

PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(21) Číslo dokumentu:

2003 - 87

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **09.07.2001**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **10.07.2000**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **2000/613266**

(33) Země priority: **US**

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **14.05.2003**
(Věstník č. 5/2003)

(86) PCT číslo: **PCT/US01/21601**

(87) PCT číslo zveřejnění: **WO02/003952**

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl. ⁷:

A 61 K 7/48

(71) Přihlašovatel:

**THE PROCTER & GAMBLE COMPANY, Cincinnati,
OH, US;**

(72) Původce:

**Robinson Larry Richard, Loveland, OH, US;
Ha Robert Bao Kim, Milford, OH, US;
Sunkel Jorge Max, Cincinnati, OH, US;
Vatter Michal Lee, Okeana, OH, US;**

(74) Zástupce:

**PATENTSERVIS PRAHA a.s., Jivenská 1, Praha 4,
14000;**

(54) Název přihlášky vynálezu:

**Prostředek pro ošetření kůže obsahující
silikonové elastomery**

(57) Anotace:

Prostředky k péči o pokožku se zlepšenými estetickými vlastnostmi, které obsahují účinnou látku rozpustnou v lepkavém rozpouštědle a dermatologicky přijatelný nosný systém obsahující lepkavé rozpouštědlo v kombinaci se silikonovým elastomerem a nosičem elastomeru. Prostředky se používají k regulaci stavu pokožky savců při zachování dobrých estetických vlastností.

CZ 2003 - 87 A3

Prostředky k péči o pokožku obsahující silikonové elastomery

Oblast techniky

Předkládaný vynález se týká prostředků k zevnímu použití na pokožku obsahujících silikonové elastomery a způsobů jejich použití. Prostředky jsou vhodné k dodání účinných o pokožku pečujících látek pro spotřebitele esteticky přijatelnou formou.

Dosavadní stav techniky

Mnoho produktů osobní péče dnes dostupných spotřebiteli je primárně určeno ke zlepšení zdraví a/nebo fyzického vzhledu pokožky a/nebo vlasů. Řada produktů k péči o pokožku je určena ke zpomalení tvorby, minimalizaci nebo dokonce odstranění vrásek a dalších histologických změn spojených se stárnutím pokožky nebo s poškozením lidské pokožky vlivem prostředí. V oboru bylo popsáno množství sloučenin vhodných k regulaci stavu pokožky včetně regulace jemných rýh a dalších forem nestejnomyerné nebo hrubé struktury povrchu spojené se stárnutím nebo světelným poškozením pokožky.

Pokožka je poškozována mnoha vnějšími a vnitřními faktory. Vnější faktory zahrnují ultrafialové záření (např. při vystavení slunci), znečištěné prostředí, vítr, horko, nízká vlhkost, agresivní detergenty, abraziva, apod. Vnitřní faktory zahrnují chronologické stárnutí a další biochemické změny kůže. Ať vnější nebo vnitřní, vedou tyto faktory k viditelným známkám stárnutí pokožky a poškození prostředím, jako jsou vrásky a další formy drsnosti (včetně zvětšených pórů, skvrn a rýh) a další histologické změny spojené se stárnutím a poškozením pokožky. Pro mnoho lidí jsou vrásky známkou mizejícího mládí. V důsledku toho se odstranění vrásek stalo ve společnosti preferující mládí vzkvétajícím obchodem. Postupy sahají od kosmetických krémů a zvlhčujících prostředků k různým formám kosmetické chirurgie.

Vnější a vnitřní faktory vedou ke ztenčování a obecnému znehodnocování pokožky. Např. jak pokožka přirozeně stárne, snižuje se počet buněk a cévek, které zásobují pokožku. Také dochází ke zplošťování spojení pokožky a škály, které vede k menší mechanické odolnosti tohoto spojení. Viz. např. Oikarinen, „The Aging of Skin: Chronoaging Versus Photoaging“, Photodermatol. Photoimmunol. Photomed., vol. 7, pp.3-4, 1990, který je zde začleněn odkazem.

Jedním příkladem kosmetické účinné látky používané ke zmírnění známek stárnutí pokožky je niacinamid. Niacinamid je fyziologicky aktivní forma niacinu. Niacin, známý také jako vitamin B₃, je běžný název pro kyselinu nikotinovou. Niacin a niacinamid (amid kyseliny

nikotinové, nikotinamid) působí v těle jako součásti dvou koenzymů: nikotinamid adenin dinukleotidu (NAD) a nikotinamid adenin dinukleotid fosfátu (NADP). Donedávna byly tyto sloučeniny vitamínu B₃ používány výhradně k léčbě nedostatku niacinu a pelagry.

V současnosti se ale sloučeniny vitamínu B₃ také používají k lokální aplikaci jako účinné látky péče o pokožku. Britský patent 1 370 236 a U.S. Patent 4 096 240 popisují aplikaci niacinamidu na pokožku k podpoře jejího projasnění. Podobně je niacinamid popisován pro své další početné výhody včetně regulace mastné pokožky a regulace celulitidy.

Mnohé účinné látky k péči o pokožku, jako je niacinamid, mají bohužel malou rozpustnost v běžných nosných systémech. Např. prostředky k péči o pokožku obsahující vysoké koncentrace sloučenin vitamínu B₃ zanechávají po aplikaci na pokožku viditelný bílý zbytek. Tento zbytek je výsledkem „vysolení“ sloučenin vitamínu B₃.

Podle již zmíněných skutečností zůstává potřeba připravit prostředky k péči o pokožku se zlepšenou dopravou účinných látek při zachování dobrého pocitu a estetiky.

Bylo zjištěno, že při použití vylepšených nosných systémů si prostředky obsahující účinné látky vyžadující k zajištění rozpustnosti lepkavé rozpouštědlo (zvláště při aplikaci na pokožku) udrží dobré estetické vlastnosti.

Žádná existující technika neposkytuje všechny výhody předkládaného vynálezu.

Podstata vynálezu

Předkládaný vynález se týká prostředků k lokální aplikaci majících zlepšené estetické vlastnosti, které obsahují 0,0001 až 40 % hmotnostních účinné látky k péči o pokožku, vztaženo na hmotnost prostředku. Účinná látka je rozpustná v lepkavém rozpouštědle a v dermatologicky přijatelném nosném systému, kde tento systém obsahuje 1 až 60 % hmotnostních lepkavého rozpouštědla, vztaženo na hmotnost prostředku, 0,1 % až 30 % silikonového elastomeru a 1 % až 80 % nosiče pro elastomer. Směs lepkavého rozpouštědla a účinné látky má hodnotu smyslového dotekového vnímání větší než 4,5 a výsledný prostředek má tuto hodnotu menší než 4,5.

Předkládaný vynález se také týká způsobu použití takových prostředků k regulaci stavu pokožky savců. Způsob obecně obsahuje krok místní aplikace bezpečného a účinného množství prostředku na pokožku savce potřebujícího takové ošetření.

Tyto i další rysy, aspekty a výhody předkládaného vynálezu budou zřejmé odborníkům po přečtení předkládaného popisu.

DETAILNÍ POPIS

Ačkoliv je přihláška zakončena nároky, které odděleně a jasně nárokují předkládaný vynález, lépe mu bude porozuměno z následujícího popisu.

Všechna použitá procenta a poměry jsou vztaženy na celkovou hmotnost prostředku a všechna měření jsou prováděna při 25 °C, pokud není uvedeno jinak.

Použitý termín „produkty k péči o pokožku“ značí ty, které se používají k ošetření nebo péči, zvlhčení, zlepšení nebo čištění pokožky. Produkty takto označované zahrnují, ale nejsou omezeny na, produkty zvlhčující, produkty čistící, transdermální náplasti, leštidla na nehty, pudry, čistící polštářky, vlasové kondicionéry, pokožku ošetřující emulze, holicí krémy apod.

Termín „pokojoyé podmínky“ znamená okolní prostředí za tlaku 0,1 MPa, při 50% relativní vlhkosti a při 25 °C, pokud není uvedeno jinak.

Prostředky předkládaného vynálezu zahrnují, výhradně obsahují, nebo obsahují složky předkládaného vynálezu, stejně jako další zde popsané přísady. „Výhradně obsahující“ znamená, že prostředek nebo složka zahrnuje i další přísady, pokud tyto materiálně nemění podstatu a nové vlastnosti nárokových prostředků a způsobů.

Všechna procenta, díly a poměry jsou založeny na celkové hmotnosti prostředku k péči o pokožku předkládaného vynálezu, pokud není uvedeno jinak. Všechny tyto hmotnosti týkající se uvedených přísad jsou založeny na množství účinné látky a proto nezahrnují nosiče nebo vedlejší složky, které jsou přítomny v komerčně dostupných produktech, pokud není uvedeno jinak.

Všechny zde citované publikace jsou celkově zahrnuty v odkazech.

Termín „keratinová tkáň“ se vztahuje na keratin obsahující nejzevnější krycí vrstvy savců (např. lidí, psů, koček apod.) které zahrnují, ale nejsou omezeny na, kůži, rty, vlasy, nehty, pokožku, kopyta apod.

Termín „dermatologicky přijatelný“ znamená, že popsané prostředky nebo složky jsou vhodné pro kontakt se savčí keratinovou tkání bez nepatřičné toxicity, nesnášenlivosti, nestability, alergické reakce apod.

Termín „bezpečné a účinné množství“ znamená dostatečné množství složky nebo prostředku, které dokáže poskytnout významné výhody, zejména pozitivně působit na vzhled a pocit keratinové tkáně nebo na vzhled a pocit vlasů, včetně výhod zde uvedených, ale přitom dostatečně malé, aby se zamezilo vedlejším účinkům, tzn. poskytnout podle soudu odborníka rozumné výhody bez rizik.

Termín „ochablý“ znamená uvolnění, povolení nebo podobné vlastnosti pokožky, které se objeví v důsledku ztráty, poškození, změny a/nebo abnormalit v kožním elastinu.

Termíny „vyhlazení“ a „změkčení“ znamenají změnu povrchu keratinové tkáně, která má zlepšený pocit na dotek.

„Známky stárnutí pokožky“ zahrnují, ale nejsou omezeny na, všechny vnější viditelné a dotekem rozeznatelné projevy a další makro i mikro efekty v důsledku stárnutí pokožky. Takové známky jsou způsobeny vnitřními nebo vnějšími faktory, např. postupným stárnutím a/nebo poškozením vlivem prostředí. Tyto známky jsou vlivem procesů, které zahrnují, ale nejsou omezeny na, tvorbu tkáňových nerovností jako jsou vrásky a hluboké vrásky, rýhy, trhliny, hrbolky, velké póry (např. spojené s přídatnými strukturami jako jsou kanálky potních žláz, mazové žlázy, nebo vlasové váčky), nebo nerovnost, hrubost, ztrátu elasticity pokožky (ztráta a/nebo inaktivace funkčního kožního elastinu), ochabnutí (včetně opuchlosti v oblasti očí a spodní čelisti), ztrátu pevnosti a napnutí pokožky, ztrátu pružnosti, barevné změny (včetně kruhů pod očima), skvrnitost, bledost, hyperpigmentaci kožních okrsků jako jsou stařecké skvrny a fleky, rohovatění, abnormální rozdílnosti, hyperkeratinizace, selhání kolagenu a další histologické změny ve stratu corneu, škáře, pokožce, kožním cévním systémem (např. teleangiektazie nebo pavoučí cévky) a podkožních tkání, zvláště těch nejbližších kůži.

Je potřebné mít jednu nebo více účinných látek pečujících o pokožku, které ve velkém množství poskytují pokožce výhody jako je regulace stavu pokožky. Použití velkých množství takových látek v tradičních produktech má ale své nevýhody. Např. zbytek způsobený „vysolením“ niacinamidu vytváří na pokožce nežádoucí bělicí efekt.

Při použití netěkavých rozpouštědel jako je glycerin zůstanou účinné látky na pokožce rozpuštěné a tím se omezí viditelný zbytek (např. bělení). Použití takových rozpouštědel k redukci viditelného zbytku přináší ovšem jiný problém, lepkavý pocit na pokožce.

Silikonové elastomery jsou v oboru známé jako užitečné součásti prostředků k péči o pokožku. Jsou známé pro svou schopnost redukovat lepkavost spojenou s pokožku upravujícími činidly včetně glycerinu

Bylo zjištěno, že přidáním silikonového elastomeru k prostředku s velkým množstvím účinných látek péče o pokožku a netěkavého rozpouštědla se dosáhne přijatelné estetiky včetně zredukovaného viditelného zbytku a zredukované lepkavosti.

Předkládaný vynález je také použitelný k terapeutické regulaci viditelných a/nebo hmatatelných disproporcí na pokožce savců, včetně disproporcí ve struktuře pokožky a barvě. Např. zjevná velikost pórů se zmenší, zjevná výška tkáně se okamžitě přiblíží otvorům pórů přídatných podkožních orgánů, tón/barva pokožky se stane stejnoměrnější a/nebo rozměry rýh a/nebo vrásek se zmenší.

Prostředky předkládaného vynálezu se také používají k regulaci stavu pokožky a zvláště k regulaci stavu keratinové tkáně. Regulace stavu pokožky zvláště savců a především lidí je často potřebná v důsledku podmínek způsobených tělu vnitřními a/nebo vnějšími faktory. Příklady zahrnují poškození prostředím, vystavení záření (včetně ultrafialového záření), postupné stárnutí, přechod (např. popřechodové změny na pokožce), stres, nemoci apod. Např. „regulace stavu pokožky“ zahrnuje profylaktickou regulaci a/nebo terapeutickou regulaci stavu pokožky a poskytuje jednu nebo více dále uvedených výhod: ztlustění kůže (t.j. výstavba pokožky a/nebo škáry a podkoží (např. podkožního tuku nebo svalů), vrstev kůže a kde je to možné keratinových vrstev nehtů a střední části vlasů) k redukci atrofie kůže, ke zvýšení konvoluce předělu mezi škárou a pokožkou (též známého jako předělová pleteň), prevence ztráty elasticity pokožky (ztráta, poškození a/nebo inaktivace funkčního kožního elastinu) jako je elastoza, ochabnutí, ztráta pružnosti; nemelaninové změny zbarvení pokožky jako jsou kruhy pod očima, skvrnitost (např. nerovnoměrné červené zbarvení vlivem např. růžovky) (dále uváděné jako „červená skvrnitost“), bledost (bledá barva), změny zbarvení způsobené telangiektázií nebo pavoučími cévkami.

Profylaktická regulace stavu pokožky zahrnuje zpoždění, minimalizaci a/nebo prevenci viditelných a/nebo hmatatelných disproporcí na pokožce (např. tkáňové nerovnoměrnosti na pokožce rozeznatelné vizuálně nebo dotekem).

Terapeutická regulace stavu pokožky zahrnuje zlepšení např. zmenšení, minimalizaci nebo zahlazení disproporcí pokožky.

Prostředky předkládaného vynálezu poskytují další výhody, včetně stability, absence významného (tj. pro spotřebitele nepříjemného) podráždění a dobrou estetiku.

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují účinnou látku péče o pokožku, lepkavé rozpouštědlo, silikonový elastomer a rozpouštědlo silikonového elastomeru.

Prostředky též volitelně obsahují širokou řadu dalších přísad. Prostředky předkládaného vynálezu jsou podrobně popsány dále.

I. Účinná látka péče o pokožku

Prostředky k lokálnímu použití předkládaného vynálezu zahrnují 0,0001 % až 40 % účinné látky rozpustné v lepkavém rozpouštědle.

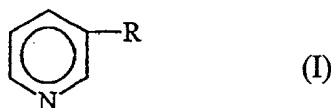
„Rozpustné v lepkavém rozpouštědle“ znamená účinné látky, které se smíchají s lepkavým rozpouštědlem, aby se v něm rozpustily nebo dispergovaly. Pokud se k rozpouštění/dispergování účinné látky lepkavé rozpouštědlo nepoužije, látka se po aplikaci na

pokožku vysráží. Rozpustné účinné látky jsou vybrány ze skupiny obsahující niacinamid, askorbylfosfát hořečnatý, zeolity, peptidy, opalovací látky a jejich směsi.

Niacinamid

Účinnou látkou péče o pokožku použitelnou v předkládaném vynálezu je výhodně niacinamid (nebo jiná sloučenina vitamínu B₃ pevná při pokojové teplotě a rozpustná v lepkavém rozpouštědle). Prostředek výhodně obsahuje 3,0 % až 40 %, výhodněji 5 % až 30 % a nejvýhodněji 5 % až 20 % sloučeniny vitamínu B₃.

„Niacinamid“ znamená sloučeninu obecného vzorce I



kde R je – CONH₂

Účinná látka rozpustná v lepkavém rozpouštědle je kromě niacinamidu také vybrána z dalších sloučenin vitamínu B₃, které jsou pevné při pokojové teplotě a rozpustné v lepkavém rozpouštědle.

Niacinamid je použit ve značně čisté formě, nebo ve formě extraktu získaného vhodnou fyzikální a/nebo chemickou izolací z přírodního (např. rostlinného) zdroje. Sloučeniny vitamínu B₃ jsou výhodně ve značně čisté formě, výhodněji v zásadě čisté formě.

Askorbylfosfát hořečnatý

Askorbylfosfát hořečnatý je stálá forma vitamínu C. V živém organismu je přeměněn na vitamin C. Je rozpustný a stálý v mnoha rozpouštědlech včetně vody, propylenglykolu, 1,3-butylenglykolu, maltitolu a glycerinu. Narozdíl od vitamínu C se absorbuje kůží. Askorbylfosfát hořečnatý je komerčně dostupný u Barnett Product Corp. jako NIKKOL VC-PMG.

Zeolity

Zeolity jsou přírodně hydratované hlinitokřemičitany sodíku nebo vápníku, nebo obou, typu $\text{Na}_2\text{O} \cdot \text{Al}_2\text{O}_3 \cdot x\text{SiO}_2 \cdot x\text{H}_2\text{O}$. Vhodné jsou přírodní i syntetické zeolity.

Vhodné přírodní zeolity zahrnují analcit, chabazit, heulandit, natrolit, stilbit a thomosonit. Vhodné syntetické zeolity zahrnují ty připravené krystalizačním procesem (křemičitan sodný a hliník) nebo procesem přípravy kaolinu, který tvoří základ zeolitů. Výhodné zeolity jsou hlinitokřemičitany sodné dostupné u UOP Molecular Sieves, Molecular Sieve Type 13X, Valfor Zeolite Na-A od PQ Corporation a Zeolex 7, 35 a 23A od Huber.

Peptidy

K prostředkům předkládaného vynálezu se v bezpečném a účinném množství přidávají peptidy včetně, ale ne omezeně na, di-, tri-, tetra- a pentapeptidů a jejich derivátů. Termín „peptidy“ znamená přírodní i syntetické peptidy. Vhodné jsou i přirozeně se vyskytující a komerčně dostupné prostředky, které peptidy obsahují.

Vhodné dipeptidy zahrnují Carnosine® (beta-ala-his). Vhodné tripeptidy zahrnují gly-his-lys, arg-lys-arg, his-gly-gly. Výhodné tripeptidy a jejich deriváty zahrnují palmitoyl-gly-his-lys, dostupné pod názvem Biopeptide CL® (100ppm palmitoyl-gly-his-lys komerčně dostupný u Sederma, Francie); Peptide CK (arg-lys-arg); PEPTIDE CK+(ac-arg-lys-arg-NH₂); a měďnaté komplexy his-gly-gly dostupné pod názvem IAMIN u Sigma (St. Louis, Missouri). Vhodné jsou i tetrapeptidy a pentapeptidy. Výhodný komerčně dostupný přípravek pentapeptidového derivátu je palmitoyl-lys-thr-thr-lys-ser (dostupný u Sederma, Francie).

Do předkládaného prostředku jsou peptidy výhodně přidávány v množství 1×10^{-6} % až 10 % , výhodněji 1×10^{-6} % až 0,1 % a nejvýhodněji 1×10^{-5} % až 0,01 % hmotnostních. V určitých prostředcích, kde peptidem je Carnosine®, prostředek výhodně obsahuje 0,1 % až 5 % hmotnostních tohoto peptidu. V jiných prostředcích, kde je použit peptid nebo peptid obsahující přípravek palmitoyl-lys-thr-thr-lys-ser a/nebo Biopeptide CL®, prostředky výhodně obsahují 0,0001 % až 10 % přípravku obsahujícího palmitoyl-lys-thr-thr-lys-ser a/nebo Biopeptide CL®.

Opalovací látky

V rozpouštědle rozpustnou účinnou látkou je také opalovací látka, která je pevná při pokojové teplotě a je rozpustná a/nebo dispergovatelná v lepkavém rozpouštědle. Nelimitující příklady takových opalovacích látek zahrnují soli 2-fenylbenzimidazol-5-sulfonové kyseliny, benzofenon-4, kyselinu benzylidenskafrsulfonovou, DEA-methoxycinamát, TEA-salicylát, soli kyseliny tereftalylidendikafrsulfonové a jejich směsi.

a) Soli kyseliny 2-fenylbenzimidazol-5-sulfonové

Soli kyseliny 2-fenylbenzimidazol-5-sulfonové jsou opalovací látky rozpustné ve vodě nebo v polyolech jako je glycerin. Soli sodné, draselné a triethanolaminu jsou připraveny *in situ* z odpovídajících bází. Kyselina 2-fenylbenzimidazol-5-sulfonová je komerčně dostupná u fy. E. Merck (EUSOLEX 232), Roche (PARSOL HS) a Haarmann & Reimer (Neo Heliopan Type Hydro).

b) 4-benzofenon

4-benzofenon (Sulisobenzon) je ve vodě nebo polyolech rozpustná opalovací látka. Je komerčně dostupný u fy. BASF pod názvem Uvinol MS-40.

c) Kyselina benzylidenskafrsulfonová

Kyselina benzylidenskafrsulfonová je ve vodě nebo polyolech rozpustná opalovací látka komerčně dostupná u fy. Chimex pod názvem MEXORYL SL.

d) DEA-methoxycinamát

DEA-methoxycinamát je ve vodě nebo polyolech rozpustný derivát kyseliny 4-methoxy-skořicové. Je komerčně dostupný u fy. Nipa Hardwicke pod názvem NIPASORB D.

e) TEA-salicylát

TEA-salicylát (triethanolaminsalicylát) je ve vodě nebo polyolech rozpustný derivát kyseliny salicylové. Je komerčně dostupný u fy. Haarmann & Reimer pod názvem NEO HELIOPAN TYPE TS a Kato Worldwide Ltd. pod názvem KATOSCREEN TES.

f) Soli kyseliny tereftalylidendikafrsulfonové

In situ připravené soli kyseliny tereftalylidendikafrsulfonové jsou rozpustné ve vodě a v polyolech. Tyto opalovací látky jsou také známy jako 3,3'-(1,4-fenylendimethylen)bis(7,7-dimethyl-2-oxo-bicyklo-(2,2,1)hept-1-yl methansulfonová kyselina. Komerčně dostupná sůl kyseliny tereftalylidendikafrsulfonové je od fy. Chimex pod názvem MEXORYL SX.

II. Nosný systém

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují zlepšený nosný systém. Tento systém je dermatologicky přijatelný. Termín „dermatologicky přijatelný systém“ znamená, že systém je

vhodný k lokální aplikaci na pokožku, má dobré estetické vlastnosti, je slučitelný s účinnými látkami předkládaného vynálezu a dalšími složkami a nepůsobí žádné problémy s bezpečností a toxicitou.

