



УКРАЇНА

(19) UA (11) 88175 (13) C2  
(51) МПК (2009)  
A61K 8/34 (2006.01)  
A61Q 19/08

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ

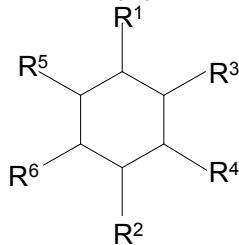
## ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) СПОСІБ КОСМЕТИЧНОЇ ОБРОБКИ СТАРІЮЧОЇ ШКІРИ ЗА ДОПОМОГОЮ МІСЦЕВОГО ЗАСТОСУВАННЯ КОМПОЗИЦІЇ, ЩО МІСТИТЬ ЦИКЛОГЕКСАНМОНО-, -ДИ- АБО -ТРИОЛИ АБО ЦИКЛОГЕКСИЛ-МЕТАН- АБО -ЕТАН-, АБО -ПРОПАНОЛИ

1

(21) a200703109  
(22) 29.07.2005  
(24) 25.09.2009  
(86) PCT/US2005/027053, 29.07.2005  
(31) 10/925,851  
(32) 25.08.2004  
(33) US  
(46) 25.09.2009, Бюл.№ 18, 2009 р.  
(72) ЧОМЗІНСЬКІ ПІОТР, US/US  
(73) МОЛЕКУЛАР РЕСЕРЧ СЕНТЕР, ІНК., US  
(56) US 2003/232893 A1, 18.12.2003  
US 2004/067209 A1, 08.04.2004  
DE 101 51 247 A1, 30.04.2003  
EP 0 566 049 A, 20.10.1993  
DE 197 37 987 C1, 14.01.1999

(57) 1. Спосіб косметичної обробки старіючої шкіри та підтримання її здорового вигляду шляхом досягнення ефектів, вибраних із зменшення плям на шкірі та поверхневих недоліків, заспокоєння та покращення стану подразненої та запаленої шкіри, зменшення почервоніння, припухлості та рубців на шкірі, підтримання структури шкіри, очищення закритих та запалених пор та їх комбінацій, що включає місцеве застосування до людини, якій необхідне таке лікування, у місці зазначеного стану безпечної та ефективної кількості сполуки, що має формулу:



у якій R<sup>1</sup> вибирають з -ОН, та C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкіл ОН; та R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> і R<sup>6</sup> кожен незалежно вибирають з -Н, -ОН, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілу та C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкілу за умо-

2

ви, що сполука містить не більше ніж п'ять -ОН груп.

2. Спосіб за п. 1, у якому сполуку застосовують до шкіри у кількості від 0,001 до приблизно 10 мг/см<sup>2</sup>.

3. Спосіб за п. 2, у якому сполуку застосовують до шкіри у місцевому косметичному носії.

4. Спосіб за п. 3, у якому сполуку вибирають з циклогексанолу, 2-циклогексилетанолу, циклогексилметанолу, 3-циклогексил-1-пропанолу, 1,4-циклогександіолу, 1,3-циклогександіолу, 1,2-циклогександіол, 4-циклогексилциклогексанолу, 4-метилциклогексанолу, 1,2,3-циклогексантриолу, 1,3,5-циклогексантриолу, 1,4,5-циклогексантриолу та їх сумішей.

5. Спосіб за п. 3, у якому сполука містить не більше ніж 3 гідроксильні групи.

6. Спосіб за п. 5, у якому сполуку вибирають з 1,2-циклогександіолу, 1,3-циклогександіолу, 1,4-циклогександіолу, 1,2,3-циклогексантриолу, 1,3,5-циклогексантриолу та їх сумішей.

7. Спосіб за п. 3, у якому R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> і R<sup>6</sup> незалежно вибирають з -Н та -ОН.

8. Спосіб за п. 3, у якому косметичний носій містить матеріал, вибраний з пропіленгліколю, гліцерину, води, диметилізосорбіду та їх сумішей.

9. Спосіб за п. 6, у якому косметичний носій містить матеріал, вибраний з пропіленгліколю, гліцерину, води, диметилізосорбіду та їх сумішей.

