



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 22615

(13) C2

(51) 6 A61K9/127, 7/48

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(54) СКЛАД-ОСНОВА ДЛЯ КОСМЕТИЧНИХ ТА ДЕРМАТОЛОГІЧНИХ ПРЕПАРАТІВ

1

2

(21) 95062844  
(22) 19 06 1995  
(24) 15 01 2002  
(46) 15 01 2002, Бюл № 1, 2002 р  
(72) Трикаш Ірина Олегівна, Терлецька Яніна Тимофіївна, Костенко Юрій Веніамінович  
(73) Трикаш Ірина Олегівна, Терлецька Яніна Тимофіївна, Костенко Юрій Веніамінович  
(56) Заявка Франції №2 627 385, МПК<sup>6</sup> А61К 9/50, 03 02 1989г  
(57) Состав - основа для косметических и дерматологических препаратов, включающий фосфолипид в липосомальной форме, активное вещество, консервант и воду, отличающийся тем, что в качестве активного вещества он содержит липидный комплекс из тимуса крупного рогатого скота, а

в качестве консервантов - димол С и этиловый спирт и дополнительно содержит масло растительное, моноглицериды дистиллированные и 10 %-ный водный раствор гидрата окиси натрия при следующем соотношении компонентов, мас %

фосфолипид	0,2 - 0,6
этиловый спирт	2,0 - 3,0
липидный комплекс из тимуса крупного рогатого скота	12,0 - 18,0
масло растительное	3,0 - 5,0
моноглицериды дистиллированные	4,0 - 6,6
димол С	0,3 - 0,5
10%-ный водный раствор гидрата окиси натрия	0,2 - 0,3
вода дистиллированная	остальное

Изобретение относится к медицинской и косметологической промышленности и может быть использовано для производства лечебных дерматологических препаратов и биологически активных кремов для ухода за кожей

Известны составы применяемые в качестве основы для производства косметических препаратов с такими биологически активными добавками как аминокислоты, пептиды, витамины А и Е /См prospect А/О Низар/

За прототип нами принят состав, применяемый в качестве основы для фармацевтических, дерматологических и косметических препаратов по заявке Франции № 2627385, А61К 9/50, 03 02 89 г

Этот состав содержит липосомы, заполненные азотсодержащим веществом аминокислотой, олиго- или полипептидом, белком или их производными. Так, например, липидная фаза, составляющая оболочку липосом, включает, мас %

фосфолипиды	~ 90
холестерин	~ 10

Активная водная фаза, заполняющая липосомы, включает, мас %

манитол	~ 0,10
лейцин	~ 0,10
пролин	~ 0,40

глицин	~ 0,40
L - цистеин	~ 0,10
L - метионин	~ 0,10
ДНК	~ 0,50
вода дистиллированная	— остальное

В составе по прототипу в качестве активных используются только водо-растворимые вещества, отсутствует жировая основа, поэтому он не оказывает смягчающего и регенерирующего воздействия на кожу

Задачей изобретения является разработка состава — основы для косметических и дерматологических препаратов, позволяющего путем введения нового активного вещества оказывать противовоспалительное, смягчающее и регенерирующее воздействие на кожу

Для этого состав-основа для косметических и дерматологических препаратов, включающий фосфолипид в липосомальной форме, активное вещество, консерванты и воду, в качестве активного вещества содержит липидный комплекс из тимуса крупного рогатого скота /КРС/, а в качестве консервантов — димол С и этиловый спирт и дополнительно содержит масло растительное, моноглицериды дистиллированные и гидрат окиси натрия при следующем соотношении компонентов, мас %

(13) C2

(11) 22615

(19) UA

фосфолипид	0,2 - 0,6
этиловый спирт	2,0 - 3,0
липидный комплекс из тимуса КРС	12,0 - 18,0
масло растительное	3,0 - 5,0
моногидриды дистиллированные	4,0 - 6,6
димол С	0,3 - 0,5
10%-ный гидрат окиси натрия	0,2 - 0,3
вода дистиллированная	остальное

В качестве фосфолипида, образующего оболочку липосом в заявляемом составе используется фосфатидилхолин /ТУ 6-09-10-289-90/. Введение его ниже 0,2мас % не обеспечивает образования нужного количества липосом, а введение его в количестве выше 0,6мас % повышает стоимость основы, не улучшая ее качества.

Этиловый спирт используется в качестве растворителя фосфатидилхолина и в то же время является консервантом. Введение этилового спирта ниже 2мас % не обеспечивает достаточного растворения фосфатидилхолина, при введении этилового спирта выше 3мас % нарушается его соотношение с водой, что препятствует формированию липосом.