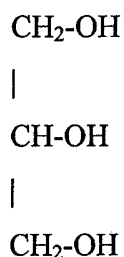
A. Lepkavé rozpouštědlo

Prostředky k lokálnímu použití předkládaného vynálezu obsahují 1 % až 60 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku, lepkavého rozpouštědla. Jsou to rozpouštědla mající zásadně tahové napětí větší než je tahové napětí vazelíny. Stanovení tahového napětí je v oboru známé a může být provedeno způsobem popsáním Ziedlerem v Journal Seifen, Ole, Fette, Wache, 118 (1992) 1 001, zde začleněn odkazem.

Výhodně prostředky obsahují 2 % až 50 %, výhodněji 5 % až 40 % hmotnostních lepkavého rozpouštědla, vztaženo na hmotnost prostředku.

Vhodná lepkavá rozpouštědla zahrnují polyoly jako jsou polyalkylenglykoly. Výhodné jsou alkylénové polyoly a jejich deriváty. Příklady vhodných polyolů zahrnují propylenglykol, dipropylenglykol, polypropylenglykol, polyethylenglykol, sorbitol, hydroxypropylsorbitol, hexylenglykol, 1,3-butylenglykol, 1,2,6-hexentriol, glycerin, ethoxylovaný glycerin, propoxylovaný glycerin, butantriol a jejich směsi. Výhodným polyolem je glycerin.

Glycerin, také známý jako „glycerol“ nebo „glycylalkohol“, je triol (polyol) vzorce



Vhodná lepkavá rozpouštědla jsou vyráběna jakýmkoliv tradičními prostředky a způsoby čištění.

B. Silikonový elastomer

Prostředky předkládaného vynálezu také obsahují 0,1 % až 30 % silikonového elastomeru, vztaženo na hmotnost prostředku. Výhodně prostředek obsahuje 1 % až 20 % a nejvýhodněji 2 % až 10 % silikonového elastomeru.

Vhodné silikonové elastomery jsou emulgující nebo neemulgující síťované siloxanové elastomery nebo jejich směsi. Neexistují žádná specifická omezení typu organopolysiloxanového prostředku, který slouží jako výchozí materiál pro síťovaný organopolysiloxanový elastomer. Příklady v této souvislosti jsou organopolysiloxanové prostředky vznikající adiční reakcí na platinovém katalyzátoru, adiční reakcí mezi SiH- obsahujícím diorganopolysiloxanem a organopolysiloxanem majícím vinylové skupiny; kondenzací vznikající organopolysiloxanové prostředky, které se tvoří za přítomnosti organocíničité sloučeniny dehydrogenací diorganopolysiloxanu s koncovou hydroxyskupinou a SiH- obsahujícím diorganopolysiloxanem; kondenzací organopolysiloxanových prostředků za přítomnosti organocíničité sloučeniny nebo titanového esteru; kondenzační reakcí diorganopolysiloxanu s koncovou hydroxyskupinou a hydrolyzovatelného organosilanu (tato kondenzační reakce je doložena dehydrogenací a reakcemi za uvolnění alkoholu, oximu, aminu, amidu, karboxylu a ketonu); organopolysiloxanové prostředky, které se tvoří za tepla v přítomnosti organoperoxidového katalyzátoru; a organopolysiloxanové prostředky, které se tvoří působením vysokoenergetického záření, jako jsou gama paprsky, ultrafialového záření nebo elektronových svazků.

Adiční reakce vedoucí ke vzniku organopolysiloxanových prostředků jsou výhodné pro svůj rychlý průběh a jednotnost produktu. Zvláště výhodné organopolysiloxanové prostředky vznikající adiční reakcí se připravují z:

- (A) organopolysiloxanu majícího alespoň 2 nižší alkenylskupiny v každé molekule;
- (B) organopolysiloxanu majícího alespoň 2 vodíkové atomy vázané na křemík v každé molekule;

a

- (C) platinového katalyzátoru

S ohledem na uvedené skutečnosti, složka (A) je základní složkou organopolysiloxanu tvořícího silikonový elastomer, reakce probíhá adicí této složky se složkou (B) za katalýzy složkou (C). Tato složka (A) musí obsahovat alespoň 2 nižší alkenylové skupiny vázané na křemík v každé molekule; dobrý produkt se nezíská u méně než dvou nižších alkenylových skupin, protože se nevytvoří síťovaná struktura. Příklady nižších alkenylových skupin jsou vinyl, allyl a propenyl. Nižší alkenylové skupiny jsou přítomny v jakékoliv pozici v molekule, je ale výhodná jejich přítomnost na koncích. Molekulovou strukturou této složky je přímý řetězec, řetězec rozvětvený přímý, cyklický nebo síťovaný. Výhodný je ale přímý řetězec, případně mírně rozvětvený. Molekulová hmotnost prostředku není specificky omezena, takže viskozita se pohybuje od nízkoviskózních kapalin k vysoce viskózním gumám. Aby se získal produkt ve formě gumového elastomeru, výhodná je viskozita alespoň $1 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 25°C . Příklady takových organopolysiloxanů jsou methylvinylsiloxany, methylvinylsiloxan-dimethylsiloxanové

kopolymery, dimethylpolysiloxany s koncovou dimethylvinylsiloxyskupinou, kopolymery dimethylsiloxanu a methylfenylsiloxanu s koncovou dimethylvinylsiloxyskupinou, kopolymery dimethylsiloxanu, difenylsiloxanu a methylvinylsiloxanu s koncovou dimethylvinylsiloxyskupinou, kopolymery dimethylsiloxanu a methylvinylsiloxanu s koncovou trimethylsiloxyskupinou, kopolymery dimethylsiloxanu, methylfenylsiloxanu a methylvinylsiloxanu s koncovou trimethylsiloxyskupinou, methyl(3,3,3-trifluorpropyl)polysiloxany s koncovou dimethylvinylsiloxyskupinou a kopolymery dimethylsiloxanu a methyl(3,3,3-trifluorpropyl)siloxanu s koncovou dimethylvinylsiloxyskupinou.

Složka (B) je organopolysiloxan mající alespoň 2 vodíkové atomy vázané na křemík atomy v každé molekule a je síťovacím činidlem pro složku (A). Reakce pokračuje adicí vodíkového atomu vázaného na křemík této složky na nižší alkenylovou skupinu ve složce (A) za katalýzy složkou (C). Aby tato složka (B) působila jako síťovací činidlo, musí obsahovat alespoň 2 vodíkové atomy vázané na křemík v každé molekule. Navíc součet alkenylových skupin v každé molekule složky (A) a počtu vodíkových atomů vázaných na křemík v každé molekule složky (B) musí být alespoň 5. Nižší hodnoty nejsou vhodné, protože pak se netvoří síťovaná struktura.

Neexistují žádná omezení na strukturu této složky, má proto strukturu přímého řetězce, rozvětveného přímého řetězce, cyklickou atd. Molekulová hmotnost této složky není specificky omezena, ale k zajištění dobré mísitelnosti se složkou (A) je výhodná viskozita 0,01 až $500 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 25°C . Výhodně se tato složka přidá v takovém množství, aby molární poměr mezi celkovým množstvím na křemík vázaných vodíkových atomů v dané složce a celkovým množstvím všech nižších alkenylových skupin ve složce (A) byl v rozmezí 1,5 : 1 až 20 : 1. Je obtížné získat dobré reakční vlastnosti, pokud je molární poměr nižší než 0,5 : 1. Pokud je překročen poměr 20 : 1, produkt má při zahřátí tendenci silně tvrdnout. Pokud se dodatečně přidá organosiloxan obsahující alkenyl z důvodu např. posílení, je výhodné přidat danou SiH-obsahující složku v množství vyrovnávajícím tyto alkenylové skupiny. Konkrétními příklady této složky jsou methylhydrogenpolysiloxany s koncovou trimethylsiloxyskupinou, dimethylsiloxan-methylhydrogensiloxanové kopolymery s koncovou trimethylsiloxyskupinou a dimethylsiloxan-methylhydrogensiloxanové cyklické kopolymery.

Složka (C) je katalyzátor adiční reakce na křemík vázaných vodíkových atomů a alkenylových skupin a jeho konkrétními příklady jsou kyselina chloroplaticitá, případně rozpuštěná v alkoholu nebo ketonu a tento roztok případně ponechaný zrást, komplexy kyseliny chloroplaticité s olefiny, komplexy kyseliny chloroplaticité s alkenylsiloxany, komplexy kyseliny chloroplaticité s diketony, platínová čerň a platina na nosiče.

Složka (C) se výhodně přidává v množství 0,1 až 1 000 hmotnostních částí, výhodněji 1 až 100 hmotnostních částí platiny na 1 000 000 hmotnostních částí celkového množství složek (A) plus (B). Další organické skupiny, které se váží k silikonu v organopolysiloxany tvořících základech, pro výšepopsané reaktivní organopolysiloxanové prostředky jsou např. alkylskupiny jako je methyl, ethyl, propyl, butyl a oktyl; substituované alkylové skupiny jako je 2-fenylethyl, 2-fenylpropyl a 3,3,3-trifluorpropyl; arylskupiny jako je fenyl, tolyl a xylyl; substituované arylové skupiny jako je fenylethyl; a jednovazné uhlovodíkové skupiny substituované např. epoxyskupinou, karboxyesterskupinou, merkaptoskupinou atd.

Dále jsou uvedeny příklady přípravy organopolysiloxanového prášku: organopolysiloxanový prostředek popsany výše (podléhající adici, kondenzaci nebo oxidaci) se smíchá s vodou za přítomnosti povrchově aktivní látky (neionogenní, anionogenní, kationogenní nebo amfoterní) a po zhomogenizování v homomixéru, koloidním mlýnu, homogenizátoru, hřidelovém mixéru atd. se nechá zreagovat v horké vodě (o teplotě alespoň 50 °C) a poté se usuší. Organopolysiloxanový prostředek (podléhající adici, kondenzaci nebo oxidaci) se přímo rozprašuje do horkého vzduchu; prášek se získá rozprašením organopolysiloxanového prostředku za působení vysokoenergetického záření; organopolysiloxanový prostředek (podléhající adici, kondenzaci nebo oxidaci) nebo organopolysiloxanový prostředek reagující působením vysokoenergetického záření se nechá zreagovat a produkt je potom rozmělněn na prášek s použitím známých drtičů např. kulového mlýnu, rozprašovače, hnětače, válcovacího mlýnu apod.

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují emulgující síťovaný organopolysiloxanový elastomer, neemulgující síťovaný organopolysiloxanový elastomer nebo jejich směsi. Termín „neemulgující“ znamená síťovaný organopolysiloxanový elastomer, kde chybí polyoxyalkylenové jednotky. Termín „emulgující“ znamená síťované organopolysiloxanové elastomery mající alespoň jednu polyoxyalkylenovou (tj. polyoxyethylenovou nebo poluoxypropylenovou) jednotku. Výhodné emulgující elastomery zahrnují polyoxyalkylenem modifikované elastomery tvořené z divinylných sloučenin, zejména siloxanové polymery s alespoň dvěma volnými vinylskupinami, reagující s Si-H vazbami na látky se základním polysiloxanovým řetězcem. Výhodnými elastomery jsou dimethylpolysiloxany zesíťované přes Si-H skupiny na MQ pryskyřice s molekulami kulového tvaru. Emulgující síťovaný organopolysiloxanový elastomer je vybrán ze síťovaných polymerů popsanych v US Patentech 5 412 004 (vydaný 2.5.95); 5 837 793 (vydaný 17.11.98); a 5 811 487 (vydaný 22.9.98), zde zahrnutých odkazy. Navíc je emulgující elastomer obsahující dimethikon kopolyol síťovaný polymer (a) dimethikon dostupný u fy. Shin Etsu pod obchodním názvem KSG-21.

Silikonové elastomery předkládaného vynálezu jsou dále zpracovávány krájením (34,5 MPa) za přítomnosti rozpouštědla silikonového elastomeru pomocí Sonolatoru. Postup se opakuje 1 až 60krát, aby bylo dosaženo příslušné průměrné velikosti částic silikonového elastomeru. Méně než 10 průběhů poskytuje průměrnou velikost částic 20 až 200 mikrometrů. 10 až 60 průběhů poskytuje průměrnou velikost částic menší než 20 mikrometrů, měřeno přístrojem Horiba LA-910. Termín „velikost částic“ elastomeru znamená velikost částic elastomeru v jeho nabobtnalém stavu. „Nabobtnalý“ znamená, že částice elastomeru se zvětšují nad svou normální velikost a tvarují se svou schopností absorbovat rozpouštědlo.

Výhodné neemulgující elastomery jsou síťované polymery dimethikon/vinyldimethikon. Takové dimethikon/vinyldimethikon síťované polymery jsou dostupné u různých firem včetně Dow Corning (DC 9 040 a DC 9 041), General Electric (SFE 839), Shin Etsu (KSG-15, 16, 18 [dimethikon/fenylvinyldimethikon síťovaný polymer]) a Grant Industries (GRANSILTM elastomery). Vhodné síťované organopolysiloxanové elastomery a způsoby jejich přípravy jsou dále popsány v U.S. Patent 4 970 252 od Sakuta, et al., vydaném 13.11.1990; U.S. Patent 5 760 116 od Kilgour, et al., vydaném 2.6.1998; U.S. Patent 5 654 326 od Schulz, Jr., et al., vydaném 5.8.1997, všechny jsou zde začleněny odkazem. Další vhodné síťované organopolysiloxanové elastomery jsou zahrnuty v japonské patentové přihlášce JP-61-18 708 od Pola Kasei Kogyo KK.

Výhodné komerčně dostupné elastomery jsou Dow Corning 9 040 směsi silikonových elastomerů, KSG-21 od fy Shin Etsu a jejich směsi.

B. Nosič elastomeru

Prostředky k lokálnímu použití předkládaného vynálezu obsahují 1 % až 80 % hmotnostních vhodného nosiče síťovaného organopolysiloxanového elastomeru, vztaženo na hmotnost prostředku. Nosič skombinovaný s částicemi síťovaného organopolysiloxanového elastomeru slouží k suspendování a zvětšení částic elastomeru, aby se vytvořila elastická, gelu podobná síť nebo základ. Nosič síťovaného siloxanového elastomeru je při pokojové teplotě kapalný a výhodně má nízkou viskozitu k zlepšení roztírání na pokožku.

Koncentrace nosiče v kosmetickém prostředku předkládaného vynálezu se liší podle typu a množství použitého nosiče a síťovaného siloxanového elastomeru. Výhodná koncentrace nosiče je 5 % až 50 %, výhodněji 5 % až 40 %, vztaženo na hmotnost prostředku.

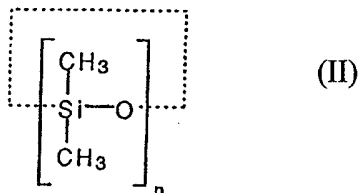
Nosič síťovaného siloxanového elastomeru obsahuje jeden nebo více kapalných nosičů vhodných k místní aplikaci na lidskou pokožku. Kapalné nosiče jsou organické, obsahující

křemík nebo fluor, těkavé nebo netěkavé, polární nebo nepochární. Podmínkou je, aby kapalný nosič tvořil roztok nebo homogenní disperzi s danou koncentrací síťovaného siloxanového elastomeru při teplotě 28 °C až 250 °C, výhodně při 28 °C až 100 °C, výhodněji při 28 °C až 78 °C. Výhodné parametry rozpustnosti nosiče síťovaného siloxanového elastomeru jsou 3 až 13 (cal/cm³)^{0,5}, výhodnější 5 až 11 (cal/cm³)^{0,5} a nejvýhodnější 5 až 9 (cal/cm³)^{0,5}. Parametry rozpustnosti kapalných nosičů nebo dalších materiálů i prostředky k jejich stanovení jsou v oboru dobře známé. Popis parametrů rozpustnosti a prostředků k jejich stanovení je obsažen v C.D.Vaughan „Solubility Effects in Product, Package, Penetration and Preservation“ 103 Cosmetics and Toiletries 47-69, October 1998; a v C.D. Vaughan „Using Solubility Parameters in Cosmetics Formulation“, 36 J. Soc. Cosmetic Chemists 319-333, September/october 1998. Tyto články jsou zde zahrnuty odkazem.

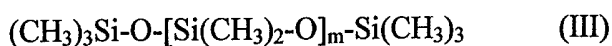
Nosič výhodně zahrnuje těkavé nepochární oleje; netěkavé, relativně polární oleje; netěkavé nepochární oleje; a netěkavé parafinové uhlovodíkové oleje; každý bude šířeji zmíněn dále. Termín „netěkavý“ je použit pro materiály, které vykazují tenzi vodní par ne větší než 26,6 Pa při 25 °C, při tlaku 0,1 MPa a/nebo pro materiály, které mají teplotu varu při 0,1 MPa alespoň 300 °C. Termín „těkavé“ je použit pro materiály, které nejsou „netěkavé“ podle předchozí definice. „Relativně polární“ znamená více polární než jiný materiál ve smyslu parametrů rozpustnosti; tj. čím větší rozpustnost, tím polárnější kapalina. Termín „nepochární“ znamená, že materiál má parametry rozpustnosti pod hodnotu 6,5 (cal/cm³)^{0,5}.

1. Nepochární těkavé oleje

Nepochární těkavé oleje propůjčují prostředkům předkládaného vynálezu požadované estetické vlastnosti. Proto se nepochární těkavé oleje výhodně používají ve značně velkém množství. Zvláště vhodné nepochární těkavé oleje jsou silikonové oleje; uhlovodíky; a jejich směsi. Takové nepochární těkavé oleje jsou zahrnuty např. v Cosmetics, Science, and Technology, Vol. 1, 27-104 vyd. Balsam and Sagarin, 1972. Nepochární těkavé oleje vhodné v předkládaném vynálezu jsou nasycené nebo nenasycené, mají alifatický charakter a jsou tvořeny přímými nebo rozvětvenými řetězci nebo obsahují alicyklické nebo aromatické cykly. Příklady výhodných nepochárních těkavých uhlovodíků zahrnují polydekany jako je isododekan a isodekan (např. Pemethyl-99A dostupný u fy Presperse Inc.) a C₇-C₈ až C₁₂-C₁₅ isoparafíny (jako jsou Isopar serie dostupné u fy Exxon Chemicals). Nepochární těkavé kapalně silikonové oleje jsou zahrnuty v U.S. Patent 4 781 917 vyd. Luebbe et al. 1.11.1988, zde zahrnutý odkazem. Navíc je popis různých těkavých silikonových materiálů obsažen v Todd et al. „Volatile Silicone Fluids for Cosmetics“, Cosmetics and Toiletries, 91:27-32 (1976), zde zahrnutý odkazem. Zvláště výhodné těkavé silikonové oleje jsou vybrány z cyklických těkavých silikonů obecného vzorce II



kde n je 3 až 7; a z lineárních těkavých silikonů obecného vzorce III



kde m je 1 až 7. Lineární těkavé silikony mají viskozitu menší než $0,05 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 25°C , zatímco cyklické silikony mají viskozitu menší než $0,1 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 25°C . Nejvýhodnější příklady těkavých silikonových olejů zahrnují cyklomethikony o různých hodnotách viskozity, např. Dow Corning 200, Dow Corning 244, Dow Corning 245, Dow Corning 344 a Dow Corning 345 (komerčně dostupné u fy Dow Corning Corp.); SF-1 204 a SF-1 202 silikonové kapaliny (komerčně dostupné u fy G.E. Silikones); GE 7 207 a 7 158 (komerčně dostupné u fy General Electric Co.); a SWS-03314 (komerčně dostupný u fy SWS Silicones Corp.).

2. Relativně polární netěkavé oleje

Netěkavý olej je „relativně polární“ při srovnání s nepolárním těkavým olejem popsáním výše. Proto je netěkavý spolunosič polárnější (tj. má vyšší parametr rozpustnosti) než alespoň jeden z nepolárních těkavých olejů. Vhodné relativně polární netěkavé oleje jsou např. zahrnuty v *Cosmetics, Science, and Technology*, Vol. 1, 27-104 vyd. Balsam and Sagarin, 1972; v U.S. Patentech 4 202 879 vyd. Shelton 13.5.1980; a 4 816 261 vyd. Luebbe et al. 28.3. 1989, všechny zde začleněny odkazy. Výhodné relativně polární netěkavé oleje jsou vybrány ze silikonových olejů; uhlovodíkových olejů; mastných alkoholů; mastných kyselin; esterů mono a dibazických karboxylových kyselin s alkoholy s jednou a více hydroxylovými skupinami; polyoxyethylenů; polyoxypropylenů; směsí polyoxyethylenových a polyoxypropylenových etherů mastných alkoholů; a jejich směsí. Vhodné relativně polární netěkavé spolunosiče jsou nasycené nebo nenasycené, mají alifatický charakter a jsou tvořeny přímým nebo rozvětveným řetězcem nebo obsahují alicyklické nebo aromatické cykly. Výhodněji jsou relativně polární netěkavé kapalné spolunosiče vybrány z mastných alkoholů majících 12 až 26 uhlíkových atomů; mastných kyselin majících 12 až 26 uhlíkových atomů; esterů monobazických karboxylových kyselin a

alkoholů majících 14 až 30 uhlíkových atomů; esterů dibazických karboxylových kyselin majících 5 až 25 uhlíkových atomů; ethoxylovaných, propoxylovaných a směsí ethoxylovaných a propoxylovaných etherů mastných alkoholů s 12 až 26 uhlíkovými atomy a se stupněm ethoxylace a propoxylace nižším než 50; a jejich směsí. Výhodnější jsou propoxylované ethery C_{14} - C_{18} mastných alkoholů majících stupeň propoxylace menší než 50, estery C_2 - C_8 alkoholů a C_{12} - C_{26} karboxylových kyselin (např. ethylmyristát, isopropylpalmitát), estery C_{12} - C_{26} alkoholů a kyseliny benzoové (např. Finsolv TN dodávaný fy Finetex), diestery C_2 - C_8 alkoholů a kyseliny adipové, sebakové a ftalové (např. diisopropylsebakát, diisopropyladipát, di-n-butylftalát), estery polyolů C_6 - C_{26} karboxylových kyselin (např. propylenglykol dikaprát/dikaprylát, propylenglykolisostearát); a jejich směsí. Ještě výhodnější jsou rozvětvené řetězce alifatických mastných alkoholů majících 12 – 26 uhlíkových atomů. Nejvýhodnější je isocetylalkohol, oktyldodekanol, oktyldodekanol a undecylpentadekanol; a z nich je nejvýhodnější oktyldodekanol. Tyto výhodné alifatické mastné alkoholy jsou zvláště vhodné v kombinaci s těkavými kapalnými silikonovými oleji potřebnými k úpravě průměrné rozpustnosti nosiče.