10. Спосіб за п. 3, у якому носій формують у композицію, вибрану з розчинів, суспензій, гелів, паст, твердих речовин та мил.

11. Спосіб за п. 3, у якому місцеве застосування сполуки доповнюють медично активною пероральною добавкою.

12. Спосіб за п. 11, у якому пероральна добавка являє собою томатні продукти, вибрані з соку, гомогенату, конденсату, паст, екстрактів, екстрагованих продуктів та їх сумішей

зовнішнього вигляду шкіри, включаючи зменшення почервоніння, запалення, подразнення та старіння шкіри, та недоліки шкіри, пов'язані з захворюваннями шкіри, також як і для підтримання здоров'я шкіри та волосся.

Передумови створення винаходу

Повсякденне старіння та зношування шкіри приводить до численних станів, які можуть бути неприємними, незручними та непривабливими. Вони включають почервоніння шкіри та цілу низку симптомів шкіри, які пов'язані з захворюваннями шкіри, такими як запалення, подразнення та старіння шкіри. Даний винахід забезпечує косметичні композиції та способи, які можуть бути використані для полегшення цих симптомів, збільшуючи привабливість та/або покращуючи зовнішній вигляд шкіри. Крім того, даний винахід також охоплює косметичну композицію та спосіб лікування, який може бути використаний для підтримання здоров'я шкіри та волосся, також як і зменшення подразнення волоссяних фолікулів та втрати волосся.

Органічні спирти, діоли та поліоли описані для місцевого застосування у лікуванні цілої низки дерматологічних станів.

В патенті США 6 290 937, Brown, та ін., виданому 18 вересня 2001 року, та який був анульований після видачі Патентним бюро, описаний ряд фармацевтичних композицій, що, як описувалось, підвищують вміст меланіну меланоцитів ссавців та які, як також було зазначено, є корисними у лікуванні проліферативних розладів шкіри, таких як звичайних вугрів. В розкритих композиціях можуть використовуватись  $C_3$ - $C_{50}$  діоли як фармацевтично активні агенти; 1,2-цис- та 1,2-транс-циклогександіол специфічно розкриті як активні інгредієнти. Крім того, 1,2-цис-циклопентандіол являв собою одну з кращих активних сполук. Так як зазначений патент був анульований після видачі, він не становить частину попереднього рівня техніки.

В патенті США 6 184 422, Barbier, та ін., виданому 6 лютого 2001, розкрита група ненасичених довго-ланцюгових (наприклад,  $C_{12}$ ) похідних циклогександіолу. Зазначені матеріали, як описано, є корисними при місцевому застосуванні для лікування гіперпроліферативних захворювань та хвороб сальних залоз, таких як акне. Дивись також пов'язаний Патент США 5 969 190.

В патенті США 5 886 233, Steinmeyer, та ін., виданому 23 березня 1999, описані похідні циклогексанону, використані для синтезу сполук вітаміну D. Зазначено, що сполуки є корисними для лікування шкіри, наприклад, у лікуванні акне.

В патенті США 6 277 837, DeLuca, Jr., та ін., виданому 21 серпня 2001, описана група сполук, споріднених з вітаміном D, які включають циклогександіольний залишок. Зазначено, що композиції є корисними для лікування хвороб, пов'язаних з проліферацією клітин, таких як псоріаз. Дивись також пов'язані Патенти США 6 127 559; 5 945 410; 5 936 133; та 5 843 928.

В патенті США 5 641 809, Hagen, та ін., виданому 24 червня 1997, описано композицію для лікування шкіри, яка включає ланолін разом зі складним ефіром ланолінової кислоти. В зазначеному патенті зазначено, що ланолін включає  $C_9$ - $C_{22}$  діоли як один з його компонентів.

Патент США 6,723,755, Chomczynski, виданий 20 квітня 2004, відноситься до застосування матеріалів, одержаних з циклогексанолу, для лікування розацеа (червоних вугрів), звичайних вугрів та запальних симптомів. США та РСТ еквіваленти зазначеного виданого патенту надруковані як патентні заявки у грудні 2003 року.

