



(51) МПК  
*A61K 8/60* (2006.01)  
*A61K 8/49* (2006.01)  
*A61K 8/63* (2006.01)  
*A61Q 19/08* (2006.01)  
*A61Q 19/10* (2006.01)

**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

**(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ**

(21)(22) Заявка: 2013140385, 30.01.2012

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:  
 30.01.2012

Дата регистрации:  
 22.09.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
 31.01.2011 DE 102011003408.0;  
 21.02.2011 US 61/444,795

(43) Дата публикации заявки: 10.03.2015 Бюл. № 7

(45) Опубликовано: 22.09.2017 Бюл. № 27

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
 национальной фазе: 02.09.2013

(86) Заявка РСТ:  
 EP 2012/051421 (30.01.2012)

(87) Публикация заявки РСТ:  
 WO 2012/104240 (09.08.2012)

Адрес для переписки:  
 129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,  
 ООО "Юридическая фирма Городисский и  
 Партнеры"

(72) Автор(ы):  
**ШМИДТ Альфред (FR)**

(73) Патентообладатель(и):  
**ЛУКОЛАС-М.Д. ЛТД (GB)**

(56) Список документов, цитированных в отчете  
 о поиске: US 20070148123 A1, 28.07.2007. US  
 20050266064 A1, 01.12.2005. RU 2295951 C1,  
 27.03.2007. RU 2078561 C1, 10.05.1997. US  
 7238377 B2, 03.07.2007. US 5945109 A,  
 31.08.1999. DE 102008034265 A1, 28.01.2010.  
 US 20060003033 A1, 05.01.2006. EP 1265583  
 A1, 18.12.2002. How does alpha lipoic fight  
 cellulite. 17.06.2009. Найдено в Интернет:  
 (см. прод.)

**(54) КОСМЕТИЧЕСКОЕ ПРИМЕНЕНИЕ**

(57) Реферат:

Изобретение относится к косметической промышленности и представляет собой применение в косметических целях в случае целлюлита, растяжек, явлений старения кожи, морщин и сосудистых сеточек, средства, содержащего стероидный инактиватор ароматазы и ингибитор 5- $\alpha$ -редуктазы, где ингибитор 5- $\alpha$ -редуктазы выбран из группы, состоящей из: экстракта из плодов пальмы сереноа (*Serenoa repens*, синоним *Sabal serrulata*), корней крапивы (*Urtica dioica*), экстракта из коры африканской

сливы (*Pygeum africanum*), экстракта из ядер семян тыквы (*Cucurbita pepo*) или финастерида и присутствует в концентрации в интервале от 0,5 до 5 мас.%, антиоксидант, представляющий собой  $\alpha$ -липоевую кислоту или экстракт из зеленого чая, содержащего полифенолы в концентрации от 0,2 до 2,5 мас.% и гиалуроновую кислоту. Изобретение обеспечивает уменьшение или предотвращение целлюлита, растяжек, сосудистых сеточек, улучшение внешнего вида кожи. 6 з.п. ф-лы, 3 пр.

(56) (продолжение):

<http://www.ayushveda.com/dietfitness/how-does-alpha-lipoic-fight-cellulite>. "Обнаружен новый ингредиент против растяжек" 05.08.2010. найдено в Интернет <http://www.dom-olhon.ru/news/412>.

А.И. Венгеровский "Фармакологическая несовместимость", Бюллетень сибирской медицины, 3, 2003, найдено в Интернет: <http://old.ssmu.ru/bull/03/3/1684.pdf>. Харкевич Д.А. Фармакология: Учебник, М.: ГЭОТАР-Медиа, 2006.-736с., стр.66-71. .

R U 2 6 3 1 4 8 3 C 2

R U 2 6 3 1 4 8 3 C 2



FEDERAL SERVICE  
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(51) Int. Cl.  
*A61K 8/60* (2006.01)  
*A61K 8/49* (2006.01)  
*A61K 8/63* (2006.01)  
*A61Q 19/08* (2006.01)  
*A61Q 19/10* (2006.01)

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21)(22) Application: **2013140385, 30.01.2012**

(24) Effective date for property rights:  
**30.01.2012**

Registration date:  
**22.09.2017**

Priority:

(30) Convention priority:  
**31.01.2011 DE 102011003408.0;**  
**21.02.2011 US 61/444,795**