3. Napolární, netěkavé oleje

Kromě kapalin popsaných výše obsahuje nosič síťovaného siloxanového elastomeru případně i netěkavé napolární oleje. Typická netěkavá napolární změkčovadla jsou zahrnuta např. v *Cosmetics, Science, and Technology*, Vol. 1, 27-104 vyd. Balsam and Sagarin, 1972; v *U.S. Patents* 4 202 879 vyd. Shelton 13.5. 1980; a 4 816 261 vyd. Luebbe et al. 28.3. 1989. Oba jsou zde začleněny odkazem. Vhodné netěkavé oleje jsou netěkavé polysiloxany, parafinové uhlovodíkové oleje a jejich směsí. Vhodné polysiloxany jsou vybrány z polyalkylsiloxanů, polyarylsiloxanů, polyalkylarylsiloxanů, polyethersiloxanových kopolymerů a jejich směsí. Příkladem jsou polydimethylsiloxany mající viskozitu 0,01 až 1 000 $\text{cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 25 °C. Mezi výhodná netěkavá silikonová změkčovadla patří polydimethylsiloxany mající viskozitu 0,02 až 4 $\text{cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 25 °C. Takové polyalkylsiloxany jsou zahrnuty ve Viscasil sériích (dostupných u General Electric Company) a v Dow Corning 200 sériích (dostupných u fy Dow Corning Corp.). Polyalkylarylsiloxany zahrnují polymethylfenylsiloxany mající viskozitu 0,15 až 0,65 $\text{cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 25 °C. Ty jsou dostupné např. jako SF 1 075 methyl-fenyl fluid (dodávaný fy General Electric Company) a 556 Cosmetic Grade Fluid (dodávaný fy Dow Corning Corp.). Vhodné polyethersiloxanové kopolymery zahrnují např. polyoxyalkylenetherový kopolymer mající viskozitu 12 až 15 $\text{cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 25 °C. Tato kapalina je dostupná jako SF1 066 organosiloxanová povrchově aktivní látka (od fy General Electric Company). Výhodné jsou polysiloxanové ethylenglykoetherové kopolymery.

Vhodné netěkavé parafinové uhlovodíkové oleje zahrnují minerální oleje a určité uhlovodíky s rozvětveným řetězcem. Příklady těchto kapalin jsou zahrnuty v U.S. Patent 5 019 375 vyd. Tanner et al. 28.5. 1991, zde začleněn odkazem. Výhodné minerální oleje mají tyto vlastnosti:

- (1) viskozita 0,05 až 0,7 $\text{cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ při 40 °C;
- (2) hustota 0,82 až 0,89 g/cm^3 při 25 °C;
- (3) teplota vznícení 138 °C až 216 °C;
- (4) délka uhlíkového řetězce 14 až 40 uhlíkových atomů.

Výhodné uhlovodíkové oleje s rozvětveným řetězcem mají tyto vlastnosti:

- (1) hustota 0,79 až 0,89 g/cm^3 při 20 °C;
- (2) teplota varu vyšší než 250 °C;
- (3) teplota vznícení 110 °C až 200 °C.

Zvláště výhodné uhlovodíky s rozvětveným řetězcem zahrnují Permethyl 103A, který průměrně obsahuje 24 uhlíkových atomů; Permethyl 104A, který průměrně obsahuje 68 uhlíkových atomů; Permethyl 102A, který průměrně obsahuje 20 uhlíkových atomů; všechny jsou dostupné u fy Permethyl Corporation; a Ethylflo 364, který obsahuje směs 30 a 40 uhlíkových atomů a je dostupný u fy Ethyl Corp.

Další vhodné nosiče zahrnují rozpouštědla popsaná v US Patent 5 750 096 Gerald J. Guskey et al., vyd. 12.5. 1998, zde zahrnutý odkazem.

Strukturující činidla

V některých případech obsahují prostředky předkládaného vynálezu také strukturující činidla jako součást nosného systému. Tato činidla jsou výhodná u prostředků ve formě emulze a zvláště u prostředků ve formě emulze olej ve vodě. Bez ohledu na teorii se má za to, že strukturující činidla pomáhají zlepšit reologické vlastnosti prostředku, což přispívá k jeho stabilitě. Např. strukturující činidlo pomáhá při tvorbě krystalických gelových struktur. Strukturující činidlo je též vhodné jako emulgátor nebo povrchově aktivní látka. Prostředky podle vynálezu obsahují 0,1 % až 20 %, výhodně 0,1 % až 10 % a výhodněji 0,5 % až 9 % jednoho nebo více strukturujících činidel.

Výhodná strukturující činidla mají HLB (hydrofilní-lipofilní rovnováhu) 1 až 8 a teplotu tání alespoň 45 °C. Vhodná strukturující činidla jsou vybrána ze skupiny obsahující nasycené C_{14} až C_{30} mastné alkoholy, nasycené C_{16} až C_{30} mastné alkoholy obsahující 1 až 5 molů ethylenoxidu, nasycené C_{16} až C_{30} dioly, nasycené C_{16} až C_{30} monoglycerolethery, nasycené C_{16}

až C₃₀ mastné hydroxykyseliny, C₁₄ až C₃₀ hydroxylované a nehydroxylované nasycené mastné kyseliny, C₁₄ až C₃₀ nasycené ethoxylované mastné kyseliny, aminy a alkoholy obsahující 1 až 5 molů ethylenoxidových diolů, C₁₄ až C₃₀ nasycené glycerylmonoestery s obsahem monoglyceridu alespoň 40 %, C₁₄ až C₃₀ nasycené polyglycerolestery mající 1 až 3 alkylskupiny a 2 až 3 nasycené glycerolové jednotky, C₁₄ až C₃₀ glycerylmonoethery, C₁₄ až C₃₀ sorbitanmono/diestery, C₁₄ až C₃₀ nasycené ethoxylované sorbitanmono/diestery s 1 až 5 moly ethylenoxidu, C₁₄ až C₃₀ nasycené methylglukosidové estery, C₁₄ až C₃₀ nasycené mono/diestery sacharózy, C₁₄ až C₃₀ nasycené ethoxylované methylglukosidové estery s 1 až 5 moly ethylenoxidu, C₁₄ až C₃₀ nasycené polyglukosidy mající průměrně 1 až 2 glukózové jednotky a jejich směsi, mající teplotu tání alespoň 45 °C.

Příklady výhodných strukturujících činidel zahrnují kyselinu stearovou, kyselinu palmitovou, stearylalkohol, cetylalkohol, behenylalkohol, polyethylenglykoether stearylalkoholu mající průměrně 1 až 5 ethylenoxidových jednotek, polyethylenglykoether cetylalkoholu mající průměrně 1 až 5 ethylenoxidových jednotek a jejich směsi. Výhodnější jsou stearylalkohol, cetylalkohol, behenylalkohol, polyethylenglykoether stearylalkoholu mající průměrně 2 ethylenoxidové jednotky (steareth-2), polyethylenglykoether cetylalkoholu mající průměrně 2 ethylenoxidové jednotky a jejich směsi. Nejvýhodnější strukturující činidla jsou kyselina stearová, kyselina palmitová, stearylalkohol, cetylalkohol, behenylalkohol, steareth-2 a jejich směsi.

Zahušťovadla

Prostředky předkládaného vynálezu v některých případech dále obsahují jedno nebo více zahušťovadel. Prostředek výhodně obsahuje 0,1 % až 5 %, výhodněji 0,1 % až 4 % a nejvýhodněji 0,25 % až 3 % zahušťovadla, vztaheno na hmotnost prostředku.

Nelimitující třídy zahušťovadel jsou vybrány z následujících skupin:

a) Polymery karboxylových kyselin

Tyto polymery jsou síťované sloučeniny obsahující jeden nebo více monomerů odvozených od kyseliny akrylové, substituované kyseliny akrylové a solí a esterů těchto akrylových kyselin a substituovaných akrylových kyselin, kde síťované činidlo obsahuje dva nebo více uhlíkových dvojných vazeb a je odvozeno od polyolu. Vhodné polymery jsou více popsány v U.S. Patent 5 087 445, Haffey et al, vyd. 11.2.1992; U.S. Patent 4 509 949, Huang et al, vyd. 5.4.1985; U.S. Patent 2 798 053, Brown, vyd. 2.7.1957; a v CTFA International Cosmetics Ingredient Dictionary, Fourth Edition, 1991, pp. 12 až 80.

Vhodné příklady komerčně dostupných polymerů karboxylových kyselin zahrnují karbomery, které jsou homopolymery akrylové kyseliny síťované s allyletherem sacharózy nebo pentaerytritol. Karbomery jsou dostupné jako série Carbopol® 900 od fy B.F. Goodrich (např. Carbopol® 954). Další vhodné polymery karboxylových kyselin zahrnují kopolymery C₁₀-C₃₀ alkylakrylátů s jedním nebo více monomery akrylové kyseliny, methakrylové kyseliny, nebo jejich esterů s krátkým řetězcem (tj. C₁₋₄ alkoholy), kde síťovací činidlo je allylether sacharózy nebo pentaerytritol. Tyto kopolymery jsou známé jako akrylát/C₁₀-C₃₀alkylakrylátové síťované polymery a jsou komerčně dostupné jako Carbopol® 1 342, Carbopol® 1 382, PEMULEN TR-1 a PEMULEN TR-2 od fy B.F. Goodrich. Jinými slovy, příklady vhodných polymerů karboxylových kyselin jsou vybrány z karbomerů, akrylát/C₁₀-C₃₀alkylakrylátových síťovaných polymerů a jejich směsí.

b) Síťované polyakrylátové polymery

Prostředky předkládaného vynálezu také případně obsahují síťované polyakrylátové polymery vhodné jako zahušťovadla nebo želatinační činidla, včetně kationogenních i neionogenních polymerů, výhodně kationogenních. Příklady vhodných síťovaných neionogenních polyakrylátových polymerů a síťovaných kationogenních polyakrylátových polymerů jsou popsány v U.S. Patent

5 100 660, Hawe et al, vyd. 31.3.1992; U.S. Patent 4 849 484, Heard, vyd. 18.7.1989; U.S. Patent 4 835 206, Farrar et al, vyd. 30.5.1989; U.S. Patent 4 628 078, Glover et al, vyd. 9.12.1986; U.S. Patent 4 599 379, Flesher et al, vyd. 8.7.1986; a EP 228 868 Farrar et al, vyd. 15.7.1987.

c) Polyakrylamidové polymery

Prostředky předkládaného vynálezu případně obsahují polyakrylamidové polymery, zvláště neionogenní polyakrylamidové polymery včetně substituovaných rozvětvených nebo nerozvětvených polymerů. Mezi nimi je výhodný neionogenní polymer pod CTFA označením polyakrylamid, isoparafin a laureth-7, dostupné pod obchodním názvem Sepigel 305 od fy Seppic Corporation (Fairfield, NJ).

Další vhodné polyakrylamidové polymery zahrnují blokové kopolymery akrylamidů a substituovaných akrylamidů s akrylovými kyselinami a substituovanými akrylovými kyselinami. Komerčně dostupné příklady těchto blokových kopolymerů zahrnují HYPAN SR150H, SS500V, SS500W, SSSA100H od fy Lipo Chemicals, Inc., (Patterson, NJ).

d) Polysacharidy

Vhodná pro použití v předkládaném vynálezu je řada polysacharidů. „Polysacharidy“ představují želatinační činidla, která obsahují základní řetězec cukerných (tj. uhlovodíkových)

jednotek. Nelimitující příklady polysacharidových želatinačních činidel jsou vybrány ze skupiny obsahující celulózu, karboxymethylhydroethylcelulózu, acetát celulózy, propionát celulózy, karboxylát celulózy, hydroxyethylcelulózu, hydroxyethylethylcelulózu, hydroxypropylcelulózu, hydroxypropylmethylcelulózu, methylhydroxyethylcelulózu, mikrokystalickou celulózu, sodnou sůl sulfátu celulózy a jejich směsi. Dále jsou vhodné alkylem substituované celulózy. U těchto celulóзовých polymerů jsou hydroxyskupiny alkylovány (výhodně hydroxyethyl nebo hydroxypropyl), aby tvořily hydroxyalkylovanou celulózu, která je dále modifikována s C_{10} - C_{30} přímým řetězcem nebo rozvětveným řetězcem alkylových skupin přes etherickou vazbu. Tyto polymery jsou typicky ethery C_{10} - C_{30} alkoholů s přímým nebo rozvětveným řetězcem a hydroxyalkylcelulózy. Příklady vhodných alkylových skupin jsou vybrány ze skupiny obsahující stearyl, isostearyl, lauryl, myristyl, cetyl, isocetyl, kokoyl (tj. alkylové skupiny odvozené z alkoholů kokosového oleje), palmityl, oleyl, linoleyl, linolenyl, ricinoleyl, behenyl a jejich směsi. Výhodný alkylhydroxyalkylcelulóзовý ether má CTFA označení cetylhydroxyethylcelulóza, což je ether cetylalkoholu a hydroxyethylcelulózy. Tento materiál je dodáván pod obchodním názvem Natrosol® CS Plus od fy Aqualon Corporation (Wilmington, DE).

Dalšími vhodnými polysacharidy jsou skleroglukany, které jsou lineárními řetězci glukózových jednotek spojených vazbami (1-3) s glukózou vázanou vazbou (1-6) každé tři jednotky. Jejich komerčně dostupnými příklady jsou Clearogel™ CS11 od fy Michel Mercier Products Inc. (Mountainside, NJ).

e) Gummy

Další vhodná zahušťovadla a želatinační činidla zahrnují materiály, které jsou primárně odvozeny z přírodních zdrojů. Nelimitujícími příklady takových gum jsou akácie, agar, algin, kyselina alginová, alginát amonný, amylopektin, alginát vápenatý, karagen vápenatý, karnitin, karagenan, dextrin, želatina, gelanová guma, guarová guma, guarhydroxypropyltrimoniumchlorid, hektorit, hyaluronová kyselina, silikagel, hydroxypropylchitosan, hydroxypropylguar, karayová guma, hnědá řasa, guma z lasku rohovníku, guma natto (sojová), alginát draselný, karagen draselný, propylenglykolalginát, guma ze sklerocia, karboxymethyldextran sodný, karagenan sodný, tragantová guma, xanthanová guma a jejich směsi.

Prostředky předkládaného vynálezu výhodně obsahují zahušťovadlo vybrané ze skupiny obsahující polymery karboxylových kyselin, síťované polyakrylátové polymery, polyakrylamidové polymery a jejich směsi, výhodněji vybrané z polymerů karboxylových kyselin, polyakrylamidových polymerů a jejich směsí.

Voda

Prostředky předkládaného vynálezu v některých případech obsahují vodu v množství 0,1 % až 95 %, výhodně 0,5 % až 90 % a nejvýhodněji 0,1 % až 70 %, vztaženo na hmotnost prostředku.

Vhodné formy

Nosný systém zahrnuje silikonový elastomer, nosič elastomeru a lepkavé rozpouštědlo. Nosný systém se připravuje v různých formách. Např. jsou vhodné, ale nelimitující, formy emulzí olej ve vodě, voda v oleji, voda v silikonu, voda v oleji ve vodě a olej ve vodě v silikonu. Další vhodné formy zahrnují bezvodé směsi jako jsou směsi glycerinu a silikonu. Nosný systém výhodně obsahuje emulzi olej ve vodě, voda v oleji nebo voda v silikonu. Odborníkům je jasné, že daná složka bude v první řadě rozšířena do vody nebo do fáze olej/silikon, v závislosti na rozpustnosti ve vodě/dispergovatelnosti složky v prostředí.

Pokud je prostředek ve formě emulze, obsahuje dále 0,01 % až 10 %, výhodněji 0,1 % až 5 % emulgátoru, vztaženo na hmotnost nosného systému. Emulgátor je neionogenní, anionogenní nebo kationogenní. Vhodné emulgátory jsou zahrnuty např. v U.S. Patent 3 755 560, vyd. 28.8.1973, Dickert et al.,; U.S. Patent 4 421 769, vyd. 20.12.1983, Dixon et al.,; a McCutcheon's Detergents and Emulsifiers, north American Edition, p. 317-324 (1986). Příklady vhodných emulgátorů jsou také v U.S. Patent 5 085 856, Dunphy et al. a U.S. Patent 5 688 831, El-Nokaly et al., oba jsou zde začleněny odkazem.

Emulze také obsahuje protipěňivé činidlo k minimalizaci pěnivosti po aplikaci na keratinovou tkáň. Protipěňivá činidla zahrnují silikony s vysokou molekulovou hmotností a další pro tento účel vhodné materiály známé odborníkům.

Vhodné emulze mají různou viskozitu v závislosti na požadované formě produktu.

Výhodné emulze voda v silikonu a olej ve vodě jsou podrobně popsány níže.

a) Emulze voda v silikonu

Emulze voda v silikonu jsou v oboru dobře známé a obsahují homogenní silikonovou fázi a dispergovanou vodnou fázi.

1) souvislá homogenní fáze

Výhodné emulze voda v silikonu předkládaného vynálezu obsahují 1 % až 80 %, výhodněji 5 % až 50 % a nejvýhodněji 5 % až 40 % hmotnostních homogenní silikonové fáze. Homogenní silikonová fáze je vnější fáze, která obsahuje nebo obklopuje nehomogenní vodnou fázi popsanou níže.

Homogenní silikonová fáze obsahuje organopolysiloxanový olej. Výhodně obsahuje 50 % až 99,9 % hmotnostních organopolysiloxanového oleje a méně než 50 % hmotnostních nesilikonového oleje. Zvláště výhodně obsahuje homogenní silikonová fáze alespoň 50 %, výhodněji 60 % až 99,9 %, ještě výhodněji 70 % až 99,9 % a nejvýhodněji 80 % až 99,9 % organopolysiloxanového oleje, vztaženo na hmotnost homogenní silikonové fáze, a dále obsahuje do 50 % nesilikonového oleje, výhodně méně než 40 %, výhodněji méně než 30 %, ještě výhodněji méně než 10 % a nejvýhodněji méně než 2 % nesilikonového oleje, vztaženo na hmotnost homogenní silikonové fáze. Tyto výhodné emulze dodávají prostředku větší stabilitu vůči oxidaci po delší dobu, v porovnání s emulzemi voda v oleji, které obsahují nižší koncentrace organopolysiloxanového oleje. Emulze voda v silikonu tohoto typu jsou popsány v PCT Application WO 97/21 423, vyd. 19.6.1997.

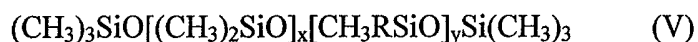
Vhodný organopolysiloxanový olej je těkavý, netěkavý, nebo směs těkavých a netěkavých silikonů. Termín „netěkavý“ značí ty silikony, které jsou za pokojových podmínek kapalně a mají teplotu vznícení (za tlaku 0,1 MPa) větší než 100 °C. Termín „těkavý“ označuje všechny ostatní silikonové oleje. Vhodné organopolysiloxany jsou vybrány z široké řady silikonů s různou těkavostí a viskozitou. Příklady vhodných organopolysiloxanových olejů zahrnují polyalkylsiloxany, cyklické polyalkylsiloxany a polyalkylarylsiloxany.

Vhodné polyalkylsiloxany zahrnují ty s viskozitou 0,005 až 10 000 cm².s⁻¹ při 25 °C. Takové polyalkylsiloxany mají obecný vzorec IV



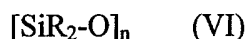
kde R je alkylová skupina mající 1 až 30 uhlíkových atomů (výhodně je R methyl nebo ethyl, výhodněji methyl; používají se i smíšené alkylové skupiny) a x je celé číslo od 0 do 10 000, vybrané k dosažení požadované molekulové hmotnosti, která se pohybuje v rozmezí do 10 000 000. Komerčně dostupné polyalkylsiloxany zahrnují polydimethylsiloxany, také známé jako dimethikony, jejichž příklady jsou Vicasil[®] série od fy General Electric Company a Dow Corning[®] série od fy Dow Corning Corporation. Konkrétními příklady jsou Dow Corning[®] 200 fluid mající viskozitu 0,0065 cm².s⁻¹ a teplotu varu 100 °C, Dow Corning[®] 225 fluid mající

viskozitu $0,1 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ a teplotu varu větší než 200°C a Dow Corning® 200 fluids mající viskozity $0,5$; $3,5$ a $125 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ a teplotu varu větší než 200°C . Vhodné dimethikony mají obecný vzorec V



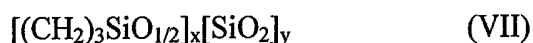
kde R je přímý nebo rozvětvený alkylový řetězec mající 2 až 30 uhlíkových atomů a x a y jsou celá čísla od 1 a větší, vybraná k dosažení požadované molekulové hmotnosti, která se pohybuje v rozmezí do 10 000 000. Příklady těchto alkylem substituovaných dimethikonů jsou dimethikon a lauryldimethikon.

Vhodné cyklické polyalkylsiloxany zahrnují ty obecného vzorce VI



kde R je alkylskupina (výhodně je R methyl nebo ethyl, výhodněji methyl) a n je celé číslo od 3 do 8, výhodně od 3 do 7 a výhodněji od 4 do 6. Pokud R je methyl, tyto materiály jsou nazývány cyklomethikony. Komerčně dostupné cyklomethikony zahrnují Dow Corning® 244 fluid mající viskozitu $0,025 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ a teplotu varu 172°C a primárně obsahující tetramer cyklomethikonu (tj. $n=4$), Dow Corning® 344 fluid mající viskozitu $0,025 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ a teplotu varu 178°C a primárně obsahující pentamer cyklomethikonu (tj. $n=5$), Dow Corning® 245 fluid mající viskozitu $0,042 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ a teplotu varu 205°C a primárně obsahující směs tetrameru a pentameru cyklomethikonu (tj. $n=4$ a 5) a Dow Corning® 345 fluid mající viskozitu $0,045 \text{ cm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$ a teplotu varu 217°C a primárně obsahující směs tetrameru, pentameru a hexameru cyklomethikonu (tj. $n=4, 5$ a 6).

Vhodné jsou také trimethylsiloxysilikáty, což je polymerní materiál obecného vzorce VII



kde x je celé číslo od 1 do 500 a y je celé číslo od 1 do 500. Komerčně dostupný trimethylsiloxysilikát je směs s dimethikonem pod názvem Dow Corning® 593 fluid.

Vhodné jsou také dimethikonoly obecného vzorce VIII a IX



kde R je alkylová skupina (výhodně je R methyl nebo ethyl, výhodněji methyl) a x je celé číslo od 0 do 500, vybrané k dosažení požadované molekulové hmotnosti. Komerčně dostupné dimethikonoly jsou směsi s dimethikonem nebo cyklomethikonem (tj. Dow Corning® fluid 1 401, 1 402 a 1 403).

Dále jsou vhodné polyalkylarylsiloxany. Zvláště jsou vhodné polymethylfenylsiloxany mající viskozitu 0,15 až 0,65 cm².s⁻¹ při 25 °C.

Výhodné organopolysiloxany jsou vybrány ze skupiny obsahující polyalkylsiloxany, alkylem substituované dimethikony, cyklomethikony, trimethylsiloxysilikáty, dimethikonoly, polyalkylarylsiloxany a jejich směsi. Výhodnější jsou polyalkylsiloxany a cyklomethikony. Mezi polyalkylsiloxany jsou výhodné dimethikony.

Jak bylo uvedeno výše, homogenní silikonová fáze obsahuje jeden nebo více nesilikonových olejů. Koncentrace nesilikonových olejů v této fázi je minimalizována, nebo nejsou použity vůbec, aby se dále zvýšila stabilita vybraného retinoidu v prostředku. Vhodné nesilikonové oleje mají teplotu tání 25 °C nebo nižší za tlaku 0,1 MPa. Příklady vhodných nesilikonových olejů použitelných v homogenní silikonové fázi jsou odborníkům dobře známe z prostředků péče o pokožku ve formě emulzí voda v oleji, např. olej minerální, rostlinný, syntetický, polosyntetický apod.

2) Dispergovaná vodná fáze

Prostředky k lokálnímu použití předkládaného vynálezu obsahují 20 % až 90 %, výhodně 30 % až 85 % a výhodněji 40 % až 80 % dispergované vodné fáze. U technologie emulzí je termín „dispergovaná fáze“ dobře známý odborníkům a znamená, že fáze je ve formě malých částecek nebo kapiček suspendovaných v a obklopených homogenní fází. Dispergovaná fáze je také známá jako vnitřní, nebo nesouvislá. Dispergovaná vodná fáze je disperzí malých kapiček vody suspendovaných v a obklopených homogenní silikonovou fází popsanou výše.