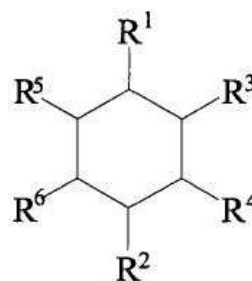
Інша похідна циклогексану, інозитол, що містить шість гідроксильних груп, була використана у фармацевтичних та косметичних галузях. Зазначена сполука матеріалу залучається у підтримання шкіри (дивись Daniel B. Mowrey, *The Scientific Validation of Herbal Medicine*, стор. 247-251, 1986). Наприклад, інозитол був використаний як додатковий компонент у лікуванні акне за допомогою рослинних екстрактів та еритроміцину у Патенті США 4 803 069, Kekesi, виданому 7 лютого 1989. У зазначеному патенті було описано застосування інозитулу, при використанні разом з іншими компонентами, для забезпечення нормалізуючого ефекту на шкіру.

В патенті США 5,116,605, Alt, виданому 26 травня 1992, описано застосування інозитулу як необов'язкового солюбілізуючого та/або диспергуючого агенту у композиції для зменшення чоловічого облісіння.

Патент США 5,962,517, Murad, виданий 5 жовтня 1999, описує застосування інозитулу як додаткового компоненту, що застосовують перорально у режимі лікування акне, використовуючи сполуки цинку та вітамін А. Патент США 6,645,510, Coury та ін., виданий 11 листопада 2003, описує продукт на основі емульсії для застосування на шкірі, який може включати інозитол як лікуючий агент.

Короткий опис винаходу

Даний винахід відноситься до способу покращення вигляду шкіри шляхом лікування почервоніння шкіри та цілого ряду симптомів шкіри, пов'язаних з захворюваннями шкіри, включаючи запалення, подразнення та старіння шкіри, у людей, що включає місцеве застосування до людини, якій необхідне таке лікування, безпечної та ефективною кількості (наприклад, від приблизно 0,001 до приблизно 10 мг/см<sup>2</sup>) сполуки, що має наступну формулу, у місці зазначеного стану:



у якій R<sup>1</sup> вибирають з -OH та  $C_1$ - $C_3$  алкіл OH (алканолу), та R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> та R<sup>6</sup> кожен незалежно вибирають з -H, -OH,  $C_1$ - $C_6$  алкілу та  $C_3$ - $C_6$  циклоалкілу; де загальна кількість -OH груп у сполуці не може перевищувати п'яти.

Особливо кращі сполуки являють собою циклогексанол, циклогександіолі (включаючи 1,2-циклогександіол, 1,3-циклогександіол та 1,4-циклогександіол), циклогексантриолі (включаючи 1,2,3-циклогексантриол та 1,3,5-циклогексантриол), та суміші зазначених матеріалів. Активний матеріал може застосовуватися з косметичним носієм.

Даний винахід також охоплює спосіб підтримання здоров'я волосся та зменшення втрати волосся у людей, що включає місцеве застосування до шкіри голови пацієнта, якому необхідне таке лікування, безпечної та ефективної кількості активної сполуки, що визначена вище.

На кінець, даний винахід включає косметичні композиції для місцевого застосування, які містять від приблизно 0,001 % до приблизно 10 % активної сполуки, що визначена вище, разом з косметично прийнятним місцевим носієм. Косметичні композиції можуть бути, наприклад, у формі гелю, крему, пасти, твердої речовини, тоніку, мила, гігієнічної рідини для тіла, маски для обличчя або шампуню.

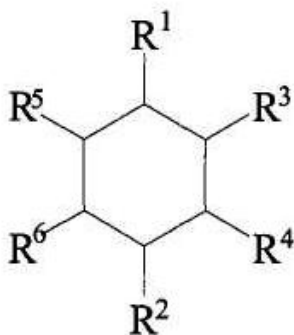
Всі відсотки та співвідношення, представлені у цьому описі, подані у одиницях за масою, поки не зазначено інше.

Всі патенти та інші публікації, процитовані у цьому описі, включені у нього шляхом посилання.

