

(19)



**Евразийское  
патентное  
ведомство**

(21) **201991532** (13) **A1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ**

(43) Дата публикации заявки  
**2019.11.29**

(22) Дата подачи заявки  
**2017.11.27**

(51) Int. Cl. *A61K 8/29* (2006.01)  
*A61K 8/34* (2006.01)  
*A61K 8/35* (2006.01)  
*A61K 8/36* (2006.01)  
*A61K 8/37* (2006.01)  
*A61K 8/44* (2006.01)  
*A61K 8/67* (2006.01)  
*A61Q 17/04* (2006.01)  
*A61Q 19/00* (2006.01)  
*A61K 8/06* (2006.01)

---

(54) **ПРИМЕНЕНИЕ ХЕЛАТИРУЮЩИХ АГЕНТОВ ДЛЯ УЛУЧШЕНИЯ СТАБИЛЬНОСТИ ЦВЕТА РЕЗОРЦИНОЛА**

---

(31) **16205674.1**

(32) **2016.12.21**

(33) **EP**

(86) **PCT/EP2017/080503**

(87) **WO 2018/114232 2018.06.28**

(71) Заявитель:  
**ЮНИЛЕВЕР Н.В. (NL)**

(72) Изобретатель:  
**Хуан Лэй, Моуддел Тинуш (US)**

(74) Представитель:  
**Фелицына С.Б. (RU)**

(57) Косметические композиции широко используются для получения определенных преимуществ, таких как, например, омолаживающий, осветляющий и увлажняющий эффект для кожи. Эти преимущества обеспечиваются агентами (активными веществами), такими как, например, антиоксиданты, гиалуроновая кислота и резорцинол, фенилэтилрезорцинол и 4-алкиламещенный резорцинол. Однако эти активные вещества имеют определенный срок годности, после которого они имеют тенденцию к деградации с точки зрения химической активности и/или их цветовой стабильности. Настоящее изобретение раскрывает новый способ получения косметических композиций, которые улучшают стабильность цвета резорцинола, фенилэтилрезорцинола и 4-алкиламещенного резорцинола, и композиции, содержащие такие активные вещества, при получении в соответствии с указанным способом.

**A1**

**201991532**

**201991532**

**A1**

## ПРИМЕНЕНИЕ ХЕЛАТИРУЮЩИХ АГЕНТОВ ДЛЯ УЛУЧШЕНИЯ СТАБИЛЬНОСТИ ЦВЕТА РЕЗОРЦИНОЛА

Область техники, к которой относится изобретение

Настоящее изобретение относится к стабильности активных веществ в косметических композициях. В частности, настоящее изобретение относится к стабильности цвета резорцинола, фенилэтилрезорцинола (ФЭР) и 4-алкилзамещенного резорцинола в косметических композициях.

Предшествующий уровень техники

Косметические композиции различных видов широко используются потребителями. Косметические композиции в форме лосьонов, кремов, гелей и масок используются потребителями для получения определенных преимуществ, таких как, например, омолаживающий, осветляющий и увлажняющий эффект для кожи. Многие из этих преимуществ обеспечиваются такими активными веществами, как, например, антиоксиданты, гиалуроновая кислота и 4-алкилзамещенный резорцинол, такой как, например, 4-этилрезорцинол (ЭР) и 4-гексилрезорцинол (ГР).

Однако эти активные вещества обычно имеют определенный срок годности, после которого они склонны подвергаться деградации с точки зрения их активности (химической стабильности) и/или проявления цвета. Например, 4-алкилзамещенный резорцинол известен своей хорошей способностью осветлять кожу. Однако они, как правило, страдают от проблемы стабильности, в частности, от стабильности цвета. В частности, в области косметики стабильность цвета тесно связана с восприятием потребителями качества и функциональности продуктов. Таким образом, стабильность цвета активных веществ, таких как, например, резорцинол, ФЭР и 4-алкилзамещенный резорцинол, были предметом исследований в течение достаточно долгого времени.

Для обеспечения стабильности цвета резорцинола и 4-алкилзамещенного резорцинола использовали обработку азотом, специальную упаковку и физический подбор цвета.

US 2008305059 (Sytheon Ltd) раскрывает использование высокоочищенного гексилрезорцинола для решения проблемы стабильности цвета, которая возникает из-за присутствия таких примесей, как другие нежелательные фенолы и полифенолы в C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> алкилрезорцинолах коммерческого качества. В US 2008305059 далее указывается, что проблема стабильности цвета является более серьезной в случае производных резорцинола с алкильной замещенной цепью с прямой или разветвленной цепью, и также упоминается, что многие, если не все, осветляющие кожу вещества на основе фенола,

независимо от их синтетического или природного происхождения, имеют тенденцию к нестабильности цвета из-за их восприимчивости к окислению под действием воздуха и/или ультрафиолета.

US6863897 (Unilever) раскрывает использование микронизированных оксидов металлов, таких как, например, оксид титана и оксид цинка, чтобы обеспечить стабильность цвета 4-замещенного резорцинола. Кроме того, в US6863897 и US2003185773 (Unilever) раскрыто, что резорцинол или его производные и хелатообразующие агенты присутствуют на разных фазах в процессе изготовления составов, раскрытых в документе. Например, производные резорцинола присутствуют в фазе D, тогда как хелатирующие агенты, то есть этилендиаминтетрауксусная кислота (ЭДТА), присутствуют в фазе B процесса приготовления композиции.

US 3265571 (Barnes Hind) раскрывает композиции, содержащие резорцинол и ЭДТА, и раскрывает способ, с помощью которого получают композицию, в которой резорцинол сначала не объединяют с ЭДТА. В US 3265571 также раскрывается, что ЭДТА хелатирует металлы, которые могут вызвать нормальное развитие цвета в присутствии салициловой кислоты и/или резорцинола.

