметичне мило металу, наприклад, лаурат цинку, можна використовувати в пропорціях від 1,0 до 5,0 процентів, краще 3,0 процента від маси композиції. Мила металів функціонують як іонні загущувачі, що підсилюють адгезію та додають гідрофобності утворюваній плівці.

Воски є іншими плівкоутворювальними агентами. Багато з них, що можуть функціонувати як плівкоутворювальні агенти в композиціях згідно з пропонуємим винаходом, добре відомі у косметичній практиці. Типовими такими матеріалами є сполуки формули R-X, в яких R - насичений, ненасичений, циклічний або розгалужений довголанцюжковий радикал, в якому від 8 до 1.000.000 атомів карбону; X = -H, -OR' або -C-OR", де R' = H, насичений, ненасичений, циклічний або розгалужений радикал з числом атомів карбону від 1 до 24; R" = H або залишок моно-, ди-, три- або полігідроксильної сполуки, здатної утворювати моно-, ді-, три- або поліестери.

Бажані воски мають точку плавлення вище 100°F. Можуть бути використані такі матеріали, як воскоподібні естери гліцерину, церезиновий, бджолиний, пальмовий та канделільський, а також інші косметично придатні воски.

Згідно з винаходом загальний вміст воску від 0 до 10,0 процентів є адекватним для забезпечення задовільних косметичних властивостей. Бажано, щоб загальний вміст воску не перевищував 5,0 процентів, а ще краще - 3,0 процентів. Придатними восками є трибегенатний естер гліцерину, церезиновий та мікрокристалічний воски, що використовуються у пропорції від 0 до 5,0 процентів, бажано - від 0,1 до 1,5 процента. Ще краще використовувати від 0,25 до 0,5 процента такого воска, як трибегенат гліцерилу, і у дещо вищій пропорції від 1 до 2 процентів - церезинового воску.

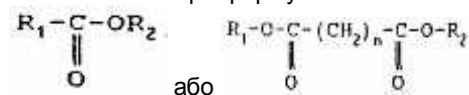
Невеликий вміст воску, досяжний в косметичних композиціях згідно з винаходом, вигідний тим, що забезпечує низькі зусилля при його нанесенні та підвищення рухливості. Корисними функціями воску є адгезійні, а також такі, що надають продукту відчуття жирності, плівкоутворювальні та такі, що збільшують в'язкість.

Іншими корисними плівкоутворювальними сполуками є пом'якшувачі. Ці матеріали звичайно є рідкими при температурах між 32°F та 100°F. Згідно з винаходом, що пропонується, корисними пом'якшувачами є такі, що включають сполуки формули  $C_nH_{2n+2-x}$ , де n - від 6 до більше, ніж один мільон, а X - не більше n, і включають насичені, ненасичені, розгалужені або циклічні вуглеводневі ланцюги. Прикладами є: мінеральні масла, петролатум, PERMETHYL (торговельна марка) флюїди та полібутилени. Далі, корисні плівкоутворювальні пом'якшувачі включають моно-, ди-, три- та полі- насичені, ненасичені, розгалужені та циклічні естери та етери



ди-, три-, полігідроксисполук, наприклад, етиленгліколю, пропіленгліколю, гліцерину, сорбіту або поліолу. Приклади таких пом'якшувачів включають, не обмежуючись цим, рослинні олії, наприклад соєву, пальмову, хлопкову, касторову, китайську талову, crambe, perilla, датську рапсову, з висівку рису, з горіхів пальми, оливкову, лляну, кокосову, сафлорову, сонячникову, арахісову та кукурудзяну олії. Бажані насичені та ненасичені рослинні олії містять жирнокислотні компоненти з числом атомів карбону від 6 до 24.

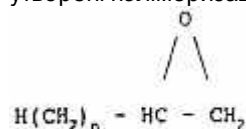
Подальші придатні для плівкоутворювальних агентів пом'якшувачі включають естери формули:



де R1 та R2 - насичені, ненасичені, розгалужені або циклічні радикали з числом атомів карбону від 2 до 24, а n знаходиться в межах від 0 до 20.

Допоміжні плівкоутворювальні агенти на основі силікону. Нові косметичні композиції згідно з винаходом можуть містити також силіконові матеріали, що забезпечують деякою мірою допоміжну плівкоутворювальну здатність. Придатні силіконові матеріали у більшості нерозчинні у воді та циклометиконі, поліалкілсилоксанах, поліарилсилоксанах, поліалкіларилсилоксанах, полісилоксанових смолах, амінофункціональних полісилоксанах та поліетерсилоксанових слів полімерах. Вказівки на додаткові силіконові матеріали можуть бути знайдені в U.S. 4.788.006; U.S. 4.341.799; 4.152.416; 3.964.500; P.208.911; 4.364.837 та U.S. 4.465.619, розкриття яких до того ж включене в наведені тут посилання.

