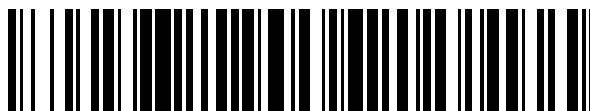


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 385 562**

51 Int. Cl.:

A61K 8/14 (2006.01)

A61K 8/39 (2006.01)

A61K 8/63 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **04785078 .9**

96 Fecha de presentación: **27.09.2004**

97 Número de publicación de la solicitud: **1670419**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **21.06.2006**

54 Título: **Composiciones hidratantes**

30 Prioridad:
06.10.2003 US 679738

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
26.07.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
26.07.2012

73 Titular/es:
**The Gillette Company
One Gillette Park- 3E
Boston, MA 02127, US**

72 Inventor/es:
**NOVIKOV, Alexander;
THONG, Stephen y
O'GRADY, Janet Kelley**

74 Agente/Representante:
de Elzaburu Márquez, Alberto

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

ES 2 385 562 T3

DESCRIPCIÓN

Composiciones hidratantes

Esta invención se refiere a composiciones hidratantes para usar en el cuidado de la piel, y más especialmente en lociones hidratantes.

- 5 Los consumidores tienen a su disposición una amplia variedad de lociones hidratantes ("las hidratantes"). Muchas de estas hidratantes son emulsiones que contienen niveles relativamente elevados de materiales lipófilos, tales como aceites, emolientes, emulsionantes lipófilos y/o polioles grasos. Las hidratantes que contienen este tipo de ingredientes pueden tener un tacto viscoso, y/o malas propiedades "de extensión", es decir, la hidratante tenderá a dejar un residuo o película perceptible sobre la superficie de la piel, en lugar de absorberse fácilmente.
- 10 Los intentos para mejorar el tacto de la piel y las propiedades de extensión de dichas emulsiones se han centrado, por lo general, en la reducción del tamaño de partículas de las gotículas de la emulsión, p. ej., mediante la formación de microemulsiones o nanoemulsiones. Las microemulsiones, de forma típica, requieren cantidades relativamente elevadas de emulsionantes y/o tensioactivos para proporcionar estabilidad a la emulsión - ingredientes que potencialmente pueden ocasionar la irritación de la piel - mientras que la formación de nanoemulsiones puede necesitar una cizalla intensa o un procesamiento con temperatura de inversión de fase, lo que puede limitar la gama de ingredientes que se pueden incluir en la hidratante.
- 15

Algunas formulaciones cosméticas contienen fosfolípidos que proporcionan una combinación de propiedades hidratantes y buenas propiedades estéticas, p. ej. tacto de la piel y extensión. Mientras que los fosfolípidos proporcionan un buen equilibrio de propiedades, por lo general son relativamente caros, y pueden tener problemas de estabilidad en almacenamiento en determinadas condiciones de almacenamiento.

20

La presente invención proporciona composiciones hidratantes que contienen vesículas multicapa, p. ej., microvesículas. El uso de estas vesículas como el componente hidratante de las composiciones proporciona un buen equilibrio entre las propiedades hidratantes y las deseables propiedades estéticas tales como una buena extensión y un buen tacto en la piel posterior a la aplicación (es decir, la piel se siente suave e hidratada). Las composiciones preferidas son relativamente baratas, y se pueden producir usando técnicas convencionales de mezclado y homogeneización, sin la necesidad de una cizalla relativamente elevada o el uso de niveles elevados perjudiciales de tensioactivos o emulsionantes irritantes para la piel. El uso de vesículas preferidas permite una amplia gama de sustancias activas para el cuidado de la piel, incluyendo ingredientes hidrosolubles y liposolubles, a administrar al usuario sin comprometer las propiedades de hidratación y estéticas.

25

30 La invención presenta composiciones hidratantes según se han definido en la reivindicación 1, incluyendo de 60% a 90% de agua, y, como sustancia activa hidratante, una pluralidad de microvesículas bicapa.

En un aspecto, las microvesículas bicapa incluyen un éster de poliol etoxilado de un ácido graso, un esteroles, y un alcohol graso de cadena larga como se ha definido en la reivindicación 1.

35 En otro aspecto, las microvesículas bicapa según se han definido en la reivindicación 1, incluyen un éster de poliol etoxilado de un ácido graso, un esteroles, y un alcohol graso de cadena larga en una relación en el intervalo de aproximadamente 1,0:0,4:1,7 a 1,0:0,3:1,2, y cada una de las microvesículas bicapa contiene una pluralidad de bicapas.

40 En un aspecto adicional, la invención presenta un método para fabricar una composición hidratante que incluye combinar una fase acuosa y una fase lipídica, incluyendo la fase lipídica un éster de poliol etoxilado de un ácido graso, un esteroles, y un alcohol graso de cadena larga con la agitación suficiente para formar una emulsión.

Los ingredientes se pueden calentar antes de o durante la etapa de combinación. La etapa de combinación puede incluir mezclar en primer lugar el éster de poliol etoxilado de un ácido graso, el esteroles, y el alcohol graso de cadena larga y cualquiera de componentes de la fase lipídica para formar una mezcla y, a continuación, agregar la fase acuosa a la mezcla.