(43) Application published: **10.03.2015** Bull. № 7

(45) Date of publication: **22.09.2017** Bull. № 27

(85) Commencement of national phase: **02.09.2013**

(86) PCT application:  
**EP 2012/051421 (30.01.2012)**

(87) PCT publication:  
**WO 2012/104240 (09.08.2012)**

Mail address:  
**129090, Moskva, ul. B. Spasskaya, 25, stroenie 3,**  
**OOO "Yuridicheskaya firma Gorodisskij i Partnery"**

(72) Inventor(s):  
**SHMIDT Alfred (FR)**

(73) Proprietor(s):  
**LUKOLAS-M.D. LTD (GB)**

(54) **COSMETIC APPLICATION**

(57) Abstract:

FIELD: cosmetology.

SUBSTANCE: invention is the application in cosmetic purposes in case of cellulite, stretch marks, skin aging phenomena, wrinkles and spider veins, of the agent, containing the steroid inactivator of the aromatase and 5- $\alpha$ -reductase inhibitor, where 5- $\alpha$ -reductase inhibitor is selected from the group, containing the Serenoa extract and fruit (Serenoa repens, synonymous with Sabal serrulata), the nettle roots (Urtica dioica), the extract from the prunus africana

bark (Pygeum africanum), the extract from the pumpkin seeds cores (Cucurbita vero), or finasteride and it is present in the concentration in the range from 0.5 to 5 wt %, the antioxidant, that is  $\alpha$ the lipoic acid or the green tea extract, containing the polyphenols in the concentration of 0.2 up to 2.5 wt % and hyaluronic acid.

EFFECT: reduction or prevention of cellulite, stretch marks, spider veins, improving the appearance of the skin.

7 cl, 3 ex

Настоящее изобретение относится к косметическому применению композиции для улучшения общего состояния и внешнего вида кожи.

Идеалы красоты претерпевают некоторые изменения в зависимости от культурной среды или эпохи. Однако и в настоящее время для большинства людей безупречный внешний вид имеет большое значение. При этом решающую роль играют состояние и внешний вид кожи.

В случае кожи речь идет о чрезвычайно многофункциональном органе, которому в организме человека или животного придан ряд существенных функций. Так, например, кожа в одной из функций представляет собой барьер, который ограничивает тело снаружи и предохраняет от вредного влияния окружающей среды или обеспечивает обмен с окружающей средой. В другой из функций кожа играет важную роль в обмене веществ и, например, существенно влияет на защиту от возбудителей заболеваний, а также на аллергические реакции.

Например, в результате злоупотребления никотином и/или алкоголем и постоянного воздействия на кожу факторов окружающей среды, таких, как, например, УФ-излучение, наступает так называемое экзогенное старение кожи. Кроме того, эндогенные факторы, такие, как, например, генетическая предрасположенность, вызывают дополнительный эффект старения.

Результат старения кожи выражается в образовании морщин вследствие высыхания и потери эластичности эпидермиса. Вместе с этим проявляется ухудшенное заживление ран и наблюдается в целом более тонкий слой эпидермиса. Данное обстоятельство ведет к большей заметности измененных кровеносных сосудов, особенно в случае сосудистых сеточек.

Другое состояние, приводящее к значительному ухудшению внешнего вида кожи, представляет собой целлюлит. В случае целлюлита речь идет не о состоянии, обусловленном заболеванием, а скорее об эстетической проблеме, которая в первую очередь проявляется у женщин. При этом в подкожной ткани происходит повышенное отложение жира, что при соответствующей слабости соединительной ткани ведет к неравномерному образованию углублений на коже, т.е. так называемой "апельсиновой корки".

Так называемые растяжки также представляют собой для многих людей ухудшение качества их жизни. Растяжки образуются при перерастяжении соединительной ткани в подкожной ткани, например, вследствие сильного увеличения массы тела. Перерастяжение соединительной ткани ведет сначала к появлению иссиня-красных полос; вследствие зарубцовывания эти разрывы ткани позже проявляются в виде светлых полос, которые в зависимости от пигментации поврежденных участков кожи в разной степени отличаются от окружающей кожи.