#### Детальний опис винаходу

Як використано у цьому описі, термін "безпечна та ефективна кількість", як передбачають, визначає ту кількість активного матеріалу або косметичної композиції, що містить зазначений активний матеріал, який використаний для забезпечення ефективного лікування стану, що лікують, такого як почервоніння шкіри, запалення шкіри, подразнення шкіри та старіння шкіри, або з метою підтримання стану шкіри та волосся, не наражаючи користувача на значний ризик побічних ефектів, які можуть супроводжувати застосування будь-якого активного матеріалу.

Даний винахід забезпечує композицію та спосіб покращення вигляду шкіри шляхом зниження почервоніння шкіри або симптомів, пов'язаних із запаленням шкіри, подразненням та старінням шкіри. Зазначений спосіб виконують шляхом місцевого застосування активного матеріалу, що має наступну формулу:



У зазначеній формулі,  $R^1$  вибирають з -ОН та  $C_1$ - $C_3$  алкіл ОН ( $C_1$ - $C_3$  алканолі); та  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  та  $R^6$  незалежно вибирають з -Н, -ОН,  $C_1$ - $C_6$  алкілу

та  $C_3$ - $C_6$  циклоалкілу. Загальна кількість ОН груп у формулі не повинна перевищувати п'яти. У зазначеній формулі, вважається кращим, коли  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  та  $R^6$  вибирають з -Н та -ОН, та додатково коли молекула загалом містить не більше ніж три гідроксильні групи. Кращі сполуки для застосування у даному винаході вибирають з групи, що включає циклогексанол, 2-циклогексилетанол, циклогексилметанол, 3-циклогексил-1-пропанол, 1,4-циклогександіол, 1,3-циклогександіол, 1,2-циклогександіол, 4-циклогексилциклогексанол, 4-метилциклогексанол, 1,2,3-циклогексантриол, 1,3,5-циклогексантриол, та 1,4,5-циклогексантриол. Також можуть бути використані суміші цих матеріалів. Відповідно до винаходу, можуть бути використані як цис, так і транс ізомери (або суміші) активних матеріалів. Ізомери (як структурні, так і стереохімічні), фосфо- та фосфатидило- похідні, та метаболіти активних сполук, як передбачається включені у визначення цих сполук.

Споріднені матеріали, які були випробувані та було знайдено, що вони не є корисними у даному винаході, включають такі як: циклогексан, циклогексен, циклогексилацетат, циклогексилхлорид, 4-циклогексил-1-бутанол, циклогексил-карбонова кислота, 1-метилциклогексанол та ментол. Насправді, ментол не тільки не забезпечує користі при застосуванні у даному винаході, але також може подразнювати (і таким чином викликати почервоніння) шкіру, до якої його застосовують. Інші матеріали, які не придатні для даного винаходу включають: 1,2-циклопентандіол (як цис, так і транс ізомери), 5-норборен-2,2-диметанол, та (1R,2R,3S,5S(-))-пінандіол.

Особливо кращі сполуки для застосування у даному винаході включають 1,2-циклогександіол, 1,3-циклогександіол, 1,4-циклогександіол, 1,3,5-циклогексантриол та 1,2,3-циклогексантриол, та суміші зазначених матеріалів. Цис та транс ізомери, також як і різні оптичні ізомери зазначених матеріалів, також є активними у даному винаході.

Активний матеріал застосовують місцево до шкіри у місці, яке необхідно лікувати, (наприклад, місце, де є почервоніння шкіри або симптоми, пов'язані з захворюваннями шкіри). Активний матеріал застосовують місцево до шкіри у кількості від приблизно 0,001 до приблизно 10  $\text{mg}/\text{cm}^2$ , переважно від приблизно 0,1 до приблизно 1  $\text{mg}/\text{cm}^2$ , краще від приблизно 0,1 до приблизно 0,5  $\text{mg}/\text{cm}^2$ , але зазначена кількість може змінюватися в залежності від композиції, людини та природи специфічного стану шкіри, який лікують. Даний винахід може забезпечувати користувачу можливість покращення вигляду шкіри шляхом зменшення плям на шкірі та поверхневих недоліків; заспокоєння та покращення стану подразненої та запаленої шкіри; зменшення почервоніння, припухлості та рубців на шкірі; підтримання структури шкіри; очищення закритих та запалених пор; підтримання здорового вигляду шкіри; та шляхом підтримання здорового волосся та зменшення втрати волосся.