JP S61 236709 (Shiseido Co) раскрывает способ устранения недостатков нестабильности резорцинола в композиции на основе глинистых минералов и/или неорганического порошка. Раскрытые там композиции получают, когда эдетат добавляют к предварительной смеси, содержащей глину, то есть бентонит и каолин, цинк, глицерин, воду и резорцинол.

Способы, которые до сих пор пытались решить проблему стабильности цвета, по-видимому, связаны либо со сложной и/или неэффективной с точки зрения затрат обработкой, либо с требованием специальных соединений, которые не всегда являются предпочтительными. Поэтому стабилизация активных веществ, в частности резорцинола, ФЭР и 4-алкилзамещенного резорцинола в косметических композициях, все еще остается необходимой.

В настоящее время обнаружено, что комбинация соединения, выбранного из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, с хелатирующими агентами особым образом обеспечивает стабильность цвета резорцинола, ФЭР и 4-алкилзамещенного резорцинола.

Краткое изложение сущности изобретения

В первом аспекте настоящее изобретение относится к способу получения композиции, включающей:

i) соединение, выбранное из резорцинола, фенилэтилрезорцинола, 4-

алкилзамещенного резорцинола и их смесей;

ii) хелатирующий агент; и

iii) косметически приемлемую основу, содержащую водную фазу и масляную фазу; где способ включает стадии:

(a) объединение соединения, выбранного из резорцинола, фенилэтилрезорцинола, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, с хелатирующим агентом в воде;

(b) приготовление водной фазы и масляной фазы;

(c) объединение водной фазы и масляной фазы для получения косметически приемлемой основы; и

(d) объединение аддукта, полученного на стадии (a), с косметически приемлемой основой со стадии (c).

Подробное описание изобретения

Если не указано иное, используемые в настоящей заявке количества выражены в процентах по массе в расчете на общую массу композиции и сокращенно обозначены как «масс.%».

Использование любого и всех примеров или образцового выражения, например, «такой как», предоставленное в данном документе, предназначено просто для лучшего освещения изобретения и никоим образом не ограничивает объем изобретения, заявленного иным образом.

Композиция, полученная в соответствии со способом по настоящему изобретению, содержит:

i) соединение, выбранное из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей;

ii) хелатирующий агент; и

iii) косметически приемлемую основу.

Резорцинол, ФЭР и 4-алкилзамещенный резорцинол

Композиция, полученная в соответствии со способом по настоящему изобретению, содержит соединение, выбранное из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей. Алкильная группа в 4-алкилзамещенном резорциноле может быть алкилом с прямой или разветвленной цепью. Например, алкильная группа может представлять собой алкил с прямой цепью, такой как, например, в случае 4-пропилрезорцинола, или она может представлять собой алкил с разветвленной цепью, такой как, например, в случае 4-изопропилрезорцинола (ИПР). Иллюстративные примеры 4-алкилзамещенного резорцинола включают 4-метилрезорцинол, ЭР, 4-пропилрезорцинол, ИПР, 4-бутилрезорцинол, 4-пентилрезорцинол, ГР, 4-гептилрезорцинол, 4-октилрезорцинол и их

смеси. Предпочтительным 4-алкилзамещенным резорцинолом является любой из ЭР и ГР.

Понятно, что композиция может содержать комбинацию одного или нескольких соединений, выбранных из резорцинола, ФЭР и 4-алкилзамещенного резорцинола. Например, композиция может содержать один или несколько 4-алкилзамещенных резорцинолов в присутствии или при отсутствии резорцинола. Предпочтительно композиция содержит одно соединение, выбранное из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола. Общее количество резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей в композиции предпочтительно находится в диапазоне от 0,01 до 10 масс.%, более предпочтительно от 0,1 до 5 масс.% и наиболее предпочтительно от 0,25 до 3 масс.%.

#### Хелатирующие агенты

Хелатирующие агенты хорошо известны в данной области техники и часто используются в косметических композициях.

Иллюстративные примеры хелатирующих агентов включают ЭДТА, этилендиаминдиантарную кислоту (ЭДДЯК), диэтилентриаминпентаацетат пентанатрия, тринатрий-N-(гидроксиэтил)этилендиаминтриацетат, кислотную форму ЭДТА, тиоцианат натрия, тринатриевую соль метилглициндиуксусной кислоты, тетранатрия глутамат диацетат и фитиновую кислоту. Предпочтительными хелатирующими агентами являются ЭДТА, ЭДДЯК и их смеси.

Композиция по настоящему изобретению может содержать один или несколько хелатирующих агентов, предпочтительно один агент. Общее количество хелатирующего агента в композиции предпочтительно находится в диапазоне от 0,001 до 10 масс.%, более предпочтительно от 0,01 до 5 масс.%, еще более предпочтительно от 0,05 до 3 масс.% и наиболее предпочтительно от 0,1 до 2 масс.%.

Иллюстративные комбинации соединений резорцинола и хелатирующих агентов включают ГР + ЭДТА, ЭР + ЭДТА, ФЭР + ЭДТА, ИПР + ЭДТА, ЭР + ЭДДЯК, ФЭР + ЭДДЯК, ИПР + ЭДДЯК.

Предпочтительными комбинациями являются ГР + ЭДТА, ЭР + ЭДТА и ЭР + ЭДДЯК.

Способ по настоящему изобретению не включает комбинацию ГР + ЭДДЯК. То есть, когда ГР используют в качестве соединения резорцинола, то используют хелатирующий агент, отличный от ЭДДЯК.