Индустрия косметических средств предлагает различные продукты, которые в общем случае должны противодействовать явлениям старения. Однако долговременный успех соответствующих продуктов и способов значительно отстают от ожиданий пользователей. Так, например, преимущественно применяют два способа удаления сосудистых сеточек, при этом оба способа связаны с побочными эффектами, и в их случае часто встречаются рецидивы. В случае склерозирования речь идет об инвазивном способе, при котором наряду с болями могут встречаться такие побочные эффекты, как гематомы и тромбозы вен. В случае обработки лазером, при которой часто требуется проводить несколько сеансов, в качестве побочных эффектов могут встречаться аллергические реакции кожи и боли. Частота рецидивов является относительно большой в случае обоих способов.

Таким образом, существует потребность в косметическом вмешательстве, которое в общем случае противодействует указанным ранее феноменам и явлениям старения кожи.

5 Задачей настоящего изобретения является разработка косметического применения композиции, улучшающей внешний вид кожи. При этом видимые проявления целлюлита, растяжек, сосудистых сеточек и явлений старения в общем случае должны в особой степени уменьшаться или предотвращаться.

10 Эта задача решается в настоящем изобретении соответственно сущности п.1 формулы изобретения. Предпочтительные варианты осуществления описаны в соответствующих зависимых пунктах формулы изобретения.

Настоящее изобретение относится к применению в косметических целях средства, предпочтительно композиции, содержащей следующие активные вещества:

- а) ингибитор ароматазы и/или ингибитор 5- $\alpha$ -редуктазы;
- б) антиоксидант;
- 15 в) гиалуроновая кислота.

При применении по настоящему изобретению отдельные компоненты а), б) и/или в) могут быть использованы независимо друг от друга совместно, т.е. в общей композиции, или альтернативно по отдельности в индивидуальных формах, используемых при этом так, что они действуют по меньшей мере в течение одного общего промежутка времени.

20 Применение в общей композиции является предпочтительным.

Состояние кожи в существенной степени определяется микроциркуляцией в коже. Микроциркуляция препятствует, например, росту или размножению жировых клеток. Прирост жировых клеток или увеличение содержания жира в клетках уменьшает водосвязывающую способность кожи и ведет к образованию морщин.

25 По настоящему изобретению неожиданно было найдено, что применение композиции по настоящему изобретению, содержащей наряду с ингибитором ароматазы и/или ингибитором 5- $\alpha$ -редуктазы также антиоксидант и гиалуроновую кислоту, отчетливо улучшает общий внешний вид кожи. Применение по настоящему изобретению ведет не только к уменьшению морщин, но и вызывает также улучшение в отношении

30 целлюлита, растяжек, сосудистых сеточек, а также общего вида поверхности кожи. Применение по настоящему изобретению благоприятно действует особенно в отношении явлений старения (например, старческих пятен, морщинок в уголках глаз, морщин на лице вообще и т.п.), старения кожи в области шеи и плеч или явлений УФ-старения (Foto-Aging (фотостарение)).

35 Без намерений ограничить объем настоящего изобретения теорией принято, что эффект по настоящему изобретению основан на улучшении микроциркуляции в коже. Микроциркуляция в свою очередь ведет не только к повышенному связыванию воды в коже, но также и к укреплению коллагеновых волокон и, таким образом, к гладкой поверхности кожи. Кроме того, микроциркуляция, улучшенная благодаря применению

40 по настоящему изобретению, видимо, стимулирует также процессы обмена веществ в коже. Принято, что вредные продукты обмена веществ, накапливающиеся при недостаточной микроциркуляции в коже, метаболизируются и/или отводятся лимфой. Благодаря этому в дополнение к гормональному балансу восстанавливается также метаболическое равновесие кожи и укрепляется соединительная ткань. Предполагается,

45 что одновременно с этим благодаря действию антиоксиданта уменьшается или полностью предотвращается действие вредных радикалов, что служит защите кожи от новых повреждений. Таким образом, благодаря этому составу, направленному на устранение центральных причин большинства повреждений кожи, можно влиять на

самые разные феномены, вредящие внешнему виду кожи. Благодаря улучшенному питанию кожи и улучшенной защите кожи от повреждений радикалами и от потерь влаги улучшается общее состояние кожи.

Кроме того, предполагается, что неожиданное улучшение внешнего вида кожи вызывается благодаря синергическому взаимодействию отдельных компонентов композиции по настоящему изобретению. Благодаря действию ингибитора ароматазы или ингибитора 5- $\alpha$ -редуктазы локально уменьшается или предотвращается превращение тестостерона в эстроген. Данное обстоятельство ведет, в частности, к уменьшенному приросту жировых клеток или к уменьшению объема/содержания жира жировых клеток. Одновременно с этим ускоряются анаболические процессы, способствующие укреплению соединительной ткани и заживлению ран. В частности, одновременное применение гиалуроновой кислоты является важным потому, что оно усиливает действие ингибитора ароматазы или ингибитора 5- $\alpha$ -редуктазы вследствие того, что улучшает резорбцию этих активных веществ и антиоксиданта и "удерживает" активные вещества в коже.