Vodná fáze je voda nebo kombinace vody a jedné nebo více ve vodě rozpustných složek. Nelimitujícími příklady takových složek jsou zahušřovadla, kyseliny, zásady, soli, chelatační činidla, gumy, ve vodě rozpustné nebo dispergovatelné alkoholy nebo polyoly, puify, konzervační látky, opalovací látky, barviva apod.

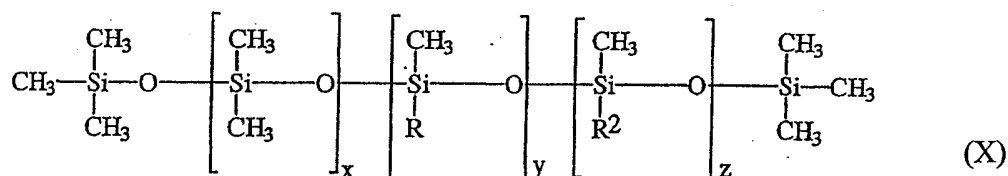
3) Emulgátor k disperzi vodné fáze

Emulze voda v silikonu obsahují kromě emulgátoru pro elastomer také jiný emulgátor. V některých prostředcích je obsaženo 0,1 % až 10 %, výhodně 0,5 % až 7,5 % a výhodněji 1 % až 5 % emulgátoru, vztaženo na hmotnost prostředku. Emulgátor pomáhá dispergovat a suspendovat vodnou fázi v homogenní silikonové fázi.

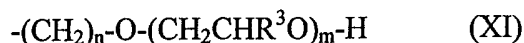
K vytvoření výhodných emulzí voda v silikonu je vhodná řada emulgátorů. Používají se známé nebo běžné emulgátory, pokud jsou chemicky a fyzikálně slučitelné se složkami prostředku a poskytují požadované dispergující vlastnosti. Vhodné emulgátory jsou silikonové nebo nesilikonové nebo jejich směsi, dobře známé odborníkům z prostředků péče o pokožku. Výhodné emulgátory mají hodnotu HLB menší než 14, výhodně 2 až 14, výhodněji 4 až 14. Emulgátory mající hodnotu HLB mimo toto rozmezí jsou použity v kombinaci s dalšími emulgátory, aby byl dosažen požadovaný průměr HLB.

Výhodné jsou silikonové emulgátory, použitelná je celá řada těchto emulgátorů. Typicky jsou silikonové emulgátory organicky modifikované organopolysiloxany, také známé jako silikonové povrchově aktivní látky. Vhodné silikonové emulgátory zahrnují kopolyoly dimethikonu. Jsou to polydimethylsiloxany modifikované tak, aby obsahovaly polyetherové postranní řetězce jako jsou polyethylenoxidové řetězce, polypropylenoxidové řetězce, jejich směsi a polyetherové řetězce obsahující skupiny odvozené od ethylenoxidu a propylenoxidu. Další příklady zahrnují alkylem modifikované kopolyoly dimethikonu, tj. sloučeniny obsahující C₂-C₃₀ postranní řetězce. Další vhodné kopolyoly dimethikonu obsahují různé kationogenní, anionogenní a amfoterní skupiny.

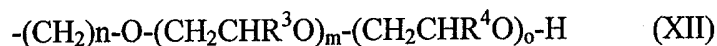
Vhodné emulgátory obsahující kopolyoly dimethikonu mají obecný vzorec X



kde R je C₁-C₃₀ přímý, rozvětvený nebo cyklický alkyl a R² je vybrán ze skupin obecného vzorce XI a XII

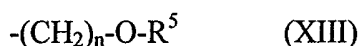


a



kde n je celé číslo od 3 do 10; R^3 a R^4 jsou vybrány z H a C_1-C_6 přímého nebo rozvětveného alkylového řetězce tak, že R^3 a R^4 nejsou současně stejné; m , o , x a y jsou vybrány tak, aby celková molekulová váha byla 200 až 10 000 000, přičemž m , o , x a y jsou nezávisle celá čísla od 0 a větší, kdy m a o nejsou současně nula a z je nezávisle celé číslo od 1 a větší. Bylo zjištěno, že se dají připravit polohové isomery těchto kopolyolů. Zobrazené skupiny pro R_2 jsou vybrány jako nelimitující příklady obsahující R^3 a R^4 .

Další vhodné materiály, ačkoliv nejsou klasifikovány jako kopolyoly dimethikonu, jsou silikonové povrchově aktivní látky zobrazené ve strukturách předešlého odstavce kde R^2 má obecný vzorec XIII



kde R^5 je kationogenní, anionogenní nebo amfoterní skupina.

Nelimitující příklady kopolyolů dimethikonu a dalších silikonových povrchově aktivních látek vhodných jako emulgátory zahrnují kopolymery polydimethylsiloxanpolyetheru s polyethylenoxidovými postranními řetězci, kopolymery polydimethylsiloxanpolyetheru s polypropylenoxidovými postranními řetězci, kopolymery polydimethylsiloxanpolyetheru s e směsnými polyethylenoxidovými a polypropylenoxidovými postranními řetězci, kopolymery polydimethylsiloxanpolyetheru se směsnými polyethylenoxidovými a polypropylenoxidovými postranními řetězci, kopolymery polydimethylsiloxanpolyetheru s organobetainovými postranními řetězci, kopolymery polydimethylsiloxanpolyetheru s karboxylátovými postranními řetězci, kopolymery polydimethylsiloxanpolyetheru s kvarterními amoniovými postranními řetězci; a další modifikace popsaných kopolymerů obsahujících C_2-C_{30} přímé, rozvětvené nebo cyklické alkylové skupiny. Příklady vhodných komerčně dostupných kopolyolů dimethikonu prodáváných fy Dow Corning Corporation jsou Dow Corning® 190, 193, Q2-5 220, 2 501 Wax, 2-5 324 fluid a 3 225C (tento poslední materiál je prodáván ve směsi s cyklomethikonem). Kopolyol cetyl dimethikonu je komerčně dostupný jako směs s polyglyceryl-4-isostearátu (a) hexyllaurátu pod obchodním názvem ABIL® WE-09 (dostupný u fy Goldschmidt). Kopolyol cetyl dimethikonu je také komerčně dostupný jako směs hexyllaurátu s polyglyceryl-3-oleátem (a) cetyl dimethikonu pod obchodním názvem ABIL® WS-08 (také dostupný u fy Goldschmidt). Další nelimitující příklady kopolyolů dimethikonu zahrnují kopolyol lauryl dimethikonu, dimethikonkopolyolacetát, dimethikonkopolyoladipát, dimethikonkopolyolamin, dimethikonkopolyolbehenát, dimethikonkopolyolbutylether, dimethikonkopolyolhydroxystearát, dimethikonkopolyolisostearát, dimethikonkopolyollaurát, dimethikonkopolyolmethylether,

dimethikonkopolyolfosfát a dimethikonkopolyolstearát, viz. International Cosmetic Ingredient Dictionary, Fifth Edition, 1993.

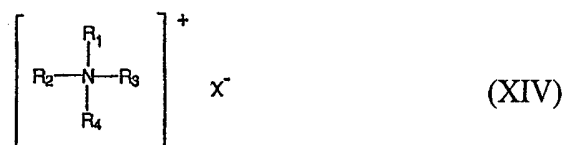
Vhodné emulgátory kopolyolů dimethikonu jsou popsány např. v U.S. Patent 4 960 764, Figueroa, Jr. et al., vyd. 2.10. 1990; European Patent EP 330 369, SanoGueira, vyd. 30.8.1989; G.H. Dahms, et al., „New Formulation Possibilities Offered by Silicone Copolyols“, Cosmetics & Toiletries, vol. 110, pp. 91-100, březen 1995; M.E. Carlotti et al., „Optimization of W/O-S Emulsions And Study Of The Quantitative Relationships Between Ester Structure And Emulsion Properties“, J. Dispersion Science And Technology, 13(3), 315-336(1992); P. Hameyer, „Comparative Technological Investigations of Organic and Organosilikone Emulsifiers in Cosmetic Water-in-Oil Emulsion Preparations“, HAPPI 28(4), pp. 88-128 (1991); J. Smid-Korbar et al., „Efficiency and usability of silicone surfactants in emulsions“, Provisional Communion, International Journal of Cosmetic Science, 12, 135-139 (1990); a D.G. Krzysik et al., „A New Silicone Emulsifier For Water-in.Oil Systems“, Drug and Cosmetic Industry, vol. 146(4) pp. 28-81 (duben 1990).

Mezi vhodnými nesilikonovými emulgátory jsou různá neionogenní a anionogenní emulgační činidla jako jsou cukerné estery a polyestery, alkoxylované cukerné estery a polyestery, C_1 - C_{30} estery mastných kyselin C_1 - C_{30} mastných alkoholů, alkoxylované deriváty C_1 - C_{30} esterů mastných kyselin C_1 - C_{30} mastných alkoholů, alkoxylované ethery C_1 - C_{30} mastných alkoholů, polyglycerylestery C_1 - C_{30} mastných kyselin, C_1 - C_{30} estery polyolů, C_1 - C_{30} ethery polyolů, alkylfosfáty, polyoxyalkylenfosfáty mastných etherů, amidy mastných kyselin, acyllaktyláty, mýdla a jejich směsi. Další vhodné emulgátory jsou popsány např. v McCutcheon's, Detergens and Emulsifiers, North American Edition (1986), vyd. Allured Publishing Corporation; U.S. Patent 5 011 681, Ciotti et al., vyd. 30.4. 1991; U.S. Patent 4 421 769, Dixon et al., vyd. 20.12. 1983; a U.S. Patent 3 755 560, Dickert et al., vyd. 28.8. 1973.

Další vhodné povrchově aktivní látky zahrnují širokou řadu kationogenních, anionogenních a amfoterních látek známých v oboru a popsanych níže. Viz např. McCutcheon's Detergents and Emulsifiers, North American Edition (1986), vyd. Allured Publishing Corporation; U.S. Patent 5 011 681, Ciotti et al., vyd. 30.4. 1991; U.S. Patent 4 421 769, Dixon et al., vyd. 20.12. 1983; a U.S. Patent 3 755 560, Dickert et al., vyd. 28.8. 1973; všechny čtyři jsou zde celé zahrnuty v odkazech. Vhodné hydrofilní povrchově aktivní látky obsahují jednu látku nebo kombinaci vhodných povrchově aktivních látek. Druh povrchově aktivní látky (látek) závisí na pH prostředí a dalších jeho složkách.

Vhodné kationogenní povrchově aktivní látky zahrnují dialkylové kvarterní amoniové sloučeniny, jejichž příklady jsou popsány v U.S. Patent 5 151 209; U.S. Patent 5 151 210; U.S.

Patent 5 120 532; U.S. Patent 4 387 090; U.S. Patent 3 155 591; U.S. Patent 3 929 678; U.S. Patent 3 959 461; McCutcheon's, Detergents & Emulsifiers, (North American Edition 1979) M.C. Publishing Co.; a Schwartz et al., Surface Active Agents, Their Chemistry and Technology, New York: Interscience Publishers, 1949; zde jsou zahrnuty v odkazech. Vhodné kationogenní povrchově aktivní látky také zahrnují kationogenní amoniové soli obecného vzorce XIV



kde R_1 je alkylová skupina mající 12 až 30 uhlíkových atomů, nebo aromatická arylová nebo alkarylová skupina mající 12 až 30 uhlíkových atomů; R_2 , R_3 a R_4 jsou nezávisle vybrány ze skupiny obsahující vodík, alkylovou skupinu mající 1 až 22 uhlíkových atomů, nebo aromatické arylové nebo alkarylové skupiny mající 12 až 22 uhlíkových atomů; a X je jakýkoliv slučitelný anion, výhodně vybraný ze skupiny obsahující chlorid, bromid, jodid, acetát, fosfát, nitrát, sulfát, methylsulfát, ethylsulfát, tosylát, laktát, citrát, glykolát a jejich směsi. Navíc alkylové skupiny substituentů R_1, R_2, R_3 a R_4 obsahují esterové a/nebo etherické vazby, nebo hydroxy nebo aminoskupinu (např. alkylové skupiny obsahují polyethylenglykolové a polypropylenglykolové skupiny).

Výhodně je R_1 alkylová skupina mající 12 až 22 uhlíkových atomů; R_2 je vodík nebo alkylová skupina mající 1 až 22 uhlíkových atomů; R_3 a R_4 jsou nezávisle vodík nebo alkylová skupina mající 1 až 3 uhlíkové atomy; a X je jak popsáno výše.

Výhodněji je R_1 alkylová skupina mající 12 až 22 uhlíkových atomů; R_2, R_3 a R_4 jsou vodík nebo alkylová skupina mající 1 až 3 uhlíkové atomy; a X je jak popsáno výše.

Eventuálně další vhodné kationogenní emulgátory zahrnují aminoamidy, kde v obecném vzorci XIV R_1 je $R_5\text{CONH}-(\text{CH}_2)_n$, kde R_5 je alkylová skupina mající 12 až 22 uhlíkových atomů a n je celé číslo od 2 do 6, výhodně od 2 do 4 a výhodněji od 2 do 3. Nelimitujícími příklady těchto emulgátorů jsou stearamidopropyl-PG-dimoniumchloridfosfát, behenamidopropyl-PG-dimoniumchlorid, stearamidopropylethylmoniumethosulfát, stearamidopropylmethyl(myristylacetát)amoniumchlorid, stearamidopropylmethylcetearylamoniumtosylát, stearamidopropylmethylamoniumchlorid, stearamidopropylmethylamoniumlaktát a jejich směsi. Výhodný je behenylamidopropyl-PG-dimoniumchlorid.

Nelimitující příklady kationogenních povrchově aktivních látek obsahujících kvarterní amoniové soli zahrnují cetylamoniumchlorid, cetylamoniumbromid, laurylamoniumchlorid, laurylamoniumbromid, stearylamoniumchlorid, stearylamoniumbromid, cetyldimethylamoniumchlorid, cetyldimethylamoniumbromid, lauryldimethylamoniumchlorid, lauryldimethylamoniumbromid, stearyldimethylamoniumchlorid, stearyldimethylamoniumbromid, cetyltrimethylamoniumchlorid, cetyltrimethylamoniumbromid, lauryltrimethylamoniumchlorid, lauryltrimethylamoniumbromid, stearyltrimethylamoniumchlorid, stearyltrimethylamoniumbromid, lauryldimethylamoniumchlorid, stearyldimethylcetyldi(lojový alkyl)dimethylamoniumchlorid, dicetylamoniumchlorid, dicetylamoniumbromid, dilaurylamoniumchlorid, dilaurylamoniumbromid, distearylamoniumchlorid, distearylamoniumbromid, dicetylmethylamoniumchlorid, dicetylmethylamoniumbromid, dilaurylmethylamoniumchlorid, dilaurylmethylamoniumbromid, distearylmethylamoniumchlorid, distearylmethylamoniumbromid a jejich směsi. Navíc kvarterní amoniové soli zahrnují ty, kde je C_{12} až C_{30} alkylový uhlíkový řetězec odvozený od mastných kyselin loje nebo kokosového oleje. Termín „lůj“ se vztahuje na alkylovou skupinu odvozenou od mastných kyselin loje (většinou hydrogenovaných mastných kyselin loje), které obecně obsahují směs alkylových řetězců od C_{16} do C_{18} . Termín „kokosový“ se vztahuje na alkylovou skupinu odvozenou od kokosových mastných kyselin, které obecně obsahují směs alkylových řetězců od C_{12} do C_{14} . Příklady kvarterních amoniových solí odvozených z tohoto lojového nebo kokosového zdroje zahrnují di(lojový alkyl)dimethylamoniumchlorid, di(lojový alkyl)dimethylamoniummethylsulfát, di(hydrogenovaný lojový alkyl)dimethylamoniumchlorid, di(hydrogenovaný lojový alkyl)dimethylamoniumacetát, di(lojový alkyl)dipropylamoniumfosfát, di(lojový alkyl)dimethylamoniumnitrát, di(kokosový alkyl)dimethylamoniumchlorid, di(kokosový alkyl)dimethylamoniumbromid, (lojový alkyl)amoniumchlorid, (kokosový alkyl)amoniumchlorid, stearamidopropyl-PG-dimoniumchloridfosfát, stearamidopropylethyldimoniumethosulfát, stearamidopropyl-dimethyl(myristylacetát)amoniumchlorid, stearamidopropyldimethylcetearylamoniumtosylát, stearamidopropyldimethylamoniumchlorid, stearamidopropyldimethylamoniumlaktát a jejich směsi. Příkladem kvarterní amoniové sloučeniny mající alkylovou skupinu s esterovou vazbou je di(lojový alkyl)oxyethyldimethylamoniumchlorid.

Výhodné kationogenní povrchově aktivní látky jsou vybrány ze skupiny obsahující behenamidopropyl-PG-dimoniumchlorid, dilauryldimethylamoniumchlorid, distearyldimethylamoniumchlorid, dimyristyldimethylamoniumchlorid, dipalmytyldimethylamoniumchlorid, distearyldimethylamoniumchlorid, stearamidopropyl-PG-dimoniumchloridfosfát, stearamidopropylethyldiamoniumethosulfát, stearamidopropyldimethyl(myristylacetát)amoniumchlorid,

stearamidopropyldimethylcetearylamoniumtosylát, stearamidopropyldimethylamoniumchlorid, stearamidopropyldimethylamoniumlaktát a jejich směsi.

Výhodnější kationogenní povrchově aktivní látky jsou vybrány ze skupiny obsahující behenamidopropyl-PG-dimoniumchlorid, dilauryldimethylamoniumchlorid, distearyldimethylamoniumchlorid, dimyristyldimethylamoniumchlorid, dipalmytyldimethylamoniumchlorid a jejich směsi.

Výhodná kombinace kationogenní povrchově aktivní látky a strukturujícího činidla je behenamidopropyl-PG-dimoniumchlorid a/nebo behenylalkohol, kde poměr je výhodně optimalizován, aby zvyšoval fyzikální a chemickou stabilitu, zvláště pokud taková kombinace obsahuje iontové a/nebo vysoce polární rozpouštědlo. Tato kombinace je zvláště vhodná k přenosu opalovacích látek jako je oxid zinečnatý a oktylmethoxycinamát.

Vhodná je řada anionogenních povrchově aktivních látek. Viz např. U.S. Patent 3 929 678, Laughlin et al., vyd. 30.12. 1975, zde zahrnut odkazem. Nelimitující příklady anionogenních povrchově aktivních látek zahrnují alkoylisethionáty, akyl a alkylethersulfáty. Alkoylisethionáty mají obecný vzorec XV



kde R je alkyl nebo alkenyl o 10 až 30 uhlíkových atomech a M je ve vodě rozpustný kation jako je amonium, sodík, draslík a triethanolamin. Nelimitující příklady isethionátů zahrnují alkoylisethionáty vybrané ze skupiny obsahující (kokosový alkyl)isethionát amonný, (kokosový alkyl)isethionát sodný, lauroylisethionát sodný, stearylisethionát sodný a jejich směsi.

b) Emulze olej ve vodě

Další vhodné povrchové nosiče zahrnují emulze olej ve vodě s homogenní vodnou fází a v ní dispergovanou hydrofobní ve vodě nerozpustnou fází („olejovou fází“). Příklady vhodných nosičů ve formě emulzí olej ve vodě jsou popsány v U.S. Patent 5 073 371, Turner, D.J. et al., vyd. 17.12 1991 a U.S. Patent 5 073 372, Turner, D.J. et al., vyd. 17.12 1991. Zvláště výhodné emulze olej ve vodě obsahující strukturující činidlo, hydrofilní povrchově aktivní látku a vodu jsou podrobně popsány dále.

1) Strukturující činidlo

Výhodné emulze olej ve vodě obsahují strukturující činidlo, které pomáhá vytvořit kapalnou krystalickou gelovou síť. Bez ohledu na teorii se má za to, že strukturující činidlo podporuje reologické vlastnosti prostředku, které přispívají k jeho stabilitě. Strukturující činidlo také plní funkci emulgátoru nebo povrchově aktivní látky. Výhodné prostředky předkládaného

vynálezu obsahují 0,5 % až 20 %, výhodněji 1 % až 10 % a nejvýhodněji 1 % až 5 % strukturujícího činidla, vztaženo na hmotnost prostředku.

Výhodná strukturující činidla zahrnují kyselinu stearovou, palmitovou, stearylalkohol, cetylalkohol, behenylalkohol, polyethylenglykoether stearylalkoholu mající průměrně 1 až 21 ethylenoxidových jednotek, polyethylenglykoether cetylalkoholu mající 1 až 5 ethylenoxidových jednotek a jejich směsi. Výhodnější strukturující činidla předkládaného vynálezu jsou vybrána ze skupiny obsahující stearylalkohol, cetylalkohol, behenylalkohol, polyethylenglykoether stearylalkoholu mající průměrně 2 ethylenoxidové jednotky (steareth-2), polyethylenglykoether stearylalkoholu mající průměrně 21 ethylenoxidových jednotek (steareth-21), polyethylenglykoether cetylalkoholu mající průměrně 2 ethylenoxidové jednotky a jejich směsi. Nejvýhodnější strukturující činidla jsou vybrána ze skupiny obsahující kyselinu stearovou, kyselinu palmitovou, stearylalkohol, cetylalkohol, behenylalkohol, steareth-2, steareth-21 a jejich směsi.

2) Hydrofilní povrchově aktivní látka

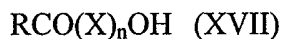
Výhodné emulze olej ve vodě obsahují 0,05 % až 10 %, výhodněji 1 % až 6 % a nejvýhodněji 1 % až 4 % alespoň jedné hydrofilní povrchově aktivní látky, která disperguje hydrofobní materiály ve vodné fázi (procenta vztažena na hmotnost povrchového nosiče). Povrchově aktivní látka musí být přinejmenším natolik hydrofilní, aby se dispergovala ve vodě.

Výhodné hydrofilní povrchově aktivní látky jsou vybrány z neionogenních povrchově aktivních látek. Mezi ně patří ty, které jsou definovány jako kondenzační produkty alkoholů s dlouhým řetězcem, např. C_8 - C_{30} alkoholů s cukernými nebo škrobovými polymery, tj. glykosidy. Tyto sloučeniny jsou charakterizovány obecným vzorcem XVI



kde S je cukerná skupina jako je glukóza, fruktóza, manóza a galaktóza; n je celé číslo od 1 do 1 000 a R je C_8 - C_{30} alkylová skupina. Příklady alkoholů s dlouhým řetězcem, od kterých je alkylová skupina odvozena, zahrnují decylalkohol, cetylalkohol, stearylalkohol, laurylalkohol, myristylalkohol, oleylalkohol apod. Výhodné příklady těchto povrchově aktivních látek zahrnují ty, kde S je glukózová skupina, R je C_8 - C_{20} alkylová skupina a n je celé číslo od 1 do 9. Komerčně dostupné příklady těchto povrchově aktivních látek zahrnují decylpolyglukosid (dostupný jako APG 325 CS od fy Henkel) a laurylpolyglukosid (dostupný jako APG 600 CS a 625 CS od fy Henkel).

