

(19)



**Евразийское  
патентное  
ведомство**

(11) **041056**

(13) **B1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

(45) Дата публикации и выдачи патента  
**2022.09.05**

(21) Номер заявки  
**202092837**

(22) Дата подачи заявки  
**2019.06.12**

(51) Int. Cl. *A61K 8/06* (2006.01)  
*A61K 8/365* (2006.01)  
*A61Q 1/06* (2006.01)

---

(54) **СТАБИЛИЗИРОВАННЫЕ ЭМУЛЬСИИ С КИСЛОТНЫМИ СРЕДСТВАМИ**

---

(31) **62/683,960; 16/439,509**

(32) **2018.06.12; 2019.06.12**

(33) **US**

(43) **2021.03.30**

(86) **PCT/US2019/036835**

(87) **WO 2019/241429 2019.12.19**

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:  
**ЭЙВОН ПРОДАКТС, ИНК. (US)**

(72) Изобретатель:  
**Хатсон Эшли Л., Новак Кандис ДеЛео  
(US)**

(74) Представитель:  
**Поликарпов А.В., Соколова М.В.,  
Путинцев А.И., Черкас Д.А., Игнатьев  
А.В., Билык А.В., Дмитриев А.В.,  
Бучака С.М., Бельтюкова М.В. (RU)**

(56) **US-A1-2011147259  
US-B1-6596263  
US-A1-2015164768  
WO-A1-0056346**

(57) Было обнаружено, что комбинация полиолов с определенными активными ингредиентами подавляет потенциальные раздражающие свойства некоторых активных ингредиентов (например, гидроксикислот и т.д.). При нанесении на губы данная комбинация может обеспечивать терапевтические и/или косметические преимущества, в том числе более гладкие губы, повышенное увлажнение, сниженную потерю влаги и их комбинации. Тем не менее создание стабильных эмульсий с определенными активными ингредиентами оказалось проблематичным. В данном изобретении также представлены новые механизмы стабилизации эмульсий, включающие изменение вязкости при объемном расширении внутренней фазы.

**B1**

**041056**

**041056**

**B1**

### **Перекрестная ссылка на родственные заявки**

Данная заявка испрашивает приоритет заявки на патент США № 16/439509, поданной 12 июня 2019 г., которая испрашивает приоритет заявки на патент США № 62/683960, поданной 12 июня 2018 г., которая включена в данный документ посредством ссылки во всей своей полноте.

### **Область техники, к которой относится изобретение**

Изобретение относится к композициям эмульсий, содержащим определенные активные ингредиенты. Данные композиции эмульсий обычно представляют собой эмульсии типа глицерин-в-масле и содержат гидроксикислоты. Было обнаружено, что комбинация полиолов с определенными активными ингредиентами подавляет потенциальные раздражающие свойства активных ингредиентов. При нанесении на губы данная комбинация может обеспечивать терапевтические и/или косметические преимущества, в том числе более гладкие губы, повышенное увлажнение, сниженную потерю влаги и их комбинации. Также представлены способы получения данных эмульсий.

### **Предпосылки к созданию изобретения**

Кожа на губах структурно отличается от кожи на других участках тела человека. Губы имеют более тонкий роговой слой и меньшее количество липидов, чем кожа, отличная от кожи губ, или обычная кожа. Это позволяет воде легко проходить через губы и испаряться с них. В действительности, потеря воды через губы в 10 раз превышает потерю воды через обычную кожу. Это делает губы более склонными к сухости и со временем - к более сильным повреждениям. Роговой слой губ также имеет высокую скорость оборота, что означает, что корнеоциты постоянно отшелушиваются. В качестве части процесса отшелушивания отмершие клетки скапливаются в чешуйки на поверхности губ. Если губы сухие, то данные чешуйки становятся более видимыми. Вследствие различий кожи губ по сравнению с остальным телом, более тонкий роговой слой вместе с более высокой скоростью оборота клеток делают губы более восприимчивыми к воздействию окружающей среды, механических и химических факторов. Данные факторы приводят к ощущению сухих, потрескавшихся губ и визуальному образованию чешуек, которые возникают, если губы повреждены сильнее естественной способности кожи самовосстанавливаться.

Соответственно, потребители нуждаются в эффективном уходе за губами, который увлажняет, лечит и разглаживает уязвимую и нежную поверхность губ. Большинство продуктов для губ на рынке состоят из окклюзионных масел или восков, которые ограничивают количество влаги, покидающей губы. Данные системы в конечном итоге полагаются на естественную способность кожи к самовосстановлению. Данные продукты не устраняют какую-либо причину сухости, а только предотвращают дальнейшее высыхание. Некоторые продукты также содержат увлажняющие ингредиенты и заживляющие ингредиенты. Эффективность таких продуктов находится в широком диапазоне.

Как правило, продукты в виде губной помады представляют собой безводные системы. Данные системы состоят из комбинации структурообразующих веществ, смягчающих веществ и пигментных материалов. Губные помады также могут содержать от 0,05 до 3% увлажнителя, такого как глицерин. Также были случаи, когда губные помады, представляющие собой эмульсию, обычно состояли как минимум из двух фаз, которые частично или полностью не смешивались между собой. Эмульсии типа глицерин-в-масле представляют особый интерес в областях губ и кожи, поскольку они могут обеспечивать увлажненность выше и за пределами достижимых уровней в однофазных системах на основе масла. Общеизвестно, что эмульсии с применением глицерина вместо воды либо в непрерывных, либо в дисперсных фазах создают более высокий уровень увлажненности, чем возможно достичь при применении только воды.

Тем не менее данные эмульсионные помады зачастую страдают от проблем в отношении стабильности. Для сведения к минимуму термодинамически неблагоприятного взаимодействия между фазами вследствие несмешиваемости фаз в эмульсии существует тенденция к разделению фаз с течением времени. Как известно, эмульсии подвергаются фазовому разделению вследствие дестабилизирующих процессов, таких как расслоение, флокуляция, коалесценция, и Оствальдовское созревание.

Для борьбы с дестабилизацией эмульсии могут применяться эмульгаторы. Например, эмульгатор может быть выбран специально для типа применяемой эмульсии. Для систем с низким рН в водной фазе (или кажущимся рН, где это применимо) можно применять несколько обычных эмульгаторов, таких как стеарат PEG-2 и стеарет-2. Также известно, что загущение внешней фазы по отношению к внутренней фазе повышает стабильность эмульсии.

Тем не менее включение в данные системы определенных активных веществ, таких как  $\alpha$ -гидроксикислоты, приводит к повышению концентрации электролитов в дисперсной фазе, что, в свою очередь, влияет на стабилизирующий механизм, обеспечиваемый эмульгатором. Например, данные электролиты могут дестабилизировать эмульгаторы/стабилизаторы, основанные на электростатическом отталкивании. Тем не менее, для некоторых активных ингредиентов необходимый рН является слишком низким для стандартных механизмов стабилизации эмульсии.

Кроме того,  $\alpha$ -гидроксикислоты обычно не наносят на губы вследствие раздражения кожи губ, обусловленного низкими рабочими диапазонами рН. Данное раздражение усиливается для губ по сравнению с кожей вследствие уникальных структурных и морфологических характеристик кожи губ. Составы, содер-

жащие  $\alpha$ -гидроксикислоты, например гликолевую и молочную кислоту, при нанесении на лицо могут вызывать значительный дискомфорт у некоторых людей и симптомы сильного раздражения кожи у других.

Эмульсии типа глицерин-в-масле являются особенно чувствительными к данным изменениям во внутренней фазе, где дестабилизация и синерезис внутренней глицериновой фазы на поверхности может проявляться в виде выпотевания помады. Данная нестабильность может усугубляться при воздействии экстремальных значений температуры и высокой влажности вследствие увлажняющего свойства глицерина. С целью обеспечения коммерческой жизнеспособности эмульсия должна демонстрировать достаточную стабильность при колебаниях температуры и влажности. Тем не менее, ограничения в отношении стабильности глицерина в масле препятствовали какой-либо коммерческой эффективности.

#### **Краткое описание изобретения**

Таким образом, целью настоящего изобретения является обеспечение стабильных помад на основе эмульсии типа глицерин-в-масле, содержащих одну или несколько  $\alpha$ -гидроксикислот. Данные помады преодолевают многие проблемы, ранее обнаруженные при нанесении определенных активных веществ (например,  $\alpha$ -гидроксикислот) на кожу губ. Было обнаружено, что данные помады неожиданно обеспечивают повышенные терапевтические и/или косметические эффекты по сравнению с увлажняющими помадами, основанными исключительно на окклюзионных механизмах действия или других активных ингредиентах (например, на витамине Е). Факторы, обеспечиваемые комбинациями полиолов и определенных кислотных активных ингредиентов (например,  $\alpha$ -гидроксикислот и т.д.), могут совмещаться и обеспечивать более гладкую поверхность губ, увеличение удержания воды в губах, улучшение барьерных функций, утолщение рогового слоя, повышение увлажнения и их комбинации. Более того, помады по настоящему изобретению могут характеризоваться повышенной стабильностью и, следовательно, способностью включать более широкий спектр активных ингредиентов (например,  $\alpha$ -гидроксикислоты и т.д.), которые не влияют на описанный в данном документе механизм стабилизации эмульсии.