Допоміжні поліалкіленоксидні плівкоутворювальні агенти. Інший клас придатних допоміжних плівкоутворювальних агентів включає речовини, утворені полімеризацією алкіленоксидних мономерів формули:



в якій n знаходиться в межах від 0 до 3.

Ці матеріали можуть бути гомогенними полімерами або співполімерами двох або більше мономерів. Приклади гомогенних полімерів включають поліпропіленоксидні та бутиленоксидні полімери. Звичайно молекулярні маси цих матеріалів знаходяться між 100 та 10.000 дальтон. Крім того, ці матеріали можна конденсувати з моно- або полігідроксіалкільними спиртами, які ілюструються флюїдами UCON (торговельна марка) від Union Carbide Corp.

Плівкоутворювальні агенти можна використовувати поодиночі або в комбінації з іншими плівкоутворювальними агентами для досягнення бажаних естетичних властивостей кінцевого препарату. Бажаний вміст плівкоутворювальних агентів - від 1 до 99%, більш бажаний - від 1 до 50% від маси композиції.

Придатні неотверджуючі утворювачі плівок, наприклад, диметикон, можуть бути використані в кількості від 0,5 до 5,0 процентів, бажано від 0,6 до 1,5 процента, більш бажано до 1,0 процента. Бажані функції включають в себе плівкоутворення, захист шкіри або утворення водного бар'єра, змашувальні та пом'якшувальні (відчуття шовковистості) властивості.

Можуть бути використані посилюючі плівку агенти, наприклад, слюда, оброблена міристатом алюмінію, при вмісті від 4,0 до 20,0 процентів від маси композиції, краще від 5,0 до 8,0 процента, ще краще 6,5 процентів. Бажані підсилюючі плівку функції включають прилипання до шкіри, надання композиції відчуття шовковистості та м'якості та підсилення гідрофобності плівки.

Хоч сильні адгезивні властивості можуть бути надані безводній косметичній композиції введенням воскових плівкоутворювальних<sup>1</sup> агентів, але високий вміст воску призводить до утруднення нанесення та появи небажаного відчуття клейкості при використанні косметики, а також може утруднювати позбавлення від косметичного препарату.

Для розв'язання цієї задачі згідно з винаходом запропоновано також нові плівкоутворювальні системи, що містять відносно багато загущувачів на базі мінеральних часток, наприклад, часток бентонітових глин, а також часток мил металів, наприклад, лаурату цинку, але які використовують

тільки при малому вмісті воску.

При використанні цих систем в косметичних композиціях, що містять мікросфери, можна одержати гарні безводні плівки з чудовою здатністю до нанесення та відсутністю липкості. Ці бажані властивості з'являються в результаті унікальної комбінації гарних адгезивних по відношенню до шкіри властивостей мил металів зі змащуючими властивостями, обумовленими наявністю кульоподібних мікросфер.

В одному з практичних втілень винаходу носії, насичені нашими АГК, одержані розчиненням АГК у гліцерині та поглинанням утвореного розчину АГК пористими мікросферами або дуже дрібними полімерними частками. Ця система призначена для використання в гідрофобному оточенні, в якому АГК зберігається в порах мікросфер. При нанесенні на шкіру, оскільки косметика втирається в шкіру або масажується, мікросфери переміщуються відносно поверхні шкіри, вступають в контакт з вологою, яка забирає гідрофільний АГК-гліцериновий розчин від мікроскопічних полімерних часток.

Втративши АГК-гліцериновий розчин, мікросфери набувають можливості поглинати жир, попереджуючи його прориви крізь шар косметики.

АГК є бажаним для насичення часток носія, наприклад, пористих часток найлону у рідкому середовищі, яке повинно мати придатну в'язкість, щоб утримуватися в порах часток в процесі отримання композиції. Молочна кислота плавиться при 16,8°C і може бути абсорбована в порах часток носія без будь-яких допоміжних речовин при температурах вище точки плавлення перемішуванням в придатних пропорціях, наприклад, близько 1 : 1 по масі, аж поки молочна кислота буде поглинута. Інші кислоти, такі як змішані фруктові кислоти, можуть бути аналогічно нанесені на частки носія перемішуванням, тобто додаванням присадок з використанням їх дуже дрібних порошоків, що складаються з часток достатньо малого розміру, щоб розміститися в порах носія.

Користь від підживлення шкіри АГК виявляється в кращих структурних та візуальних її якостях, що може почати виявлятися тільки після тривалого застосування косметичної композиції згідно з винаходом при регулярному, наприклад щоденному, нанесенні впродовж періода від тижня до, наприклад, чотирьох чи шести тижнів, або більше.