#### Косметически приемлемая основа

Композиция содержит косметически приемлемую основу, действующую в качестве разбавителя, диспергатора или носителя для других материалов, присутствующих в

композиции, чтобы облегчить их распределение при нанесении композиции на кожу.

Косметически приемлемая основа согласно настоящему изобретению представляет собой эмульсию, включающую водную фазу и масляную фазу, и включает эмульсии масло-в-воде и вода-в-масле. Предпочтительным типом эмульсии является масло-в-воде.

Водная фаза, если необходимо, может состоять только из воды. Количество воды может составлять от 1 до 99 масс.%, предпочтительно от 5 до 90 масс.%, более предпочтительно от 35 до 85 масс.% и наиболее предпочтительно от 40 до 75 масс.%.

Масляная фаза может содержать жирные кислоты, имеющие от 10 до 30 атомов углерода, и их соли. Иллюстративные примеры жирных кислот, имеющих от 10 до 30 атомов углерода, включают пеларгоновую, лауриновую, миристиновую, пальмитиновую, стеариновую, изостеариновую, олеиновую, линолевую, арахидовую, бегеновую или эруковую кислоту и их смеси. Иллюстративным примером солей жирных кислот является стеарат калия.

Композиция предпочтительно содержит от 5 до 25 масс.%, более предпочтительно от 7 до 20 масс.%, еще более предпочтительно от 9 до 17 масс.% и наиболее предпочтительно от 10 до 15 масс.% жирных кислот и/или их солей.

Косметически приемлемая основа может дополнительно содержать жидкие или твердые смягчающие вещества, растворители, увлажнители, загустители и порошки, усилители проникновения через кожу или их смеси.

Иллюстративные примеры смягчающих средств включают стеариловый спирт, глицерилмонорицинолеат, норковое масло, изопропилизостеарат, стеариновую кислоту, изобутилпальмитат, изоцетилстеарат, олеиловый спирт, изопропиллаурат, гексиллаурат, децилолеат, октадекан-2-ол, изоцетиловый спирт, эйкозаниловый спирт, цетилпальмитат, силиконовые масла, такие как диметилполисилоксан, ди-н-бутилсебацинат, изопропилмиристанат, изопропилпальмитат, изопропилстеарат, бутилстеарат, полиэтиленгликоль, триэтиленгликоль, ланолин, масло какао, кукурузное масло, хлопковое масло, оливковое масло, пальмовое масло, рапсовое масло, сафлоровое масло, масло примулы вечерней, соевое масло, подсолнечное масло, масло авокадо, кунжутное масло, кокосовое масло, арахисовое масло, касторовое масло, ацетилированные ланолиновые спирты, вазелин, минеральное масло, бутилмиристанат, изостеариновую кислоту, пальмитиновую кислоту, изопропиллинолеат, лауриллактат, миристаллактат, децилолеат и миристалмиристанат.

Иллюстративные примеры растворителей включают этиловый спирт, изопропанол, ацетон, моноэтиловый эфир этиленгликоля, монобутиловый эфир диэтиленгликоля и моноэтиловый эфир диэтиленгликоля.

Иллюстративные примеры порошков включают мел, тальк, фуллерову глину, каолин, крахмал, камеди, коллоидный кремнезем, полиакрилат натрия, тетраалкил- и/или триалкилариламмониевые смектиты, химически модифицированный алюмосиликат магния, органически модифицированную монтмориллонитовую глину, гидратированный силикат алюминия, коллоидный диоксид кремния, карбоксивиниловый полимер, натрия карбоксиметилцеллюлозу и этиленгликоль моностеарат.

Соединения, которые, как полагают, улучшают проникновение через кожу, такие как диметилсульфоксид, также могут быть использованы в качестве косметически приемлемой основы.

Предпочтительная косметически приемлемая основа включает воду, стеариновую кислоту и стеарат калия.

Косметически приемлемая основа обычно присутствует в количестве от 10 до 99,9 масс.%, предпочтительно от 50 до 99 масс.%, более предпочтительно от 60 до 99 масс.%, еще более предпочтительно от 70 до 99 масс.%, еще более предпочтительно от 80 до 99 масс.% и наиболее предпочтительно от 90 до 99% масс.

#### Витамины

Композиция может дополнительно содержать витамины, такие как, например, витамин С, витамин В2, витамин В3, витамин В6, витамин Е, фолиевая кислота, биотин, витамин D и витамин К. Кроме того, производные витаминов, такие как, например, производное витамина Е, например, токоферил ацетат, или производное витамина С, например, такие как аскорбил тетраизопальмитат, и производное витамина А, такие как, например, витамина А пальмитат, также могут присутствовать в композиции. Предпочтительными витаминами являются витамин Е или его производные, такие как, например, токоферил ацетат, и витамин В3.

Общее количество витаминов, которые могут присутствовать в композиции, может составлять от 0 до 10 масс.%, предпочтительно от 0,01 до 7 масс.%, более предпочтительно от 0,1 до 5 масс.% и наиболее предпочтительно от 1 до 3 масс.%.

#### Полиолы

Композиция может дополнительно содержать полиолы, которые повышают растворимость резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола, например, растворимость ГР в воде. Иллюстративные примеры полиолов включают глицерин, этиленгликоль, пропиленгликоль, бутиленгликоль, полипропиленгликоль и полиэтиленгликоль. Предпочтительным полиолом является глицерин, бутиленгликоль, пропиленгликоль или их смеси.

Настоящее изобретение включает полиолы в количестве от 0,01 до 10 масс.%,

предпочтительно от 0,1 до 5 масс.%, более предпочтительно от 1 до 3 масс.%.

#### Эмульгаторы

Эмульгаторы могут присутствовать в композиции по настоящему изобретению. Выбранные эмульгаторы могут иметь неионную, анионную, катионную и амфотерную природу.