Представлен способ обеспечения терапевтического и/или косметического эффекта в отношении губ, предусматривающий нанесение эмульсионной композиции для местного применения, содержащей глицерин и одну или несколько  $\alpha$ -гидроксикислот. В предпочтительных вариантах осуществления эмульсия содержит одну  $\alpha$ -гидроксикислоту, и кажущийся рН глицериновой фазы является близким к  $pK_a$   $\alpha$ -гидроксикислоты. Величину раздражения (или силу композиции) можно регулировать путем изменения рН фаз, содержащих кислоту, поскольку при рН, значение которого приближается к  $pK_a$  в водной системе, кислотное равновесие устанавливается приблизительно с 50% кислоты и 50% соответствующей соли кислоты. Например, если  $\alpha$ -гидроксикислота представляет собой молочную кислоту ( $pK_a = 3,86$ ), то кажущийся рН глицериновой фазы может составлять от 3,3 до 4,3 (например, от 3,4 до 4,2, от 3,5 до 4,1, от 3,6 до 4,0, от 3,7 до 3,9, от 3,7 до 4,0 и т.д.).

В некоторых вариантах осуществления композиция для губ может быть представлена в форме эмульсии, содержащей глицериновую внутреннюю фазу и одну или несколько  $\alpha$ -гидроксикислот. В некоторых вариантах осуществления глицериновая фаза характеризуется значением первой разницы нормальных напряжений (показателем вязкости при объемном расширении), составляющим менее 20 Па (например, менее 15 Па, менее 10 Па, менее 8 Па и т.д.) при напряжении сдвига 100 Па и температуре 25°C.

Предпочтительно композиция для губ представлена в форме эмульсии типа глицерин-в-масле, содержащей одну или несколько  $\alpha$ -гидроксикислот.

#### **Краткое описание графических материалов**

На фиг. 1 проиллюстрированы различия в отношении преломления света между здоровыми и нездоровыми губами;

на фиг. 2А показано среднее процентное изменение показаний корнеометра для каждой выборки клинического исследования. "\*" означает статистически значимые результаты в отношении измерения на губах в начале исследования со значимостью  $p \leq 0,05$ , а "x" означает такие результаты, которые имеют статистическую значимость  $p \leq 0,10$ ;

на фиг. 2В - среднее процентное изменение измерений TEWL для каждой выборки клинического исследования;

на фиг. 2С - среднее процентное изменение барьерной функции для каждой выборки клинического исследования.

#### **Подробное описание изобретения**

В данном документе раскрыты подробные варианты осуществления настоящего изобретения; однако следует понимать, что раскрытые варианты осуществления являются всего лишь иллюстративными для настоящего изобретения, которое может быть воплощено в различных формах. Кроме того, каждый из примеров, приведенных в отношении различных вариантов осуществления изобретения, предназначен для иллюстрации, а не для ограничения.

Предполагается, что все термины в данном документе используются в их обычном значении в данной области техники, если не указано иное. Все значения концентрации выражены в процентах по весу указанного компонента относительно всего веса композиции для местного применения, если не указано

иное.

Используемые в данном документе формы единственного числа включают также множественное число. Формы единственного числа, используемые в данном документе вместе со словом "содержащий", также включают множественное число. Используемый в данном документе термин "другой" означает по меньшей мере второй или более.

Все диапазоны числовых значений, используемые в данном документе, включают конечные точки и все возможные значения, раскрытые между раскрытыми значениями. Точные значения всех полуцелых числовых значений также рассматриваются как конкретно раскрытые и как пределы для всех подмножеств раскрытого диапазона. Например, диапазон от 0,1 до 3% конкретно раскрывает процентные значения 0,1, 0,5, 1, 1,5, 2,0, 2,5 и 3%. Кроме того, диапазон от 0,1 до 3% включает подмножества исходного диапазона, в том числе от 0,5 до 2,5%, от 1 до 3%, от 0,1 до 2,5% и т.д.

Следует понимать, что сумма всех вес.% отдельных компонентов не будет превышать 100%.

Подразумевается, что используемый в данном документе термин "масло" включает силиконовые масла, если не указано иное. Подразумевается, что термин "масло" охватывает летучие и/или нелетучие масла. Следует понимать, что масляные фазы композиций могут содержать одно или несколько силиконовых масел в качестве основного или отличного от основного компонента масляной фазы.

Термины "внутренняя" и "дисперсная" фаза являются синонимами, как и термины "внешняя" и "непрерывная" фаза. Термины "глицерин" и "глицерол" являются синонимами и используются взаимозаменяемо. Также будет понятно, что водные фазы композиций могут содержать один или несколько полиолов (например, глицерин и т. д.) в качестве компонента, отличного от основного, и фазы композиций на основе полиола (например, глицерина и т.д.) могут включать воду в качестве компонента, отличного от основного.

Под "близким к рКа" в отношении рН фазы подразумевается, что фаза имеет рН, значение которого приближается к указанному значению рКа. В некоторых вариантах осуществления рН может находиться в пределах 0,5 единицы рН относительно рКа (т. е.  $pH = pK_a \pm 0,5$ ), 0,4 единицы рН относительно рКа (т.е.  $pH = pK_a \pm 0,4$ ), 0,4 единицы рН относительно рКа (т. е.  $pH = pK_a \pm 0,4$ ), 0,3 единицы рН относительно рКа (т. е.  $pH = pK_a \pm 0,3$ ), 0,2 единицы рН относительно рКа (т. е.  $pH = pK_a \pm 0,2$ ) и т.д.

Композиции по настоящему изобретению применяют для нанесения на кожу, губы, ногти, волосы и другие ороговевшие поверхности. Используемый в данном документе термин "ороговевшая поверхность" означает кератинсодержащие части системы наружного покрова человека, которая включает без ограничения кожу, губы, волосы (в том числе брови и ресницы) и ногти (ногти на пальцах ног, ногти на пальцах рук, надногтевые пластинки и т.д.) млекопитающих, предпочтительно людей. Предпочтительно композиции наносят на губы.

Композиции представлены в форме эмульсии с фазой на основе полиола и/или водной фазой. Обычно эмульсии могут содержать воду и/или глицерин. В некоторых вариантах осуществления эмульсии могут представлять собой эмульсии типа полиол-в-масле, масло-в-полиоле, глицерин-в-масле, масло-в-глицерине, силикон-в-глицерине, глицерин-в-силиконе, силикон-в-полиоле или полиол-в-силиконе. В предпочтительных вариантах осуществления эмульсия представляет собой эмульсию типа полиол-в-масле или глицерин-в-масле. Эмульсии могут содержать безводную внешнюю фазу (например, масляную фазу, фазу на основе силикона и т.д.). В некоторых вариантах осуществления эмульсии могут содержать внутреннюю фазу, которая представляет собой водную фазу, фазу на основе полиола или глицерина.

В определенных вариантах осуществления композиция представляет собой эмульсию типа полиол-в-масле, содержащую дисперсную внутреннюю фазу на основе полиола (например, глицерина и т.д.) и одну или несколько гидроксикислот (например,  $\alpha$ -гидроксикислоту,  $\beta$ -гидроксикислоту и т.д.). В большинстве вариантов осуществления композиция представляет собой эмульсию типа глицерин-в-масле. В определенных вариантах осуществления композиция содержит одну  $\alpha$ -гидроксикислоту. В вариантах осуществления с одной  $\alpha$ -гидроксикислотой кажущийся рН фазы на основе полиола является близким к рКа  $\alpha$ -гидроксикислоты. Внутренняя фаза обычно составляет от 1 до 65 вес.% всей эмульсии. Чаше внутренняя фаза будет составлять от 5 до 45 вес.% всей эмульсии. Внешняя фаза обычно содержит от 25 до 95% (например, от 55 до 85%) по весу всей эмульсии.

Подходящие полиолы для включения в эмульсии включают без ограничения  $C_{2-6}$ -полиолы, такие как этиленгликоль, пропиленгликоль, бутиленгликоль, гексиленгликоль, сорбит, диэтиленгликоль и глицерин. В большинстве вариантов осуществления внутренняя фаза содержит глицерин. В некоторых вариантах осуществления фаза на основе полиола будет содержать глицерин в комбинации с одним или несколькими дополнительными компонентами, представляющими собой  $C_{2-6}$ -полиолы. В некоторых вариантах осуществления фаза на основе полиола будет дополнительно содержать воду, не считая воды, которая естественным образом поглощается фазой на основе полиола вследствие своей гигроскопичности.

Активный ингредиент может представлять собой отшелушивающее средство. Подходящие отшелушивающие средства включают  $\alpha$ -гидроксикислоты,  $\beta$ -гидроксикислоты, кетокислоты, ретиноевую кислоту, лактамыды, лактаты четвертичного аммония, гидроксилированные  $C_{4-12}$ -карбоновые кислоты,

салициловую кислоту и их различные производные. Примеры включают гликолевую кислоту, молочную кислоту, лимонную кислоту, яблочную кислоту, миндальную кислоту, тартроновую кислоту, винную кислоту, глюкуроновую кислоту, пировиноградную кислоту, 2-гидроксиалкановую кислоту, 2-гидроксиизомаляновую кислоту, 3-гидроксиаляновую кислоту и их производные (например, сложные эфиры и обратные сложные эфиры со спиртами, содержащими от одного до шести атомов углерода, например, метилпируват). Другие активные ингредиенты могут включать витамин А<sub>2</sub> (3,4-дидегидроретинол), гепаксантин (эпоксид витамина А; 5-6-эпокси-5,6-дигидроретинол) и дополнительные производные соединения. В определенных вариантах осуществления композиции содержат α-гидроксикислоту. В предпочтительных вариантах осуществления композиции содержат молочную кислоту. В некоторых вариантах осуществления одно или несколько активных средств присутствуют в количестве от 0,1 до 20 вес.% композиции (например, от 0,5 до 10%, от 0,5 до 5% и т.д.).