Как было указано ранее, антиоксидант защищает от свободных радикалов и, таким образом, уменьшает или устраняет повторное повреждение кожи.

При этом действие отдельных активных веществ усиливается в заметно повышенной пропорции, что ведет к неожиданному улучшению общего состояния кожи.

Настоящее изобретение подробно и наглядно поясняется приведенным далее описанием предпочтительных вариантов осуществления, однако без ограничения общей концепции изобретения.

Настоящее изобретение относится к применению в косметических целях средства или композиции, содержащих наряду с ингибитором ароматазы и/или ингибитором 5- $\alpha$ -редуктазы также антиоксидант и гиалуроновую кислоту.

По настоящему изобретению применение антиоксиданта в комбинации с ингибитором ароматазы и/или ингибитором 5- $\alpha$ -редуктазы и другими компонентами, гиалуроновой кислотой, противодействует процессу старения кожи и улучшает - в первую очередь вследствие комбинации с гиалуроновой кислотой - микроциркуляцию в коже.

Ингибиторы ароматазы по настоящему изобретению представляют собой любые вещества, которые – независимо от их структуры – отличаются общим признаком, заключающимся в их способности эффективно ингибировать или полностью инактивировать ароматазу (обзорная статья: Santen et al., *Endocrine Reviews* 2009; 30: 343-375). Способность вещества ингибировать или инактивировать ароматазу может быть определена способами, известными специалистам в данной области техники.

Радиометрическое испытание позволяет измерять активность ароматазы в ходе только одной стадии посредством определения высвобождения трития субстратом, меченным тритием (Thompson and Siiteri, *Journal of Biological Chemistry* 1974; 249:5364-5372). Группа ингибиторов ароматазы является структурно неоднородной и включает в себя как стероидные, так и нестероидные соединения, причем для лекарственной терапии по настоящему изобретению приемлемыми являются представители обеих групп. В качестве нестероидных ингибиторов ароматазы могут быть использованы, например, анастрозол, летрозол и ворозол. Предпочтительные стероидные ингибиторы ароматазы (инактиваторы ароматазы) представляют собой 4-гидроксиандростендион, эксеместан, 4-ацетоксиандростендион, 5- $\alpha$ -андрост-3-ен-17-он и 3- $\alpha$ ,4- $\alpha$ -эпокси-5- $\alpha$ -андростан-17-он.

Ингибиторы 5- $\alpha$ -редуктазы в смысле настоящего изобретения представляют собой любые вещества, уменьшающие или полностью ингибирующие активность 5- $\alpha$ -редуктазы типа I и/или типа II. Примеры ингибиторов 5- $\alpha$ -редуктазы, которые могут быть

использованы по настоящему изобретению, представляют собой, в частности, экстракт из плодов пальмы сереноа (*Serenoa repens*, синоним *Sabal serrulata*), корней крапивы (*Urtica dioica*), экстракт из коры африканской сливы (*Pygeum africanum*), экстракт из ядер семян тыквы (*Cucurbita pepo*) или финастерид.

5 По настоящему изобретению ингибитор ароматазы предпочтительно обладает силой действия, характеризуемой средней ингибирующей концентрацией IC(50) в интервале от 0,2 до 500 нМ.

Ингибитор 5- $\alpha$ -редуктазы по настоящему изобретению предпочтительно характеризуется средней ингибирующей концентрацией IC(50) в интервале от 5 до 500  
10 нМ.