На закінчення, нові практично безводні косметичні композиції для очей та губ згідно з втіленням винаходу містять як дерматологічно активні агенти щонайменше одну АГК, наприклад, молочну, або змішані фруктові кислоти, що утримуються на матриці або у пористих частках носія у формі порошка синтетичного органічного полімера, наприклад, найлону. Бажано, щоб АГК знаходилася в поверхневих порах часток носія, а також у внутрішніх порах, що сполучаються з цими поверхневими порами, щоб АГК могла перейти на поверхню частки, а з неї на вологу шкіру.

Винахід також забезпечує плівкоутворювальну основу для крем-пудри з малим вмістом воску, або без нього, для вищезначених насичених АГК систем. Ці системи з малим вмістом воску роблять можливим створення унікальної комбінації з відносно великим вмістом такого загущувача, як бентоніт, та високим вмістом мила металу в бажано такій летючій розчинювальній системі, як циклометикон, наприклад, диметикон або неполярному розчиннику, наприклад, летючому вуглеводні.

Несподівано завдяки включенню в композицію насичених АГК мікросфер основа з гарною плівкоутворювальною здатністю, яка легко наноситься та має низьку липкість, отримує вищеписану властивість прокатного ковзання ("rolling slip"). Мила металів самі по собі не забезпечують липкості або адгезії, а ці адгезивні властивості необхідні для нанесення косметичної основи на шкіру, і в разі первинної композиції їх забезпечують відповідною косметичною основою для останнього шару, наприклад олівця для очей.

Бажаним результатом, який досягається завдяки таким новим косметичним засобам, є відчуття шовковистості при нанесенні пудри. Перевагою адгезивних, при відсутності липкості властивостей нових поліпшувачів вигляду очей згідно з винаходом є несподівано тривала стійкість, що доведено порівняльними випробуваннями. В той час, як традиційний макіяж для очей може потребувати повторного нанесення після кількох годин та звичайно помітно вицвітає через приблизно шість годин, косметика, одержана згідно з винаходом, може залишатися задовільною більше 12 годин без несприятливих наслідків.

Крем-пудри згідно з винаходом є швидковисихаючими. Розчинник

випаровується за кілька секунд, забезпечуючи шовковистий на дотик тар пудри. Включення світлорозсіюючих агентів забезпечує розсіювання світла в тінях всередині зморшок або інших дефектів шкіри і допомагає одержати продукт з "м'якофокусним" виглядом. Такі поліпшувачі вигляду очей згідно з винаходом забезпечують синергізм між плівкоутворювальною системою та мікросферами, що містять АГК і забезпечують поліпшення зовнішнього вигляду при нанесенні, що надає шкірі ілюзію поліпшення її якості, в той час як альфа-гідрокислоти, вступаючи в контакт зі шкірою, активно на неї впливають та підживлюють її, так що після регулярного вживання щонайменше впродовж чотирьох тижнів зовнішній вид шкіри поліпшується навіть при відсутності на ній косметики.

Розміщення АГК в порах мікросферичних часток, використання як розчинника для АГК гліцерину ефективно ізолює гідрофільні інгредієнти від гідрофобних без створення для диспергування окремої водної фази. Інша користь використання мікросфер полягає в зниженні дифузії в чутливі тканини біля очей, обумовленому зв'язувальною дією мікросфер.

Бажаним гідрофобним середовищем для мікросферних часток, що містять активний агент, є силіконовий гель, який краще одержувати з використанням такого летючого силіконового розчинника, як диметикон. Бажаним загущувачем є бентонітовий порошок.

Як вщевказане, згідно з винаходом бажано використовувати косметичні плівкоутворювальні системи з малим вмістом воску, що включають в процентах від маси композиції від 5,0 до 13,0 процентів часток мінерального загущувача, наприклад, бентоніту., та щонайменше 1,0 процент загущувача, яким є мило метала, і не більше, ніж 5,0 процентів косметичного воску, диспергованого, при його наявності, в летючому косметичному розчиннику, бажано циклометиконі в кількості від 30,0 до 70,0 процентів.

Летючий розчинник, наприклад, циклометикон, бажано у формі пентамеру, можна використовувати як гідрофобний розчинник для, наприклад, композиції крем-пудри. Придатними пропорціями є від 20,0 до 70,0 процентів від маси композиції, бажано від 30 до 40 процентів, а ще краще - 33,0 проценти. Функціонує як змочувальний агент, поки швидко випаровується після нанесення. Деякі альтернативні або додаткові летючі силіконові розчинники описані нижче.

Загущувач, придатний для летючого розчинника, наприклад, quaternium-18 бентоніт при вмісті від 1,0 до 15,0 процента, бажано від 3,0 до 10,0 процентів, ще бажаніше - від 5,0 до 6,0 процентів, фізично стабілізує композиції та функціонує як середовище для суспензії пігмента, поглинання жиру та зменшення блиску.