В зависимости от активного ингредиента, кажущийся рН фазы на основе полиола или рН водной фазы можно изменять для создания материалов, вызывающих меньшее раздражение, на основе активного ингредиента (например, сопряженных оснований гидроксикислот). Например, для изменения рН и изменения баланса кислотного равновесия в фазе можно применять добавление основных солей (например, гидроксида натрия, гидроксида калия, гидроксида магния). Обычно полиол находится в пределах 0,5 единиц рН (например, в пределах 0,4 рН, в пределах 0,3 рН, в пределах 0,2 рН) относительно рК<sub>а</sub> гидроксикислоты. В некоторых вариантах осуществления основная соль присутствует в количестве от 0,1 до 5 вес.% композиции.

В некоторых вариантах осуществления внешняя (непрерывная) фаза представляет собой масляную фазу. Например, непрерывная масляная фаза может содержать любые подходящие для эмульсий масла, включая без ограничения растительные масла; сложные эфиры жирных кислот; жирные спирты; изопарафины, такие как изододекан и изоэйкозан; углеводородные масла, такие как минеральное масло, жидкий парафин и полиизобутен; полиолефины и их гидрированные аналоги (например, гидрированный полиизобутен); натуральные или синтетические воски; силиконовые масла, такие как диметиконы, циклические силиконы и полисилоксаны, и подобные.

Подходящие сложноэфирные масла включают сложные эфиры жирных кислот. Конкретное упоминание можно сделать для таких сложных эфиров, которые обычно применяют в качестве смягчающих средств в косметических составах. Такие сложные эфиры будут обычно представлять собой продукт этерификации кислоты в виде R<sub>4</sub>(COOH)<sub>1-2</sub> со спиртом в виде R<sub>5</sub>(OH)<sub>13</sub>, где каждый из R<sub>4</sub> и R<sub>5</sub> независимо представляет собой неразветвленную, разветвленную или циклическую углеводородную группу, необязательно содержащую ненасыщенные связи (например, 1-6, или 1-3, или 1) и содержащую от 1 до 30 (например, 6-30, или 8-30, или 12-30, или 16-30) атомов углерода, необязательно замещенных одной или несколькими функциональными группами, в том числе гидроксильной, окса-, оксо- и им подобными группами. Предпочтительно по меньшей мере один из R<sub>4</sub> и R<sub>5</sub> содержит по меньшей мере 8, или по меньшей мере 10, или по меньшей мере 12, или по меньшей мере 16, или по меньшей мере 18 атомов углерода, таким образом, сложный эфир содержит по меньшей мере одну цепь жирной кислоты. Определенные выше сложные эфиры будут включать без ограничения сложные эфиры одноосновных кислот с одноатомными спиртами, одноосновных кислот с диолами и триолами, двухосновных кислот с одноатомными спиртами и трехосновных кислот с одноатомными спиртами.

Подходящие сложные эфиры жирных кислот включают без ограничения бутилацетат, бутилизостеарат, бутилолеат, бутилостеарилстеарат, цетилпальмитат, цетилоктаноат, цетиллаурат, цетиллактат, цетил-изононаноат, цетилстеарат, диизостеарилфумарат, диизостеарилмалат, неопентилгликольдиоктаноат, дибутилсебацат, ди-C<sub>12-13</sub>алкилмалат, дицетеарил димер дилинолеат, дицетиладипат, диизоцетиладипат, диизонониладипат, диизопропилдимерат, триизостеарилтрилинолеат, октодецилстеароилстеарат, гексиллаурат, гексадецил-изостеарат, гексадециллаурат, гексилдецилоктаноат, гексилдецилолеат, гексилдецилпальмитат, гексилдецилстеарат, изононил-изононаноат, изостеарил-изононат, изогексилнеопентаноат, изогексадецилстеарат, изопропил-изостеарат, н-пропилмиристанат, изопропилмиристанат, н-пропилпальмитат, изопропилпальмитат, гексакозанилпальмитат, лауриллактат, октакозанилпальмитат, пропиленгликольмонолаурат, триаконтанилпальмитат, дотриаконтанилпальмитат, тетратриаконтанилпальмитат, гексакозанилстеарат, октакозанилстеарат, триаконтанилстеарат, дотриаконтанилстеарат, стеариллактат, стеарилоктаноат, стеарилгептаноат, стеарилстеарат, тетратриаконтанилстеарат, триарахидин, трибутилцитрат, триизостеарилцитрат, три-C<sub>12-13</sub>алкилцитрат, трикаприлин, трикаприлцитрат, тридецилбегенат, триоктилодецилцитрат, тридецилкокоат, тридецил-изононаноат, глицерилмонорицинолеат, 2-октилодецилпальмитат, 2-октилодецилмиристанат или лактат, ди(2-этилгексил)сукцинат, токоферилацетат и им подобные.

Другие подходящие сложные эфиры включают такие, в которых R<sub>5</sub> предусматривает полигликоль вида Н-(О-CHR\*-CHR\*)<sub>n</sub>-, где R\* независимо выбран из водорода или C<sub>1-12</sub>алкила с прямой цепью, в том числе метила и этила, примером которого является полиэтиленгликольмонолаурат.

Масло также может предусматривать летучее или нелетучее силиконовое масло. Подходящие силиконовые масла включают неразветвленные или циклические силиконы, такие как полиалкил- или полиарилсилоксаны, необязательно содержащие алкильные или алкоксигруппы, которые содержат от 1 до 10

атомов углерода. Иллюстративные силиконовые масла включают, например, каприлилметикон, циклометикон, циклопентасилоксан декаметилциклопентасилоксан, декаметилтетрасилоксан, дифенилдиметикон, додекаметилциклогексасилоксан, додекаметилпентасилоксан, гептаметилгексилтрисилоксан, гептаметилоктилтрисилоксан, гексаметилдисилоксан, метикон, метил-фенилполисилоксан, октаметилциклотетрасилоксан, октаметилтрисилоксан, перфторнонилдиметикон, полидиметилсилоксаны и их комбинации. Силиконовое масло будет иметь вязкость, как правило, но не обязательно, составляющую от 5 до 3000 сантистокс (сСт), предпочтительно от 50 до 1000 сСт, измеренную при 25°C.

В одном варианте осуществления силиконовое масло содержит фенильные группы, как и в случае силиконового масла, такого как метилфенилполисилоксан (название по INCI - дифенилдиметикон), коммерчески доступный от Shin Etsu Chemical Co под названием, включающим F-5W, KF-54 и KF-56. Дифенилдиметиконы характеризуются надлежащей органической совместимостью и могут придавать продукту пленкообразующие характеристики. Кроме того, присутствие фенильных групп повышает показатель преломления силиконового масла и, таким образом, при необходимости может способствовать сильному блеску продукта. В одном варианте осуществления силиконовое масло будет иметь показатель преломления по меньшей мере 1,3, предпочтительно по меньшей мере 1,4, более предпочтительно по меньшей мере 1,45 и еще более предпочтительно по меньшей мере 1,5 при измерении при 25°C. Другое подходящее функционализированное фенилом силиконовое масло имеет название по INCI фенилтриметикон и доступно на рынке под торговым названием DC 556 от Dow Corning. DC 556 имеет показатель преломления 1,46. В одном варианте осуществления силиконовое масло представляет собой фторированный силикон, как например, перфторированный силикон (т.е. фторсиликоны). Фторсиликоны преимущественно являются как гидрофобными, так и олеофобными, и за счет этого наделяют продукт требуемыми качествами скольжения и тактильными характеристиками. Фторсиликоны также придают свойства, способствующие длительной стойкости продукта для губ. При необходимости фторсиликоны можно подвергнуть загущению с использованием бегенилбегената. Один подходящий фторсиликон представляет собой текучую среду на основе фторированного органofункционального силикона, имеющего название по INCI перфторнонилдиметикон. Перфторнонилдиметикон доступен на рынке от компании Phoenix Chemical под торговым названием PECOSIL®. Композиции могут содержать от 5 до 75% силиконового масла по весу композиции (например, от 10 до 60 вес.% композиции, от 20 до 50 вес.% композиции, от 25 до 45 вес.% композиции и т.д.).

Композиции могут также содержать углеводородные масла. Иллюстративные углеводородные масла представляют собой парафиновые углеводороды с прямой или разветвленной цепью, содержащие от 5 до 80 атомов углерода, как правило, от 8 до 40 атомов углерода и более типично от 10 до 16 атомов углерода, включая без ограничения пентан, гексан, гептан, октан, нонан, декан, ундекан, додекан, тетрадекан, тридекан и им подобные. Некоторые применимые углеводородные масла представляют собой алифатические углеводороды высокой степени разветвления, включая C<sub>8-9</sub>изопарафины, C<sub>9-11</sub>изопарафины, C<sub>12</sub>изопарафин, C<sub>20-40</sub>изопарафины и им подобные. Особенно следует упомянуть изопарафины, имеющие такие названия по INCI как изогексадекан, изоэйкозан и изододекан.

В качестве углеводородных масел подходящими также являются поли- $\alpha$ -олефины, содержащие, как правило, более 20 атомов углерода, включая (необязательно, гидрированные) C<sub>24-28</sub>олефины, C<sub>30-45</sub>олефины, полиизобутен, гидрогенизированный полиизобутен, гидрогенизированный полидецен, полибутен, гидрогенизированный полициклопентан, минеральное масло, пентагидросквален, сквален и им подобные. Углеводородное масло также может предусматривать высшие жирные спирты, такие как олеиловый спирт, октилдодеканол и им подобные.