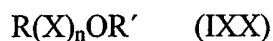
Další vhodné neionogenní povrchově aktivní látky zahrnují kondenzační produkty alkylenoxidů s mastnými kyselinami (tj. alkylenoxidestery mastných kyselin). Tyto materiály mají obecný vzorec XVII



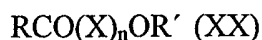
kde R je C_{10-30} alkylová skupina, X je $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ (tj. odvozena od ethylenglykolu nebo oxidu) nebo $-\text{OCH}_2\text{CHCH}_3-$ (tj. odvozena od propylenglykolu nebo oxidu) a n je celé číslo od 6 do 200. Další neionogenní povrchově aktivní látky jsou kondenzačními produkty alkylenoxidů se 2 moly mastných kyselin (tj. alkylenoxiddiestery mastných kyselin). Tyto materiály mají obecný vzorec XVIII



kde R je C_{10-30} alkylová skupina, X je $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ (tj. odvozena od ethylenglykolu nebo oxidu) nebo $-\text{OCH}_2\text{CHCH}_3-$ (tj. odvozena od propylenglykolu nebo oxidu) a n je celé číslo od 6 do 100. Další neionogenní povrchově aktivní látky jsou kondenzačními produkty alkylenoxidů s mastnými alkoholy (tj. alkylenoxidethery mastných alkoholů). Tyto materiály mají obecný vzorec IXX



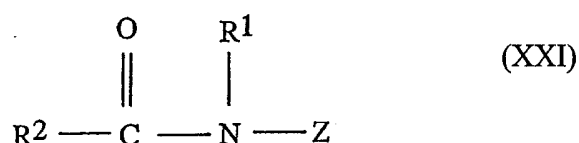
kde R je C_{10-30} alkylová skupina, X je $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ (tj. odvozena od ethylenglykolu nebo oxidu) nebo $-\text{OCH}_2\text{CHCH}_3-$ (tj. odvozena od propylenglykolu nebo oxidu), n je celé číslo od 6 do 100 a R' je H nebo C_{10-30} alkylová skupina. další neionogenní povrchově aktivní látky jsou kondenzačními produkty alkylenoxidů s mastnými kyselinami a mastnými alkoholy (tj. kde polyalkylenoxidová část je na jednom konci esterifikována mastnou kyselinou a etherifikována – tj. připojena přes etherovou vazbu- na druhém konci mastným alkoholem). Tyto materiály mají obecný vzorec XX



kde R a R' jsou C_{10-30} alkylové skupiny, X je $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ (tj. odvozena od ethylenglykolu nebo oxidu) nebo $-\text{OCH}_2\text{CHCH}_3-$ (tj. odvozena od propylenglykolu nebo oxidu) a n je celé číslo od 6

do 100. Nelimitující příklady těchto alkylenoxidů odvozených od neionogenních povrchově aktivních látek zahrnují ceteth-6, ceteth-10, ceteth-12, cetareth-6, cetareth-10, cetareth-12, steareth-6, steareth-10, steareth-12, steareth-21, PEG-6 stearát, PEG-10 stearát, PEG-100 stearát, PEG-12 stearát, PEG-20 glycerylsteárá, PEG-80 glyceryl(lojový alkylát), PEG-10 glycerylsteárá, PEG-30 glyceryl(kokosový alkylát), PEG-80 glyceryl(kokosový alkylát), PEG-200 glyceryl(lojový alkylát), PEG-8 dilaurát, PEG-10 distearát a jejich směsi.

Další vhodné neionogenní povrchově aktivní látky zahrnují amidy polyhydroxy mastných kyselin obecného vzorce XXI



kde R^1 je H, C_1 - C_4 alkyl, 2-hydroxyethyl, 2-hydroxypropyl, výhodně C_1 - C_4 alkyl, výhodněji methyl nebo ethyl, nejvýhodněji methyl; R^2 je C_5 - C_{31} alkyl nebo alkenyl, výhodně C_7 - C_{19} alkyl nebo alkenyl, výhodněji C_9 - C_{17} alkyl nebo alkenyl, nejvýhodněji C_{11} - C_{15} alkyl nebo alkenyl; a Z je cukerná skupina mající přímý řetězec s alespoň 3 hydroxyly nebo alkoxyly (výhodně ethoxyly nebo propoxyly) přímo na cukerné jednotce. Z je výhodně cukerná skupina vybraná ze skupiny obsahující glukózu, fruktózu, maltózu, laktózu, galaktózu, manózu, xylózu a jejich směsi. Zvláště výhodná povrchově aktivní látka odpovídající výše uvedené struktuře je (kokosový alkyl)-N-methylglukosamid (tj. kde $\text{R}^2\text{CO}-$ je odvozena od mastných kyselin kokosového oleje). Způsoby přípravy prostředků obsahujících polyhydroxyamidy mastných kyselin jsou zahrnuty např. v G.B. Patent Specification 809 060, vyd. 18.2. 1959, Thomas Hedley & Co., Ltd.; U.S. Patent 2 965 576, E.R. Wilson, vyd. 20.12. 1960; U.S. Patent 2 703 798, A.M. Schwartz, vyd. 8.3. 1955; a U.S. Patent 1 985 424, Piggott, vyd. 25.12. 1934; které jsou zde zahrnuty odkazy.

Výhodné neionogenní povrchově aktivní látky jsou vybrány ze skupiny obsahující steareth-21, cetareth-20, cetareth-12, kokosový alkylát sacharózy, steareth-100, PEG-100 stearát a jejich směsi.

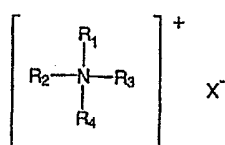
Další vhodné neionogenní povrchově aktivní látky zahrnují cukerné estery a polyestery, alkoxylované cukerné estery a polyestery, C_1 - C_{30} estery mastných kyselin C_1 - C_{30} mastných alkoholů, alkoxylované deriváty C_1 - C_{30} esterů mastných kyselin C_1 - C_{30} mastných alkoholů, alkoxylované ethery C_1 - C_{30} mastných alkoholů, polyglycerylestery C_1 - C_{30} mastných kyselin, C_1 - C_{30} estery polyolů, C_1 - C_{30} ethery polyolů, alkylfosfáty, polyoxyalkylen etherfosfáty, amidy mastných kyselin, acyllaktyláty a jejich směsi. Nelimitujícími příklady těchto emulgátorů zahrnují

polyethylenglykol 20 sorbitanmonolaurát (Polysorbate 20), polyethylenglykol 5 sojový sterol, Steareth-20, Cetareth-20, PPG-2 methylglukózový etherdistearát, Ceteth-10, Polysorbate 80, cetylfosfát, cetylfosfát draselný, diethanolamincetylfosfát, Polysorbate 60, glycerylstearát, polyoxyethylen 20 sorbitantrioleát (Polysorbate 85), sorbitanmonolaurát, polyoxyethylen 4 lauryletherstearát sodný, polyglyceryl-4 isostearát, hexyllaurát, PPG-2 methylglukózový etherdistearát, PEG-100 stearát a jejich směsi.

Další skupinou vhodných neionogenních povrchově aktivních látek jsou směsi esterů mastných kyselin založených na směsi esterů mastných kyselin se sorbitanem nebo sorbitolem a esterů mastných kyselin se sacharózou. V každém případě je mastná kyselina výhodně C_8-C_{24} , výhodněji $C_{10}-C_{20}$. Výhodný emulgátor obsahující ester mastné kyseliny je směs esterů $C_{16}-C_{20}$ mastných kyselin se sorbitanem nebo sorbitolem a esteru $C_{10}-C_{16}$ mastné kyseliny se sacharózou, zvláště sorbitansteáráť a ester kokosových mastných kyselin se sacharózou. Jsou komerčně dostupné u fy ICI pod obchodním názvem Arlatone 2 121.

Další vhodné povrchově aktivní látky zahrnují širokou řadu kationogenních, anionogenních a amfoterních látek známých v oboru a popsanych podrobně níže. Viz. např. McCutcheon's, Detergents and Emulsifiers, North American Edition (1986), vyd. Allured publishing Corporation; U.S. Patent 5 011 681, Ciotti et. al., vyd. 30.4. 1991; U.S. Patent 4 421 769, Dixon et al., vyd. 20.12 1983; U.S. Patent 3 755 560, Dickert et al., vyd. 28.8. 1973; zde zahrnutý odkazem. Vhodné hydrofilní povrchově aktivní látky obsahují jednu látku, nebo jakoukoliv kombinaci vhodných povrchově aktivních látek. Zvolený druh povrchově aktivní látky (nebo látek) závisí na pH prostředí a dalších jeho složkách.

Vhodné jsou také kationogenní povrchově aktivní látky, zvláště dialkylové kvarterní amoniové sloučeniny, jejichž příklady jsou popsány v U.S. Patent 5 151 209; U.S. Patent 5 151 210; U.S. Patent 5 120 532; U.S. Patent 4 387 090; U.S. Patent 3 155 591; U.S. Patent 3 929 678 a U.S. Patent 3 959 461; v McCutcheon's, Detergents and Emulsifiers, (North American Edition 1979) M.C. Publishing Co.; a Schwartz, et al., Surface Active Agents, Their Chemistry and Technology, New York: Interscience Publishers, 1949; zde zahrnutý odkazy. Vhodné kationogenní povrchově aktivní látky zahrnují kationogenní amoniové soli obecného vzorce XXII



(XXII)

kde R_1 je alkylová skupina mající 12 až 30 uhlíkových atomů, nebo aromatická, arylová nebo alkarylová skupina mající 12 až 30 uhlíkových atomů; R_2 , R_3 a R_4 jsou nezávisle vybrány ze skupiny obsahující vodík, alkylovou skupinu mající 1 až 22 uhlíkových atomů, nebo aromatické, arylové nebo alkarylové skupiny mající 12 až 22 uhlíkových atomů; a X je jakýkoliv slučitelny anion, výhodně chlorid, bromid, jodid, acetát, fosfát, nitrát, sulfát, methylsulfát, ethylsulfát, tosylát, laktát, citrát, glykolát a jejich směsi. Navíc alkylová skupina R_1 , R_2 , R_3 a R_4 obsahuje esterové a/nebo etherické vazby, nebo hydroxy nebo aminoskupiny (např. alkylové skupiny obsahují polyethylenglykolové a polypropylenglykolové skupiny).

Výhodněji je R_1 alkylová skupina mající 12 až 22 uhlíkových atomů; R_2 je vodík nebo alkylová skupina mající 1 až 22 uhlíkových atomů; R_3 a R_4 jsou nezávisle vodík nebo alkylová skupina mající 1 až 3 uhlíkové atomy; a X je jak popsáno výše.

Nejvýhodněji je R_1 alkylová skupina mající 12 až 22 uhlíkových atomů; R_2 , R_3 a R_4 jsou vodík nebo alkylová skupina mající 1 až 3 uhlíkové atomy; a X je jak popsáno výše.

Alternativně další vhodné kationogenní emulgátory zahrnují aminoamidy, kde ve výše popsaném obecném vzorci XXII R_1 je $R_5\text{CONH}-(\text{CH}_2)_n$, kde R_5 je alkylová skupina mající 12 až 22 uhlíkových atomů a n je celé číslo od 2 do 6, výhodně od 2 do 4 a výhodněji od 2 do 3. Nelimitujícími příklady těchto kationogenních emulgátorů zahrnují stearamidopropyl PG dimonium chlorid a fosfát, behenamidopropyl PG dimoniumchlorid, stearamidopropylethyl-dimoniumethosulfát, stearamidopropyldimethyl (myristylacetát) amoniumchlorid, stearamidopropyldimethylcetearylamoniumtosylát, stearamidopropyldimethylamoniumchlorid, stearamidopropyldimethylamoniumlaktát a jejich směsi. Zvláště výhodný je behenamidopropyl PG dimoniumchlorid.

Nelimitující příklady kationogenních povrchově aktivních látek obsahujících kvarterní amoniové soli jsou vybrány ze skupiny obsahující cetylamoniumchlorid, cetylamoniumbromid, laurylamoniumchlorid, laurylamoniumbromid, stearylamoniumchlorid, stearylamoniumbromid, cetyldimethylamoniumchlorid, cetyldimethylamoniumbromid, lauryldimethylamoniumchlorid, lauryldimethylamoniumbromid, stearyldimethylamoniumchlorid, stearyldimethylamoniumbromid, cetyltrimethylamoniumchlorid, cetyltrimethylamoniumbromid, lauryltrimethylamoniumchlorid, lauryltrimethylamoniumbromid, stearyltrimethylamoniumchlorid, stearyltrimethylamoniumbromid, lauryldimethylamoniumchlorid, stearyldimethylcetyldi(lojový alkyl)dimethylamoniumchlorid, dicetylamoniumchlorid, dicetylamoniumbromid, dilaurylamoniumchlorid, dilaurylamoniumbromid, distearylamoniumchlorid, distearylamoniumbromid, dicetylmethylamoniumchlorid, dicetylmethylamoniumbromid, dilaurylmethylamoniumchlorid,

dilaurylmethylamoniumbromid, distearylmethylamoniumchlorid, distearylmethylamoniumbromid a jejich směsi. Navíc kvarterní amoniové soli zahrnují ty, kde C_{12} až C_{30} alkylový uhlíkový řetězec je odvozen z mastných kyselin loje nebo kokosových mastných kyselin. Termín „lojový“ přísluší alkylové skupině odvozené z mastných kyselin loje (obvykle hydrogenovaných mastných kyselin loje), které mají směs alkylových řetězců od C_{16} do C_{18} . Termín „kokosový“ přísluší alkylové skupině odvozené z mastných kyselin kokosu, které mají směs alkylových řetězců od C_{12} do C_{14} . Příklady kvarterních amoniových solí odvozených z těchto lojových a kokosových zdrojů zahrnují di(lojový alkyl)dimethylamoniumchlorid, di(lojový alkyl)dimethylamoniummethylsulfát, di(hydrogenovaný lojový alkyl)dimethylamoniumchlorid, di(hydrogenovaný lojový alkyl)dimethylamoniumacetát, di(lojový alkyl)dipropylamoniumfosfát, di(lojový alkyl)dimethylamoniumnitrat, di(kokosový alkyl)dimethylamoniumchlorid, di(kokosový alkyl)dimethylamoniumbromid, (lojový alkyl)amoniumchlorid, (kokosový alkyl)amoniumchlorid, stearamidopropyl PG dimoniumchlorid a fosfát, stearamidopropylethyldimoniumethosulfát, stearamidopropyldimethyl(myristylacetát)amoniumchlorid, stearamidopropyldimethylcetearylamoniumtosylát, stearamidopropyldimethylamoniumchlorid, stearamidopropyldimethylamoniumlaktát a jejich směsi. Příkladem kvarterní amoniové sloučeniny mající alkylovou skupinu s esterovou vazbou je di(lojový alkyl)oxyethyldimethylamoniumchlorid.

Výhodnější kationogenní povrchově aktivní látky jsou vybrány ze skupiny obsahující behenamidopropyl PG dimoniumchlorid, dilauryldimethylamoniumchlorid, distearyldimethylamoniumchlorid, dimyristyldimethylamoniumchlorid, dipalmityldimethylamoniumchlorid, distearyldimethylamoniumchlorid, stearamidopropyl PG dimoniumchlorid a fosfát, stearamidopropylethyldimoniumethosulfát, stearamidopropyldimethyl (myristylacetát) amoniumchlorid, stearamidopropyldimethylcetearylamoniumtosylát, stearamidopropyldimethylamoniumchlorid, stearamidopropyldimethylamoniumlaktát a jejich směsi.

Nejvýhodnější kationogenní povrchově aktivní látky jsou vybrány ze skupiny obsahující behenamidopropyl PG dimoniumchlorid, dilauryldimethylamoniumchlorid, distearyldimethylamoniumchlorid, dimyristyldimethylamoniumchlorid, dipalmityldimethylamoniumchlorid a jejich směsi.

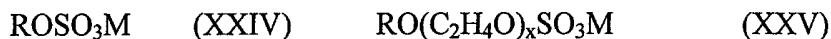
Výhodná kombinace kationogenní povrchově aktivní látky a strukturujícího činidla je behenamidopropyl PG dimoniumchlorid a/nebo behenylalkohol, kde poměr je výhodně optimalizován, aby podpořil fyzikální a chemickou stabilitu, zvláště pokud tato kombinace obsahuje ionogenní a/nebo vysoce polární rozpouštědla. Tato kombinace je zvláště vhodná k přenosu opalovacích činidel jako je oxid zinečnatý a oktylmethoxycinamát.

Vhodná je také řada anionogenních povrchově aktivních látek. Viz. např. U.S. Patent 3 929 678, Laughlin et al., vyd. 30.12. 1975, zde zahrnut odkazem. Nelimitující příklady anionogenních povrchově aktivních látek zahrnují alkoylisethionáty a alkylsulfáty a alkylethersulfáty. Alkoylisethionáty mají obecný vzorec XXIII

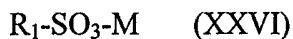


kde R je alkyl nebo alkenyl s 10 až 30 uhlíkovými atomy a M je ve vodě rozpustný kation jako je amonium, sodík, draslík a triethanolamin. Nelimitující příklady isethionátů zahrnují amonium(kokosový alkyl)isethionát, (kokosový alkyl)isethionát sodný, laurylisethionát sodný, stearylisethionát sodný a jejich směsi.

Alkyl a alkylethersulfáty mají obecné vzorce XXIV a XXV



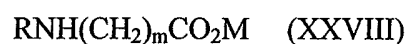
kde R je alkyl nebo alkenyl s 10 až 30 uhlíkovými atomy, x je celé číslo od 1 do 10 a M je ve vodě rozpustný kation jako je amonium, sodík, draslík a triethanolamin. Další vhodná třída anionogenních povrchově aktivních látek jsou ve vodě rozpustné soli produktů reakcí organických sulfokyselin obecného vzorce XXVI



kde R_1 je vybráno ze skupiny obsahující nasycené uhlovodíkové radikály s přímým nebo rozvětveným řetězcem mající 8 až 24, výhodně 10 až 16, uhlíkových atomů a M je kation. Další anionogenní syntetické povrchově aktivní látky zahrnují třídu označovanou jako sukcinamáty, olefinsulfonáty mající 12 až 24 uhlíkových atomů a β -alkyloxyalkansulfonáty. Příklady těchto materiálů jsou laurylsulfát sodný a laurylsulfát amonný.

Další vhodné anionogenní materiály jsou mýdla (tj. soli alkalických kovů, např. sodné nebo draselné soli) mastných kyselin, typicky mající 8 až 24 uhlíkových atomů, výhodně 10 až 20 uhlíkových atomů. Mastné kyseliny používané k výrobě mýdel se získají z přírodních zdrojů jako jsou např. rostlinné nebo živočišné glyceridy (např. olej palmový, kokosový, sojový, ricinový, lůj, sádlo apod.). Mastné kyseliny jsou připravovány také synteticky. Mýdla jsou podrobně popsána v U.S. Patent 4 557 853.

Vhodné jsou také amfoterní povrchově aktivní látky. Příklady vhodných amfoterních povrchově aktivních látek jsou popisovány jako deriváty alifatických sekundárních a terciárních aminů, kde alifatický radikál je přímý nebo rozvětvený řetězec a kde jeden z alifatických substituentů obsahuje 8 až 22 uhlíkových atomů (výhodně C₈-C₁₈) a jeden obsahuje anionogenní rozpustnost ve vodě podporující skupinu, např. skupinu karboxy, sulfonát, sulfát, fosfát nebo fosfonát. Příklady jsou alkyliminoacetáty, iminodialkanoáty a aminoalkanoáty obecných vzorců XXII a XXIII



kde m je celé číslo od 1 do 4, R je C₈-C₂₂ alkyl nebo alkenyl a M je vodík, alkalický kov, kov alkalických zemin, amonium nebo alkylamonium. Také jsou zahrnuty imidazolinium a deriváty amonia. Specifické příklady amfoterních povrchově aktivních látek zahrnují 3-dodecyl-amino-propionát sodný, 3-dodecylaminopropansulfonát sodný, N-alkyltauriny jako je ten připravený reakcí dodecylaminu s isethionátem sodným podle U.S. Patent 2 658 072, zde zahrnutý odkazem; vyšší N-alkylasparagové kyseliny jako ty vyrobené podle U.S. Patent 2 438 091, zde zahrnut odkazem; a produkty prodávané pod názvem „Miranol“ popsané v U.S. Patent 2 528 378, zde zahrnut odkazem. Další příklady vhodných amfoterních látek zahrnují fosfáty, jako je koamidopropyl PG dimoniumchlorid a fosfát (komerčně dostupný jako Monaquat PTC od fy Mona Corp.).

Další amfoterní povrchově aktivní látky zahrnují betainy. Jejich příklady zahrnují vyšší alkylbetainy jako je (kokosový alkyl)dimethylkarboxymethylbetain, lauryldimethylkarboxymethylbetain, lauryldimethyl- α -karboxyethylbetain, cetyldimethylkarboxymethylbetain, cetyl-dimethylbetain (dostupný jako Lonzaine 16SP od fy Lonza Corp.), lauryl-bis-(2-hydroxyethyl)karboxybetain, stearyl-bis-(2-hydroxypropyl)karboxymethylbetain, oleyldimethyl- γ -karboxypropylbetain, lauryl-bis-(2-hydroxypropyl)- α -karboxyethylbetain, (kokosový alkyl)dimethylsulfopropylbetain, stearyldimethylsulfopropylbetain, lauryldimethylsulfoethylbetain, lauryl-bis-(2-hydroxyethyl)sulfopropylbetain, amidobetainy a amidosulfobetainy (dostupné jako amfoterní Velvetex OLB-50 od fy Henkel) a (kokosový alkyl)amidopropylbetain (dostupný jako Velvetex BK-35 a BA-35 od fy Henkel).

Další vhodné amfoterní povrchově aktivní látky zahrnují sultainy a hydroxysultainy jako je (kokosový alkyl)amidopropylhydroxysultain (dostupný jako Mirataine CBS od fy Rhone-Poulenc) a alkanoylsarkosináty obecného vzorce XXIX

kde R je alkyl nebo alkenyl s 10 až 20 uhlíkovými atomy a M je ve vodě rozpustný kation jako je amonium, sodík, draslík a trialkanolamin (např. triethanolamin). Výhodným příkladem je laurylsarkosinát sodný.

3) Voda

Výhodná forma emulze olej ve vodě obsahuje 25 % až 98 %, výhodněji 40 % až 95 % a nejvýhodněji 50 % až 90 % vody, vztaženo na hmotnost prostředku.

Hydrofobní fáze je dispergována v homogenní vodné fázi. Hydrofobní fáze obsahuje ve vodě nerozpustné nebo částečně rozpustné materiály známé v oboru, včetně, ale ne omezeně na, silikony popsané v emulzích silikon ve vodě a další oleje a lipidy popsané v emulzích.

Prostředky podle vynálezu vhodné k čištění obsahují vhodný nosný systém, např. jak popsáno výše a výhodně obsahují 1 % až 90 %, výhodněji 5 % až 10 %, dermatologicky přijatelné povrchově aktivní látky. Povrchově aktivní látka je výhodně anionogenní, kationogenní, amfoterní nebo amfolytická, stejně jako směs těchto látek. Takové látky jsou známé v oboru čistících prostředků. Nelimitující příklady vhodných povrchově aktivních látek zahrnují isoceteth-20, methyl(kokosový alkyl)taurát sodný, methyloleyltaurát sodný a laurylsulfát sodný. Viz. U.S. Patent 4 800 197, Kowcz et al., vyd. 24.1. 1989, zde zahrnut odkazem. Široká řada dalších vhodných povrchově aktivních látek je popsána v McCutcheon's Detergents and Emulsifiers, North American edition (1986), vyd. Allured Publishing Corporation. Čistící prostředky dále obsahují další materiály běžně používané u čistících prostředků.