Поверхнево-активні речовини. Поверхнево-активні агенти, наприклад, ізостеарат сорбітан, можна використовувати в кількості від 1,0 до 10,0 процентів від маси композиції, бажано від 3,5 до 4,5 процентів, ще бажаніше 4,0 проценти. Бажані поверхневі агенти дозволяють підвищити ємність твердих матеріалів та надати плівці гідрофобних властивостей.

Полімерні мікросфери для додавання в композицію. Синтетичні полімерні мікросфери, які додають до порошкових носіїв АГК, наприклад, поліметилметакрилат, можна використовувати при вмісті від 8,0 до 20,0 процентів від маси композиції, бажано від 10,0 до 15,0 процентів, ще бажаніше - біля 12 процентів. Такі додаткові полімерні мікросфери слугують для поліпшення відчуттів від косметичного препарату, забезпечуючи "кулькововальничні" відчуття при нанесенні і відчуття сухого оксамиту після нанесення та випаровування розчинника. Додаткові функції включають світлорозсіювання та надання продукту відчуття пудри.

Жирні естери. Жирні малолетючі естерні розчинники, наприклад, ізонананоат ізононілу використовуються для керування летючістю та молекулярною масою розчинника в пропорції від 1,0 до 10,0 проценти, бажано від 4,0 до 6,0 процента, ще бажаніше - біля 5,0 процентів від маси розчинника. Прийнятні розчинники функціонують також як ліпофільні пом'якшувачі, допомагають солюбілізації інгредієнтів та змішуються з летючим основним розчинником, наприклад, диметиконом.

Зволожнювачі. Один або більше жиророзчинних зволожнювачів, наприклад, лаурил РСА, в пропорції від 0,4 до 2,5 процентів, бажано - біля 0,5 процентів, або цетилдиметикон в пропорції від 1,0 до 5,0 процентів від маси композиції можна використовувати для підсилювання зволожнювання. Цетилдиметикон забезпечує відчуття сухості та ніжності, а також сприяє утворенню плівки.

Абсорбенти жиру. Каолін або інші абсорбенти жиру можна використовувати в пропорції від 0,50 до 3,0 процентів від маси композиції, бажано від 0,7 до 1,5 процентів, ще бажаніше 1,00 процент. Бажаними функціями абсорбентів жиру є поглинання надлишку шкіряного жиру, адгезія до шкіри, світлорозсіювання та непрозорість.

Затемнювачі. Затемнювачі, наприклад, діоксид титану, можна використовувати в пропорції від 0,10 до 5,0 процентів від маси композиції, бажано від 0,3 до 1,0 процента, ще бажаніше - 0,50 проценти, що забезпечує прикриття та допомагає маскувати дефекти.

Пластифікатори. Летючий розчинник для полярного активатора загушувача, наприклад, гексиленгліколю, можна використовувати в пропорції від 0,75 до 1,75 процента від маси композиції, бажано - біля 0,85 процента. Він повинен слугувати зв'язуючим пластифікуючим агентом, розчинником та пом'якшувачем, і в той же час забезпечувати стійкість відносно вологи та окиснення.

Консерванти. Такі консерванти, як, наприклад, метил- чи пропилпарабен, можна використовувати в пропорції, наприклад, 0,1 - 0,3%, як це відомо спеціалістам.

Необов'язкові інгредієнти. Як відомо спеціалістам, можна використовувати і інші інгредієнти, включаючи пігменти та віддушки. Ще деякі необов'язкові інгредієнти включають: лінолеат вітаміну Е в кількості біля 0,10%, як додатковий зволожувач, ацетат вітаміну Е - біля 0,10%, що функціонує як поглинач вільних радикалів та антиоксидант, пальмітат ретинілу у кількості біля 0,1%, який функціонує як похідне ретинової кислоти для послаблення тонких зморшок; кераміди, з вмістом менше 0,3%, які укріплюють шкіру; сфінголіпіди, що слугують укріпленню шкіри, в кількості менше 0,3%, а також посилюють бар'єрні властивості шкіри, завдяки чому зростає її вологість та зменшується проникнення подразнюючих речовин.

Альтернативні летючі силіконові розчинники. Клас циклометиконових сполук, які придатні для використання в косметичних композиціях згідно з винаходом, ілюструється сполуками формули  $-(R_1R_2SiO)_n$ , в яких  $R_1$  та  $R_2$  - нижчий алкіл, що містить від одного до чотирьох вуглецевих атомів з або без шкідливих замісників, вибраних з групи, яка містить атоми галогена, гідроксильні, карбоксильні та метоксильні групи, а  $n = 3 - 6$ ; при цьому ці сполуки є циклічними. Вищенаведені летючі циклометиконові розчинники можуть бути використані поодиноці або в суміші, крім того кожна сполука може бути гомополімером, в якому усі мономерні ланки однакові, або гетерополімером, в якому вони різні. Деякими з бажаних циклометиконів є диметикони, особливо полімери, в яких  $n = 4 - 5$ , а  $R_1$  та  $R_2$  - обидва метили, тобто октаметилциклотетрасилоксан та декаметилциклопентасилоксан.