Иллюстративные примеры неионных эмульгаторов включают разветвленный или линейный C<sub>10</sub>-C<sub>20</sub> жирный спирт, такой как, например, цетиловый спирт и бегениловый спирт, или кислое гидрофобное соединение, конденсированное примерно с 2-100 моль этиленоксида или пропиленоксида на моль гидрофобного соединения; C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкилфенолы, конденсированные с 2-20 молями алкиленоксида; эфиры этиленгликоля и моно- и дижирных кислот, моноглицерид жирных кислот, сорбитан, моно- и ди-C<sub>8</sub>-C<sub>20</sub> жирные кислоты и полиоксиэтиленсорбитан и их комбинации. Алкилполигликозиды и сахаридные жирные амиды (например, метилглюконамиды) также являются подходящими неионными эмульгаторами. Предпочтительным неионным эмульгатором является цетиловый спирт и BRIJ 72.

Предпочтительные анионные эмульгаторы включают алкилэфирсульфат и сульфонаты, алкилсульфаты и сульфонаты, алкилбензолсульфонаты, алкил- и диалкилсульфосукцинаты, C<sub>8</sub>-C<sub>20</sub>-ацилизетионаты, C<sub>8</sub>-C<sub>20</sub>-алкилэфирфосфаты, алкилэфиркарбоксилаты и их комбинации.

Предпочтительные катионные эмульгаторы включают хлорид пальмитамидопропилтримония, хлорид дистеарилдимония и их смеси.

Другие обычно предпочтительные эмульгаторы включают глицерилстеарат, гликоль стеарат, стеарамид АМР, стеарат ПЭГ-100, а также эмульгирующие/загущающие добавки, такие как сополимер/сквалан гидроксиэтилакрилата/ акрилдиметилтаурата натрия и их смеси.

Композиция по настоящему изобретению содержит эмульгаторы в количестве от 0,1 до 40 масс.%, предпочтительно от 1 до 20 масс.% и более предпочтительно от 1 до 5 масс.%.

#### Консерванты

Консерванты могут быть включены в композицию для защиты от роста потенциально вредных микроорганизмов. Иллюстративные примеры консервантов включают метилпарабен, этилпарабен, бутилпарабен, алкиловые эфиры парагидроксибензойной кислоты, гидантоин, феноксиэтанол, йодопропинилбутилкарбамат, 1,2-октандиол, этилгексилглицерин, гексиленгликоль, имидазолидинилмочевину, натрия дегидроацетат и бензиловый спирт. Предпочтительными консервантами являются

метилпарабен, феноксиэтанол, изопропинилбутилкарбамат или их смеси.

Композиция по настоящему изобретению содержит консерванты в количестве от 0,01 до 2 масс.%, предпочтительно от 0,1 до 1 масс.%.

Солнцезащитные агенты

Органические солнцезащитные агенты

Композиция согласно настоящему изобретению предпочтительно дополнительно содержит один или несколько органических солнцезащитных агентов. Широкий выбор органических солнцезащитных агентов подходит для использования в композициях данного изобретения.

Подходящие УФ-А и УФ-В солнцезащитные агенты включают 2-гидрокси-4-метоксибензофенон, октилдиметил-п-аминобензойную кислоту, дигаллоилтриолеат, 2,2-дигидрокси-4-метоксибензофенон, этил-4-(бис(гидроксипропил))аминобензоат, 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилат, 2-этилгексилсалицилат, глицерил-п-аминобензоат, 3,3,5-триметилциклогексилсалицилат, метилантранилат, п-диметиламинобензойную кислоту или аминобензоат, 2-этилгексиметил-п-диметиламинобензоат, 2-фенилбензимидазол-5-сульфоновую кислоту, 2-(п-диметиламинофенил)-5-сульфонбензоксазиную кислоту, 2-этилгексил-п-метоксициннамат, производные дибензоилметана, 2-гидрокси-4-метоксибензофенон, октилдиметил-п-аминобензойную кислоту, диэтилгексилнафтилат, Мексорил, Тиносорб S, Тиносорб М и их смеси.

Предпочтительными дибензоилметановыми производными являются 4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметан, 2-метилдибензоилметан, 4-метилдибензоилэтан, 4-изопропилдибензоилметан, 4-трет-бутилдибензоилметан, 2,4-диметилдибензоилметан, 2,5-диметилдибензоилметан, 4,4'-диизопропил-дибензоилметан, 2-метил-5-изопропил-4'-метоксидибензоилметан, 2-метил-5-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметан, 2,4-диметил-4'-метоксидибензоилметан или 2,6-диметил-4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметан.

Предпочтительными органическими солнцезащитными агентами являются 2-этилгексил-п-метоксициннамат (Парсол МСХ), дибензоилметановое производное; в частности, 4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметан (Парсол 1789), 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенил-2-пропеноат (Октокрилен) или их смеси.

Эффективное количество органических солнцезащитных агентов можно использовать в композициях по настоящему изобретению. Композиция предпочтительно содержит от 0,1 до 15 масс.%, более предпочтительно от 1 до 10 масс.%, наиболее предпочтительно от 2 до 5 масс.% органических солнцезащитных агентов.

Неорганические солнцезащитные агенты

Композиция может дополнительно содержать неорганические солнцезащитные

агенты. Иллюстративными примерами неорганических солнцезащитных агентов являются оксид цинка, оксид железа, диоксид кремния, такой как коллоидный диоксид кремния, или диоксид титана. Предпочтительными неорганическими солнцезащитными агентами являются диоксид титана (TiO<sub>2</sub>) и оксид цинка (ZnO).