Другие подходящие масла включают без ограничения касторовое масло, C<sub>10-18</sub>триглицериды, каприловые/каприновые/триглицериды, кокосовое масло, кукурузное масло, хлопковое масло, льняное масло, норковый жир, оливковое масло, пальмовое масло, масло из ореха бассия, рапсовое масло, соевое масло, подсолнечное масло, масло грецкого ореха, масло авокадо, масло камелии, масло макадамии, жир черепахи, норковый жир, соевое масло, масло из виноградных косточек, кунжутное масло, маисовое масло, рапсовое масло, подсолнечное масло, хлопковое масло, масло жожоба, арахисовое масло, оливковое масло и их комбинации.

Предполагается, что любое из вышеуказанных сложноэфирных масел, силиконовых масел и углеводородных масел можно применять на практике в соответствии с настоящим изобретением. Следовательно, в одном варианте осуществления композиции содержат по меньшей мере одно масло, выбранное из сложноэфирных масел, силиконовых масел и углеводородных масел, описанных выше. В другом варианте осуществления композиции содержат два или более масел, выбранных из сложноэфирных масел, силиконовых масел и углеводородных масел, описанных выше. В еще одном варианте осуществления композиции будут содержать по меньшей мере одно сложноэфирное, по меньшей мере одно силиконовое масло и по меньшей мере одно углеводородное масло из списка выше. Поскольку сложноэфирные масла, описанные в данном документе, выполняют функцию смягчающих средств, может быть предпочтительным, чтобы композиции содержали по меньшей мере одно сложноэфирное масло, и они могут не обязательно содержать по меньшей мере одно дополнительное масло, выбранное из углеводородных ма-

сел, силиконовых масел и их комбинаций. Например, в некоторых вариантах осуществления композиции содержат ланолин, стеарилдиметикон, миристиллактат и дифенилдиметикон.

Также необязательно можно добавлять воски и/или наполнители (в частности, в тех вариантах осуществления, где композиция представляет собой сохраняющее форму твердое вещество при комнатной температуре) в количестве, находящемся в диапазоне от 1 до 20% включительно по весу композиции или в диапазоне от 1 до 10% включительно по весу композиции. Примеры наполнителей могут включать без ограничения диоксид кремния, РММА, нейлон, оксид алюминия, сульфат бария или любой другой наполнитель, применяемый в таких композициях. Примеры восков могут включать без ограничения линейный полиэтилен, микрокристаллический нефтяной воск, карнаубский воск, лигнитовый воск, воск урикури, воск рисовых отрубей, касторовый воск, строительный воск, стеарон, Асгавакс, воск восковницы, касторовый воск, воск плодов сумаха, озокерит, пчелиный воск, канделильский воск, жидкий парафин, церезиновый воск, масло какао, масло из ореха бассия, воск из эспарто, шеллачный воск, сложные эфиры или сложные триэфиры этиленгликоля и  $C_{18-36}$ -жирных кислот, цетилпальмитат, твердый жир, твердый парафин, ланолин, ланолиновый спирт, цетиловый спирт, глицерилмоностеарат, воск сахарного тростника, воск жожоба, стеариловый спирт, силиконовые воски и их комбинации.

В некоторых вариантах осуществления масляная фаза может включать один или несколько восков. Воск может придавать эмульсии консистенцию, так что эмульсия имеет физическую форму полутвердого или твердого вещества. Подразумевается, что используемый в данном документе термин "твердый" означает композицию, которая сохраняет форму и является подходящей для формования в сохраняющий форму карандаш (например, губную помаду). В некоторых вариантах осуществления воски присутствуют в количестве, достаточном для придания эмульсии формы твердой эмульсии. Например, твердая эмульсия может иметь твердость по меньшей мере 30 г. Композиция, как правило, имеет твердость по меньшей мере 40 г при комнатной температуре. В одном варианте осуществления композиция может иметь значительно большую твердость, от 100 до 300 г. Твердость эмульсии может быть измерена с помощью анализатора текстуры модели QTS-25, оснащенного 4-мм зондом из нержавеющей стали (ТА-24), как описано в патенте США № 8580283, выданном Avon, раскрытие которого включено в данный документ посредством ссылки.

Воски могут быть натуральными, минеральными и/или синтетическими. Природные воски включают воски животного происхождения (например, пчелиный воск, спермацет, ланолин и шеллачный воск) и воски растительного происхождения (например, карнаубский, канделильский воски, воск восковницы и воск сахарного тростника). Минеральные воски включают без ограничения озокерит, церезин, монтанный воск, парафин, микрокристаллический, нефтяной воски и жидкий парафин. Синтетические воски включают, например, полиэтиленгликоли, такие как PEG-18, PEG-20, PEG-32, PEG-75, PEG-90, PEG-100 и PEG-180, доступные на рынке под торговым названием CARBOWAX® (The Dow Chemical Company). Следует упомянуть воск на основе полиэтиленгликоля CARBOWAX 1000, который имеет молекулярную массу в диапазоне от 950 до 1050 и температуру плавления, равную 38°C, CARBOWAX 1450, который имеет молекулярную массу в диапазоне от 1305 до 1595 и температуру плавления, равную 56°C, CARBOWAX 3350, который имеет молекулярную массу в диапазоне от 3015 до 3685 и температуру плавления, равную 56°C, и CARBOWAX 8000 который имеет молекулярную массу в диапазоне от 7000 до 9000 и температуру плавления, равную 61°C.

Синтетические воски также включают воски, полученные по технологии синтеза Фишера-Тропша (FT), и полиолефиновые воски, такие как гомополимеры этилена, этилен-пропиленовые сополимеры и этилен-гексеновые сополимеры. Иллюстративные воски на основе гомополимера этилена доступны на рынке под торговым названием POLYWAX® Polyethylene (Baker Hughes Incorporated), характеризующиеся значениями температуры плавления в диапазоне от 80 до 132°C. Коммерчески доступные воски на основе этилен- $\alpha$ -олефинового сополимера включают воски, доступные на рынке под торговым названием PETROLITE® Copolymers (Baker Hughes Incorporated), характеризующиеся значениями температуры плавления в диапазоне от 95 до 115°C.

В одном варианте осуществления масляная фаза эмульсии включает по меньшей мере один воск, выбранный из Асгавакс (N,N'-этилен-бис-стеарамида), микрокристаллического воска, линейного воска на основе полиэтилена, стеарона (18-пентатриаконтанона), касторового воска, монтанного воска, лигнитового воска, воска урикури, карнаубского воска, воска рисовых отрубей, шеллачного воска, воска из эспарто, озокеритового воска, воска жожоба, канделильского воска, церезинового воска, пчелиного воска, касторового воска, воска сахарного тростника, стеарилового спирта, твердого жира, цетилового спирта, жидкого парафина, глицерилмоностеарата, воска плодов сумаха, силиконового воска, твердого парафина, ланолинового воска, ланолинового спирта, воска восковницы, цетилпальмитата, масла из ореха бассия, масла какао и сложных ди- или триэфиров этиленгликоля и  $C_{18-36}$ -жирных кислот.

Количество воска, если он присутствует, может составлять менее 2% (например, 0,1-2%) по весу композиции, если композиция представляет собой жидкость, или если требуется прозрачность. Количество воска, если он присутствует, обычно будет составлять более 10% (например, 10-20%) по весу композиции, если композиция является полутвердой или твердой, или если прозрачность не является целью.

В некоторых вариантах осуществления эмульсия может содержать воск в количестве от 1 до 25%, или 1-20%, или 1-5%, или 1-10 вес.% композиции, в частности в вариантах осуществления, составленных в виде губных помад.

Масляная фаза эмульсии может также включать одно или несколько из загустителей/гелеобразующих средств и/или объемообразующих средств, которые выполняют функцию средств, улучшающих структуру. Такие объемообразующие средства включают слюду, сульфат бария, нейлон, тальк, крахмал, карбонат кальция, диоксид кремния и их смеси. Объемообразующие средства могут присутствовать в количестве от 0,01 до 5 вес.% эмульсии (например, от 0,1 до 5 вес.% эмульсии, от 0,1 до 1 вес.% эмульсии и т.д.).

Другие загустители можно применять для загущения внутренней или внешней фазы эмульсий. Например, полисахаридные загустители можно применять для структурирования фазы эмульсии на основе полиола, как описано в публикации патента США № 2015/0164768, включенной в данный документ посредством ссылки во всей своей полноте и, в частности, в отношении полисахаридных структурообразующих средств и эмульгаторов. Тем не менее, поскольку было показано, что ксантановая камедь увеличивает вязкость при объемном расширении фазы на основе полиола (см. пример 2), в предпочтительных вариантах осуществления композиция не содержит ксантановой камеди или содержит ксантановую камедь в настолько малых количествах, что первая разница нормальных напряжений фазы на основе полиола составляет не более 20 Па. В некоторых вариантах осуществления композиция не содержит структурообразующего средства во внешней фазе. В некоторых вариантах осуществления внутренней фазе можно придавать структуру с помощью  $TiO_2$  квалификации "для ослабления излучения". Композиция может содержать от 0,1 до 20% (например, от 0,1 до 10% и т.д.)  $TiO_2$  квалификации "для ослабления излучения" по весу композиции.  $TiO_2$  квалификации "для ослабления излучения" можно подвергать поверхностной обработке, например, с помощью гидрофобных модификаторов, таких как лауроиллизин, изопропилтитана триизостеарат (ИТТ), сшитые сополимеры ИТТ и диметикона (ИТТ/диметикон), ИТТ и аминокислоты, сшитый сополимер ИТТ и триэтоксикаприлилсилана, воски (например, карнаубский), жирные кислоты (например, стеараты и т.д.), сшитый сополимер HDI и триметилолгексиллактона, PEG-8 метиловый простой эфир-триэтоксисилан, экстракт алоэ, сложный эфир жожоба, лецитин, фосфат перфторспирта и мирилат магния (ММ), и это лишь некоторые из них.