Активний матеріал може бути використаний у комбінації з місцевим косметичним носієм.

Місцеві косметичні носії є добре відомими у даній галузі техніки та описані, наприклад, у Патенті США 6 696 069, Harichian та ін., виданому 24 лютого 2004; Патенті США 6 692 754, Makimoto та ін., виданому 17 лютого 2004; Патенті США 6 660 283, Breton та ін., виданому 9 грудня 2003; та Патенті США 6 623 778, Harichian та ін., виданому 23 вересня 2003; кожен з яких включений у даний опис шляхом посилання.

При застосуванні з місцевим косметичним носієм, активний матеріал та місцевий косметичний носій разом складають місцеву косметичну композицію. У таких місцевих косметичних композиціях, активний матеріал в основному становить від приблизно 0,001 % до приблизно 10 % композиції, переважно від приблизно 0,1 % до приблизно 10 % композиції, краще від приблизно 1 % до приблизно 5 % композиції, найкраще приблизно 1 % композиції, при цьому залишок композиції в основному включає місцевий косметичний носій. Додаткові сумісні косметично або терапевтично активні матеріали, такі як засоби для підтримання стану шкіри та/або волосся, антисептики, протизапальні агенти, агенти депігментації, інгібітори алергічних реакцій, протисвербіжні засоби, засоби проти зморшок, засоби від втрати волосся, рослинні екстракти, засоби з природних продуктів, засоби для росту волосся, засоби від сонячних опіків або декоративно-косметичні засоби, можуть бути включені у композиції даного винаходу. Місцевий косметичний носій являє собою матеріал або суміш матеріалів, які можуть бути сумісними з активним матеріалом (та додатковими активними матеріалами, якщо вони включені), не подразнює при застосуванні на шкіру, забезпечує косметичну користь, та може сприяти проникненню активного матеріалу у шкіру.

Носій може містити один інгредієнт або комбінацію з двох або більше інгредієнтів. Кращі косметичні носії містять один або більше інгредієнтів, вибраних з групи, що включає воду, спирти, гель з алое, алантоїн, гліцерин, олії вітамінів А та Е, мінеральне масло, пропіленгліколь, поліпропіленгліколь-2 міристилпропіонат, диметилізосорбід, та їх комбінації. Особливо кращі носії включають гліцерин, пропіленгліколь, диметилізосорбід, воду та суміші зазначених матеріалів.

Місцевий косметичний носій може містити один або більше інгредієнтів, вибраних з групи, що включає пом'якшуючі засоби, пропеланти, розчинники, гігроскопічні речовини, згущувачі, порошки та духмяні речовини, додатково до, або замість, інгредієнтів кращих місцевих косметичних носіїв, представлених вище. Спеціаліст, кваліфікований у даній галузі техніки, зможе вибрати та оптимізувати інгредієнти носія для місцевих косметичних композицій, використаних у даному винаході без зайвого експериментування.

Якщо пом'якшуючий засіб включений у носій, його зазвичай вносять на рівні від приблизно 5 % до приблизно 95 % загальної кількості носія. Прийнятні пом'якшуючі засоби включають, наприклад, стеариловий спирт, гліцерил-моноріцинолеат, гліцерил-моностеарат, пропан-1,2-діол, бутан-1,3-діол, норковий жир, цетиловий спирт, ізопропіл

ізостеарат, стеаринову кислоту, ізобутил палмітат, ізоцетил стеарат, олеїловий спирт, ізопропіллаурат, гексиллаурат, децилолеат, октадекан-2-ол, ізоцетиловий спирт, цетилпалмітат, ди-н-бутилсебакат, ізопропілміристан, ізопропілпалмітат, ізопропілстеарат, бутилстеарат, поліетиленгліколь, триетиленгліколь, ланолін, сезамове масло, кокосове масло, арахісове масло, касторове масло, ацетильовані ланолінові спирти, вазелін, мінеральне масло, бутилміристан, ізостеаринову кислоту, пальмітинову кислоту, ізопропіллінолеат, лауриллактат, міристиллактат, міристилміристан, полідиметилсилоксан, та суміші зазначених матеріалів. Кращі пом'якшуючі засоби включають стеариловий спирт та полідиметилсилоксан.