Антиоксидант по настоящему изобретению представляет собой "акцептор свободных радикалов", который улавливает свободные радикалы или прекращает их вредное влияние в клетке. Антиоксидант должен отличаться от ингибитора ароматазы. Как уже было указано в описании настоящего изобретения, в то время как принципы  
15 действия антиоксидантов являются совпадающими и непротиворечивыми, сама группа антиоксидантов является очень неоднородной структурно. Вещества, приемлемые по настоящему изобретению, выбирают по их способности предотвращать окисление других соединений. Специалисты в данной области техники могут идентифицировать антиоксидант принятыми и опубликованными способами. Эти способы известны  
20 специалистам в данной области техники и в настоящем описании подробно не поясняются. Так, например, количество свободных радикалов может быть определено способом ЭПР (electric paramagnetic resonance (электронный парамагнитный резонанс)) (Lo Scalzo, EJEAFChе 2010; 9:1360-1371). С этой целью применяют такие вещества, как, например, 5,5-диметил-1-пирролин-N-оксид (DMPO) или 1,1-дифенил-2-пикрилгидразил (DPPH), имеющие высокое сродство к свободным радикалам и образующие с ними  
25 стабильные соединения, которые можно определять спектрометрически. Также используют способы, в случае которых определяемое вещество очищают хроматографически (например, способом ВЭЖХ) (Yamaguchi et al., Bioscience, Biotechnology, and Biochemistry 1998; 62:1201-1204). По настоящему изобретению используют вещества-антиоксиданты. Применяемые антиоксиданты могут представлять собой вещества различных химических классов и различного происхождения. Они могут представлять собой также вещества-антиоксиданты, которые продуцируются в организме и количество или возможность использования которых активно повышают за счет дополнительного введения в пределах применения по настоящему изобретению  
35 и/или которые при необходимости доставляют непосредственно к требуемому месту приемлемым способом введения. Антиоксиданты неферментного типа представляют собой предпочтительно флавоноиды (например, олигомеры проантоцианидинов (ОРС), антоцианы или полифенолы, такие, как кверцетин или катехин), витамины (например, витамин С, витамин Е), каротиноиды (например,  $\beta$ -каротин, ликопен, лютеин),  
40 минеральные вещества (например, медь, марганец, цинк, селен), гормоны (например, мелатонин), стероиды (например, кортизон), убихинон, N-ацетилцистеин,  $\alpha$ -липоевую кислоту, экстракт из зеленого чая, содержащий активную антиокислительную композицию из полифенолов, при необходимости также аминокислот, минеральных веществ (микроэлементов) и полисахаридов, и в первую очередь содержащий особые  
45 полифенолы эпикатехин и эпигаллокатехин с высоким антиокислительным действием (например, OM24<sup>®</sup>, поставляемый компанией Omnimedica, Швейцария), и глутатион. Некоторые ферменты выполняют функцию антиоксидантов и квалифицируются как антиоксиданты ферментного типа, такие, как, например, глутатионпероксидаза,

супероксиддисмутаза и каталаза. По сравнению с антиоксидантами, имеющими только возможное эндогенное происхождение или вводимыми только окказионально или для других целей, по настоящему изобретению приемлемое количество может быть обеспечено дозировкой или топическим применением, так что достигается требуемый косметический эффект.

В предпочтительном варианте осуществления антиоксидант, применяемый в косметической композиции, представляет собой  $\alpha$ -липоевую кислоту (1,2-дителилан-3-пентановую кислоту) или экстракт из зеленого чая, содержащий полифенолы, в частности ОМ24<sup>®</sup>.  $\alpha$ -Липоевая кислота является активной как в водной, так и в жировой среде клеток. Она резорбируется кожей в значительной степени. Это относится в первую очередь к комбинации с гиалуроновой кислотой. Это обстоятельство открывает различные возможности для применения.  $\alpha$ -Липоевая кислота в организме быстро превращается в дигидролипоевую кислоту. Дигидролипоевая кислота восстанавливает другие, дополнительные, антиоксиданты, такие, как витамин С и витамин Е, что может приводить к другим усиленным эффектам при применении  $\alpha$ -липоевой кислоты. Кроме того,  $\alpha$ -липоевая кислота индуцирует образование в ткани глутатиона. При этом  $\alpha$ -липоевая кислота восстанавливает глутатион из глутатиондисульфида.

При топическом применении композиции на коже активные вещества наносят на обрабатываемый участок кожи. При этом количество активного вещества предпочтительно выбирают так, чтобы эффективная концентрация достигалась только локально при отсутствии содержания в плазме. Это позволяет избегать нежелательного системного действия. Аналогично предотвращаются нежелательные побочные действия при применении в течение более длительного промежутка времени.

Альтернативно могут быть использованы другие формы нанесения, например распыление активных веществ на поверхности кожи, подлежащей лечению.