Композиция предпочтительно содержит от 0,1 до 15 масс.%, более предпочтительно от 1 до 10 масс.%, наиболее предпочтительно от 2 до 5 масс.% неорганических солнцезащитных агентов.

#### Дополнительные активные вещества

Композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать дополнительные активные вещества.

Иллюстративные примеры дополнительных активных веществ включают 12-гидроксистеариновую кислоту, предшественники глутатиона, галардин, адапален, экстракт алоэ, лактат аммония, арбутин, азелаиновую кислоту, бутилгидроксианизол, бутилгидрокситолуол, сложные эфиры цитрата, дезоксиарбутин, производные 1,3-дифенилпропана, 2,5-дигидроксибензойную кислоту и ее производные, 2-(4-ацетоксифенил)-1,3-дителиан, 2-(4-гидроксифенил)-1,3-дителиан, эллаговую кислоту, глюкопиранозил-1-аскорбат, глюконовую кислоту, гликолевую кислоту, экстракт зеленого чая, 4-гидрокси-5-метил-3[2H]-фуранон, гидрохинон, 4-гидроксианизол и его производные, производные 4-гидроксибензойной кислоты, гидроксикаприловую кислоту, инозитол аскорбат, койевую кислоту, молочную кислоту, экстракт лимона, линолевую кислоту, аскорбилфосфат магния, 5-октаноилсалициловую кислоту, салициловую кислоту, 3,4,5-тригидроксибензильные производные, октадецендиоевую кислоту, ацетилглюкозамин, экстракт Pitera®, пантотенат кальция (Melano-block), Sepiwhite™, экстракт сои (ингибитор Баумана-Бирка) и их смеси. Предпочтительными активными веществами являются 12-гидроксистеариновая кислота, предшественники глутатиона и галардин.

При включении в композицию дополнительный активный компонент добавляют в количестве предпочтительно от 0,001 до 15 масс.%, более предпочтительно от 0,01 до 10 масс.% и наиболее предпочтительно от 0,1 до 5 масс.%.

#### Регуляторы pH

Обычные буферы/ регуляторы pH, такие как, например, буферы из гидроксида натрия, гидроксида калия, соляной кислоты, лимонной кислоты и цитрата/ лимонной кислоты, можно использовать для доведения pH композиции по настоящему изобретению до значения от 5 до 8, предпочтительно от 6,5 до 7,5.

#### Дополнительные косметические ингредиенты

Композиция согласно настоящему изобретению может содержать широкий спектр других необязательных компонентов. Иллюстративными примерами являются антиоксиданты, связующие агенты, биологические добавки, красители, полимеры, вяжущие вещества, ароматизаторы, замутняющие агенты, кондиционеры, отшелушивающие агенты, натуральные экстракты, эфирные масла, вещества, обеспечивающие согревающий или охлаждающий эффект для кожи, успокаивающие кожу агенты и агенты, заживляющие кожу.

#### Форма продукта

Композиция по настоящему изобретению предпочтительно составлена в форме порошка, хлопьев, тоника, лосьона, кондиционеров, крема, геля или мусса. Композиция по настоящему изобретению может представлять собой косметическую композицию для нанесения на кожу млекопитающих, особенно людей. Такая косметическая композиция обычно может быть классифицирована как не требующая смывания или смываемая.

Композиция в соответствии с настоящим изобретением предпочтительно представляет собой не требующую смывания композицию.

#### Способ согласно настоящему изобретению

Способ согласно настоящему изобретению включает стадии (a) - (d), из которых стадии (a) - (c) могут выполняться в любом конкретном порядке. Например, соединение, выбранное из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, может быть объединено с хелатирующим агентом в воде и храниться до получения косметически приемлемой основы на стадии (c). Альтернативно, стадия (a) может быть выполнена после того, как будет готова косметически приемлемая основа стадии (c). Также на стадии (b) подготовка водной фазы и масляной фазы может проводиться в произвольном порядке.

Согласно настоящему изобретению требуется, чтобы соединение, выбранное из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, было объединено с хелатирующим агентом в воде; перед этим выбранное соединение объединяют с косметически приемлемой основой на стадии (d).

Стадия (a): объединение соединения, выбранного из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, с хелатирующим агентом.

На стадии (a) соединение, выбранное из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, объединяют с хелатирующим агентом в воде. Как используется в настоящей заявке, «объединение» может просто означать смешивание.

В дополнение к воде, полиолы, такие как глицерин, пропиленгликоль, бутиленгликоль или их смеси, могут быть использованы для повышения растворимости соединения, выбранного из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их

смесей в воде. При использовании полиолы предпочтительно смешивают с водой, а затем к такой смеси добавляют соединение, выбранное из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, и хелатирующий агент. Полиол, такой как, например, бутиленгликоль, предпочтительно добавляют в отношении 1:8 с водой, более предпочтительно 1:6 и наиболее предпочтительно 1:4 с водой. Например, в случае ГР 20 частей бутиленгликоля сначала смешивали с 80 частями воды. К этой смеси воды и бутиленгликоля добавляли ГР и хелатирующий агент. В случае ЭР могут использоваться или не использоваться полиолы, повышающие растворимость.

Стадию (а) предпочтительно проводят при комнатной температуре.

Аддукт, полученный на этой стадии, может быть готов для добавления к косметически приемлемой основе. Альтернативно, стадия (а) может быть выполнена, когда косметически приемлемая основа со стадии (с) готова.

Стадии (b): подготовка водной и масляной фаз.

Косметически приемлемую основу согласно настоящему изобретению готовят объединением водной и масляной фаз.