В залежності від характеру кінцевого продукту композиції, наприклад, поліпшувача очей, основи під олівець для очей, губної помади, рум'янів, гриму і т.п., можуть бути використані і інші оптичні інгредієнти, відомі спеціалістам, і у відомій їм кількості. Такі інгредієнти включають, не обмежуючись цим, віддушки, барвники, пігменти, поверхнево-активні агенти, консерванти, поглиначі жиру, затемнювачі та антиоксиданти.

Нижченаведені приклади ілюструють практичне застосування згідно з винаходом більш детально. Вміст інгредієнтів, використаних у прикладах, наведений далі у різних таблицях, що ідентифіковано в прикладах.

Таблиця 1 наводить інгредієнти, що використані в прикладах 1 та 2.

Таблиця 1

Фаза	Опис компонента	Приклад 1	Приклад 2
A	молочна кислота	20	
A	суміш комплексу фруктових кислот		20
A	гліцерин	20	20
B	найлон 12	60	60

#### Приклад 1

У прикладі 1 пористі мікросфери з найлону-12 насичені розчином молочної кислоти у гліцерині. Гліцерин перемішують у змішувачі з такою ж кількістю молочної кислоти з утворенням фази А, використовуючи пропорції, наведені в таблиці II. Порошок найлону-12 додають до фази А при співвідношенні - дві частини фази А на три частини найлону-12. Гліцерино-молочнокислотна фаза практично повністю поглинається

мікросферами з найлону-12, при чому їх густина зростає, з утворенням сипучого порошку. Цю композицію перемішують впродовж одного часу до утворення фізично стабільної трохи липкої порошкоподібної суміші молочної кислоти, яка надалі використана у прикладі 9.

#### Приклад 2

Повторюють приклад 1, замінюючи молочну кислоту на змішані фруктові кислоти в пропорціях, вказаних в таблиці 1. Отримують фізично стабільний, трохи липкий порошок, який далі використовується у прикладі 10.

Таблиця II

Фаза	Опис компонента	Приклад 3
B	лаурат цинку	27,27
B	слюда-міристант алюмінію	59,23
B	каолін	9,00
B	діоксид титану	4,50

#### Приклад 3

Суша суміш для підмальовування очей

Сушу суміш для використання в композиціях для підмальовування очей готували як одну фазу, використовуючи інгредієнти, наведені в таблиці II. Порошок лаурата цинку комбінують з міристантом алюмінію, нанесеним на слюду, каоліном та діоксидом титану і змішують до отримання гладенького гомогенного порошку.

У таблиці III наведені інгредієнти, що використовуються в прикладах 4 - 5.

Таблиця III

Фаза	Назва компонента	Приклад 4	Приклад 5
A	найлон-12	80,00	50,00
C	суміш фруктових кислот		50,00
C	молочна кислота	20,00	

#### Приклад 4

Суміш носія з найлону-12 та молочної кислоти, що не містить розчинника. В цьому прикладі пористі мікросфери з найлону-12 насичені молочною кислотою без застосування розчинника. Інгредієнт фази A повільно додають до інгредієнта фази B при перемішуванні в змішувачі при кімнатній температурі. Препарат зі співвідношенням найлон-12/молочна кислота 4 : 1 в суміші використовували у прикладі 7.

#### Приклад 5

Суміш носія з найлону-12 зі змішаними фруктовими кислотами, що не містить розчинника.

Процес проводять як у прикладі 4 з заміною молочної кислоти на змішані фруктові кислоти та зменшенням пропорції найлон-12/змішані фруктові кислоти 1 : 1. Цей препарат використовується в прикладі 6.

У таблиці IV наведені інгредієнти, використані в прикладах 6 - 8.

Таблиця IV

Фаза	Назва інгредієнта	Приклад 6	Приклад 7	Приклад 8
A	Диметикон	0,50	0,50	0,50
A	Ізостеарат сорбітану	4,00	4,00	4,00
A	Ізонанонат ізоналілу	5,00	5,00	5,00
A	Лаурил-лаурилдон	3,00	3,00	0,50
A	Диметикон SL88	10,00	10,00	
A	Цетилдиметикон	10,00	10,00	3,10
A	Трибегенат гліцерилу			0,17
A	Низькоплавкий церезин			0,76
A	Мікрокристалічний віск			0,17
A	Пропілпарабен	0,10	0,10	0,10
A	Метилпарабен	0,30	0,30	0,30