При этом активные вещества могут быть нанесены отдельно друг от друга или в общей композиции, если при этом гарантируется, что активные вещества одновременно достигают целевой ткани или по меньшей мере перекрываются промежутки времени, в течение которых отдельные активные вещества находятся в целевой ткани в форме активных субстанций.

В предпочтительном варианте осуществления настоящего изобретения  $\alpha$ -липоевую кислоту и гиалуроновую кислоту применяют в комбинации с ингибитором ароматазы и/или ингибитором 5- $\alpha$ -редуктазы. В особенно предпочтительном варианте осуществления по настоящему изобретению применяют  $\alpha$ -липоевую кислоту, гиалуроновую кислоту и 4-ацетоксиандростендион. Применение в качестве антиоксиданта экстракта из зеленого чая, содержащего полифенолы, в частности ОМ24<sup>®</sup>, при применении вместо  $\alpha$ -липоевой кислоты или в дополнение к ней также является предпочтительным.

Дополнительные вспомогательные вещества, используемые, как правило, в косметических композициях (кремы, мази, гели, пены, настойки, лосьоны и т.д.), могут комбинироваться с указанными ранее активными веществами. В частности, композиция по настоящему изобретению может содержать вспомогательные вещества, используемые, как правило, в случае топических форм применения. В таких формах, как спрей, могут быть использованы соответствующие носители и вспомогательные вещества, известные специалистам в данной области техники.

По настоящему изобретению предпочтительные концентрации ингибитора ароматазы в композиции находятся в интервале от 0,25 до 1,5 мас.% (например, 0,6 мас.% в случае целлюлита).

Концентрация ингибитора 5- $\alpha$ -редуктазы по настоящему изобретению находится в интервале от 0,5 до 5 мас. %.

Антиоксидант содержится в композиции предпочтительно с концентрацией от 0,2 до 2,5 мас. %.

5 Композицию наносят на соответствующие участки кожи, как правило, 1-2 раза в день. При этом при каждом применении, как правило, используют, например, 1-5 г крема или 2-5 мл спрея.

Настоящее изобретение наглядно поясняется приведенными далее примерами, не ограничивающими изобретение.

10 Приведенные примеры 1 и 2 наглядно показывают эффективность применения по настоящему изобретению в случае сосудистых сеточек. При этом была использована следующая композиция:

1,0% ацетоксиандростендиона;

0,5%  $\alpha$ -липоевой кислоты;

15 0,5% гиалуроновой кислоты;

в качестве активных веществ

в креме-основе DAC:

4,0 г глицеринмоностеарата;

6,0 г цетилового спирта;

20 7,5 г триглицеридов с цепями средней длины (нейтральное масло, миглиол);

25,5 г белого вазелина;

7,0 г глицеринмоностеарата макрогола-20;

10,0 г пропиленгликоля;

40,0 г очищенной воды.

25 Пример 1

S.H.C., 48 лет, женщина: сосудистые сеточки на внутренней поверхности бедра на высоте коленного сустава с обеих сторон, а также заметное округлое скопление (диаметром около 1,5 см) на задней поверхности левого бедра немного выше коленного сустава.

30 После четырехнедельного лечения кремом по настоящему изобретению 2 раза в день: округлое скопление на задней поверхности исчезло, однако еще видны протяженные, но уже светлые сосудистые сеточки. Лечение продолжается при полном отсутствии побочных действий.

Пример 2

35 E.C., 51 год, женщина: сосудистые сеточки на наружных сторонах обоих бедер и на икрах.

После лечения кремом по настоящему изобретению в течение 3 месяцев 2 раза в день: видимые сосудистые сеточки почти отсутствуют.

40 Лечение продолжается при применении один раз в день при полном отсутствии побочных действий. В приведенном далее примере 3 представлены результаты, полученные на пациентках-испытательницах с целлюлитом. При этом 1 раз в день использовали следующую композицию крема (приблизительно 1,5 г на один поврежденный участок тела; результаты приведены в мас. %):

0,6% ацетоксиандростендиона;

45 0,5%  $\alpha$ -липоевой кислоты;

0,2% гиалуроновой кислоты;

в качестве активных веществ

в креме-основе DAC:

4,0 г глицеринмоноостеарата;  
 6,0 г цетилового спирта;  
 7,5 г триглицеридов с цепями средней длины (нейтральное масло, миглиол);  
 25,5 г белого вазелина;  
 5 7,0 г глицеринмоноостеарата макрогола-20;  
 10,0 г пропиленгликоля;  
 40,0 г очищенной воды.