Водную фазу готовят нагреванием воды до температурного диапазона предпочтительно от 60 до 85°C, более предпочтительно от 65 до 80°C и наиболее предпочтительно от 70 до 75°C. Ингредиенты, которые подходят для добавления к водной фазе, могут быть добавлены на этой стадии и могут быть гомогенизированы предпочтительно до 30 минут, более предпочтительно до 20 минут и наиболее предпочтительно до 10 минут, так что все ингредиенты расплавляются.

Масляную фазу готовят путем нагревания масла до температуры в диапазоне предпочтительно от 60 до 85°C, более предпочтительно от 65 до 80°C и наиболее предпочтительно от 70 до 75°C. Ингредиенты, которые подходят для добавления в масляную фазу, могут быть добавлены на этой стадии и могут быть гомогенизированы предпочтительно в течение до 30 минут, более предпочтительно до 20 минут и наиболее предпочтительно до 10 минут, так что все ингредиенты расплавляются.

Стадия (с): объединение водной и масляной фаз.

Затем масляную фазу добавляют к водной фазе, предпочтительно, когда температура находится в диапазоне от 60 до 85°C, более предпочтительно от 65 до 80°C и наиболее предпочтительно от 70 до 75°C, при надлежащей гомогенизации, предпочтительно до 30 минут, более предпочтительно до 20 минут и наиболее предпочтительно до 10 минут.

Стадия (d): смешивание аддукта стадии (а) с косметически приемлемой основой стадии (с).

Косметически приемлемую основу, полученную на стадии (с), охлаждают до температуры, подходящей для добавления аддукта, полученного на стадии (а). Температурный интервал, подходящий для проведения стадии (d), предпочтительно составляет от 30 до 60°C, более предпочтительно от 35 до 55°C и наиболее предпочтительно от 40 до 45°C. После объединения аддукта стадии (а) с косметически приемлемой основой надлежащее смешивание проводят предпочтительно до 30 минут, более предпочтительно до 20 минут и наиболее предпочтительно до 10 минут. Серию затем охлаждали до комнатной температуры.

Различие между способом по настоящему изобретению и известными способами получения косметических композиций заключается в том, что в способе согласно настоящему изобретению соединение, выбранное из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, объединяют с хелатирующим агентом перед тем, как резорцинол или ФЭР или 4-алкилзамещенный резорцинол или их смеси добавляют к косметически приемлемой основе или приводят в контакт с любым другим ингредиентом, который может присутствовать в композиции.

При этом в известных способах резорцинол или ФЭР или 4-алкилзамещенный резорцинол или их смеси не объединяют с хелатирующим агентом перед добавлением их к косметически приемлемой основе или обеспечением контакта с любым другим ингредиентом, который может присутствовать в композиции. То есть резорцинол или ФЭР или 4-алкилзамещенный резорцинол или их смеси и хелатирующие агенты всегда присутствуют на разных фазах приготовления композиций и заранее не взаимодействуют друг с другом.

Не желая углубляться в какую-либо теорию, полагают, что в способе согласно настоящему изобретению два ингредиента взаимодействуют друг с другом определенным образом. В результате композиции, полученные в соответствии со способом по настоящему изобретению, демонстрируют улучшенную стабильность цвета по сравнению с композициями, полученными в соответствии с известным способом. Однако улучшенная стабильность цвета не достигается при использовании ГР в сочетании с ЭДДЯК.

При этом точный характер взаимодействия между двумя ингредиентами до конца не выяснен. Считается, что такое взаимодействие не происходит из-за уже известного хелатирующего действия металла. Когда простой водный раствор резорцинола или ФЭР или 4-алкилзамещенного резорцинола, приготовленный с хелатирующим агентом или без него, хранили при 45°C в течение 7 дней, было обнаружено, что растворы, которые содержали хелатирующий агент, показали меньшее изменение цвета по сравнению с растворами, которые не содержат хелатирующий агент. Важно, что было обнаружено, что

эти водные растворы содержат менее 2 ч./млн металлов, например, железа, кальция и цинка при анализе на содержание металлов.

Для оценки цветовой стабильности изменение цвета ( $\Delta E$ ) рассчитывали на основе измерения цвета, представленного в цветовом пространстве Hunter lab  $L^*$ ,  $a^*$  и  $b^*$ , где  $L^*$  - черно-белое пространство,  $a^*$  - зелено-красное пространство,  $b^*$  это сине-желтое пространство. Например, большее значение  $L^*$  означает больше белого, а меньшее значение  $b^*$  означает больше синего. Чем ниже значение  $\Delta E$ , тем меньше уменьшение изменения цвета, т.е. повышена стабильность цвета.

Изображения водных растворов, упомянутых выше, были получены в нулевой момент времени, то есть сразу после их изготовления, и в конце периода хранения, то есть в конце 4 недель. Все изображения были преобразованы в данные  $L^*$ ,  $a^*$  и  $b^*$  с использованием прибора Hunter lab-lab scan XE. Значения  $L^*$ ,  $a^*$  и  $b^*$  на 4-й неделе и нулевой неделе (исходные данные) были использованы для расчета  $\Delta E$  по формуле:

$$\Delta E = \sqrt{(L_2^* - L_1^*)^2 + (a_2^* - a_1^*)^2 + (b_2^* - b_1^*)^2}$$

Кроме того, было также обнаружено, что после добавления хелатирующего агента не происходит обратного развития цвета из-за потери стабильности цвета соединения, выбранного из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей в композициях, полученных согласно сравнительному способу. Следовательно, было обнаружено, что объединение соединения, выбранного из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, с хелатирующим агентом в соответствии со способом по настоящему изобретению является решающим, поскольку стабильность цвета проявлялась только тогда, когда выполняли способ согласно настоящему изобретению.

Изобретение далее описано с использованием следующих неограничивающих примеров.