A	Циклометикон			18,00
B	Лаурат цинку	3,00	3,00	3,00
B	Слюда-міристат алюмінію	2,00	11,52	12,00
B	Каолін	1,00	1,00	1,00
B	Діоксид титану	1,00		
B	Найлон-12	5,00		
C	Найлон-12/молочна кислота 4 : 1		5,00	
C	Найлон-12/суміш фруктових кислот 1:1		5,00	
B	MBX8C (PMMA) поліметилметакрилат	5,87	12,00	12,00
D	Тіоксогель СУМ	34,10	34,258	34,20
E	Лінолеат токоферолу		0,10	0,10
E	Ацетат токоферолу		0,10	0,10
E	Ретинілпальмітат	0,10	0,10	
B	Жовтий (55-0242)	0,03		
B	Червоний (55-0241)		0,02	
B	Чорний (55-0016)		0,002	

#### Приклад 6

Суміш найлону-12 зі змішаними фруктовими кислотами, яка не містить розчинника, у безводній основі

Приклад 6 включає композицію, виготовлену, як і у прикладі 5, на безводній основі, вміст компонентів наведено в таблиці III. Інгредієнти фази В диспергують перемішуванням з великою швидкістю щонайменше протягом трьох хвилин. Після цього фазу В додають до фази С і перемішують на низькій швидкості одну хвилину. Інгредієнти фази А змішують та нагрівають до 65 градусів Цельсія до досягнення прозорості. Після досягнення прозорості до фази А додають суміш фаз В та С і змішують з допомогою пропелерного змішувача до досягнення однорідного стану та відсутності грудок. Після цього до цієї однорідної суміші додають інгредієнти фази D і знов перемішують до однорідного стану.

#### Приклад 7

Суміш носія з найлону-12 та молочної кислоти, що не містить розчинника, в безводному середовищі

Приклад 6 повторюється з додаванням найлону-12 до фази В для подальшого покращання відчуття від композиції з заміною суміші найлону-12 з молочною кислотою, що не містить розчинника, як це зроблено у прикладі 4, на суміш найлону-12 зі змішаними фруктовими кислотами, що не містять розчинника, як це зроблено у прикладі 5. Заміна кислотної суміші дає композицію з підвищеним вмістом альфа-гідрокси кислот.

#### Приклад 8

Суміш найлону-12 зі змішаними фруктовими кислотами, що не містить розчинника, в безводному середовищі, що виступає як кольорова основа

Приклад 8 використовує процедуру, описану у прикладі 6, з введенням фази Е, що містить добавки та барвники. Ця кінцева фаза включає суміш, яка була нагріта до 45 градусів Цельсія, при якій до неї були додані інгредієнти фази Е з наступним перемішуванням до досягнення однорідності. Цетилдиметикон та диметикон реально замінені циклометиконом. Завдяки меншій летючості цетилдиметикона продукт одержують як кремову композицію, в той час як при використанні більш летючого циклометикона одержують композицію, яку втирають в основу крем-пудри. Можна використовувати різні кольорові агенти, вводючи їх в склад фази В. Таблиця V вказує інгредієнти, які використані у прикладах 9-10.

Таблиця V

Фаза	Назва інгредієнта	Приклад 9	Приклад 10
A	Диметикон	1,00	1,00

A	Ізостеарат сорбітану	4,00	4,00
A	Изононаноат ізононіліну	5,00	5,00
A	Лаурил PCA	0,50	0,50
A	Цетилдиметикон	2,13	2,13
A	Трибегенат гліцерилу	0,32	0,32
A	Легкоплавкий церезин	1,43	1,43
A	Мікрокристалічний віск	0,32	0,32
A	Пропілпарабен	0,10	0,10
A	Метилпарабен	0,30	0,30
B	Циклометикон	17,60	17,60
C	Суша суміш для поліпшення вигляду очей	11,00	11,00
D	Найлон-12	5,00	5,00
C	Порошкова суміш змішаних фруктових кислот		5,00
D	Порошкова суміш молочної кислоти	5,00	
D	MBX8C (PMMA) поліметилакрилат	12,00	12,00
E	Тиксогель СУМ	33,50	33,50
E	Лінолеат токоферолу	0,10	0,10
E	Ацетат токоферолу	0,10	0,10
E	Пальмітат ретинілу	0,10	0,10
E	Гідрофобний сфінголіпід	0,50	0,50

Тиксогель СУМ (Гексиленгліколь/Qaterium-18  
Бентоніт/циклометикон

Приклад 9

Поліпшувач вигляду очей з молочною кислотою

До суміші композицій з прикладу 9, одержаних як описано в прикладах 1 та 5, додали інгредієнти, описані в таблиці III. Процедура виготовлення продукту згідно з прикладом 9 така ж, як і у прикладі 8. Приклад 9 використовує гідрофобний сфінголіпідний комплекс для сприяння укріпленню шкіри.

Приклад 10

Поліпшувач вигляду очей зі змішаними фруктовими кислотами

Приклад 9 повторює приклад 2, але з заміною наведеної у прикладі 1 порошкової суміші молочної кислоти на порошкову суміш змішаних фруктових кислот.