Konkrétní forma čistících prostředků není podstatná. Prostředky jsou dodávány např. ve formě toaletních tyčinek, kapalin, šamponů, koupelových gelů, vlasových kondicionérů, vlasových tonik, past nebo pěn. Čistící prostředky, které se oplachují, potřebují patřičný nosný systém, který zajistí dopravu dostatečného množství účinných látek k pokožce. Výhodný nosný systém zahrnuje použití nerozpustných komplexů. Podrobnější údaje o těchto nosných systémech jsou v U.S. Patent 4 835 148, Barford et al., vyd. 30.5. 1989.

VOLITELNÉ SLOŽKY

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují jednu nebo více dalších látek péče o pokožku. Výhodné prostředky určené pro kontakt s keratinovou tkání obsahují další složky, které

musí být vhodné k aplikaci na lidskou keratinovou tkáň, aniž by z lékařského hlediska působily toxicky, vyvolávaly nestabilitu, neslučitelnost, alergickou reakci apod.

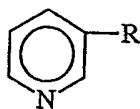
V CTFA Cosmetic Ingredients Handbook, Second Edition (1992) je popsána řada nelimitujících kosmetických a farmaceutických složek běžně používaných v průmyslu péče o pokožku, které jsou vhodné k použití v prostředcích předkládaného vynálezu. Příklady tříd těchto složek jsou esenciální oleje, adstringencia (např. hřebíčková silice, mentol, kafr, eukalyptový olej, eugenol, menthyllaktát, destilát z vilínu), činnidla proti akné, činnidla proti vysušování, protipěnivá činnidla, antioxidanty, pojiva, biologické látky, pufrací činnidla, činnidla na bobtnání, chelatační činnidla, chemické látky, kosmetická adstringencia, kosmetické biocidy, denaturanty, léčivá adstringencia, zevní analgetika, látky vytvářející film, např. polymery pomáhající k tvorbě filmu a stálosti prostředku (např. kopolymer eikosenu a vinylpyrrolidonu), opalescenční činnidla, činnidla k nastavení pH, konzervační látky, hnací plyny, redukční činnidla, pokožku bělící a zjasňující činnidla (např. hydrochinon, kyselina kojová, kyselina askorbová, askorbylglukosamin), činnidla k péči o pokožku (např. zvlhčovač a okluziva), pokožku zklidňující a/nebo léčící činnidla (např. panthenol a deriváty jako ethylpanthenol, aloe vera, kyselina pantothenová a její deriváty, allantoin, bisabolol a glycyrrhizinát draselný), o pokožku pečující činnidla, zahušťovač a vitaminy a jejich deriváty.

V jakékoliv části předkládaného vynálezu jsou ale vhodné účinné látky rozděleny také podle účinků a vlivů, které vykazují. Je jasné, že některé účinné látky v některých případech poskytují více než jednu výhodu a působí více směry. Proto jsou uvedené kategorie použity pro zjednodušení a nijak účinné látky nelimitují pouze k dané nebo uvedené aplikaci.

Sloučeniny vitamínu B₃

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují v některých případech sloučeniny vitamínu B₃ (jiné než niacinamid). Prostředky obsahují 0,01 % až 50 %, výhodně 0,1 % až 10 %, výhodněji 0,5 % až 10 % a nejvýhodněji 1 % až 5 % sloučeniny vitamínu B₃, vztaženo na hmotnost prostředku.

„Sloučenina vitamínu B₃“ znamená sloučeninu obecného vzorce XXX



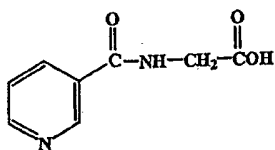
(XXX)

kde R je $-\text{COOH}$ (tj. kyselina nikotinová) nebo $-\text{CH}_2\text{OH}$ (tj. nikotinyllkohol); její deriváty a soli.

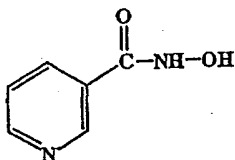
Příklady těchto sloučenin vitamínu B₃ zahrnují estery kyseliny nikotinové včetně cévy nerozšiřujících esterů kyseliny nikotinové, nikotinyllaminokyseliny a nikotinyllkoholestery karboxylových kyselin.

Vhodné estery kyseliny nikotinové zahrnují estery nikotinové kyseliny C₁-C₂₂, výhodně C₁-C₁₆, výhodněji C₁-C₆ alkoholů. Alkoholy mají výhodně přímý nebo rozvětvený řetězec, jsou cyklické, acyklické, nasycené nebo nenasycené (včetně aromatických) a substituované nebo nesubstituované. Estery výhodně nezpůsobují zarudnutí. Termín „zarudnutí“ znamená, že ester běžně nevyvolá po aplikaci na pokožku viditelné zčervenání (většina populace nezaznamená žádné zarudnutí, ačkoliv takové sloučeniny mohou způsobit vasodilataci neviditelnou pouhým okem). Případně se takový materiál, který způsobuje zarudnutí ve vyšších dávkách, použije v nižších dávkách, aby se zarudnutí zredukovalo. Estery nikotinové kyseliny nezpůsobující zarudnutí zahrnují tokoferolnikotinát a inositolhexanikotinát; výhodný je tokoferolnikotinát.

Další deriváty sloučenin vitamínu B₃ jsou deriváty niacinamidu vzniklé substitucí jednoho nebo více vodíků v amidové skupině. Nelimitující příklady vhodných derivátů niacinamidu zahrnují nikotinyllaminokyseliny odvozené např. z reakce aktivované sloučeniny kyseliny nikotinové (např. azid kyseliny nikotinové nebo nikotinyllchlorid) s aminokyselinou a nikotinyllkoholestery organických karboxylových kyselin (např. C₁-C₁₈). Specifickými příklady jsou kyselina nikotinmočová obecného vzorce XXXI a kyselina nikotinyllhydroxamová obecného vzorce XXXII



(XXXI)



(XXXII)

Příklady nikotinyllkoholestery zahrnují nikotinyllkoholestery karboxylových kyselin, kyseliny salicylové, kyseliny glykolové, kyseliny palmitové apod. Dalšími nelimitujícími příklady vhodných sloučenin vitamínu B₃ jsou 2-chlornikotinamid, 6-aminonikotinamid, 6-methylnikotinamid, n-methyl.nikotinamid, n,n-diethylnikotinamid, n-(hydroxymethyl)-

-nikotinamid, imid kyseliny chinolinové, nikotinamid, n-benzylnikotinamid, n-ethylnikotinamid, nifenazon, nikotinaldehyd, kyselina isonikotinová, kyselina methylisonikotinová, thionikotinamid, nialamid, 1-(3-pyridylmethyl)močovina, kyselina 2-merkaptonikotinová, nikomol a niaprazin.

Příklady těchto sloučenin jsou v oboru dobře známé a komerčně dostupné z mnoha zdrojů, např. od fy Sigma Chemical Company (St. Louis, MO); ICN Biomedicals, Inc. (Irvin, CA) a Aldrich Chemical Company (Milwaukee, WI).

Soli, deriváty a solné deriváty niacinamidu jsou výhodně ty, které mají stejné účinky na regulaci stavu pokožky jako niacinamid, jak popsáno výše.

Nelimitujícími příklady vhodných solí vitamínu B₃ jsou organické nebo anorganické soli jako jsou anorganické soli (např. chlorid, bromid, jodid, karbonát, výhodně chlorid) a organické soli karboxylových kyselin (včetně mono-, di- a tri- solí C₁-C₁₈ karboxylových kyselin, např. acetát, salicylát, glykolát, laktát, malát, citrát, výhodně acetát). Tyto a další soli sloučenin vitamínu B₃ jsou snadno připravitelné odborníkem, např. podle popisu ve W. Wenner, „The Reaction of L-Ascorbic and D-Isoascorbic Acid with Nicotinic Acid and Its Amide“, J. Organic Chemistry, VOL. 14, 22-26 (1949), zde zahrnutý odkazem. Wenner popisuje syntézu solí askorbové kyseliny niacinamidu.

Výhodně je dusík v cyklu sloučeniny vitamínu B₃ podstatně chemicky volný (např. nevázaný nebo volný), nebo se stane chemicky volným po aplikaci na pokožku („chemicky volný“ zde znamená nekomplexovaný).

Výhodně je sloučenina vitamínu B₃ v prostředí v podstatě nekomplexovaná ještě před aplikací na pokožku. Výhodně tato sloučenina není ve formě soli. Sloučenina vitamínu B₃ je použita jako podstatně čistý materiál, nebo jako extrakt získaný z vhodné fyzikální a/nebo chemické izolace z přírodních zdrojů (např. rostlinných). Sloučenina vitamínu B₃ je výhodně podstatně čistá, výhodněji zásadně čistá.

Fytantriol

Prostředky k lokálnímu použití předkládaného vynálezu v některých případech obsahují bezpečné a účinné množství fytantriolu. Fytantriol je běžný název pro 3,7,11,15-tetramethylhexadekan-1,2,3-triol. Fytantriol je komerčně dostupný u fy BASF (1 609 Biddle Avenue, Whyandotte, MI). Například je fytantriol vhodný jako činidlo k úpravě pavoučích cévek a červených skvrn, tmavých kruhů a oteklých víček, činidlo k úpravě bledosti, ochablosti, proti svědění, pokožku zpevňující činidlo, k redukci pórů, k redukci olejnatého lesku pokožky,

k úpravě pozánětové hyperpigmentace pokožky, k léčbě poranění, proti celulitidě a k regulaci struktury pokožky včetně vrásek a jemných rýh.

Prostředek podle vynálezu obsahuje 0,001 % až 50 %, výhodně 0,01 % až 20 %, výhodněji 0,1 % až 15 %, výhodněji 0,2 % až 10 %, ještě výhodněji 0,5 % až 10 % a nejvýhodněji 1 % až 5 % fytantriolu, vztaženo na hmotnost prostředku.

Farnesol

Prostředky k lokálnímu použití předkládaného vynálezu v některých případech obsahují bezpečné a účinné množství farnesolu. Farnesol je v přírodě se vyskytující látka, která pravděpodobně působí jako prekurzor a/nebo prostředník v biosyntéze skvalenu a sterolů, zvláště cholesterolu. Farnesol je také zapojen do modifikace a regulace proteinů (např. farnesylace proteinů), v jádře buňky je receptor, který je dostupný pro farnesol.

Chemicky je farnesol [2E,6E]-3,7,11-trimethyl-2,6,10-dodekatrien-1-ol a název „farnesol“ zahrnuje i jeho isomery a tautomery. Farnesol je komerčně dostupný např. pod názvy farnesol (směs isomerů od fy Dragoco, 10 Gordon Drive, Totowa, New Jersey) a trans-trans-farnesol (Sigma Chemical Company, P.O.Box 14 508, St. Louis, Missouri).

Prostředky podle vynálezu obsahují 0,001 % až 50 %, výhodně 0,01 % až 20 %, výhodněji 0,1 % až 15 %, výhodněji 0,1 % až 10 %, ještě výhodněji 0,5 % až 5 % a nejvýhodněji 1 % až 5 % farnesolu, vztaženo na hmotnost prostředku.

Deskvamační činidla

Do prostředků podle vynálezu se přidávají deskvamační činidla v množství 0,1 % až 10 %, výhodně 0,2 % až 5 %, výhodněji 0,5 % až 4 %, vztaženo na hmotnost prostředku. Deskvamační činidla zlepšují vzhled pokožky, např. zlepšují její strukturu (např. jemnost). Jeden z vhodných deskvamačních systémů obsahuje thioly a amfoterní povrchově aktivní látky a je popsán v U.S. Patent 5 681 852, Bissett, zde zahrnut odkazem. Další vhodný deskvamační systém obsahuje kyselinu salicylovou a amfoterní povrchově aktivní látky a je popsán v U.S. Patent 5 652 228, Bissett, zde zahrnut odkazem. Amfoterní povrchově aktivní látky popsány v těchto přihláškách jsou také vhodné jako deskvamační činidla, zvláště výhodný je cetylbetain.

Činidla proti akné

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují bezpečné a účinné množství jednoho nebo více činidel proti akné. Vhodné příklady těchto činidel zahrnují resorcinol, síru, kyselinu

salicylovou, benzoylperoxid, erythromycin, zinek apod. Další příklady těchto vhodných činidel jsou popsány podrobně v U.S. Patent 5 607 980, McAtee et al., 4.3. 1997.

Činidla proti vráskám/atrofii

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují bezpečné a účinné množství činidel proti vráskám a atrofii. Příklady těchto vhodných činidel zahrnují síru obsahující D a L aminokyseliny a jejich deriváty a soli, zvláště N-acetyl deriváty, jejichž výhodným příkladem je N-acetyl-L-cystein; thioly; hydroxykyseliny (např. alfa-hydroxykyseliny jako je kyselina mléčná a glykolová, nebo beta-hydroxykyseliny jako je kyselina salicylová a její deriváty jako je oktanoylderivát), kyselina fytová, lipoová; kyselina lysofosfátová, činidla pro odlupování kůže (např. fenol apod.) a retinoidy, které zlepšují vzhled pokožky, zvláště regulací stavu tkáně, např. pokožky.

a) Retinoidy

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují také retinoidy. Termín „retinoid“ zahrnuje přírodní a/nebo syntetické analogy vitamínu A nebo sloučeniny podobné retinolu, které mají biologické účinky vitamínu A na pokožku, stejně jako geometrické isomery a stereoisomery těchto sloučenin. Retinoid je výhodně retinol, estery retinolu (např. C₂-C₂₂ alkyl estery retinolu, včetně retinylpalmitátu, retinylacetátu, retinylpropionátu), retinal a/nebo kyselina retinová (včetně všech trans retinových kyselin a/nebo 13-cis retinových kyselin), výhodněji jiné než kyselina retinová. Tyto sloučeniny jsou v oboru dobře známé a jsou komerčně dostupné z různých zdrojů, např. u fy Sigma Chemical Company (St. Louis, MO) a Boehringer Mannheim (Indianapolis, IN). Další vhodné retinoidy jsou popsány v U.S. Patent 4 677 120, vyd. 30.6. 1987, Parish et al.; 4 885 311, vyd. 5.12. 1989, Parish et al.; 5 049 584, vyd. 17.9. 1991, Purcell et al.; 5 124 356, vyd. 23.6. 1992, Purcell et al.; a dotisk 34 075, vyd. 22.9. 1992, Purcell et al. Další vhodné retinoidy jsou tokoferylretinoát [tokoferolester kyseliny retinové (trans- nebo cis-), adapalen{6-[3-(1-adamantyl)-4-methoxyfenyl]-2-kyselina naftoová} a tazaroten(ethyl 6-[2-(4,4-dimethyl-thiochroman-6-yl)-ethynyl]nikotinát). Výhodné retinoidy jsou retinol, retinylpalmitát, retinylacetát, retinylpropionát, retinal a jejich kombinace.

Retinoid je použit v podstatně čisté formě, nebo jako extrakt získaný vhodnou fyzikální nebo chemickou izolací z přírodních (např. rostlinných) zdrojů. Retinoid je výhodně podstatně čistý, výhodněji zásadně čistý.

Prostředky podle vynálezu obsahují bezpečné a účinné množství retinoidu, takže výsledný prostředek je bezpečný a účinný v regulaci stavu keratinové tkáně, výhodně v regulaci viditelných a/nebo hmatatelných nerovností na pokožce, výhodněji v regulaci známek stárnutí,

nejvýhodněji v regulaci viditelných a/nebo hmatatelných nerovností na pokožce spojených se stárnutím. Prostředky výhodně obsahují 0,005 % až 2 %, výhodněji 0,01 % až 2 % retinoidu. Retinol je výhodně použit v množství 0,01 % až 0,15 %; estery retinolu (např. retinylpropionát, retinylpalmitát) jsou výhodně použity v množství 0,01 % až 2 % (např. 1 %); kyseliny retinové jsou výhodně použity v množství 0,01 % až 0,25 %; tokoferylretinoát, adapalen a tazaroten jsou výhodně použity v množství 0,01 % až 2 %.

b) Hydroxykyseliny

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují bezpečné a účinné množství hydroxykyselin. Výhodnou hydroxykyselinou je kyselina salicylová a její deriváty. Kyselina salicylová je použita v množství 0,01 % až 50 %, výhodně 0,1 % až 20 %, výhodněji 0,1 % až 10 %, výhodněji 0,5 % až 5 % a nejvýhodněji 0,5 % až 2 %.

Antioxidanty

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují bezpečné a účinné množství antioxidantu. Antioxidanty jsou zvláště vhodné k ochraně proti UV záření, které způsobuje zvýšenou tvorbu šupin nebo změn struktury strata cornea a proti dalším vlivům prostředí, které způsobují poškození pokožky.

Antioxidant se přidává k prostředkům podle vynálezu v množství výhodně 0,1 % až 10 %, výhodněji 1 % až 5 %, vztaženo na hmotnost prostředku.

Vhodné jsou antioxidanty jako je kyselina askorbová (vitamin C) a její soli, askorbylestery mastných kyselin, deriváty kyseliny askorbové (např. askorbylfosfát hořečnatý, askorbylfosfát sodný, askorbylsorbát), tokoferol (vitamin E), tokoferolsorbát, tokoferolacetát, další estery tokoferolu, butylované hydroxybenzoové kyseliny a jejich soli, 6-hydroxy-2,5,7,8-tetramethylchroman-2-karboxylová kyselina (komerčně dostupná pod názvem Trolox^R), kyselina galová a její alkylestery, zvláště propylgalát, kyselina močová a její soli a alkylestery, kyselina sorbová a její soli, kyselina lipoová, aminy (např. N,N-diethylhydroxylamin, aminoguanidin), thioly (např. glutathion), kyselina dihydroxyfumarová a její soli, lysin pidolát, arginin pidolát, kyselina norhydroguaiaretová, bioflavonoidy, kurkumin, lysin, methionin, prolin, superoxiddismutáza, silymarin, extrakty z čaje, extrakty z kůry/semene grepu, melanin a extrakty rozmarýnu. Výhodnými antioxidanty jsou tokoferolacetát a další estery tokoferolu, výhodnější je tokoferolacetát. Použití tokoferolsorbátu, vhodné i v předkládaném vynálezu, je popsáno v U.S. Patent 4 847 071, vyd. 11.7. 1989, Donald L. Bissett, Rodney D. Bush and Ranjit Chatterjee.

Chelatační činidla

Prostředky předkládaného vynálezu také obsahují bezpečné a účinné množství chelatačního činidla. Termín „chelatační činidlo“ znamená činidlo schopné odstranit kovový ion ze systému vytvořením komplexu, takže kovový ion se nemůže snadno podílet na katalyticky na chemických reakcích. Chelatační činidla jsou vhodná zvláště k ochraně proti UV záření, které přispívá k přílišnému šupinatění nebo změnám struktury pokožky a proti dalším vlivům prostředí, které způsobují poškození pokožky.

Chelatační činidlo se přidává k prostředku v množství 0,1 % až 10 %, výhodně 1 % až 5 %, vztaženo na hmotnost prostředku. Vhodná chelatační činidla jsou popsána v U.S. Patent 5 487 884, vyd. 30.1. 1996, Bissett et al.; International Publication No. 91/16 035, Bush et al., vyd. 31.10. 1995. Výhodná chelatační činidla jsou furyldioxim, furylmonoxim a jejich deriváty.

Flavonoidy

Prostředky předkládaného vynálezu obsahují také sloučeniny flavonoidů. Flavonoidy jsou široce popsány v U.S. Patent 5 686 082 a 5 686 367, zde zahrnutý odkazem. Vhodné flavonoidy jsou flavanony vybrané z nesubstituovaných flavanonů, mono-substituovaných flavanonů a jejich směsí; chalkony vybrané z nesubstituovaných chalkonů, mono-substituovaných chalkonů, di-substituovaných chalkonů, tri-substituovaných chalkonů a jejich směsí; flavony vybrané z nesubstituovaných flavonů, mono-substituovaných flavonů, di-substituovaných flavonů a jejich směsí; jeden nebo více isoflavonů; kumariny vybrané z nesubstituovaných kumarinů, mono-substituovaných kumarinů, di-substituovaných kumarinů a jejich směsí; chromony vybrané z nesubstituovaných chromonů, mono-substituovaných chromonů, di-substituovaných chromonů a jejich směsí; jeden nebo více dikumarolů; jeden nebo více chromanonů; jeden nebo více chromanolů; jejich isomery (např. cis/trans isomery) a jejich směsí. Termín „substituovaný“ znamená flavonoidy, kde jeden nebo více vodíkových atomů flavonoidu je nezávisle nahrazen skupinou hydroxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, O-glykosidem apod. a směsí těchto substituentů.

Nelimitující příklady vhodných flavonoidů zahrnují nesubstituovaný flavanon, mono-hydroxyflavanony (např. 2'-hydroxyflavanon, 6-hydroxyflavanon, 7-hydroxyflavanon apod.), monoalkoxyflavanony (např. 5-methoxyflavanon, 6-methoxyflavanon, 7-methoxyflavanon, 4'-methoxyflavanon apod), nesubstituovaný chalkon (zvláště nesubstituovaný trans-chalkon), mono-hydroxychalkony (např. 2'-hydroxychalkon, 4'-hydroxychalkon apod.), di-hydroxychalkony (např. 2',4'-dihydroxychalkon, 2',4'-dihydroxychalkon, 2,2'-dihydroxychalkon, 2',3-di-

hydroxychalkon, 2',5'-dihydroxychalkon apod.) a trihydroxychalkony (např. 2',3',4'-trihydroxychalkon, 4,2',4'-trihydroxychalkon, 2,2',4'-trihydroxychalkon apod.), nesubstituovaný flavon, 7,2'-dihydroxyflavon, 3',4'-dihydroxynaftoflavon, 4'-hydroxyflavon, 5,6-benzoflavon a 7,8-benzoflavon, nesubstituovaný isoflavon, daidzein(7,4'-dihydroxyisoflavon), 5,7-dihydroxy-4'-methoxyisoflavon, sojové isoflavony (směs extrahovaná ze soji), nesubstituovaný kumarin, 4-hydroxykumarin, 7-hydroxykumarin, 6-hydroxy-4-methylkumarin, nesubstituovaný chromon, 3-formylchromon, 3-formyl-6-isopropylchromon, nesubstituovaný dikumarol, nesubstituovaný chromanon, nesubstituovaný chromanol a jejich směsi.

Výhodný je nesubstituovaný flavanon, methoxyflavanony, nesubstituovaný chalkon, 2',4-dihydroxychalkon a jejich směsi. Výhodnější je nesubstituovaný flavanon, nesubstituovaný chalkon (zvláště trans isomer) a jejich směsi.

Jsou to buď syntetické materiály, nebo jsou získány jako extrakty z přírodních (např. rostlinných) zdrojů. Materiál z přírodního zdroje je dále derivatizován (např. esterový nebo etherový derivát připravený následnou extrakcí z přírodního zdroje). Vhodné sloučeniny flavonoidů jsou komerčně dostupné z různých zdrojů, např. u fy Indofine Chemical Company, Inc. (Somerville, New Jersey), Steraloids, Inc. (Wilton, New Hampshire) a Aldrich Chemical Company, Inc. (Milwaukee, Wisconsin).

Používají se také směsi výše zmíněných sloučenin flavonoidů.

Sloučeniny flavonoidů se do prostředků přidávají v množství 0,01 % až 20 %, výhodně 0,1 % až 10 % a výhodněji 0,5 % až 5 %.

Protizánětlivá činidla

K prostředkům podle vynálezu se také přidává bezpečné a účinné množství protizánětlivého činidla. Výhodně se přidává 0,1 % až 10 %, výhodněji 0,5 % až 5 % tohoto činidla, vztaženo na hmotnost prostředku. Protizánětlivá činidla vylepšují vzhled pokožky, např. přispívají k jednotnějšímu a přijatelnému zabarvení pokožky. Množství protizánětlivého činidla závisí na daném použitém činidle, protože jejich síla účinku se velice liší.