В качестве активного вещества состав содержит липидный комплекс из тимуса КРС, который является отходом производства ДНК /ДСТУ 2217-93/. Этот комплекс содержит моно-, ди-, триглицериды – 37-55%, холестерин в свободной и этерифицированной форме – 4-13%, свободные жирные кислоты – 6-12%, фосфолипиды – 7-13%.

Липидный комплекс вместе с маслом растительным /ГОСТ 1129-73/ составляют активную жировую основу заявляемого состава.

Введение липидного комплекса и масла растительного, в количествах ниже 12мас % и 3мас % соответственно, не обеспечивает нужного питательного эффекта, а введение этих компонентов в количествах, превышающих 18мас % и 5мас % соответственно, создает избыточный пережиривающий эффект.

В качестве эмульгатора состав содержит моноглицериды диэтиллированные /ТУ 10-04-02-42-89/. Введение эмульгатора в количестве ниже 4мас % не обеспечивает оптимального первичного эмульгирующего эффекта, а введение в количестве выше 6,6мас % создает жесткую структуру состава.

Эмульгирующий и структурообразующий эффект обеспечивается в результате омыления компонентов активной жировой основы гидратом окиси натрия /ГОСТ 2263-79/. Мягкая структура состава образуется при содержании NaOH в пределах от 0,2 до 0,3мас %.

В качестве консерванта в составе использован димол С /ТУ 6-01-4689387-66-91/. При содержании димола С ниже 0,3мас % не обеспечивается консервирующий эффект, а при содержании его выше 0,5мас % – создается некоторый раздражающий эффект.

В заявляемый состав входит также вода дистиллированная /ГОСТ 6709-72/, которая является нейтральной и абсолютно не изменяет активные свойства компонентов.

Приготовление заявляемого состава осуществляется в такой последовательности:

В плавильный эмалированный котел с паровой рубашкой и мешалкой загружают рецептурное количество липидного комплекса из тимуса КРС, моноглицеридов дистиллированных и масла растительного, нагревают до 60-65°C. Перемешивание проводят до получения однородной массы.

В стеклянном реакторе готовят 20%-ный раствор фосфатидилхолина в этиловом спирте.

В основной варочный эмалированный котел с паровой рубашкой и мешалкой загружают рецептурное количество воды, вливают рецептурное количество 20%-ного раствора фосфатидилхолина в этиловом спирте, перемешивают при 50-70об/мин 5-10 минут. Затем содержимое плавильного котла перекачивают в основной варочный котел, доводят температуру до 60°C. Процесс эмульгирования проводят при перемешивании в течение 20-80 минут, загружают рецептурное количество 10%-ного гидрата окиси натрия. Перемешивают до образования однородной массы, снижают температуру до 30-40°C и добавляют рецептурное количество димола С. Снижают температуру до 20-25°C и продолжают перемешивание еще 20-30 минут. Далее состав поступает на созревание в течение 24 часов.

В таблице 1 приведены составы с содержанием компонентов в пределах, указанных в формуле изобретения, и за пределами.

В таблице 2 приведены данные по заживлению нарушений эпителия кожи при бритье в результате действия заявляемого состава /примеры 1-6/.

Таблица 1

Компоненты	Содержание компонентов, мас %					
	1	2	3	4	5	6
Фосфатидилхолин	0,1	0,2	0,4	0,3	0,6	0,8
Этиловый спирт	1,0	2,0	2,0	3,0	3,0	4,0
Липидный комплекс из тимуса КРС	10,0	12,0	14,0	16,0	18,0	20,0
Масло растительное	2,0	3,0	4,0	3,0	5,0	6,0
Моногидриды дистиллированные	3,0	4,0	5,0	6,0	6,6	7,0
Димол С	0,2	0,3	0,5	0,5	0,5	0,6
10%-ный NaOH	0,1	0,2	0,3	0,3	0,3	0,4
Вода дистиллированная	84,6	78,3	73,8	70,9	66,0	61,2

Таблица 2

№ состава	Количество циклов обработки					Эффект действия
	1	2	3	4	5	
1	x	x	x	x	x	Неполное заживление
2	x	x	x	x	x	Полное заживление
3	x	x	x	x		Полное заживление
4	x	x	x			Полное заживление
5	x	x	x	x		Полное заживление
6	x	x	x	x	x	Неполное заживление