Продукти з прикладів 9 та 10 були тестовані для визначення їх дерматологічних та косметичних властивостей. Деякі з цих результатів наведені нижче.

Фізіологічна користь. Контрольне біофізичне визначення наслідків вживання косметичних композицій для очей з, прикладів 9 (молочна кислота) та 10 (змішані фруктові кислоти) продемонструвало корисне поліпшення структурних дерматологічних властивостей. Деякі контрольні тести показали значне зростання вологості кантуса (зовнішнього кута очей) та шкіри під очима, що також супроводжувалось зростанням її щільності та відновленням тонких зморшок і інших недоліків.

20 жінок на кожний продукт з прикладів 9 та 10 випробували їх, наносячи на половину обличчя. Кожний з цих продуктів поодиночі наносили навкруги одного ока, а навкруги другого ока наносили попередньо до продукту зволожуючий очі крем-концентрат. Обробку обличчя проводили двічі на день, крім ранку того дня, коли були проведені виміри. Зволоження, щільність шкіри та структурні характеристики кантуса, що були визначені, наведені нижче.

Зволоження шкіри. Імпедансні виміри кантуса та щік під очима вимірювачем шкір іншої фази показали середнє зростання вмісту вологи, що показано нижче в таблицях VI та VII, відповідно, де дані порівнюються з контрольними вимірами, проведеними до застосування препарату (не наведеними):

Таблиця VI

Процентне зростання вмісту води в кантусах

Час використання (тижні)	Приклад 9 молочна кислота без добавок	Приклад 9 молочна кислота + зволожувач	Приклад 10 суміш фруктових кислот без добавок	Приклад 10 суміш фруктових кислот + зволожувач
2	8,5	9,8	7,6	7,6
4	20,1	24,9	16,2	21,2
6	23,3	29,5	20,8	27,4

Отже, після шести тижнів користування зростання вологості складало не менше 20% для усіх композицій, рецептура прикладу 9 на базі молочної кислоти була більш ефективною, ніж рецептура прикладу 10 на базі змішаних фруктових кислот, а крем для зволоження очей забезпечував додатковий корисний ефект після чотирьох або більше тижнів користування. Аналогічні, хоча трохи нижчі результати були одержані для щік під очима, що показано нижче в таблиці VII.

Таблиця VII

Процентне зростання вмісту води в щоках під очима

Час використання (тижнів)	Рецептура з молочною кислотою без добавок	Молочна кислота + зволожувач	Рецептура зі змішаними фруктовими кислотами	Змішані фруктові кислоти + зволожувач
2	5,3	6,3	4,9	5,8
4	14,7	19,3	12,8	15,6
6	20,6	25,6	16,5	22,1

Щільність шкіри. Щільність шкіри кантуса визначали з використанням балестометра як індикативний час і порівнювали з аналогічними даними (не приведеними), одержаними до використання препарату. Результати наведені нижче у таблиці VIII:

Таблиця VIII

Зростання щільності кантуса в процентах

Час використання (тижні)	Рецептура з молочною кислотою без добавок	Молочна кислота + зволожувач	Рецептура зі змішаними фруктовими кислотами без добавок	Змішані фруктові кислоти + зволожувач
2	8,1	10,0	5,5	7,1
4	19,0	20,0	12,1	15,0
6	26,8	29,1	21,8	26,7

Ці результати вказують на значне, 19-ти процентне, зростання щільності шкіри, одержане з допомогою рецептури на базі молочної кислоти згідно з прикладом 9 після усього чотирьох тижнів використання. Рецептура на базі змішаних фруктових кислот згідно з прикладом 10 була дещо менш ефективною, але все ж давала значне зростання щільності шкіри. Кращі результати одержані після шести тижнів користування та при використанні зволожувачів.

Вимірювання структури шкіри. З використанням комп'ютерного аналізатора образів провели вимірювання відбитків кантуса, які показали зменшення чітких зморшок та інших недоліків у порівнянні з їх кількістю до використання препарату. Результати вимірювань представлені нижче в таблиці IX:



Таблиця IX

Процент поліпшення чітких зморшок та інших недоліків кантусу

Час використання (тижні)	Рецептура з молочною кислотою без добавок	Молочна кислота + зволожнювач	Рецептура зі змішаними фруктовими кислотами без добавок	Змішані фруктові кислоти + зволожнювач
4	16,0	19,4	14,9	15,6
6	23,2	27,1	20,6	22,3

Наведені у таблиці IX результати показують значне, 16-ти процентне поліпшення щільності шкіри при використанні рецептури з прикладу 9 з молочною кислотою після усього чотирьох тижнів. Рецепт з прикладу 10 зі змішаними фруктовими кислотами дещо менш ефективна, однак призводить до значного поліпшення щільності шкіри. Кращі результати одержані після шести тижнів використання та при використанні зволожнювача.