Vhodné nelimitující příklady steroidních protizánětlivých činidel jsou kortikosteroidy jako jsou hydrokortizon, hydroxytriamcinolon, alfa-methyldexamethazon, dexamethazonfosfát, beklomethazondipropionáty, klobetazolvalerát, desonid, desoxymethazon, desoxykortikosteronacetát, dexamethazon, dichlorizon, diflorazon diacetát, diflukortolonvalerát, fluadrenolon, fluklorolonacetamid, fludrokortizon, flomethazonpivalát, fluosinolonacetamid, fluocinonid, flukortinbutylestery, fluokortolon, flupredniden (fluprednyliden)acetát, flurandrenolon,

halcinonid, hydrokortizonacetát, hydrokortizonbutyrát, methylprednizolon, triamcinolon-acetonid, kortizon, kortodoxon, flucetonid, fludrokortizon, difluorosondiacetát, fluadrenolon, difluorosondiacetát, fluadrenolonacetonid, medryzon, amcinafel, amcinafid, betamethazon a jeho estery, chlorprednizon, chlorprednizonacetát, klokortelon, klescínolon, dichlorizon, diflurprednát, flukloronid, flunisolid, fluoromethalon, fluperolon, fluprednizolon, hydrokortizon-valerát, hydrokortizoncyklopentylpropionát, hydrokortamát, meprednizon, paramethazon, prednizolon, prednizon, beklomethazondipropionát, triamcinolon a jejich směsi. Výhodné steroidní protizánětlivé činidlo je hydrokortizon.

Druhou třídou vhodných protizánětlivých činidel jsou nesteroidní protizánětlivá činidla. Odborníkům je známá široká řada takových činidel. Podrobný popis chemických struktur, syntézy, vedlejších účinků apod. nesteroidních protizánětlivých činidel se nachází ve standardních textech včetně *Anti-inflammatory and Anti-Rheumatic Drugs*, K.D. Rainsford, Vol. I-III, CRC Press, Boca Raton, (1985) a *Anti-inflammatory Agents, Chemistry and Pharmacology*, I, R.A. Scherrer, et. al., Academic Press, New York (1974).

Příklady vhodných nelimitujících nesteroidních protizánětlivých činidel jsou:

- 1) oxikamy jako je piroxikam, isoxikam, tenoxikam, sudoxikam a CP-14 304;
- 2) salicyláty jako je aspirin, disalcid, benorylát, trilisát, safapryn, solprin, diflunisal a fendosal;
- 3) deriváty kyseliny octové jako je diklofenak, fenklofenak, indomethacin, sulindak, tolmetin, isoxepak, furofenak, tiopinak, zidometacin, acematacin, fentiazak, zomepirak, klindanak, oxepinak, felbinak a ketorolak;
- 4) fenamáty jako je mefenamid, meklofenamid, flufenamid, niflumid a kyseliny tolfenamidu;
- 5) deriváty kyseliny propionové jako je ibuprofen, naproxen, benoxaprofen, flurbiprofen, ketoprofen, fenoprofen, fenbufen, indoprofen, piroprofen, karprofen, oxaprozin, pranoprofen, miroprofen, tioxaprofen, suprofen, alminoprofen a tiaprofenid; a
- 6) pyrazoly jako je fenylbutazon, oxyfenbutazon, feprazon, azapropazon a trimethazon

Vhodné jsou také směsi, soli a estery těchto nesteroidních protizánětlivých činidel. Například etofenamát, derivát kyseliny flufenamové, je zvláště výhodný pro lokální aplikaci. Výhodnými nesteroidními protizánětlivými činidly jsou ibuprofen, naproxen, kyselina flufenamová, etofenamát, aspirin, kyselina mefenamová, kyselina meklofenamová, piroxikam a felbinak, výhodnější jsou ibuprofen, naproxen, ketoprofen, etofenamát, aspirin a kyselina flufenamová.

Nakonec jsou také vhodná tzv. „přírodní“ protizánětlivá činidla. Výhodně se získávají fyzikální a/nebo chemickou izolací z přírodních zdrojů (např. z rostlin, plísní, jako odpadní produkty mikroorganismů), nebo se připravují synteticky. Např. jsou vhodné vosk kaktusu Candelilla, bisabolol (např. α -bisabolol), aloe vera, rostlinné steroly (např. fytosterol), Manjistha (extrakt z rodu *Rubia* - mořena, zvláště *Rubia Cordifolia*) a Guggal (extrakt z rostlin rodu *Commiphora* – myrhovník, zvláště *Commiphora Mukul*), extrakt z koly, heřmánku, jetele lučního a mořského živočicha *Osteocella septentrionalis*.

Další vhodná protizánětlivá činidla zahrnují sloučeniny lékořice (rostlinný rod/druh *Glycyrrhiza glabra*) včetně kyselin glycyrhetové a glycyrhizové a jejich derivátů (např. soli a esterů). Vhodné soli těchto sloučenin zahrnují kovy a amonné soli. Vhodné estery zahrnují C_2 - C_{24} nasycené nebo nenasycené estery kyselin, výhodně C_{10} - C_{24} , výhodněji C_{16} - C_{24} . Vhodné příklady těchto sloučenin zahrnují v oleji rozpustný lékořicový extrakt, kyselinu glycyrhetovou a glycyrhizovou, glycyrhizinát amonný, glycyrhizinát monodraselný, glycyrhizinát didraselný, kyselina 1- β -glycyrhezová, stearylglcyrhetinát, kyselina 3-stearyloxy-glycyrhetinová a 3-sukcinyloxy- β -glycyrhetinát. Výhodný je stearylglcyrhetinát.

Činidla proti celulitidě

Prostředky podle vynálezu také obsahují činidla proti celulitidě. Nelimitující příklady vhodných činidel jsou sloučeniny xanthinu (např. kofein, theofylin, theobromin a aminofylin).

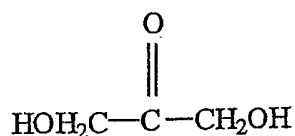
Lokální anestetika

Prostředky podle vynálezu také obsahují bezpečné a účinné množství lokálních anestetik. Jejich příklady zahrnují benzokain, hexylkain, prokain, kokain, ketamin, pramoxin, fenol a jejich farmaceuticky přijatelné soli.

Samoopalovací činidla

Prostředky podle vynálezu také obsahují samoopalovací činidlo. Výhodně obsahují 0,1 % až 20 %, výhodněji 2 % až 7 % a nejvýhodněji 3 % až 6 % dihydroxyacetonu jako umělého samoopalovacího činidla, vztaženo na hmotnost prostředku.

Dihydroxyaceton, také známý jako DHA nebo 1,3-dihydroxy-2-propanon, je bílý nebo špinavě bílý krystalický prášek. Tato látka má sumární vzorec $C_3H_6O_3$ a strukturní vzorec



Sloučenina je směsí monomerů a dimerů s dimery převažujícími v pevném krystalickém stavu. Po zahřátí nebo roztavení se dimery rozloží na monomery. Tato přeměna z dimerů na monomery vzniká i ve vodném roztoku. Je známo, že dihydroxyaceton je stálejší při kyselých hodnotách pH. Viz. The Merck Index, Tenth Edition, entry 3 167, p. 463 (1983) a „Dihydroxyacetone for Cosmetics“, E. Merck Technical Bulletin, 03-304 110, 319 897, 180 588.

Pokožku zjasňující činidla

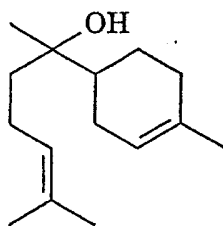
Prostředky podle vynálezu obsahují také pokožku zjasňující činidlo v množství výhodně 0,1 % až 10 %, výhodněji 0,2 % až 5 % a nejvýhodněji 0,5 % až 2 %, vztaženo na hmotnost prostředku. Zjasňující činidla zahrnují ta známá v oboru, včetně kyseliny kojové, arbutinu, kyseliny askorbové a jejich derivátů (např. askorbylfosfát sodný) a extraktů (např. z moruše nebo placenty). Vhodná zjasňující činidla jsou popsána v PCT publication No. 95/34 280, Hillebrand, odpovídající přihlášce PCT Application No. U.S. 95/07 432, 12.6.95; a U.S. Application No. 08/390 152, Kvalnes, Mitchell A. DeLong, Barton J. Bradbury, Curtis B. Motley a John D. Carter, odpovídající PCT Publication No. 95/23 780, vyd. 9/8/95.

Pokožku zklidňující a hojící činidla

Prostředky podle vynálezu obsahují také pokožku zklidňující a hojící činidlo. Příklady těchto činidel zahrnují deriváty kyseliny panthotenové (včetně panthenolu, dexpanthenolu, ethylpanthenolu), aloe vera, allantoin, bisabolol a glycyrrhizinát didraselný. Činidlo se k prostředku přidává v bezpečném a účinném množství, výhodně 0,1 % až 30 %, výhodněji 0,5 % až 20 % a nejvýhodněji 0,5 % až 10 %, vztaženo na hmotnost prostředku.

a) bisabolol

Prostředky podle vynálezu obsahují také bezpečné a účinné množství bisabololu. Bisabolol je v přírodě se vyskytující nenasycený monocyklický terpenový alkohol vzorce



Je to primární účinná složka heřmánkového extraktu/oleje. Bisabolol je syntetický (D,L- α -isomer nebo (+/-)- α -isomer) nebo přírodní ((-)- α -isomer) a používá se jako zásadně čistá sloučenina nebo směs sloučenin (např. extrakty z přírodních zdrojů jako je heřmánek). Alfa forma bisabololu (α -bisabolol) se používá v různých kosmetických produktech jako pokožku zlepšující či zjemňující činidlo. Termín „bisabolol“ zahrnuje heřmánkový extrakt nebo olej a jakékoli jeho isomery a tautomery. Vhodné sloučeniny bisabololu jsou komerčně dostupné jako přírodní materiál u fy Dragoco (Totowa, New Jersey) pod obchodním názvem alpha-bisabolol natural a jako syntetický materiál u fy Fluka (Milwaukee, Wisconsin) pod obchodním názvem alpha-bisabolol.

Prostředky obsahují 0,001 % až 50 %, výhodně 0,01 % až 20 %, výhodněji 0,01 % až 15 %, výhodněji 0,1 % až 10 % a nejvýhodněji 0,1 % až 5 % bisabololu, vztaženo na hmotnost prostředku.

Antimikrobiální a protiplísňová činidla

Prostředky podle vynálezu obsahují také antimikrobiální a protiplísňové činidlo. Tato činidla jsou schopná ničit mikroby a působit jako prevence proti mikrobům nebo jejich patologickému vlivu. Přidává se bezpečné a účinné množství tohoto činidla, výhodně 0,001 % až 10 %, výhodněji 0,01 % až 5 % a nejvýhodněji 0,05 % až 2%.

Příklady antimikrobiálních a protiplísňových činidel zahrnují β -laktamová léčiva, chinolonová léčiva, ciprofloxacin, norfloxacin, tetracyklin, erythromycin, amikacin, 2,4,4'-tri-chlor-2'-hydroxydifenylether, 3,4,4'-trichlorbanilid, fenoxylethanol, fenoxipropanol, fenoxisopropanol, doxycyklin, kapreomycin, chlorhexidin, chlortetracyklin, oxytetracyklin, klindamycin, ethambutol, hexamidin isethionát, metronidazol, pentamidin, gentamicin, kanamycin, lineomycin, methacyklin, methenamin, minocyklin, neomycin, netilmycin, paromomycin, streptomycin, tobramycin, mikonazol, tetracyklinhydrochlorid, erythromycin, Zn-erythromycin, erythromycinestolát, erythromycinstearát, amikacinsulfát, doxycyklin-

hydrochlorid, kapreomycinsulfát, chlorhexidinglukonát, chlorhexidinhydrochlorid, chlortetracyklinhydrochlorid, oxytetracyklinhydrochlorid, klindamycinhydrochlorid, ethambutolhydrochlorid, metronidazolhydrochlorid, pentamidinhydrochlorid, gentamicinsulfát, kanamycinsulfát, lineomycinhydrochlorid, methacyklinhydrochlorid, methenaminhipurát, methenaminmandelát, minocyklinhydrochlorid, neomycinsulfát, netimicinsulfát, paromomycinsulfát, streptomycinsulfát, tobramycinsulfát, mikonazolhydrochlorid, ketakonazol, amanfadinhydrochlorid, amanfadinsulfát, oktopirox, parachlormetaxylenol, nystatin, Zn-pyrithion a klotrimazol

Opalovací látky

Vystavení ultrafialovému záření vede k nadměrnému odlupování a strukturálním změnám strata cornea. Proto prostředky podle vynálezu obsahují také opalovací látky. „Opalovací látka“ znamená jak opalovací činidlo, tak fyzikální sluneční blokátor. Vhodné jsou organické i anorganické opalovací látky.

Vhodné anorganické opalovací látky zahrnují tyto oxidy kovů: oxid titaničitý s průměrnou velikostí částic 15 nm až 100 nm, oxid zinečnatý s průměrnou velikostí částic 15 nm až 150 nm, oxid zirkonia s průměrnou velikostí částic 15 nm až 150 nm, oxid železnatý s průměrnou velikostí částic 15 nm až 500 nm a jejich směsi. Anorganické opalovací látky se přidávají v množství výhodně 0,1 % až 20 %, výhodněji 0,5 % až 10 % a nejvýhodněji 1 % až 5 %, vztaženo na hmotnost prostředku.

Vhodná je řada běžných organických opalovacích látek, např. zahrnutý v Sagarin, et al., Chapter VIII, pages 189 et seq., of Cosmetics Science and Technology (1972). Vhodnými příklady opalovacích látek jsou kyselina *p*-aminobenzoová, její soli a deriváty (ethyl, isobutyl, glycerylestery; kyselina *p*-dimethylaminobenzoová); anthraniláty (např. *o*-aminobenzoáty; methyl, menthyl, fenyl, benzyl, fenylethyl, linalyl, terpinyl a cyklohexenylestery); salicyláty (amyl, fenyl, oktyl, benzyl, menthyl, glyceryl a dipropylenglykolestery); deriváty kyseliny skořicové (menthyl a benzylestery, α -fenylcinamonitril; butylcinamoylpyruvát); deriváty kyseliny dihydroxyskořicové (umbelliferon, methylumbelliferon, methylacetoumbelliferon); deriváty kyseliny trihydroxyskořicové (eskuletin, methyleskuletin, dafnetin a glukosidy eskulin a dafnin); uhlovodíky (difenylbutadien, stilben); dibenzylaceton a benzylacetofenon; naftolsulfonáty (sodné soli kyseliny 2-naftol-3,6-sulfonové a 2-naftol-6,8-disulfonové); kyselina dihydroxynaftoová a její soli; *o*- a *p*-hydroxybifenyldisulfonáty; deriváty kumarinu (7-hydroxy, 7-methyl, 3-fenyl); diazoly (2-acetyl-3-bromindazol, fenylbenzoxazol, methylnaftoxazol, různé

arylbenzothiazoly); soli chininu (bisulfát, sulfát, chlorid, oleát a tanát); deriváty chinolinu (soli 8-hydroxychinolinu, 2-fenylchinolin); hydroxy- nebo methoxy- substituované benzofenony; kyselina močová a violurová; kyselina tanová a její deriváty (např. hexaethylether); butylkarbotolether a 6-propylpiperonylether; hydrochinon; benzofenony (fenol, sulisobenzon, dioxybenzon, benzoesorcinol, 2,2',4,4'-tetrahydroxybenzofenon, 2,2'-dihydroxy-4,4'-dimethoxybenzofenon, oktabenzon; 4-isopropylidibenzoylmethan; butylmethoxydibenzoylmethan; etokrylen; oktokrylen; 3-(4'-methylbenziliden)bornan-2-on, kyselina tereftalylidendikafersulfonová a 4-isopropylidibenzoylmethan.

Z těchto příkladů jsou výhodné 2-ethyl-*p*-methoxycinamát (komerčně dostupný jako PARSOL MCX), 4,4'-*t*-butylmethoxydibenzoylmethan (komerčně dostupný jako PARSOL 1 789), 2-hydroxy-4-methoxybenzofenon, kyselina oktyldimethyl-*p*-aminobenzoová, digaloyl-trioleát, 2,2-dihydroxy-4-methoxybenzofenon, ethyl-4-(bis(hydroxypropyl))aminobenzoát, 2-ethylhexyl-2-kyano-3,3-difenylakrylát, 2-ethylhexylsalicylát, glyceryl-*p*-aminobenzoát, 3,3,5-trimethylcyklohexylsalicylát, methylanthranilát, kyselina *p*-dimethylaminobenzoová nebo aminobenzoát, 2-ethylhexyl-*p*-dimethylaminobenzoát, kyselina 2-fenylbenzimidazol-5-sulfonová, kyselina 2-(*p*-dimethylaminofenyl)-5-benzoxazolsulfonová, oktokrylen a jejich směsi.

Výhodnější organické opalovací látky vhodné v prostředcích podle vynálezu jsou 2-ethylhexyl-*p*-methoxycinamát, butylmethoxydibenzoylmethan, 2-hydroxy-4-methoxybenzofenon, kyselina 2-fenylbenzimidazol-5-sulfonová, kyselina oktyldimethyl-*p*-aminobenzoová a jejich směsi.

Také jsou vhodné opalovací látky zahrnuté v U.S. Patent 4 937 370, Sabatelli, vyd. 26.6.1990 a U.S. Patent 4 999 186, Sabatelli and Spirnak, vyd. 12.3.1991. Tyto látky mají v jedné molekule dvě různé chromoforové skupiny, které mají odlišná absorpční spektra ultrafialového záření. Jedna z chromoforových skupin absorbuje převážně záření v UVB oblasti a druhá v UVA oblasti.

Výhodnými zástupci této třídy opalovacích látek jsou ester kyseliny 4-N,N-(2-ethylhexyl)methylaminobenzoové s 2,4-dihydroxybenzofenonem; ester kyseliny N,N-di-(2-ethylhexyl)-4-aminobenzoové s 4-hydroxydibenzoylmethanem; ester kyseliny 4-N,N-(2-ethylhexyl)methylaminobenzoové s 4-hydroxydibenzoylmethanem; ester kyseliny 4-N,N-(2-ethylhexyl)methylaminobenzoové s 2-hydroxy-4-(2-hydroxyethoxy)benzofenonem; ester kyseliny 4-N,N-(2-ethylhexyl)methylaminobenzoové s 4-(2-hydroxyethoxy)dibenzoylmethanem; ester kyseliny N,N-di-(2-ethylhexyl)-4-aminobenzoové s 2-hydroxy-4-(2-hydroxyethoxy)benzofenonem a ester kyseliny N,N-di-(2-ethylhexyl)-4-aminobenzoové s 4-(2-

-hydroxyethoxy)dibenzoylmethanem a jejich směsi.

Zvláště výhodnými opalovacími látkami jsou 4,4'-t-butylmethoxydibenzoylmethan, 2-ethylhexyl-p-methoxycinamát, kyselina fenylbenzimidazolsulfonová a oktokrylen.

Používá se účinné a bezpečné množství opalovací látky, výhodně 1 % až 20 %, výhodněji 2 % až 10 %, vztaheno na hmotnost prostředku. Přesné množství závisí na typu použité opalovací látky a na požadovaném ochraném faktoru.

Granulovaný materiál

Prostředky podle vynálezu obsahují také v některých případech granulovaný materiál, výhodně kovový oxid. Tento granulovaný materiál je potahovaný nebo nepotahovaný, s nábojem nebo bez náboje. Granulovaný materiál s nábojem je zahrnut v U.S. Patent 5 997 887, Ha et al., zde zahrnut odkazem. Vhodný granulovaný materiál zahrnuje oxychlorid bismutitý, oxid železnatý, slídu, slídu potaženou síranem barnatým, oxid titaničitý (TiO_2), oxid zinečnatý, oxid zirkoničitý, oxid křemičitý, nylon, polyethylen, talek, styren, polypropylen, kopolymer ethylenu s kyselinou akrylovou, sericit, oxid hlinitý, silikonovou gumu, síran barnatý, uhličitán vápenatý, acetát celulózy, polymethylmetakrylát a jejich směsi.

Anorganický granulovaný materiál, např. TiO_2 , ZnO nebo ZrO_2 , je komerčně dostupný z mnoha zdrojů. Vhodným příkladem granulovaného materiálu je materiál dostupný u fy U.S. Cosmetics (TRONOX TiO_2 série, SAT-T CR837, rutil TiO_2). Výhodně se granulovaný materiál přidává v množství 0,01 % až 2 %, výhodněji 0,05 % až 1,5 % a nejvýhodněji 0,1 % až 1 %, vztaheno na hmotnost prostředku. Neexistují žádná omezení na práškové pigmenty, barviva nebo plnidla používaná v prostředcích.

Výhodné prášky/plnidla zahrnují, ale nejsou omezeny na, polymerní granule vybrané z methylsilseskvioxanových pryskyřičných mikrogranulí, jako jsou např. ty prodávané fy Toshiba silicone pod obchodním názvem Tospearl 145A; mikrogranulí polymethylmethakrylátů jako jsou ty prodávané fy Seppic pod obchodním názvem Micropearl M 100; kulovitých granulí síťovaných polydimethylsiloxanů, zvláště těch prodávaných fy Dow Corning Toray Silicone pod obchodním názvem Trefil E 506C nebo Trefil E 505C, kulovitých granulí polyamidů a zvláště Nylonu 12, jako jsou ty prodávané fy Atochem pod obchodním názvem Orgasol 2002D Nat C05, polystyrenových mikrogranulí jako jsou např. ty prodávané fy Dyno Particles pod obchodním názvem Dynospheres, ethylenakrylátový kopolymer prodávaný fy Kobo pod obchodním názvem FloBead EA209 a jejich směsí.

Vhodné jsou také pigmenty a/nebo obalená barviva jako jsou nanokoloranty od fy BASF a vícevrstevné interferenční pigmenty jako je Sicopearl od fy BASF.

Výhodně jsou pigmenty/prášky na povrchu ošetřené, aby se dosáhlo stabilní barvy a snadného zapracování. Hydrofobně ošetřené pigmenty jsou výhodnější, protože se snáze dispergují v nosném systému. Navíc je také užitečné ošetřit pigmenty materiálem slučitelným se silikonovou fází. Zvláště výhodné hydrofobní ošetření pigmentů pro použití v emulzích voda v silikonu zahrnuje polysiloxanová ošetření popsaná v U.S. Patent 5 143 722, zde zahrnut odkazem. Výhodné jsou pigmenty/prášky mající primární průměrnou velikost částic 10 nm až 100 000 nm, výhodněji 50 nm až 5 000 nm a nejvýhodněji 100 nm až 1 000 nm. Vhodné jsou i směsi stejných nebo různých pigmentů/prášků s různou průměrnou velikostí částic (např. použití TiO_2 s primární velikostí částic 100 nm až 400 nm a TiO_2 s primární velikostí částic 10 nm až 50 nm).