Противовоспалительное действие заявляемого состава показано в таблице 3. На лапку животного наносится 0,1мл 1%-ного раствора формалина, который вызывает увеличение объема лапки

уже через 1 час, затем на лапку наносят испытуемый состав, и через определенное время объем лапки восстанавливается до первоначального

Таблица 3

Время воз- действия состава, час	Объем лапки животного							
	Исходный объем	Объем после на- несения формалина	Объем после нанесения заявляемого состава					
			1	2	3	4	5	6
	3,1	3,6						
1			3,6	3,6	3,5	3,4	3,5	3,5
2			3,6	3,4	3,3	3,2	3,2	3,4
3			3,5	3,2	3,1	3,1	3,1	3,4

Как видно из табл 4, противовоспалительное действие заявляемого состава проявляется уже через 1 час, а через 3 часа воздействия восстанавливается первоначальный объем лапки, т.е. полностью устраняется воспалительная реакция кожи, вызванная воздействием 1%-ного раствора формалина

Состав-основа для косметических и дерматологических препаратов не обладает кожно-раздражающим действием, не проявляет алергизирующих и сенсибилизирующих свойств. Синергетическое действие активных компонентов липидного комплекса из тимуса КРС /триглицеридов, фосфолипидов, жирных кислот/ проявляется в противовоспалительном, смягчающем и регенерирующем действии заявляемого состава. Клини-

ческие испытания показали, что препарат легко и быстро впитывается кожей, не оставляя жирного блеска, поддерживает нормальную гидратацию кожи и повышает ее репаративные свойства

На основе заявляемого состава можно готовить разнообразные по рецептуре кремы и мази путем введения в липосомы различных лекарственных и биологически активных веществ

Чем больше растворимость вводимого в состав компонента в воде, тем большее его количество может быть включено во внутреннее водное пространство липосом. Наоборот, чем больше растворимость его в органическом растворителе, тем больше может быть заключено в гидрофобных областях липосом





УКРАЇНА

(19) UA (11) 22615 (13) A

(51)6 A 61 K 9/127

ДЕРЖАВНЕ  
ПАТЕНТНЕ  
ВІДОМСТВООПИС ДО ПАТЕНТУ  
НА ВІНАХІДбез проведення експертизи по суті  
на підставі Постанови Верховної Ради України  
№ 3769-XII від 23 XII 1993 р.Публікується  
в редакції заявника

(54) СКЛАД-ОСНОВА ДЛЯ КОСМЕТИЧНИХ ТА ДЕРМАТОЛОГІЧНИХ ПРЕПАРАТІВ

1

2

(21) 95062844

(22) 19.06.95

(24) 17.03.98

(46) 30.06.98. Бюл. № 3

(47) 17.03.98

(72) Трикаш Ірина Олегівна, Терлецька Яніна  
Тимофіївна, Костенко Юрій Веніамінович(73) Трикаш Ірина Олегівна, Терлецька Яніна  
Тимофіївна, Костенко Юрій Веніамінович(57) Состав-основа для косметических и дер-  
матологических препаратов, включающий  
фосфолипид в липосомальной форме, актив-  
ное вещество, консервант и воду, о т л и ч а  
ю щ и й с я тем, что в качестве активного  
вещества он содержит липидный комплекс  
из тимуса крупного рогатого скота (КРС), ав качестве консервантов димол С и этиловый  
спирт и дополнительно содержит масло рас-  
тительное, моноглицериды дистиллирован-  
ные и гидрат окиси натрия при следующем  
соотношении компонентов, мас. %:

Фосфолипид	0,2-0,6
Этиловый спирт	2,0-3,0
Липидный комплекс	
из тимуса КРС	12,0-18,0
Масло растительное	3,0-5,0
Моноглицериды	
дистиллированные	4,0-6,6
Димол С	0,3-0,5
10%-ный гидрат окиси	
натрия	0,2-0,3
Вода дистиллированная	Остальное

Изобретение относится к медицинской  
и косметологической промышленности и мо-  
жет быть использовано для производства  
лечебных дерматологических препаратов и  
биологически активных кремов для ухода за  
кожей.

Известны составы, применяемые в каче-  
стве основы для производства косметиче-  
ских препаратов с такими биологическими  
активными добавками как аминокислоты,  
пептиды, витамины А и Е [Прспект А/О  
Низар].

За прототип нами принят состав, приме-  
няемый в качестве основы для фармацевти-  
ческих, дерматологических и косметических

препаратов [Заявка Франции № 2627385, кл.  
А 61 К 9/50, 03.02.89].