Інші контрольні тести показали, що композиції згідно з винаходом можуть бути використаними як основи під олівці для очей, щоб зменшити утворення зморшок та втрату кольору, а також надати водостійкості.

Зморщування шару від олівців для очей. Зморщування нанесеного олівцем для очей шару або утворення на ньому пластівців - добре відомий феномен, який часто проявляється у людей з жирною шкірою і виявляє себе як нерівномірність кольору або витіснення нанесеного шару в складки та глибокі зморшки, що може виникнути впродовж кількох годин після використання олівця для очей.

Дослідження дванадцяти груп дорослих жінок, що знаходилися на військовій службі, кожна з яких мала досвід зморщування шару від олівця для очей, показало, що використання косметичної композиції для очей згідно з винаходом як основи було ефективним в досліді по вивченню зморщування шару від олівця для очей, нанесеного поверх основи.

Винайдена композиція основи під олівець для очей була нанесена на лише одну повіку в кожній з груп, потім висушена протягом однієї хвилини, після чого обидві повіки були оброблені розовим олівцем для очей. Одразу після обробки олівцем повіки були зняті на відеомагнітофон і картина центру кожної повіки була залишена для аналізу образів. Цю процедуру повторювали через три та шість годин після першого нанесення. Аналіз образів показав, що оброблені основою повіки мали незначне зростання нерівномірності шару від олівця для очей навіть через шість годин після нанесення. По контрасту, нерівномірність шару від олівця для очей, який було нанесено на повіки без основи, значно зростала і через три, і через шість годин після нанесення.

Колір олівців для очей. Інші тести показали, що композиція основи під олівець для очей з прикладу 9 виявилася ефективною при визначенні втрати кольору шару від олівця для очей. Як показали виміри на колориметрі, жодна рецептура не змінювала колір нанесеного шару олівця.

Завдяки труднощам надійного визначення кольору повік як ділянку для контролю кольору було вибрано чоло, яке фізіологічно подібне повікам по наявності шкіряного сапа та іншим властивостям. Основа та олівець для очей були нанесені на одну сторону чола кожному з дванадцяти об'єктів дослідження. На іншу сторону чола наносили олівець без основи. Виміри кольору були проведені безпосередньо після кожного нанесення і повторені через три та шість годин після цього.

Ніякої втрати кольору не спостерігали навіть після шести годин, якщо шкіра була оброблена основою, що контрастувало з необробленою шкірою, втрати кольору на якій були статистичне значущі.

Важливим є те, що колір шару від олівця для очей не змінюється, якщо він був нанесений на композицію основи згідно з винаходом.

Втрати кольору шарів олівця, нанесених разом з композицією основи згідно з винаходом, були на вигляд незначними через шість годин і фактично меншими, ніж ґрунтована сторона через три години.

Водостійкість. Подальші випробування дванадцяти об'єктів дослідження демонстрували водостійкість. Олівець для очей та композиція основи були для порівняння нанесені на передпліччя, як описано вище. Одразу після колориметричних вимірювань рука була змочена, висушена на повітрі, після чого вимірювання було проведено

знов. Отримані дані свідчать, що втрати синього кольору з поверхні, не обробленої основою, були значними, в той час, як змін кольору з обробленої сторони не спостерігали. Визначення втрат кольору свідчить, що значна водостійкість обумовлена застосуванням основи.

Бар'єрні властивості та внесення кислот у шкіру. Виміри втрат води крізь епідерміс показали, що продукти з прикладів 9 та 10 можуть суттєво зменшувати втрати води, тобто забезпечувати зростання бар'єрних функцій шкіри. Ця підвищена бар'єрна функція може підвищити проникнення в роговий шар шкіри під цей бар'єр активних інгредієнтів, наприклад, альфа-гідроксикислот, що містяться у пористих мікросферах. Цим постулюється, що насичені альфа-гідроксикислотами мікросфери згідно з винаходом можуть брати участь в поліпшенні бар'єрної функції з одночасним переносом кислот до шкіри при чому кислота виходить з мікросфер завдяки спорідненості гліцеринового розчинника до шкіряної вологи.

Подальші визначення показали, що продукти можуть забезпечувати вишуканість впродовж короткого періоду вище шести годин і не виявляють безпосереднього фізичного впливу на контактні лінзи з полімакону або сурфілкону А.

Даний винахід особливо придатний для застосування в сучасних промислових процесах. Зокрема, він корисний в косметичній промисловості, де він може забезпечити одержання нових продуктів, що пропонують користувачу нові вигоди, як це тут описано.

Оскільки ілюстративні втілення винаходу описані вище, безумовно ясно, що різноманітні модифікації повинні бути зрозумілими звичайним спеціалістам.