Якщо використовують пропелант, його зазвичай використовують у кількості від приблизно 5 % до приблизно 95 % місцевого носія. Прийнятні пропеланти включають пропан, бутан, ізобутан, диметильовий ефір, діоксид вуглецю, окис азоту, азот та суміші зазначених матеріалів.

Якщо використовують розчинник, його зазвичай використовують у кількості від приблизно 5 % до приблизно 95 % місцевого носія. Прийнятні розчинники включають, наприклад, воду, етанол, метиленхлорид, ізопропанол, касторове масло, етиленгліколь-моноетиловий ефір, діетиленгліколь-моноетиловий ефір, диметилсульфоксид, диметилформамід, тетрагідрофуран, гліколі, включаючи пропіленгліколь, та суміші зазначених матеріалів. Кращі розчинники включають етиловий спирт, воду, гліколі та суміші зазначених матеріалів.

Якщо у місцевому носії використовують гігроскопічну речовину, її зазвичай застосовують у кількості від приблизно 5 % до приблизно 95 % носія. Прийнятні гігроскопічні речовини включають, наприклад, гліцерин, сорбіт, натрію 2-піролідон-5-карбоксилат, розчинний колаген, дибутилфталат, желатин, пантенол, та суміші зазначених матеріалів. Кращою гігроскопічною речовиною є гліцерин.

Якщо у місцевому носії застосовують згущувач, його зазвичай використовують у кількості від приблизно 0,1 % до приблизно 95 % композиції носія. Прикладом такого матеріалу є Карбомерна лінійні матеріалів, що містять перехресно-зв'язані полімери акрилової кислоти, які діють у косметичних композиціях як стабілізатори емульсії та добавки, що регулюють в'язкість, та є комерційно доступними з Spectrum Quality Products, Gardena, California. Композиція носія може також містити порошки для забезпечення кінцевої композиції різними бажаними реологічними властивостями. Зазвичай, такі порошкові матеріали використовують у відносно невеликих кількостях, в основному від приблизно 0 % до приблизно 25 % місцевого носія. Приклади порошоків включають крейду, тальк, фулерову землю, каолін, крохмаль, камеді, колоїдний діоксид кремнію, поліакрилат натрію, тетраалкіламонію смектити, триалкіларил смектити, хімічно модифікований магній-алюмінієвий силікат, органічно-модифіковану монтморилонітову глину, гідратований силікат алюмінію, колоїдний кремнезем, карбоксивініловий полімер, карбоксиметил целюлозу натрію, етиленгліколь-

моностеарат та суміші зазначених матеріалів. Якщо духмяна речовина включається у місцевий носій, її зазвичай використовують у кількості від приблизно 0,001 % до приблизно 0,5 % носія. Забарвлюючі речовини (барвники, пігменти) також можуть бути включені на рівнях, встановлених у даній галузі техніки, якщо косметична композиція, яку формулюють, являє собою декоративну косметику.

Воски також можуть бути включені у місцевий носій, в основному через їх здатність надавати носію бажаних реологічних властивостей, таких як в'язкість. Приклади прийнятних восків включають тваринні воски, рослинні воски, мінеральні воски, різні фракції природних восків, синтетичні воски, нафтові воски, етиленові полімери, вуглеводневих типів, такі як воски Фішера-Тропша, силіконові воски та суміші таких матеріалів, що мають точку плавлення від приблизно 40°C до 100°C.

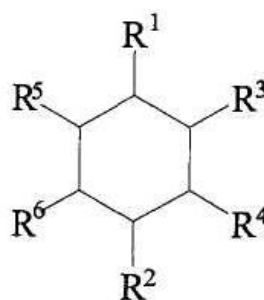
Технології для формулювання місцевих носіїв, які можуть бути використані у даному винаході, а також компоненти, включені у зазначені носії, описані у наступних джерелах: Modern Pharmaceuticals, розділи 9 та 10, Banker & Rhodes, ред. (1979); Lieberman та ін., Pharmaceutical Dosage Forms (1981); та Ansel, Introduction to Pharmaceutical Dosage Forms, 2-ге видання, (1976); International Cosmetic Ingredient Dictionary, Tenth edition, (2004), надрукований Cosmetic, Toiletry and Fragrance Association, всі включені як посилання. Місцеві косметичні композиції, які можуть бути застосовані місцево до шкіри, можуть бути у будь-якій формі, включаючи розчини, масла, креми, мазі, гелі, лосьйони, спреї, пластири на шкіру та подібні.