#### Примеры

##### Пример 1 (сравнительный пример)

Сравнительные композиции от А до D готовили в соответствии со способом, описанным ниже, способом, не соответствующим настоящему изобретению. Подробности, касающиеся композиции, приведены в таблице 1.

Стадия 1. Растворение соединения, выбранного из резорцинола, ФЭР, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, в растворителе.

ЭР или ГР растворяли в воде при комнатной температуре.

Стадия 2: Подготовка водной и масляной фаз.

Водную фазу готовили нагреванием воды до температуры 75°C, и хелатирующий

агент, то есть ЭДТА или ЭДДЯК, растворяли в ней при надлежащем перемешивании в течение 10 минут.

Масляную фазу готовили нагреванием 12 масс.% стеариновой кислоты при 75°C. К этому добавляли 0,4 масс.% Parsol 1789; 0,75 масс.% этилгексилметоксициннамата, 0,7 масс.% диоксида титана и 0,25 масс.% токоферилацетата, и смесь гомогенизировали в течение 10 минут.

Стадия 3: Объединение водной и масляной фаз.

Затем к водной фазе добавляли масляную фазу и смесь гомогенизировали при 75°C в течение 10 минут.

Стадия 4: Смешивание продукта со стадии 1 с косметически приемлемой основой со стадии 4.

Косметически приемлемую основу, полученную на стадии 3, охлаждали до 45°C, и продукт стадии 1 объединяли с ней путем надлежащего перемешивания в течение 10 минут. Серию затем охлаждали до комнатной температуры.

Пример 2

Композиции с 1 по 4 получали в соответствии со способом по настоящему изобретению, как описано ниже. Подробности, касающиеся композиции, приведены в таблице 1.

Стадия (a):

0,25 масс.% ГР объединяли с 0,1 масс.% ЭДТА в смеси 1 масс.% воды и 1 масс.% глицерина при комнатной температуре в контейнере. Таковую смесь перемешивали до полного растворения ГР и ЭДТА в воде и глицерине.

Стадия (b):

Воду нагревали при 75°C и в ней растворяли 0,2% метилпарабена, 0,91 масс.% гидроксида калия. Эту смесь продолжали перемешивать в контейнере, и масляную фазу готовили следующим образом.

Масляную фазу готовили нагреванием 12 масс.% стеариновой кислоты при 75°C. К этому добавляли 0,4 масс.% Парсола 1789, 0,75 масс.% этилгексилметоксициннамата, 0,7 масс.% диоксида титана и 0,25 масс.% токоферилацетата, и смесь гомогенизировали в течение 10 минут.

Стадия (c):

Водную и масляную фазы объединяли путем добавления масляной фазы в водную фазу с последующей гомогенизацией при 75°C в течение 10 минут для получения косметически приемлемой основы.

Стадия (d):

После охлаждения эмульсии, полученной на стадии (с), до 45°C, весь аддукт, полученный на стадии (а), объединяли с косметически приемлемой основой, и перемешивали до однородного состояния. Серию затем охлаждали до комнатной температуры.

Таблица 1: Детали композиции для примеров от А до D и от 1 до 4 (масс.%)

Ингредиент	А / 1	В / 2	С / 3	D / 4
Стеариновая кислота	12	12	12	12
Солнцезащитные агенты	1,85	1,85	1,85	1,85
Витамина Е ацетат	0,1	0,1	0,1	0,1
Витамин В3	1,25	1,25	1,25	1,25
Витамин В6	0,01	0,01	0,01	0,01
ЭДТА	0,1	-	0,1	-
ЭДДЯК	-	0,1	-	0,1
Гексилрезорцинол	0,25	0,25	-	-
Этилрезорцинол	-	-	0,25	0,25
Глицерин	1	1	1	1
Метилпарабен	0,2	0,2	0,2	0,2
Феноксиэтанол	0,4	0,4	0,4	0,4
Гидроксистеариновая кислота	0,1	0,1	0,1	0,1
Калия гидроксид	0,41	0,41	0,41	0,41
Парфюмерный агент	0,35	0,35	0,35	0,35
Вода	До 100	До 100	До 100	До 100

#### Стабильность цвета композиций

Для оценки стабильности цвета рассчитывали  $\Delta E$  всех композиций, то есть от А до D и от 1 до 4. Все образцы хранили в течение 4 недель в стеклянных банках вместимостью 2 унции при температуре от 45 до 50°C. Все образцы были загружены в измерительную ячейку Hunter Lab ХЕ в нулевой момент времени, то есть сразу после их изготовления и в конце 4 недель хранения, и данные о цвете были собраны непосредственно с прибора. Значения  $L^*$ ,  $a^*$  и  $b^*$  на 4-й неделе и нулевой неделе (исходные данные) использовали для расчета  $\Delta E$  с применением приведенной ранее формулы. Значение  $\Delta E$  всех композиций приведено в таблице 2 ниже.

Таблица 2: Стабильность цвета ГР и ЭР в композиции

Композиция	Активный агент + Хелатирующий агент	Цвет на 0 неделе			Цвет на 4 неделе			$\Delta E$
		$L^*$	$a^*$	$b^*$	$L^*$	$a^*$	$b^*$	
А	ГР + ЭДТА	87,16	8,6	5,3	84,5	9,96	11,9	7,24
1	ГР + ЭДТА	84,69	10,33	6,36	83,15	10,96	11,23	5,15
В	ГР + ЭДДЯК	83,86	9,36	6,68	79,7	12,65	18,32	12,79
2	ГР + ЭДДЯК	84,93	9,01	6,56	79,55	12,99	25,68	20,26
С	ЭР + ЭДТА	86,31	8,71	6,06	79,93	23,29	52,68	49,26
3	ЭР + ЭДТА	85,52	9,2	6,17	80,15	21,75	49,64	45,56
D	ЭР + ЭДДЯК	84,69	9,29	6,25	74,67	22,98	54,61	51,25
4	ЭР + ЭДДЯК	83,87	10,35	6,3	76,07	17,36	44,13	39,26

Как видно из данных в таблице 2, стабильность цвета ГР улучшается, когда используют хелатирующий агент, отличный от ЭДДЯК, тогда как стабильность цвета ЭР

улучшается, когда используют любой из хелатирующих агентов ЭДТА или ЭДДЯК.

## ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Способ приготовления композиции, включающей

i) соединение, выбранное из резорцинола, фенилэтилрезорцинола, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей;

ii) хелатирующий агент; и

iii) косметически приемлемую основу, содержащую водную фазу и масляную фазу;

где способ включает стадии:

(a) объединение соединения, выбранного из резорцинола, фенилэтилрезорцинола, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, с хелатирующим агентом в воде;

(b) приготовление водной фазы и масляной фазы;

(c) объединение водной фазы и масляной фазы для получения косметически приемлемой основы; и

(d) объединение аддукта, полученного на стадии (a), с косметически приемлемой основой со стадии (c).

2. Способ по п. 1, в котором 4-алкилзамещенный резорцинол выбран из 4-метилрезорцинола, 4-этилрезорцинола, 4-пропилрезорцинола, 4-изопропилрезорцинола, 4-бутилрезорцинола, 4-пентилрезорцинола, 4-гексилрезорцинола, 4-гептилрезорцинола, 4-октилрезорцинола и их смесей.

3. Способ по п.п. 1 или 2, в котором хелатирующий агент выбран из этилендиаминтетрауксусной кислоты, этилендиаминдиянтарной кислоты и их смесей.

4. Способ по любому из п.п. 1-3, в котором комбинацию соединения, выбранного из резорцинола, фенилэтилрезорцинола, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, и хелатирующего агента на стадии (a) выбирают из 4-гексилрезорцинола + этилендиаминтетрауксусной кислоты, 4-этилрезорцинола + этилендиаминтетрауксусной кислоты, и 4-этилрезорцинола + этилендиаминдиянтарной кислоты.

5. Способ по любому из п.п. 1-4, в котором стадию (d) проводят, когда температура смеси, полученной на стадии (c), находится в диапазоне от 40 до 50°C.

6. Способ по любому из п.п. 1-5, в котором водную фазу на стадии (b) готовят путем растворения ингредиентов водной фазы в воде, которая имеет температуру от 60 до 80°C.

7. Способ по любому из п.п. 1-6, в котором водная фаза содержит витамин, глицерин и сурфактант.

8. Способ по любому из п.п. 1-7, в котором масляную фазу на стадии (c) готовят путем растворения ингредиентов масляной фазы в масле, имеющем температуру от 60 до 80°C.

9. Способ по любому из п.п. 1-8, в котором масляная фаза содержит сурфактант и солнцезащитный агент.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ, ИЗМЕНЕННАЯ ПО СТАТЬЕ 34 РСТ,  
ПРЕДЛОЖЕННАЯ ЗАЯВИТЕЛЕМ К РАССМОТРЕНИЮ

1. Способ приготовления композиции, включающей
  - i) соединение, выбранное из резорцинола, фенилэтилрезорцинола, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей;
  - ii) хелатирующий агент; и
  - iii) косметически приемлемую основу, содержащую водную фазу и масляную фазу; где способ включает стадии:
    - (a) объединение соединения, выбранного из резорцинола, фенилэтилрезорцинола, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, с хелатирующим агентом в воде;
    - (b) приготовление водной фазы и масляной фазы;
    - (c) объединение водной фазы и масляной фазы для получения косметически приемлемой основы; и
    - (d) объединение аддукта, полученного на стадии (a), с косметически приемлемой основой со стадии (c),  
при этом способ не включает комбинацию 4-гексил резорцинола с этилендиаминдиянтарной кислотой.
2. Способ по п. 1, в котором 4-алкилзамещенный резорцинол выбран из 4-метилрезорцинола, 4-этилрезорцинола, 4-пропилрезорцинола, 4-изопропилрезорцинола, 4-бутилрезорцинола, 4-пентилрезорцинола, 4-гексилрезорцинола, 4-гептилрезорцинола, 4-октилрезорцинола и их смесей.
3. Способ по п.п. 1 или 2, в котором хелатирующий агент выбран из этилендиаминтетрауксусной кислоты, этилендиаминдиянтарной кислоты и их смесей.
4. Способ по любому из п.п. 1-3, в котором комбинацию соединения, выбранного из резорцинола, фенилэтилрезорцинола, 4-алкилзамещенного резорцинола и их смесей, и хелатирующего агента на стадии (a) выбирают из 4-гексилрезорцинола + этилендиаминтетрауксусной кислоты, 4-этилрезорцинола + этилендиаминтетрауксусной кислоты, и 4-этилрезорцинола + этилендиаминдиянтарной кислоты.
5. Способ по любому из п.п. 1-4, в котором стадию (d) проводят, когда температура смеси, полученной на стадии (c), находится в диапазоне от 40 до 50°C.
6. Способ по любому из п.п. 1-5, в котором водную фазу на стадии (b) готовят путем растворения ингредиентов водной фазы в воде, которая имеет температуру от 60 до 80°C.
7. Способ по любому из п.п. 1-6, в котором водная фаза содержит витамин, глицерин и сурфактант.

8. Способ по любому из п.п. 1-7, в котором масляную фазу на стадии (с) готовят путем растворения ингредиентов масляной фазы в масле, имеющем температуру от 60 до 80°C.

9. Способ по любому из п.п. 1-8, в котором масляная фаза содержит сурфактант и солнцезащитный агент.