ПРИМЕР 3. Исследование по наблюдению за 50 пациентками-испытательницами

10 Пациенток-испытательниц лечили в 5 швейцарских салонах здоровья. Были приняты только пациентки с целлюлитом выраженностью 2 и 3 балла по шкале оценок целлюлита по Нюрнбергер и Мюллер (Nürnberg F., Müller G.: So-called Cellulite: an invented disease. J. Dermatol. Surg. Oncol. 1978, 4: 221-9).

Шкала Нюрнбергер:

0 = отсутствие "апельсиновой корки" (целлюлита);  
 15 1 = незначительная выраженность;  
 2 = умеренная выраженность;  
 3 = сильная выраженность.

Продолжительность исследования составляла 12 недель. Контрольный срок наблюдения 0: перед лечением/началом лечения; другие контрольные сроки  
 20 исследования: через 4, 8 и 12 недель.

Пациентки-испытательницы со средним возрастом 36 лет (19-57 лет) были здоровы и имели массу тела от нормальной до слегка избыточной.

Результаты терапии (через 12 недель; оценка по шкале Нюрнбергер):

перед началом терапии: 29 пациенток с оценкой 2 балла;  
 25 21 пациентка с оценкой 3 балла.

Все пациентки наблюдались в течение 12 недель. Результаты через 12 недель применения: из 29 пациенток с умеренной выраженностью перед началом у 20 пациенток целлюлит отсутствовал (0 баллов), 9 пациенток получили оценку в 1 балл, соответствующую незначительной выраженности.

30 Из 21 пациентки с оценкой 3 балла через 12 недель 8 пациенток получили оценку 2 балла, 11—1 балл, 2—0 баллов.

На нежелательные эффекты не пожаловалась ни одна из пациенток; крем воспринимался как очень приятный и эффективный. Для сохранения и дальнейшего улучшения результатов пациентки продолжают применение крема именно с такой же  
 35 композицией.

#### (57) Формула изобретения

1. Применение в косметических целях в случае целлюлита, растяжек, явлений старения кожи, морщин и сосудистых сеточек, средства, содержащего следующие активные  
 40 вещества:

стероидный инактиватор ароматазы и ингибитор 5- $\alpha$ -редуктазы, где ингибитор 5- $\alpha$ -редуктазы выбран из группы, состоящей из следующих: экстракт из плодов пальмы сереноа (*Serenoa repens*, синоним *Sabal serrulata*), корней крапивы (*Urtica dioica*), экстракт из коры африканской сливы (*Pugium africanum*), экстракт из ядер семян тыквы (*Cucurbita pepo*) или финастерид и присутствует в концентрации в интервале от 0,5 до 5 мас.%;  
 45 - антиоксидант, представляющий собой  $\alpha$ -липовую кислоту или экстракт из зеленого чая, содержащего полифенолы в концентрации от 0,2 до 2,5 мас.%;  
 - гиалуроновая кислота.

2. Применение по п. 1, при котором стероидный инактиватор ароматазы выбран из группы, состоящей из следующих: 4-гидроксиандростендион, эксеместан, 4-ацетоксиандростендион, 5- $\alpha$ -андрост-3-ен-17-он и 3- $\alpha$ ,4- $\alpha$ -эпокси-5- $\alpha$ -андростан-17-он.

3. Применение по п. 1 или 2, при котором стероидный инактиватор ароматазы  
5 отличается тем, что средняя инактивирующая концентрация IC(50) находится в интервале от 0,2 до 500 нМ.

4. Применение по п. 1, при котором ингибитор 5- $\alpha$ -редуктазы ингибирует активность 5- $\alpha$ -редуктазы типа I и/или типа II.

5. Применение по п. 1, при котором ингибитор 5- $\alpha$ -редуктазы  
10 отличается тем, что средняя ингибирующая концентрация IC(50) находится в интервале от 5 до 500 нМ.

6. Применение по п. 1, при котором композицию применяют на коже.

7. Применение по п. 1, при котором композиция содержит 4-ацетоксиандростендион, экстракт из пальмы сереноа,  $\alpha$ -липоевую кислоту и/или экстракт из зеленого чая,  
15 содержащий полифенолы, предпочтительно OM24<sup>®</sup>, и гиалуроновую кислоту.

20

25

30

35

40

45