Активний матеріал, використаний у даному винаході, може бути доповнений косметичними та/або фармацевтичними активними матеріалами та рослинними екстрактами, відомими у даній галузі техніки, для забезпечення користувачу додаткової користі. Зазначені косметичні та фармацевтичні сполуки можуть містити, наприклад, вітаміни, стероїди, нестероїдні протизапальні сполуки, ретиноїди, антибіотики та інші антибактеріальні агенти, протигрибкові агенти, антиоксиданти, рослинні екстракти та екстракти природних продуктів. Приклади специфічних матеріалів включають вітамін С, вітамін К, вітамін В, бензоїлпероксид, лікопен, інозитол, еритроміцин, міноксидил, оксид цинку, ретинол, пентенол, третіноін, кератин, гідролізовані білки пшениці, екстракт зеленого чаю, екстракт часнику та їх суміші. Зазначені сполуки мають різні ефекти на шкіру та/або волосся. Однак, жодна з них не використовується як повний замісник активних сполук даного винаходу. Матеріали, що застосовують перорально або як частину композиції даного винаходу, можуть посилювати дію або доповнювати активні сполуки даного винаходу або як частина єдиної композиції або застосовуватися перорально як добавка до композиції/способу даного винаходу. Пероральна добавка у даному винаході може застосовуватися щоденно або кожні 2-3 дні. Особливо безпечною та корисною пероральною добавкою у даному винаході є перероблені продукти томатів, вибрані з томатного соку, гомо-

генату, конденсату, паст, екстрактів, екстрагованих продуктів та їх сумішей. Наприклад, добавка до місцевого застосування у даному винаході може містити добову пероральну дозу 200 мл томатного соку. Томатні продукти можуть бути додатково збагачені за допомогою вітамінів або інших косметичних або фармацевтичних добавок, корисних у лікуванні даного винаходу. Томатні продукти, екстраговані водою, зберігають свою активність у даному винаході. Це показує, що їх активний інгредієнт(и) є нерозчинним у воді.

Даний винахід також відноситься до способу для підтримання здоров'я волосся та зменшення втрати волосся у людей, який включає місцеве застосування до поверхні шкіри голови пацієнта, якому необхідне таке лікування, безпечної та ефективної кількості сполуки, вибраної з активних матеріалів, що мають формулу, описану вище. В основному, активний матеріал застосовують у кількості від приблизно 0,001 до приблизно 10 мг/см<sup>2</sup>, переважно від приблизно 0,1 до приблизно 0,5 мг/см<sup>2</sup>. Активні матеріали можуть використовуватися у комбінації з місцевим косметичним носієм, таким як ті, що описані вище; шампуні, кондиціонери для волосся, спреї для волосся, та муси для волосся являють собою особливо прийнятні носії. Можуть використовуватися стереоізомери та оптичні ізомери активних матеріалів.

Даний винахід також відноситься до місцевих косметичних композицій, які можуть бути використані у способах лікування, визначених у цьому описі. Зазначені композиції містять: від приблизно 0,001 % до приблизно 10 %, переважно від приблизно 0,5 % до приблизно 10 %, краще від приблизно 1 % до приблизно 5 %, найкраще приблизно 1 %, активного матеріалу, що має формулу:



у якій R<sup>1</sup> вибирають з -OH та C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкіл OH (алканоли); та R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> та R<sup>6</sup> кожен незалежно вибирають з -H, -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу та C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкілу, за умови, що зазначений активний матеріал містить не більше ніж п'ять -OH груп; залишок композиції становить місцевий косметичний носій, як визначено вище.