Kondicionéry

Prostředky podle vynálezu také obsahují kondicionér vybraný ze smáčedel, zvlhčovadel a kondicionérů pokožky. Používá se řada těchto materiálů v množství 0,01 % až 20 %, výhodně 0,1 % až 10 % a výhodněji 0,5 % až 7 %, vztaheno na hmotnost prostředku. Tyto materiály zahrnují, ale nejsou omezeny na, guanidin; močovinu; kyselinu glykolovou a její soli (např. amonné a kvarterní alkylamonné); kyselinu salicylovou; kyselinu mléčnou a její soli (např. amonné a kvarterní alkylamonné); aloe vera v jakékoliv své formě (např. aloe vera gel); polyethylenglykoly; cukry (např. melibióza) a škroby; cukerné a škrobové deriváty (např. alkoxylovanou glukózu, fruktózu, glukosamin); kyselinu hyaluronovou; laktamidmonoethanolamin; acetamidmonoethanolamin; panthenol; allantoin; a jejich směsi. Vhodné jsou také propoxylované glyceroly popsané v U.S. Patent 4 976 953, Orr et al., vyd. 11.12. 1990.

Vhodné jsou také různé $\text{C}_1\text{-C}_{30}$ cukerné monoestery a polyestery a podobné materiály. Tyto estery jsou odvozeny od cukerné nebo polyolové skupiny a jedné nebo více skupin karboxylové kyseliny. Takové estery jsou podrobně popsány v U.S. Patent 2 831 854, U.S. Patent 4 005 196, Jandacek, vyd. 25.1. 1977; U.S. Patent 4 005 195, Jandacek, 25.1. 1977, U.S. Patent 5 306 516, Letton et al., vyd. 26.4. 1994; U.S. Patent 5 306 515, Letton et al., vyd. 26.4. 1994; U.S. Patent 5 305 514, Letton et al., 26.4. 1994; U.S. Patent 4 797 300, Jandacek et al., 10.1. 1989; U.S. Patent 3 963 699, Rizzi et al., vyd. 15.6. 1976; U.S. Patent 4 518 772, Volpenheim, vyd. 21.5. 1985; a U.S. Patent 4 517 360, Volpenheim, vyd. 21.5. 1985.

Pokud je kondicionérem změkčovadlo, je výhodně vybráno z uhlovodíků, mastných kyselin, mastných alkoholů a esterů. Nejvýhodnějším uhlovodíkovým typem změkčovacího kondicionéru je isononylisononanoát. Další vhodné uhlovodíky zahrnují minerální oleje, polyolefiny jako je polydecen a parafiny jako je isohexadecen (např. Pemethyl 99 registrovaný TM a Permethyl 101 registrovaný TM).

Výhodně je kondicionér vybrán z močoviny, guanidinu, polyesteru sacharózy, panthenolu, dexpanthenolu, alantoinu a jejich kombinací.

Další volitelné složky

K prostředkům podle vynálezu se přidává množství dalších složek. Nelimitující příklady těchto složek zahrnují barviva, pigmenty, činidla vhodná k estetickým účelům jako jsou esenciální oleje, vůně, činidla zmatňující pokožku, aromatické sloučeniny (např. hřebíčkový olej, mentol, kafr, eukalyptový olej a eugenol), konzervační látky (např. alkylestery kyseliny *p*-hydroxybenzoové, deriváty hydantoinu jako je 1,3-bis(hydroxymethyl)-5,5-dimethylhydantoin, propionátové soli a množství kvarterních amoniových sloučenin jako je benzalkoniumchlorid, quarternium 15 [Dowicil 200], benzethoniumchlorid a methylbenzethoniumchlorid). Zvláště výhodné konzervační látky jsou EDTA dvojsodná sůl, fenoxylethanol, methylparaben, propylparaben, imidazolidinylmočovina (komerčně dostupná jako Germall 1 157), bezvodý octan sodný a benzylalkohol.

Způsoby testování

a) Vyhodnocení tahového napětí

Úroveň tahového napětí je přímým ukazatelem lepkavosti rozpouštědla. Vhodné lepkavé rozpouštědlo má hodnotu tahového napětí větší než vazelína. K určení tahového napětí se používá jakýkoliv způsob známý v oboru. Příklad určování tahového napětí je popsán v Journal Seifen, Ole, Fette, Wache, 118 (1992) 1 001, od Zeidle, zde zahrnut odkazem. Tento způsob používá jako hodnotu tahového napětí mN/cm s použitím silového snímače k měření přilnavosti testovaného materiálu.

b) Smyslové vyhodnocení lepkavosti

Smyslové dotekové hodnocení se provádí způsobem popsáním v „Sensory Evaluation Techniques“, 3. vydání, Meigaard, Civile and Carr, CRC Press 1999. Způsob se provádí následovně:

- 1) Skupina 10 osob je vyškolená pro hodnocení produktů s použitím daného protokolu. Hodnotí lepkavost ve stupnici od 1 do 10. Tento stupeň je určen srovnáním lepkavosti testovaného produktu se sadou tří standardních produktů s předem stanoveným hodnocením lepkavosti. Standardní kontrolní produkty jsou Petroleum jelly (vazelinové želé) s vysokou lepkavostí (hodnota 7,5), Avon Moisture Therapy for hands (zvlhčující prostředek na ruce od fy Avon) se střední hodnotou lepkavosti (4,5) a Estee Lauder Fruition extra (produkt fy Estee Lauder) s nízkou hodnotou lepkavosti (0,5).
- 2) Během testování si každá osoba natře 0,15 gramů testovaného produktu na jednu tvář.
- 3) Za 15 minut po natření si osoba přitiskne polštářky prstů na tvář a použije mírný tlak.
- 4) Poté každá vytrénovaná osoba určí hodnotu lepkavosti vyhodnocením, jak snadno se prsty uvolní od pokožky tváře v porovnání s výsledky standardních kontrolních produktů.
- 5) Smyslové dotekové vyhodnocení se poté vypočítá jako průměr výsledků každé osoby pro daný prostředek.

Vhodná kombinace lepkavosti rozpouštědla a v něm rozpustné účinné látky k péči o pokožku má hodnotu smyslového dotekového vyhodnocení větší než 4,5 a prostředek k péči o pokožku má tuto hodnotu nižší než 4,5. Výhodně má prostředek hodnotu smyslového vyhodnocení menší než 3,0, výhodněji menší než 1,0.

Příprava prostředku

Prostředky vhodné k použití podle vynálezu se obecně připravují běžnými způsoby známými z oboru přípravy prostředků k lokálnímu použití. Tyto způsoby typicky zahrnují smíchání složek v jednom nebo více krocích do relativně homogenního stavu, s nebo bez zahřátí, ochlazení, použití vakua apod.

Lokální prostředky podle vynálezu jsou zpracovány do formy obličejové kosmetiky, oční kosmetiky, kosmetiky rtů, vlasových prostředků, zvlhčovačů, vrásky vyhlazujících prostředků, pleťových mlék, řasenek, pleťových masek, krémů, gelů, očních gelů, očních krémů, gelů na rty, krémů na rty, kosmetiky, podkladů a jakékoliv jiné formy známé u produktů a kúr na pokožku.

Způsoby použití

Prostředky podle vynálezu jsou vhodné k regulaci stavu pokožky a/nebo vlasů s dobrými estetickými účinky. Regulace stavu pokožky zahrnuje redukci jemných rýh a/nebo vrásek na pokožce, redukci otoků a tmavých kruhů pod očima, ochablé pokožky, jizev/znamének, důlků, pórů, hrubosti, skvrn, výrazových vrásek, prasklin, poškození světlem a /nebo nerovností.

Regulace stavu keratinové tkáně pomocí účinné látky v kombinaci s lepkavým rozpouštědlem a zlepšeným nosným systémem zahrnuje také preventivní a léčebnou regulaci. Například jsou takové způsoby regulace namířeny ke zpevnění keratinové tkáně (tj. tvorbě epidermis a/nebo vrstev kůže a kde je možné keratinových vrstev nehtů a vlasů) a prevenci a/nebo zpomalení atrofie pokožky savců, prevenci a/nebo zpomalení vzniku pavoučích cévek a/nebo červených skvrn na pokožce savců, prevenci a/nebo zpomalení vzniku tmavých kruhů pod očima, prevenci a/nebo zpomalení blednutí pokožky, prevenci a/nebo zpomalení ochabování pokožky, k zjemnění a hladkosti rtů, vlasů a nehtů, prevenci a/nebo úlevě od svědění pokožky, k regulaci struktury pokožky (např. vrásky a rýhy) a zlepšení barvy pokožky (např. začervenání, pihy).

Výhodně se prostředky aplikují na pokožku po delší dobu. „Lokální aplikace po delší dobu“ znamená pokračující lokální aplikaci prostředku po určitou dobu, výhodně po dobu alespoň jednoho týdne, výhodněji alespoň jednoho měsíce, výhodněji tří měsíců, ještě výhodněji šesti měsíců a nejvýhodněji alespoň po dobu jednoho roku. I když účinky se dostaví po různě dlouhé maximální době použití (např. pět, deset nebo dvacet let), je výhodné, aby aplikace prostředku pokračovala celý život. Typicky se po tuto dobu aplikace provádí jednou denně, ale rozmezí se liší od aplikace jednou týdně po aplikaci třikrát denně a víc.

Množství prostředku k zlepšení stavu pokožky, nanášeného na pokožku, se také liší. Množství prostředku se uvádí v mg prostředku/cm² pokožky a výhodné je množství 0,1 mg/cm² až 10 mg/cm², výhodnější 1 mg/cm² až 2 mg/cm².

Úpravy a/nebo regulace vzhledu, pocitu a/nebo stavu pokožky se výhodně dosáhne aplikací prostředku ve formě plet'ového mléka, krému, gelu, pěny, masti, pasty, emulze, spreje, kondicionéru, tonika, kosmetiky, rtěnky, podkladu, laku na nehty, vody po holení apod. Výhodně je prostředek ponechán na pokožce nebo jiné keratinové struktuře, aby poskytoval estetické, preventivní, léčivé nebo jiné výhody. Po aplikaci je prostředek na pokožce ponechán alespoň po dobu 15 minut, výhodně alespoň 30 minut, výhodněji alespoň 1 hodinu a nejvýhodněji několik hodin, např. až 12 hodin. Prostředek se aplikuje na jakoukoliv část obličeje, vlasů a/nebo nehtů, např. na tvář, rty, pod oči, oční víčka, skalp, krk, trup, paže, ruce, nohy, chodidla, nehty na rukou

a nohou, vlasy, řasy, obočí apod. Prostředek se aplikuje pomocí prstů nebo nástrojů (např. polštářků, vaty, tužky, spreje apod.).

Další způsob, jak zajistit nepřetržitou dodávku prostředku na pokožku, je použití náplastí, např. na obličej. Tento způsob je zvláště výhodný u problematických oblastí pokožky, které potřebují intenzivní péči (např. vějíře vrásek ve tváři, vrásky od mračením, oblast pod očima apod.). Náplast je propustná, polopropustná, nebo nepropustná a je lepkavá nebo nelepkavá. Prostředek je obsažen v náplasti, nebo se aplikuje před jejím přiložením. Náplast také případně obsahuje další účinné látky jako jsou chemické iniciátory exotermických reakcí, jako jsou ty popsané v U.S. Patent 5 821 250, 5 981 547 a 5 972 957, Wu et al. Náplast je výhodně ponechána na pokožce po dobu alespoň 5 minut, výhodněji alespoň 15 minut, výhodněji alespoň 30 minut, ještě výhodněji alespoň 1 hodinu a nejvýhodněji přes noc jako forma noční terapie.

Příklady provedení vynálezu

Následující příklady dále popisují předkládaný vynález. Příklady slouží jako ilustrace a v žádném případě vynález nelimitují, protože v rámci vynálezu je možná řada variant.

Příklady 1 až 7

Krémy voda v silikonu

Krémy na pokožku voda v silikonu se připravují běžnými způsoby z následujících složek

	Složka	1	2	3	4
Fáze A	Voda U.S.P.	25,55	14,25	25,25	19,45
	EDTA dvojsodná sůl	0,10	0,10	0,10	0,10
	Methylparaben	0,10	0,10	0,10	0,10
	Propylparaben	0,10	0,10	0,10	0,10
	Niacinamid	7,50		7,50	5,0
	Dexpanthenol	1,0	0,50	1,0	1,0
	Askorbylfosfát hořečnatý		10		
	Alantoin	0,2	0,2	0,2	0,2
	Benzylalkohol	0,25	0,25	0,25	0,25
	Glycerin	15		20	10
	Butylenglykol		10		

	Kyselina tereftalylidenkafrsulfonová ¹				
	Palmitoyl Lys Thr Thr Lys Ser ²			0,0003	
Fáze B	Dow Corning 9 040 ³	15	30		18
	KSG-21 ⁴	8,0		15	18
	Cyklomethikon	25	17	30	18
	Dimethikon kopolyol (Dow Corning 5 225C)		3		
	Vitamin E acetát	0,5	0,5	0,5	0,5
	Oxid titaničitý GLW75CAP-MP ⁵	0,50	0,50		
	Vůně	0,2			0,2
	Farnesol				5
	(-)- α -bisabolol	1	0,5		1
	Fytantriol		5		
	Parsol 1 789 ⁶				
	Isopropylpalmitát				
	Kyselina salicylová				
	PPG-15-stearylether				
	Tospearl 145		1		1
Fáze C	Finsolv TN				2,0
	Retinol 50 P				0,1
	Retinylpropionát				

	Složka	5	6	7
Fáze A	Voda U.S.P.	35,55	56,05	32,25
	EDTA dvojsodná sůl	0,10	0,10	0,10
	Methylparaben	0,10	0,10	0,10
	Propylparaben	0,10	0,10	0,10
	Niacinamid	3,5	10	5,0
	Dexpanthenol	0,5	1,0	0,50
	Askorbylfosfát hořečnatý			
	Alantoin	0,2	0,2	0,2

	Benzylalkohol	0,25	0,25	0,25
	Glycerin	7	10	15
	Butylenglykol			
	Kyselina tereftalylidenkafrsulfonová ¹			5,0
	Palmitoyl Lys Thr Thr Lys Ser ²			
Fáze B	Dow Corning 9 040 ³	10		10
	KSG-21 ⁴	7	2	10
	Cyklomethikon	20	10	20
	Dimethikon kopolyol (Dow Corning 5 225C)			
	Vitamin E acetát	0,5	0,5	0,5
	Oxid titaničitý GLW75CAP-MP ⁵			
	Vůně		0,2	
	Farnesol			
	(-)- α -bisabolol			
	Fytantriol	3		
	Parsol 1 789 ⁶	3,0		
	Isopropylpalmitát	7,0		
	Kyselina salicylová		1,5	
	PPG-15-stearylether		8	
	Tospearl 145			1
Fáze C	Finsolv TN	2,0		
	Retinol 50 P			
	Retinylpropionát	0,2		

1 dodává fy Chimex jako Mexoryl SX

2 peptid dodává fy Sederma

3 12 % dimethikon/vinyldimethikon síťovaný polymer v cyklomethikonu od fy Dow Corning

4 dodává fy Shin.Etsu; 25 % dimethikon/kopolymer síťovaný polymer v dimethikonu

5 Oxid titaničitý GLW75CAP-MP dodává fy KOBO

6 Parsol 1 789 dodává fy Roche

Do vhodných oddělených nádob jsou přidány složky fáze A a B a obě fáze jsou míchány ve vhodném mixéru (např. Tekmar model RW20DZM) s vrtulovým nástavcem. Když jsou obě fáze homogenní, fáze A se pomalu za stálého míchání přidá k fázi B a míchá se, až je produkt jednotný. Emulze se homogenizuje vhodným mlýnem (Tekmar T25) po několik minut. Produkt se naplní do vhodných nádob.

Příklady 8 až 15

Pleťová mléka olej ve vodě

Pleťová mléka olej ve vodě se připravují běžnými způsoby z následujících složek.

	Složka	8	9	10	11
Fáze A	Voda U.S.P.	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100
	EDTA dvojsodná sůl	0,1	0,1	0,1	0,1
	Alantoin	0,2	0,2	0,2	0,2
	Glycerin	15		10	20
	Butylenglykol		10		
	Methylparaben	0,2	0,2	0,2	0,2
	Niacinamid	7,5		5	10
	Askorbylfosfát hořečnatý		10		
	Kyselina 2-fenylbenzimidazol-5-sulfonová				
	Triethanolamin				
Fáze B	Polysorbate 40	2	2	2	3
	Glycerylmonostearát	2	2	2	2
	Cetylalkohol	1	1	1	1
	Stearylalkohol	1	1	1	1
	Farnesol				5
	Fytantriol				
	Kyselina salicylová				
	Oxid titaničitý SAT-T-CR50 ¹				
	PPG-15 Stearylether				

	Vitamin E acetát	0,5	0,5	0,5	0,5
	Permethyl 101 A	5	5	3	3
	Parsol 1 789				
	Oktokrylen				
	Oktylsalicylát				
Fáze C	Sepigel 305 ⁵	1	1	1	1
Fáze D	Dow Corning 9 040 ⁴	8		4	7
	KSG-21 ³		7	4	
	Dow Corning 245	2	3	4	2
Fáze E	Retinylpropionát				
	Finsolv TN				
	Vůně	0,2	0,2		

	Složka	8	9	10	11
Fáze A	Voda U.S.P.	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100
	EDTA dvojsodná sůl	0,1	0,1	0,1	0,1
	Alantoin	0,2	0,2	0,2	0,2
	Glycerin	15	10	10	15
	Butylenglykol			5	
	Methylparaben	0,2	0,2	0,2	0,2
	Niacinamid	7,5	5		7,5
	Askorbylfosfát hořčnatý			5	
	Kyselina 2-fenylbenzimidazol-5-sulfonová				4
	Triethanolamin				2
Fáze B	Polysorbate 40	3	3	2	3
	Glycerylmonostearát	2	2	2	2
	Cetylalkohol	1	1	1	1
	Stearylalkohol	1	1	1	1
	Farnesol				
	Fytantriol	5			

	Kyselina salicylová			1,5	
	Oxid titaničitý SAT-T-CR50 ¹			0,5	
	PPG-15 Stearylether			8	
	Vitamin E acetát				
	Permethyl 101 A				3
	Parsol 1 789				2
	Oktokrylen				1,5
	Oktylsalicylát				5
Fáze C	Sepigel 305 ⁵	1	1	1	1
Fáze D	Dow Corning 9 040 ⁴		7		8
	KSG-21 ³	5		4	
	Dow Corning 245	3		2	3
Fáze E	Retinylpropionát		0,2		
	Finsolv TN		2		
	Vůně				

1 dodává fy US Cosmetics

2 dodává fy Roche

3 dodává fy Shin-Etsu; 25 % dimethikon/kopolyol síťovaný polymer v dimethikonu

4 12 % dimethikon/vinyldimethikon síťovaný polymer v cyklomethikonu

5 Sepigel 305 dodává fy Seppic a je polyakrylamid a C₁₃₋₁₄ isoparafin a Laureth-7

Složky fáze A se míchají ve vhodném mixéru (např. Tekmar model RW20DZM) a během míchání se zahřívají na teplotu 70 až 80 °C. Odděleně se míchají ve vhodném mixéru složky fáze B a zahřívají na teplotu 70 až 75 °C. Za stálého míchání se fáze B přidá k fázi A za vzniku emulze. Po vychlazení emulze na 60 °C se za stálého míchání přidá fáze C. Při teplotě emulze 50 °C se za stálého míchání přidá fáze D a při 40 °C za stálého míchání se přidá fáze E. Emulze se pak zhomogenizuje ve vhodném mlýnu (Tekmar T-25) po dobu 5 minut.

Příklady 16 až 18

Nevodné krémy

Nevodné krémy se připravují běžným způsobem z následujících složek.

Složka	16	17	18
Butylenglykol	5	5	5
Glycerin	15	15	15
MOLSIV Adsorbent 3A ¹	40	30	40
Cyklomethikon	15	15	15
Dow Corning 9 040 ²	10		5
KSG-21 ³		10	5
Polyethylenglykol	5	15	5
Kaolin ⁴	10	10	10

1 MOLSIV Adsorbent 3A je zeolit dodávaný fy UOP

2 dodává fy Shin-Etsu; 25 % dimethikon/kopolyol síťovaný polymer v dimethikonu

3 12 % dimethikon/vinyldimethikon síťovaný polymer v cyklomethikonu

4 kaolin je hydratovaný hlinitokřemičitan dodávaný fy Whittaker Clark and Daniels

Všechny složky se míchají ve vhodném mixéru (např. Tekmar model RW20DZM) do vzniku homogenní směsi.

Průmyslová využitelnost

Prostředky k lokální aplikaci na pokožku podle vynálezu jsou využitelné zvláště v kosmetickém a farmaceutickém průmyslu, kdy zajišťují dodání účinných látek na potřebná místa při současném zachování příjemného pocitu a dobrých estetických vlastností.

PATENTOVÉ NÁROKY

1. Prostředek k péči o pokožku k lokálnímu použití se zlepšenými estetickými vlastnostmi, v y z n a č u j í c í s e t í m, že obsahuje:
 - a) 0,0001 % až 40 % hmotnostních účinné látky, výhodně niacinamidu, vztaženo na hmotnost prostředku, rozpustné v lepkavém rozpouštědle;
 - b) dermatologicky přijatelný nosný systém obsahující:
 - i) 1 % až 60 % hmotnostních lepkavého rozpouštědla, výhodně glycerinu, vztaženo na hmotnost prostředku;
 - ii) 0,1 % až 30 % hmotnostních silikonového elastomeru;
 - iii) 1 % až 80 % hmotnostních nosiče elastomeru;a kde směs lepkavého rozpouštědla a účinné látky má smyslové dotekové vyhodnocení větší než 4,5 a prostředek k péči o pokožku má toto vyhodnocení nižší než 4,5, výhodně nižší než 1,0.
2. Prostředek podle nároku 1, v y z n a č u j í c í s e t í m, že poměr lepkavého rozpouštědla k účinné látce je 3 : 2 až 2 : 1.
3. Prostředek podle nároku 1 nebo 2, v y z n a č u j í c í s e t í m, že silikonový elastomer je vybrán ze skupiny obsahující síťovaný polymer kopolyolu dimethikonu, síťovaný kopolymer dimethikon/vinyldimethikon a jejich směsi
4. Prostředek podle kteréhokoliv z nároků 1 až 3, v y z n a č u j í c í s e t í m, že dále obsahuje 1 % až 95 % hmotnostních vody.
5. Prostředek podle kteréhokoliv z nároků 1 až 4, v y z n a č u j í c í s e t í m, že dále obsahuje kondicionér vybraný ze skupiny obsahující činidla na odlupování pokožky, změkčovadla a jejich směsi.
6. Prostředek podle kteréhokoliv z nároků 1 až 5, v y z n a č u j í c í s e t í m, že dále obsahuje barvivo vybrané ze skupiny obsahující anorganické pigmenty, organické pigmenty, tónovací látky a jejich směsi.

7. Prostředek k lokálnímu použití, v y z n a č u j í c í s e t í m, že má zlepšený pocit na dotek a obsahuje:
- a) 5 % až 20 % niacinamidu;
 - b) 7,5 % až 45 % glycerinu;
 - c) 2 % až 10 % silikonového elastomeru;
 - d) 5 % až 40 % nosiče elastomeru;
- kde poměr glycerinu k niacinamidu je alespoň 3 : 2.
8. Prostředek podle kteréhokoliv z nároků 1 až 7, v y z n a č u j í c í s e t í m, že dále obsahuje 0,1 % až 50 % dalších účinných látek vybraných ze skupiny obsahující farnesol, kyselinu salicylovou, pentapeptidy, deriváty vitaminu E a jejich směsi.
9. Použití prostředku podle kteréhokoliv z nároků 1 až 8 k výrobě léčiva k regulaci stavu pokožky.
10. Použití prostředku podle kteréhokoliv z nároků 1 až 8 k výrobě léčiva k regulaci výskytu jemných rýh a vrásek na pokožce.