В одном варианте осуществления масляная фаза композиции включает 0,1-2%, или 2-5%, или 5-10%, или 10-15%, или 15-20 вес.% по меньшей мере одного воска (например, микрокристаллического воска, озокеритного воска, воска на основе полиэтилена, твердого парафина, жидкого парафина и т.д.). В одном варианте осуществления масляная фаза композиции включает микрокристаллический воск в пределах вышеуказанных количеств. В одном варианте осуществления масляная фаза композиции включает озокеритный воск в пределах вышеуказанных количеств. В одном варианте осуществления масляная фаза композиции включает воск на основе полиэтилена в пределах вышеуказанных количеств. В одном варианте осуществления масляная фаза композиции включает жидкий парафин в пределах вышеуказанных количеств. В одном варианте осуществления масляная фаза композиции включает твердый парафин в пределах вышеуказанных количеств.

Как правило, эмульсии по настоящему изобретению дополнительно содержат один или несколько эмульгаторов. Например, один или несколько эмульгаторов могут присутствовать в общем диапазоне от 0,01 до 20,0 вес.% эмульсии (например, от 0,1 до 15 вес.% эмульсии). В некоторых вариантах осуществления общее количество эмульгатора находится в диапазоне от 0,1 до 6,0 вес.% или от 0,5 до 4,0 вес.% эмульсий. Примеры эмульгаторов включают полиглицериды, такие как полиглицерил-6-полирицинолеат, полиглицерил-пентаолеат, полиглицерил-изостеарат и полиглицерил-2-диизостеарат; сложные эфиры глицерина, такие как глицеринмоностеарат или глицеринмоноолеат; фосфолипиды и сложные эфиры фосфорной кислоты, такие как лецитин и трилаурет-4-фосфат (доступный под торговым названием HOSTAPHAT®KL-340-D); сорбитансодержащие сложные эфиры (включая сложные эфиры SPAN®), такие как сорбитанлаурат, сорбитанолеат, сорбитанстеарат или сорбитансесквиолеат; полиоксиэтиленфенолы, такие как полиоксиэтиленоктилфенол; простые эфиры полиоксиэтилена, такие как простой цетиловый эфир полиоксиэтилена и простой стеариловый эфир полиоксиэтилена; эмульгаторы на основе полиэтиленгликоля, такие как PEG-30-полигидроксистеарат или алкилполиэтиленгликоли; эмульгаторы на основе полипропиленгликоля, такие как PPG-6-лаурет-3; диметиконполиолы и эмульгаторы на основе полисилоксана; и т.д. Предусмотрены комбинации эмульгаторов, такие как комбинация лецитина и сорбитана. Дополнительные эмульгаторы приведены в INCI Ingredient Dictionary and Handbook, 12th Edition (2008), раскрытие которого включено в данный документ посредством ссылки. В некоторых вариантах осуществления композиция для губ содержит один или несколько эмульгаторов и/или один или несколько восков. В предпочтительных вариантах осуществления композиция для губ содержит от 1 до 20% эмульгаторов и/или от 1 до 20% восков по весу композиции.

В некоторых вариантах осуществления в композициях может потребоваться повышенная стабильность, недоступная для стандартных систем эмульгирования. Также представлены способы повышения стабильности эмульсий типа полиол-в-масле, предусматривающие уменьшение вязкости при объемном



расширении глицериновой фазы указанной эмульсии. В качестве приближенного показателя вязкости при объемном расширении можно определять первую разницу нормальных напряжений внутренней фазы при напряжении сдвига 100 Па и температуре 25°C. Более высокая первая разница нормальных напряжений коррелирует с более высокой вязкостью при объемном расширении. Было обнаружено, что стабильность эмульсии типа полиол-в-масле можно увеличивать путем уменьшения вязкости при объемном расширении внутренней фазы. В некоторых вариантах осуществления фаза на основе полиола (например, глицерина) характеризуется первой разницей нормальных напряжений, составляющей менее 20 Па (например, менее 15 Па, менее 10 Па, менее 8 Па, менее 7 Па, менее 6 Па) при напряжении сдвига 100 Па и температуре 25°C.

Композиционные эластомерные порошки могут быть включены для повышения стабильности твердых эмульсий и для уменьшения синерезиса в течение периодов длительного хранения. Примеры эластомерных порошков включают силиконовые эластомеры, которые представляют собой сшитые гибкие силиконы, которые могут выдерживать большие обратимые деформации. В некоторых вариантах осуществления вязкость при объемном расширении снижают путем добавления силиконового эластомера в дисперсную фазу эмульсии. Силиконовый эластомер может представлять собой, например, сшитый эластомерный органополисилоксановый порошок, в том числе сшитый сополимер диметикона. Такие эластомеры могут быть образованы, например, посредством катализируемых металлической платиной реакций между содержащими SiH диорганополисилоксанами и органополисилоксанами, имеющими связанные с кремнием винильные группы. Подходящие силиконовые эластомеры включают сшитые сополимеры диметикона и винилдиметикона, сшитые сополимеры винилдиметикона и метикон-силсесквиоксана и сшитые сополимеры диметикона и фенилвинилдиметикона. Примеры включают Dow Coining 9040, 9041 и 9506, и Shin-Etsu KSG-15, 16 и 17, и Shin-Etsu KSP-100, 101, 102, 103, 104, 105, 200 и 300. Коммерчески доступные порошки включают порошок Dow Coining 9506 от компании Dow Corning (название по INCI: Сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона). В частности, органополисилоксановый эластомер, применяемый в настоящем изобретении, выбран из сшитого сополимера диметикона (название по INCI), сшитого сополимера диметикона и необязательно диметикона, сшитого сополимера винилдиметикона (название по INCI), сшитого сополимера диметикона и винилдиметикона (название по INCI), сшитого сополимера диметикона-3 (название по INCI) и, в частности, сшитого сополимера диметикона и сшитого полимера диметикона (и) диметикона.

Композиционные эластомерные порошки могут быть образованы путем нанесения покрытия из неорганического порошка по меньшей мере на порцию частиц эластомерного порошка. Как правило, неорганический порошок имеет средний размер частиц меньше среднего размера частиц эластомерного порошка без покрытия. Как правило, средний размер частиц неорганического порошка для нанесения покрытия составляет менее одной десятой среднего размера частиц эластомерного порошка без покрытия. Примеры подходящих неорганических порошков для создания композиционного эластомерного порошка включают порошки оксидов металла, таких как оксид кремния, оксид титана, оксид алюминия, оксид циркония, оксид сурьмы; порошки нитридов металла, таких как нитрид бора и нитрид алюминия; порошки гидроксидов металла, такие как гидроксид алюминия, гидроксид магния; карбонатные соли металла, такие как карбонат калия; металлы, такие как никель, кобальт, железо, медь, золото и серебро; порошки сульфидов и порошки хлоридов. Предпочтительные порошки для нанесения покрытия на эластомерные частицы включают мелкодисперсные порошки оксидов металла и, в частности, диоксида кремния. Подходящие композиционные эластомерные частицы включают порошок Dow Coining 9701 от компании Dow Corning (название по INCI: Сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона (и) диоксид кремния).

Обычно композиционные эластомерные частицы могут быть покрыты компонентом для придания гидрофильности и диспергируемости композиционным эластомерным частицам. Это особенно важно в эмульсии типа глицерин-в-масле, где композиционные частицы могут быть диспергированы по всей фазе глицерин-в-масле. В некоторых вариантах осуществления композиционная эластомерная частица содержит одноатомный спирт, такой как метанол, этанол, изодециловый спирт, изотридециловый спирт и/или многоатомные спирты, в том числе гликоли, такие как 1,3-бутандиол, 1,2-пентандиол, этиленгликоль, дипропиленгликоль и т.д. В некоторых вариантах осуществления композиционная эластомерная частица покрыта бутиленгликолем. Такие композиционные эластомерные частицы описаны в патенте США № 9394412, который включен в данный документ посредством ссылки во всей своей полноте, и, в частности, в отношении композиционных отвержденных силиконовых порошков. В предпочтительных вариантах осуществления композиционные эластомерные частицы включают продукт, доступный на рынке от компании Dow Coining под названием EP-9801 Hydrocosmetic Powder (название по INCI: Сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона (и) диоксид кремния (и) бутиленгликоль).

В некоторых вариантах осуществления композиция может представлять собой эмульсию типа полиол-в-масле (например, глицерин-в-масле) и содержать от 1 до 45% полиола (например, от 1 до 20%, от 5 до 15%) по весу композиции, и от 0,1 до 5% активного ингредиента (например,  $\alpha$ -гидроксикислоты, такой как молочная кислота), и от 25 до 95% (например, от 40 до 60%) масла (например, ланолина, стеарилдиметикона, миристиллактата, дифенилдиметикона и их комбинаций) по весу композиции. В некото-

рых вариантах осуществления композиция дополнительно содержит основную соль (например, гидроксид натрия) в количестве от 0,1 до 5 вес.% композиции.

Как это принято в области косметики, для различных функциональных целей можно включать дополнительные компоненты в композицию, в частности во внутреннюю фазу эмульсий, во внешнюю фазу эмульсий или в виде дисперсной фазы. Тем не менее несмотря на то что могут быть включены дополнительные компоненты, подходящие для составления вышеуказанных косметических композиций, включение дополнительных ингредиентов ограничивается количествами таких ингредиентов, которые не влияют на образование или стабильность композиций (например, эмульсий и т.д.).