Этот состав содержит липосомы, запол-  
ненные азотсодержащим веществом: ами-  
нокислотой, олиго- или полипептидом,  
белком или их производными. Так, напри-  
мер, липидная фаза, составляющая оболоч-  
ку липосом, включает, мас. %:

Фосфолипиды	90
Холестерин	10

Активная водная фаза, заполняющая ли-  
посомы, включает, мас. %:

Манитол	0,10
Лейцин	0,10
Пролин	0,40
Глицин	0,40

(19) UA (11) 22615 (13) A

L-цистеин	0,10
L-метионин	0,10
ДНК	0,50
Вода дистиллированная	Остальное

В составе по прототипу в качестве активных используются только водорастворимые вещества, отсутствует жировая основа, поэтому он не оказывает смягчающего и регенерирующего воздействия на кожу.

Задачей изобретения является разработка состава-основы для косметических и дерматологических препаратов, позволяющего путем введения нового активного вещества оказывать противовоспалительное, смягчающее и регенерирующее воздействие на кожу.

Для этого состав-основа для косметических и дерматологических препаратов, включающий фосфолипид в липосомальной форме, активное вещество, консерванты и воду, в качестве активного вещества содержит липидный комплекс из тимуса крупного рогатого скота (КРС), а в качестве консервантов — димол С и этиловый спирт и дополнительно содержит масло растительное, моноглицериды дистиллированные и гидрат окиси натрия при следующем соотношении компонентов, мас. %:

Фосфолипид	0,2–0,6
Этиловый спирт	2,0–3,0
Липидный комплекс из тимуса КРС	12,0–18,0
Масло растительное	3,0–5,0
Моноглицериды дистиллированные	4,0–6,6
Димол С	0,3–0,5
10%-ный гидрат окиси натрия	0,2–0,3
Вода дистиллированная	Остальное

В качестве фосфолипида, образующего оболочку липосом, в заявляемом составе используется фосфатидилхолин (ТУ 6-09-10-289-90). Введение его ниже 0,2 мас. % не обеспечивает образования нужного количества липосом, а введение его в количестве выше 0,6 мас. % повышает стоимость основы, не улучшая ее качества.

Этиловый спирт используется в качестве растворителя фосфатидилхолина и в то же время является консервантом. Введение этилового спирта ниже 2 мас. % не обеспечивает достаточного растворения фосфатидилхолина, при введении этилового спирта выше 3 мас. % нарушается его соотношение с водой, что препятствует формированию липосом.

В качестве активного вещества состав содержит липидный комплекс из тимуса КРС, который является отходом производства ДНК (ДСТУ 2217-93) Этот комплекс со-

держит моно- ди-, триглицериды — 37–53%, холестерин в свободной и этерифицированной форме — 4–13%, свободные жирные кислоты — 6–12%, фосфолипиды — 7–13%.

Липидный комплекс вместе с маслом растительным (ГОСТ 1129-73) составляют активную жировую основу заявляемого состава.

Введение липидного комплекса и масла растительного в количествах ниже 12 мас. % и 3 мас. % соответственно не обеспечивает нужного питательного эффекта, а введение этих компонентов в количествах, превышающих 18 мас. % и 5 мас. % соответственно создает избыточный пережиривающий эффект.

В качестве эмульгатора состав содержит моноглицериды дистиллированные (ТУ 10-04-02-42-89). Введение эмульгатора в количестве ниже 4 мас. % не обеспечивает оптимального первичного эмульгирующего эффекта, а введение в количестве выше 6,6 мас. % создает жесткую структуру состава.

Эмульгирующий и структурообразующий эффект обеспечивается в результате омыления компонентов активной жировой основы гидратом окиси натрия (ГОСТ 2263-79). Мягкая структура состава образуется при содержании NaOH в пределах от 0,2 до 0,3 мас. %.

В качестве консерванта в составе использован димол С (ТУ 6-01-4689387-66-91). При содержании димола С ниже 0,3 мас. % не обеспечивается консервирующий эффект, а при содержании его выше 0,5 мас. % создается некоторый раздражающий эффект.

В заявляемый состав входит также вода дистиллированная (ГОСТ 6709-72), которая является нейтральной и абсолютно не изменяет нативные свойства компонентов.

Приготовление заявляемого состава осуществляется в такой последовательности.

В плавильный эмалированный котел с паровой рубашкой и мешалкой загружают рецептурное количество липидного комплекса из тимуса КРС, моноглицеридов дистиллированных и масла растительного, нагревают до 60–65°C. Перемешивание проводят до получения однородной массы.