Кращі активні матеріали включають циклогексанол, 2-циклогексилетанол, циклогексилметанол, 3-циклогексил-1-пропанол, 1,4-циклогександіол, 1,3-циклогександіол, 1,2-циклогександіол, 4-циклогексилциклогексанол, 4-метилциклогексанол, 1,2,3-циклогексантриол, 1,3,5-циклогексантриол, 1,4,5-циклогексантриол, та їх суміші. Можуть використовуватися як цис, так і транс ізомери та опти-

чні ізомери зазначених матеріалів. Особливо кращі матеріали включають 1,2-циклогександіол, 1,3-циклогександіол, 1,4-циклогександіол, 1,2,3-циклогексантриол, 1,3,5-циклогексантриол, та їх суміші.

Композиції даного винаходу можуть бути сформульовані будь-яким зручним способом, включаючи, наприклад, гель, крем, пасту, тверду речовину, тонік, мило, гігієнічну рідину для тіла, маску для обличчя або шампунь.

#### Приклад 1

Косметичну композицію даного винаходу, що має склад, представлений у наступній таблиці, одержують наступним чином: Карбомер 940, 5 г; 1,4-циклогександіол, 10 г; та гліцерин, 3 г, змішують з 982 г води. Отриманий гель доводять до pH 7,0 за допомогою гідроксиду натрію, для додаткового згущення гелю. Аліквоту приблизно 0,01 мл композиції наносять на 1 см<sup>2</sup> шкіри обличчя 2-3 рази на день, при цьому відбувається покращення вигляду шкіри та полегшення симптомів подразнення шкіри та запалення шкіри.

Компонент	% (за масою)
Карбомер 940 (Spectrum Quality Products, Inc.)	0,5
Гліцерин	0,3
1,4-циклогександіол (цис/транс)	1,0
Гідроксид натрію	Достатній для доведення композиції до pH = 7,0
Вода	Залишок композиції
Карбопол 940 (Noveon, Inc., Cleveland, Ohio) може замінити Карбомер, повністю або частково.	

#### Приклад 2

Косметичну композицію даного винаходу готують змішуванням наступних інгредієнтів з 981 г води:

Карбомер 940	5 г
1,2,3-циклогексантриол (цис/транс)	10 г
гліцерин	1 г
інозитол	2 г
метилпарабензол	1 г

Отриманий гель доводять до pH 7,0 за допомогою гідроксиду натрію для додаткового згущен-

ня гелю. Аліквоту зазначеної композиції наносять руками на шкіру обличчя та шиї 2-3 рази на день та це забезпечує корисні ефекти, описані вище.

#### Приклад 3

Косметичну композицію даного винаходу готують змішуванням наступних інгредієнтів з 984 г води:

Карбомер 940	5 г
1,4-циклогександіол (транс)	10 г
пропіленгліколь 200	1 г

Отриманий гель доводять до pH 7,0 за допомогою гідроксиду натрію для додаткового згущення гелю. Аліквоту зазначеної композиції наносять руками на шкіру обличчя 2-3 рази на день та це забезпечує корисні ефекти, описані вище.

#### Приклад 4

Косметичну композицію даного винаходу готують змішуванням наступних інгредієнтів з 985,2 г води:

Карбомер 940	5 г
1,3-циклогександіол (цис/транс)	4 г
1,4-циклогександіол (цис/транс)	4 г
Гліцерин	1 г
Екстракт алое (порошок, Spectrum Quality Products)	0,5 г
Екстракт часнику (порошок, Spectrum Quality Products)	0,3 г

Отриманий гель доводять до pH 7,0 за допомогою гідроксиду натрію для додаткового згущення гелю. Аліквоту зазначеного гелю наносять руками на шкіру обличчя та передпліччя 1-3 рази на день та це забезпечує корисні ефекти, описані вище.

#### Приклад 5

Косметичну композицію даного винаходу готують змішуванням наступних інгредієнтів з 998 г води:

1,4-циклогександіол (цис/транс)	0,5 г
1,2,3-циклогексантриол (цис/транс)	0,5 г
Гліцерин	1 г

10 мл аліквоту зазначеного розчину поміщають у 15 мл крапельний дозатор та розчин наносять на шкіру голови пацієнта один раз на день. Подразнення волоссяних фолікулів та втрата волосся знижені.