Такие компоненты могут быть выбраны из группы, состоящей из пленкообразователей, пигментов, восков, смягчающих веществ, увлажнителей, консервантов, ароматизаторов, антиоксидантов, растительных веществ и их смесей. Отдельно следует упомянуть высокоочищенные экстракты растений или синтетические средства, которые могут иметь ранозаживляющие, противовоспалительные или другие полезные эффекты для лечения кожи или губ. Дополнительные варианты осуществления могут включать антиоксиданты, такие как токоферол и/или  $\alpha$ -гидроксикислоты, такие как гликолевая кислота, молочная кислота и т.д. Композиции могут включать один или несколько пленкообразователей для повышения срока годности продукта.

Также можно применять пленкообразователи, в том числе пленкообразующие полимеры. Термин "пленкообразующий полимер" можно понимать как термин, обозначающий полимер, который способен, сам по себе или в присутствии по меньшей мере одного вспомогательного пленкообразующего средства, образовывать непрерывную пленку, которая сцепляется с поверхностью и выполняет функцию связующего для материала в виде частиц. Полимерные пленкообразующие средства включают без ограничения акриловые полимеры или сополимеры, (мет)акрилаты, алкил(мет)акрилаты, полиолефины, поливинилы, полиакрилаты, полиуретаны, силиконы, полиамиды, простые полиэфиры, сложные полиэфиры, фторполимеры, полиацетаты, поликарбонаты, полиамиды, полиимиды, каучуки, эпоксидные смолы, формальдегидные смолы, органосилоксаны, диметиконы, амодиметиконы, диметиконолы, метиконы, силиконакрилаты, сополимеры полиуретана и силиконов, целлюлозные полимеры, полисахариды, поликватерниумы и т.д. Подходящие пленкообразующие средства включают средства, перечисленные в *Cosmetic Ingredient Dictionary (INCI and Handbook, 12th Edition (2008))*, раскрытие которого включено в данный документ посредством ссылки.

Композиция может содержать один или несколько консервантов или противомикробных средств, таких как метил-, этил- или пропилпарабен и т.д., в количествах, находящихся в диапазоне от 0,0001 до 5 вес.% всей композиции. Композиции могут содержать другие ингредиенты, такие как один или несколько анестетиков, противоаллергенных, противогрибковых, противовоспалительных, противомикробных, антисептических, хелатообразующих средств, смягчающих веществ, эмульгаторов, отдушек, увлажнителей, смазывающих веществ, маскирующих средств, лекарственных средств, увлажнителей, регуляторов pH, консервантов, защитных средств, успокаивающих средств, стабилизаторов, солнцезащитных средств, поверхностно-активных веществ, загустителей, средств для повышения вязкости, витаминов или любых их комбинаций.

В одном варианте осуществления эмульсии по настоящему изобретению представлены в качестве продуктов для нанесения на губы. Такие продукты для губ могут включать крем для губ, бальзам для губ, блеск для губ, лечебное средство для губ, увлажняющее средство для губ, косметическое средство для губ, солнцезащитное средство для губ и ароматизатор для губ. В одном варианте осуществления продукт для губ представляет собой кремовый текучий продукт для губ. В определенных вариантах осуществления продукты по настоящему изобретению могут иметь консистенцию полувязкой жидкости или пасты. В других вариантах осуществления продукт представляет собой помаду.

Нанесение данных композиций на ороговевшие поверхности обеспечивает терапевтические и/или косметические эффекты. Также предусмотрены способы обеспечения терапевтических и/или косметических эффектов для губ, обнаруживаемых только при комбинировании полиолов и отшелушивающих активных веществ, описанных в данном документе. В некоторых вариантах осуществления терапевтический и/или косметический эффект выбран из уменьшения потери воды из указанных губ, более гладкой поверхности губ (по сравнению с необработанными губами), повышенной увлажненности указанных губ (по сравнению с необработанными губами), повышенной барьерной функции указанных губ (по сравнению с необработанными губами), утолщенного рогового слоя указанных губ (по сравнению с необработанными губами) и их комбинации.

Количество композиции для местного применения, которую наносят каждый раз, область, на которую ее наносят, продолжительность нанесения и частота нанесения могут сильно варьироваться в зависимости от конкретных потребностей пользователя. Например, композицию для местного применения можно наносить в течение периода времени, составляющего по меньшей мере один месяц, и с частотой, находящейся в диапазоне от одного раза в неделю до двух раз в неделю, или два раза в неделю, или через день, или один раз в день, или два раза в день (например, один раз утром и один раз вечером и т.д.), или три раза в день, или четыре раза в день, или пять раз в день. В некоторых вариантах осуществления одну форму композиции (например, помаду по настоящему изобретению) можно наносить один или несколь-

ко раз (например, один, два, три, четыре, пять и т.д.) в течение всего периода, и другую форму композиции (например, бальзам по настоящему изобретению) можно наносить и оставлять в течение ночи во время сна пользователя.

В большинстве вариантов осуществления композиции упаковывают по отдельности в индивидуальном контейнере. В одном варианте осуществления каждая из одной или нескольких композиций содержится в отдельном контейнере, и несколько контейнеров для одного состава (например, банки и дозаторы) доступны на рынке и/или упакованы вместе (например, помада и бальзам). В другом варианте осуществления несколько композиций (например, помада, бальзам, крем и т.д.) объединены в различных емкостях в одной упаковке. В некоторых вариантах осуществления данные различные емкости являются не отделяемыми друг от друга.

### Примеры

В следующих примерах проиллюстрированы конкретные аспекты данного описания. Примеры не следует рассматривать как ограничивающие, поскольку пример только обеспечивает конкретное понимание и практическое применение вариантов осуществления и их различных аспектов.

Пример 1. Измерение содержания влаги и потери воды на губах через эпидермис.

Проводили восьминедельное клиническое исследование различных составов, наносимых на губы. Женщины с шероховатыми губами в возрасте 40-65 лет и с типом кожи I-III по шкале Фитцпатрика наносили конкретную композицию помады по меньшей мере 3 раза в день. Несколько групп получали инструкции также наносить бальзам вечером. Особенности составов представлены в табл. 1. Как можно видеть, состав 1 представляет собой эмульсию типа глицерин-в-масле, содержащую  $\alpha$ -гидроксикислоты, а состав 2 представляет собой гелеобразную композицию, характеризующуюся более низким содержанием глицерина и отсутствием  $\alpha$ -гидроксикислоты. Кроме того, другая группа участников получила инструкции наносить доступную на рынке помаду Intense от oBoticário. Данная помада Intense увлажняет губы путем предотвращения испарения воды с применением комбинации витамина E и масла купуасу. Каждая группа включала от 9 до 11 участников.

Таблица 1

Компонент	Состав 1 (вес. %)	Состав 2 (вес. %)	Бальзам (вес. %)
Масло (например, ланолин, стеарилдиметикон, миристиллактат, дифенилдиметикон, сквален, диизостеарилфумарат, полибутен или их комбинации)	50,11	55,67	52,45
Глицерин	10,00	1,50	10,00
$\alpha$ -гидроксикислота (молочная кислота)	2,00	-	2,00

Основание (30% гидроксид аммония)	0,35	-	0,35
Эмульгатор (например, сополиол лаурилметикона, полиглицерил-3-дизостеарат и их комбинации)	8,75	-	8,75
Сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона, диоксид кремния и бутиленгликоль (EP-9801)	3,00	-	3,00
Другие порошки (например, полиэтилен 12 микрон, сополимер акрилата E603, сшитый полимер лаурилметакрилат/гликольдиметакрилат, коллоидный диоксид кремния, слюда или их комбинации)	2,63	2,83	2,63
Консервант	0,50	0,50	0,50
Деминерализованная вода	1,00	-	1,00
активные ингредиенты (например, солнцезащитное средство, подсластитель, антиоксидант, защитное средство для кожи, кондиционирующее средство для кожи, белок и их комбинации)	7,91	13,70	7,91
Гелеобразователь	-	2,90	-
Объемообразующее средство (например, сульфат бария)	-	0,40	2,66
Воск	8,75	13,40	8,75
Красители (например, пигменты, лаки, красящие вещества или их комбинации)	5,00	9,10	-

В течение одной (1) недели, двух (2) недель, четырех (4) недель и восьми (8) недель гидратационную и барьерную функцию губ (без продукта) оценивали путем измерения электрической емкости кожи и трансэпидермальной потери воды ("TEWL"). Здоровье губ также оценивали путем оптического измерения блеска губ. На изображениях видно, что падающий свет на нездоровые губы с повышенным количеством чешуек кожи и неоднородной поверхностью имеет склонность создавать подчеркнутые линии с тенями.

На здоровых губах отсутствие данных особенностей подавляет наличие таких теней. Схема механизма, вызывающего данное различие между здоровыми и нездоровыми губами, представлена на фиг. 1. Кроме того, измерения периода регрессии выполняли после восьминедельного исследования. Через 24 и 72 ч после завершения фазы применения исследования снова измеряли емкость кожи и TEWL участников. В периоды регрессии участники не применяли какие-либо продукты для губ.

Корнеометр (Courage & Khazaka) определяет содержание влаги в губах путем измерения электрической емкости на поверхности губ. Путем измерения электрической емкости на поверхности губ можно измерить содержание воды в губах на основании различий в диэлектрической проницаемости воды и других веществ. Более высокие показания корнеометра указывают на более высокое содержание влаги в губах. Измерения проводили на губах без продукта на них. На фиг. 2A показаны результаты измерений корнеометра для каждой тестируемой популяции в различные моменты времени.

Измерения TEWL, проведенные с помощью эвапориметра с вентилируемой камерой (cyberDERM), отражали потерю воды из эпидермиса губ в каждый момент времени. Измерения проводили на губах без продукта на них. Нарушенный барьер приводит к более высокой потере воды, в то время как более низкие значения TEWL указывают на предотвращение потери воды. На фиг. 2B показаны результаты измерений TEWL для каждой испытанной популяции в различные моменты времени на перевернутой оси y.