В стеклянном реакторе готовят 20%-ный раствор фосфатидилхолина в этиловом спирте.

В основной варочный эмалированный котел с паровой рубашкой и мешалкой загружают рецептурное количество воды,вливают рецептурное количество 20%-ного раствора фосфатидилхолина в этиловом спирте, перемешивают при 50–70 об/мин

5–10 мин. Затем содержимое плавильного котла перекачивают в основной варочный котел, доводят температуру до 60°C. Процесс эмульгирования проводят при перемешивании в течение 20–30 мин, загружают рецептурное количество 10%-ного гидрата окиси натрия. Перемешивают до образования однородной массы, снижают температуру до 30–40°C и добавляют рецептурное количество димол С. Снижают температуру до 20–25°C и продолжают перемешивание еще 20–30 мин. Далее состав поступает на созревание в течение 24 часов.

В табл.1 приведены составы с содержанием компонентов в пределах, указанных в формуле изобретения, и за пределами.

В табл.2 приведены данные по заживлению нарушений эпителия кожи при бритье в результате действия заявляемого состава (примеры 1–6).

Противовоспалительное действие заявляемого состава показано в табл.3. На лапку животного наносится 0,1 мл 1%-ного раствора формалина, который вызывает увеличение объема лапки уже через 1 час, затем на лапку наносят испытуемый состав, и через определенное время объем лапки восстанавливается до первоначального.

Как видно из табл.3, противовоспалительное действие заявляемого состава проявляется уже через 1 час, а через 3 часа воздействия восстанавливается первоначальный

объем лапки, т.е. полностью устраняется воспалительная реакция кожи, вызванная воздействием 1%-ного раствора формалина.

Состав-основа для косметических и дерматологических препаратов не обладает кожно-раздражающим действием, не проявляет аллергизирующих и сенсибилизирующих свойств. Синергетическое действие активных компонентов липидного комплекса из тимуса КРС (триглицеридов, фосфолипидов, жирных кислот) проявляется в противовоспалительном, смягчающем и регенерирующем действии заявляемого состава. Клинические испытания показали, что препарат легко и быстро впитывается кожей, не оставляя жирного блеска, поддерживает нормальную гидратацию кожи и повышает ее репаративные свойства.

На основе заявляемого состава можно готовить разнообразные по рецептуре кремы и мази путем введения в липосомы различных лекарственных и биологически активных веществ.

Чем больше растворимость вводимого в состав компонента в воде, тем большее его количество может быть включено во внутреннее водное пространство липосом. Наоборот, чем больше растворимость его в органическом растворителе, тем большее может быть заключено в гидрофобных областях липосом.

Таблица 1

Компоненты	Содержание компонентов, мас. %					
	1	2	3	4	5	6
Фосфатидилхолин	0,1	0,2	0,4	0,3	0,6	0,8
Этиловый спирт	1,0	2,0	2,0	3,0	3,0	4,0
Липидный комплекс из тимуса КРС	10,0	12,0	14,0	16,0	18,0	20,0
Масло растительное	2,0	3,0	4,0	3,0	5,0	6,0
Моногидриды дистиллированные	3,0	4,0	5,0	6,0	6,6	7,0
Димол С	0,2	0,3	0,5	0,5	0,5	0,6
10%-ный NaOH	0,1	0,2	0,3	0,3	0,3	0,4
Вода дистиллированная	84,6	78,3	73,8	70,9	66,0	61,2

Таблица 2

№ состава	Кол-во циклов обработки					Эффект дей- ствия
	1	2	3	4	5	
1	x	x	x	x	x	Неполное заживление
2	x	x	x	x	x	Полное за- живление
3	x	x	x	x		- " -
4	x	x	x			- " -
5	x	x	x	x		- " -
6	x	x	x	x	x	Неполное заживление

Таблица 3

Время воздей- ствия со- става, час	Объем лапки животного							
	Исход- ный объ- ем	Объем после на- несения формали- на	Объем после нанесения заявляемого состава					
			1	2	3	4	5	6
1	3,1	3,6	3,6	3,6	3,5	3,4	3,5	3,5
2			3,6	3,4	3,3	3,2	3,2	3,4
3			3,5	3,2	3,1	3,1	3,1	3,4

Упорядник

Техред М.Келемеш

Коректор М. Самборська

Замовлення 4496

Тираж

Підписне

Державне патентне відомство України,  
254655, ГСП, Київ-53, Львівська пл., 8

Відкрите акціонерне товариство "Патент", м. Ужгород, вул.Гагаріна, 101