На количество воды, теряемой губами, влияет не только барьер, но и количество влаги в губах. Полное представление изменения барьерной функции для губ каждой выборки рассчитывали путем вычитания процентного изменения TEWL каждого субъекта из процентного изменения электрической емкости кожи. На фиг. 2C показано изменение барьерной функции для каждой выборки. На фиг. 2A-2C "\*"

означает статистически значимые результаты в отношении измерения на губах в начале исследования со значимостью  $p \leq 0,05$  (двустороннее распределение), а "x" означает такие результаты, которые приближаются к значимости, соответствующей  $p \leq 0,10$  (двустороннее распределение).

Оптические измерения показали, что в популяциях, получавших глицерин и  $\alpha$ -гидроксикислоты, губы были более здоровыми и гладкими. Более того, как видно на фиг. 2A-2C, обработка составами, содержащими глицерин и  $\alpha$ -гидроксикислоты, позволила значительно увеличить увлажнение губ и статистически значимое снижение потери воды на необработанной коже. Фактически, только те субъекты, которые применяли лечение, включающее ежедневные многократные обработки глицерином и  $\alpha$ -гидроксикислотой, имели значительно меньшую потерю воды после трех дней регрессии. Более того, данные результаты не наблюдаются в коммерчески доступной увлажняющей помаде Intensive, которая действует путем предотвращения испарения с применением комбинации витамина E и масла купуасу. Комбинация  $\alpha$ -гидроксикислоты и глицерина уникальным образом обеспечивает более гладкую поверхность губ, обеспечивает увлажненность губ и уменьшает потерю воды на губах.

Пример 2. Измерения первой разницы нормальных напряжений фаз на основе глицерина с  $\alpha$ -гидроксикислотами.

Перед эмульгированием измеряли первую разницу нормальных напряжений нескольких фаз на основе глицерина ("фаза"). Компоненты данных фаз на основе глицерина показаны в табл. 2.

Таблица 2

	Фаза A (г)	Фаза B (г)	Фаза C (г)	Фаза D (г)	Фаза E (г)
Глицерин	93,60	93,60	93,60	93,60	93,60
Молочная кислота	-	2,00	2,00	2,00	2,00
Деминерализованная вода	-	-	-	1,00	1,00
Гидроксид аммония, 30%	-	-	0,40	0,40	0,40
Сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона/диоксид кремния/изоцетет-10/BG/антиокс.	-	-	-	-	3,00
Ксантановая камедь	1,00	-	-	-	-
Общий вес	94,60	95,60	96,00	97,00	100,00

Для выполнения измерений вязкости для каждой из фаз A-E и фазы с 100% глицерина использовали реометр AR-G2 от TA Instruments с использованием конуса, равного  $2^\circ$ , и геометрии пластины, и зазора, равного 52 мкм. Измерения проводили при напряжении сдвига 100 Па и  $25^\circ\text{C}$  ( $77^\circ\text{F}$ ). Для понимания характера изменения вязкости при объемном расширении между фазами в табл. 2 можно рассчитывать первую разницу нормальных напряжений с помощью формулы

$$N_1 = 2 \times J_e \times \eta^2 \times \dot{\gamma}^2,$$

где  $J_e$  представляет собой восстанавливаемую пластичность,  $\eta$  представляет собой вязкость и  $\dot{\gamma}$  представляет собой напряжение сдвига, измеренное реометром. Значения первой разницы нормальных напряжений для каждой испытываемой глицериновой фазы и 100% глицериновой фазы показаны в табл. 3.

Таблица 3

	Глицерин (100%)	Фаза A	Фаза B	Фаза C	Фаза D	Фаза E
Первая разница нормальных напряжений ( $N_1 = 2 \times J_e \times \eta^2 \times \dot{\gamma}^2$ , Па)	0	1315,9	164,0	0	29,6	5,7

Большее значение первой разницы нормальных напряжений указывает на более высокую вязкость при объемном расширении. Как может быть видно, 100% глицерин не имеет вязкости при объемном расширении. Тем не менее добавление различных компонентов к глицериновой фазе, таких как ксантановая камедь, молочная кислота, гидроксид аммония и вода, приводит к увеличению вязкости при объемном расширении глицериновой системы. Введение различных силиконовых эластомеров, таких как сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона/диоксид кремния/бутиленгликоль (EP-9801, доступный от Dow Corning), может снизить вязкость при объемном расширении внутренней фазы.

Пример 3. Измерения стабильности эмульсий типа глицерин-в-масле.

Эмульсии типа глицерин-в-масле получали для иллюстрации стабильности эмульсий, полученных с различными  $\alpha$ -гидроксикислотами и композиционными эластомерными полимерами. В табл. 4 показаны

компоненты составов 3-7, испытанных при измерениях стабильности.

Таблица 4

	Состав 3 (вес. %)	Состав 4 (вес. %)	Состав 5 (вес. %)	Состав 6 (вес. %)	Состав 7 (вес. %)
Молочная кислота	2,00	2,00	2,00	2,00	2,00
Основание	0,35	0,40	0,40	0,35	0,35
Кондиционирующее средство	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00
Масло	51,32	54,92	52,57	53,32	48,62
Эмульгатор	0,00	0,00	0,00	0,00	0,00
Глицерин	10,00	10,00	10,00	10,00	10,00
Вода	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00
Гранулы целлюлозы	5,00	0,00	0,00	0,00	0,00
Композиционные эластомерные частицы (EP- 9801)	0,00	1,00	2,00	3,00	5,00
Воск	4,13	8,83	8,83	7,13	11,83
Дополнительные ингредиенты†	15,83	19,03	18,03	15,83	18,53

† Дополнительные ингредиенты могут включать ароматическое масло, пигменты, другие порошки, консерванты, солнцезащитное средство, подсластитель и их комбинации.

Как можно видеть, составы 3-7 получали без эмульгаторов, что позволило продемонстрировать эффект стабильности, обеспечиваемый композиционной эластомерной частицей. Кондиционирующее средство, применяемое в данных составах, гибридный полимер, содержащий протеин шелка, силикон и алкильную группу (Protosil LH, доступный от SEPPIC) может обеспечивать некоторую стабильность эмульсии. Тем не менее, состав 3, состав без каких-либо композиционных эластомерных частиц, был нестабильным в виде эмульсии и не мог подвергаться дальнейшим экспериментам, поскольку кондиционирующее средство было недостаточно для стабилизации эмульсии. Обеспечивали затвердевание составов 4-7 в форме карандаша для дальнейшего испытания стабильности.

Карандаши помещали в несколько сред (77, 40°F, чередование 40°F (12 ч) и 110°F (12 ч), 120°F и 120°F при влажности 90%) на четыре недели. По прошествии четырех недель в каждой среде отмечали наблюдаемые изменения в карандаше и оценивали от нуля (0) до пяти (5) в зависимости от видимых изменений в карандаше (например, синерезис). Ноль означает отсутствие наблюдаемых изменений, а пять означает наблюдаемое критическое изменение, указывающее на нестабильность состава. В табл. 5 кратко изложены наблюдаемые изменения в каждом из карандашей через четыре недели в каждой среде.

Таблица 5

	Состав 4	Состав 5	Состав 6	Состав 7
% композиционных эластомерных частиц	1,00	2,00	3,00	5,00
77°F	0	0	0	0
40°F	0	0	0	0
40°F/110°F	2	2	1	1
120°F	5	2	0	0
120°F (влажность 90%)	5	5	3	1
Циклы замораживания/оттаивания	0	0	0	0

Как можно видеть, увеличение количества композиционных эластомерных частиц в композициях увеличивает стабильность эмульсий типа глицерин-в-масле. Эмульсии находились в диапазоне от полной нестабильности (состав 3) до минимального синерезиса, наблюдаемого даже в тяжелых условиях (составы 6 и 7). Например, эмульсия типа глицерин-в-масле с 5% порошка эластомера представляла собой наиболее стабильный состав при температуре окружающей среды 120°F (90% влажности).

Аналогичные измерения стабильности выполняли для композиций с другими  $\alpha$ -гидроксикис-

лотами, составленными в ней. Эмульсии типа глицерин-в-масле получали с эмульгаторами (полиглицерил-3-диизостеаратом и лаурилметиконом) и либо 2% молочной кислоты по весу, 2,43% гликолевой кислоты по весу, либо 1,89 вес.% триоксаундекандиовой кислоты. В окружающей среде при 120°F (влажность 90%) показатель стабильности состава с молочной кислотой был равен 1 через четыре недели, состав с гликолевой кислотой имел показатель стабильности 3 с некоторым обесцвечиванием карандаша, и состав с триоксаундекандиовой кислотой не был способен сохранять форму твердого карандаша. Как видно, конкретная  $\alpha$ -гидроксикислота, применяемая в данной эмульсии, влияет на стабильность эмульсии типа глицерин-в-масле. Тем не менее стабильные эмульсии типа глицерин-в-масле с различными  $\alpha$ -гидроксикислотами, отличными от молочной кислоты, могут быть получены посредством известных способов, включая применение различных систем эмульгирования, изменение вязкости внутренней фазы и т.д. Кроме того, включение различных количеств композиционных эластомерных частиц в данных составах также может повышать стабильность эмульсий.

#### **Конкретные варианты осуществления**

Конкретные варианты осуществления по настоящему изобретению пронумерованы ниже.

Конкретный вариант осуществления 1. Композиция для губ в форме эмульсии типа глицерин-в-масле, содержащая одну или несколько  $\alpha$ -гидроксикислот.

Конкретный вариант осуществления 2. Композиция в соответствии с конкретным вариантом осуществления 1, где указанная композиция содержит одну  $\alpha$ -гидроксикислоту.

Конкретный вариант осуществления 3. Композиция в соответствии с конкретным вариантом осуществления 1 или 2, где фаза на основе глицерина указанной эмульсии характеризуется кажущимся рН в пределах 0,5 единиц рН относительно рK<sub>a</sub> указанной  $\alpha$ -гидроксикислоты.

Конкретный вариант осуществления 4. Композиция в соответствии с любым из конкретных вариантов осуществления 1-3, где указанная композиция способна находиться в виде твердого карандаша в течение по меньшей мере четырех недель после затвердевания при 120°F и влажности 90%.

Конкретный вариант осуществления 5. Композиция в соответствии с любым из конкретных вариантов осуществления 1-4, где указанная  $\alpha$ -гидроксикислота представляет собой молочную кислоту.

Конкретный вариант осуществления 6. Композиция в соответствии с любым из конкретных вариантов осуществления 1-5, дополнительно содержащая композиционный эластомерный порошок.

Конкретный вариант осуществления 7. Композиция в соответствии с конкретным вариантом осуществления 6, где указанный эластомерный порошок представляет собой силиконовый эластомерный порошок.

Конкретный вариант осуществления 8. Композиция в соответствии с конкретным вариантом осуществления 6, где указанный эластомерный порошок предусматривает сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона.

Конкретный вариант осуществления 9. Композиция в соответствии с любым из конкретных вариантов осуществления 6-8, где указанный композиционный эластомерный порошок покрыт по поверхности неорганическими частицами и/или одним или несколькими спиртами (например, одноатомными спиртами, многоатомными спиртами, гликолями и т.д.).

Конкретный вариант осуществления 10. Композиция в соответствии с конкретным вариантом осуществления 6, где указанный композиционный эластомерный порошок представлен сшитым сополимером диметикона и винилдиметикона (и) диоксидом кремния (и) бутиленгликолем.

Конкретный вариант осуществления 11. Композиция для губ в соответствии с любым из конкретных вариантов осуществления 6-10, где указанный композиционный эластомерный порошок присутствует в количестве, составляющем 0,1-10 вес.% композиции.

Конкретный вариант осуществления 12. Композиция для губ в соответствии с любым из конкретных вариантов осуществления 6-10, где указанный композиционный эластомерный порошок присутствует в количестве, составляющем от 1% до 5 вес.% композиции.

Конкретный вариант осуществления 13. Композиция для губ в соответствии с любым из конкретных вариантов осуществления 1-12, где указанная композиция содержит:

- (a) от 1 до 45% глицерина по весу композиции;
- (b) от 40 до 95% масла по весу композиции;
- (c) от 1 до 10%  $\alpha$ -гидроксикислоты по весу композиции; и
- (d) от 1 до 10% эластомерного порошка по весу композиции.

Конкретный вариант осуществления 14. Способ обеспечения терапевтического и/или косметического эффекта в отношении губ, которые в этом нуждаются, предусматривающий нанесение композиции для губ в соответствии с любым из конкретных вариантов осуществления 1-13.

Конкретный вариант осуществления 15. Способ в соответствии с конкретным вариантом осуществления 14, где указанный терапевтический и/или косметический эффект выбран из уменьшения потери воды из указанных губ, более гладкой поверхности губ (по сравнению с необработанными губами), повышенной увлажненности указанных губ (по сравнению с необработанными губами), повышенной барьерной функции указанных губ (по сравнению с необработанными губами), утолщенного рогового слоя

указанных губ (по сравнению с необработанными губами) и их комбинаций.

Конкретный вариант осуществления 16. Способ в соответствии с конкретным вариантом осуществления 14 или 15, где указанную композицию наносят один или несколько раз в сутки.

Поскольку в отношении вышеописанного объекта изобретения могут быть выполнены различные изменения без отступления от объема и сущности настоящего изобретения, предполагается, что все объекты изобретения, содержащиеся в вышеприведенном описании или определенные в прилагаемой формуле изобретения, необходимо интерпретировать как описательные и иллюстративные для настоящего изобретения. С учетом вышеприведенных положений настоящее изобретение может иметь множество модификаций и вариантов. Соответственно, настоящее описание предназначено для охвата всех таких изменений, модификаций и отклонений, которые входят в объем прилагаемой формулы изобретения.

#### ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Композиция для губ в форме эмульсии типа глицерин-в-масле, содержащая одну или несколько  $\alpha$ -гидроксикислот и композиционный эластомерный порошок.

2. Композиция по п.1, где указанная композиция содержит одну  $\alpha$ -гидроксикислоту.

3. Композиция по любому из пп.1 или 2, где указанная композиция способна находиться в виде твердого карандаша в течение по меньшей мере четырех недель после затвердевания при 49°C (120°F) и влажности 90%.

4. Композиция по любому из пп.1-3, где указанная  $\alpha$ -гидроксикислота представляет собой молочную кислоту.

5. Композиция по п.4, где фаза на основе глицерина указанной эмульсии характеризуется кажущимся рН от 3,3 до 4,3.

6. Композиция по п.1, где указанный эластомерный порошок представляет собой силиконовый эластомерный порошок.

7. Композиция по п.1, где указанный эластомерный порошок предусматривает сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона.

8. Композиция по любому из пп.1-7, где указанный композиционный эластомерный порошок покрыт по поверхности неорганическими частицами и/или одним или несколькими спиртами, например одноатомными спиртами, многоатомными спиртами, гликолями и т.д.

9. Композиция по п.1, где указанный композиционный эластомерный порошок содержит сшитый сополимер диметикона и винилдиметикона и диоксид кремния и бутиленгликоль.

10. Композиция для губ по любому из пп.1-9, где указанный композиционный эластомерный порошок присутствует в количестве, составляющем 0,1-10 вес.% композиции.

11. Композиция для губ по любому из пп.1-9, где указанный композиционный эластомерный порошок присутствует в количестве, составляющем от 1 до 5 вес.% композиции.

12. Композиция для губ по любому из пп.1-11, где указанная композиция содержит:

(a) от 1 до 45% глицерина по весу композиции;

(b) от 40 до 95% масла по весу композиции;

(c) от 1 до 10%  $\alpha$ -гидроксикислоты по весу композиции; и

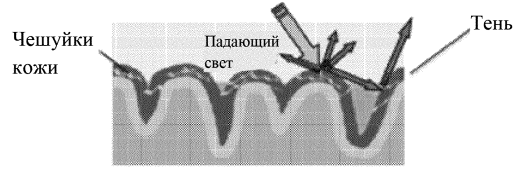
(d) от 1 до 10% эластомерного порошка по весу композиции.

13. Способ обеспечения косметического эффекта в отношении губ, которые в этом нуждаются, предусматривающий нанесение композиции для губ по любому из пп.1-12.

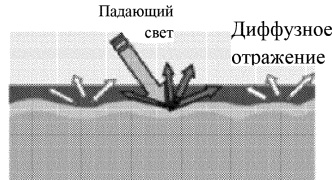
14. Способ по п.13, где указанный косметический эффект выбран из уменьшения потери воды из указанных губ, более гладкой поверхности губ по сравнению с необработанными губами, повышенной увлажненности указанных губ по сравнению с необработанными губами, повышенной барьерной функции указанных губ по сравнению с необработанными губами, утолщенного рогового слоя указанных губ по сравнению с необработанными губами и их комбинаций.

15. Способ по п.13 или 14, где указанную композицию наносят один или несколько раз в сутки.



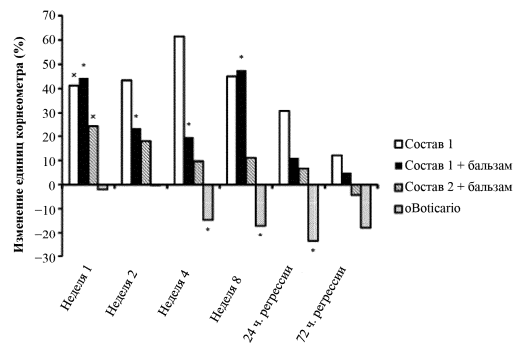


Поверхность нездоровых губ подчеркивает линии губ посредством теней

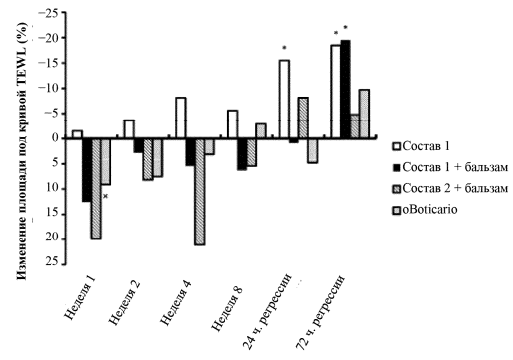


Поверхность здоровых губ с уменьшенными линиями губ и меньшими тенями

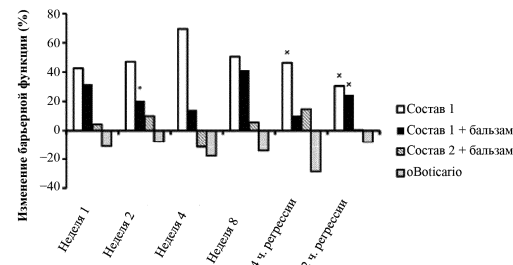
Фиг. 1



Фиг. 2А



Фиг. 2В



Фиг. 2С



Евразийская патентная организация, ЕАПВ

Россия, 109012, Москва, Малый Черкасский пер., 2