45 Los detalles de una o más realizaciones de la invención se exponen a continuación en la descripción y en los dibujos que la acompañan. Otras características y ventajas de la invención resultarán evidentes a partir de la descripción y sus dibujos y a partir de las reivindicaciones.

50 Las composiciones hidratantes preferidas contienen agua, y, como sustancia activa hidratante, una pluralidad de microvesículas bicapa compuestas por un éster de poliol etoxilado de un ácido graso, un esteroles, y un alcohol graso de cadena larga como se ha definido en la reivindicación 1. Estos componentes conjuntamente definen un sistema de emulsión.

Algunas composiciones preferidas pueden contener también otros ingredientes, por ejemplo un estabilizante, una sustancia activa para el cuidado de la piel como una vitamina, anti-irritante o filtro solar, y/o uno o más emolientes. En algunas implementaciones, la composición también pueden incluir un espesante.

5 Por “microvesículas bicapa” se entienden estructuras esféricas que tienen una o más bicapas que están compuestas de materiales anfífilos (es decir, materiales que tienen propiedades tanto hidrófilas como lipófilas) alineadas en filas paralelas. Las fracciones lipófilas de cada fila están alineadas enfrentadas entre sí, formando una interfase bicapa, mientras que las fracciones hidrófilas están alineadas hacia el exterior de la interfase de la bicapa.

Cuando hay múltiples bicapas, las fracciones hidrófilas adyacentes están colocadas enfrentadas entre sí.

10 Si están incluidas en otra formulación por otra parte similar, las microvesículas preferidas proporcionan propiedades hidratantes y estéticas comparables a las que de forma típica proporcionan los fosfolípidos. Las microvesículas tienen de forma típica un tamaño de partículas inferior a aproximadamente 1 micrómetro, preferiblemente de aproximadamente 100 nm a 1 micrómetro.

15 Las microvesículas bicapa definidas en la reivindicación 1 están formadas con tres ingredientes básicos: (a) un éster de poliol etoxilado de un ácido graso, (b) un esteroles, y (c) un alcohol graso de cadena larga. Estos ingredientes se describirán con más detalle a continuación. Debido al uso de esta combinación de ingredientes, las microvesículas se pueden formar sin cizalladura intensa. Preferiblemente, las microvesículas se han formado mezclando estos ingredientes entre sí, junto con otros ingredientes lipófilos de la composición, y combinando la mezcla lipófila resultante con agua u el resto de ingredientes acuosos con la agitación adecuada, por ejemplo usando un mezclador de laboratorio Heidolph-Brinkmann con una pala mezcladora de forma cuadrada de 120 rpm a 150 rpm) para formar una emulsión. Por lo general, se prefiere que los componentes lipófilos y acuosos se calienten antes o durante el mezclado y emulsión para facilitar dichos procesos. Las temperaturas de calentamiento variarán dependiendo de los ingredientes usados pero, de forma típica, se encuentran en el intervalo de 50 °C-100 °C, p. ej., aproximadamente 75 °C. Tras la emulsificación, la emulsión se puede homogeneizar, por ejemplo, durante aproximadamente 2 minutos a aproximadamente 55 °C usando un cabezal homogeneizador convencional. Los materiales sensibles a la temperatura, por ejemplo, vitaminas, conservantes, fragancias, extractos vegetales y aceites esenciales se pueden agregar y mezclar a una temperatura inferior y condiciones de cizalla inferiores, una vez que han finalizado las etapas de emulsión y homogeneización descritas anteriormente. Se puede llevar a cabo una etapa breve adicional de homogeneización una vez que se han agregado todos los ingredientes.

30 El éster de poliol etoxilado de un ácido graso funciona por lo general como un emulsionante primario, dejando que los tres ingredientes formen una emulsión aceite/agua en condiciones de cizalla relativamente bajas. El éster de poliol etoxilado de un ácido graso tiene una cadena principal de poliol (alcohol polihidroxilado), en la que uno de los grupos hidroxilo del poliol se ha sustituido por un grupo acilo graso y otro de los grupos hidroxilo del poliol se ha sustituido por un grupo éter polietoxilado. Los polioles (alcoholes polihidroxilados) incluyen glicerina, butilenglicol, pentilenglicol, propilenglicol y mezclas de los mismos. Los grupos acilo grasos adecuados tendrán una longitud de cadena de acilo graso intermedia, de C10 a C16, preferiblemente C12. Un intervalo de etoxilación adecuado es de aproximadamente 7 a 30 unidades de etoxilo, preferiblemente 20 unidades. Un ejemplo de un éster de poliol etoxilado de un ácido graso es el laurato de glicerilo PEG-20. De forma típica, la composición contiene de aproximadamente 0,5% a 15,0% del éster de poliol etoxilado de un ácido graso, preferiblemente aproximadamente de 1% a 3% y más preferiblemente aproximadamente de 1,6% a 2%.

40 El esteroles funciona por lo general como estabilizante, potenciando la estabilidad de las microvesículas, y también proporciona propiedades hidratantes. Los esteroides adecuados incluyen colesterol, fitosteroides tales como esteroles de glicina de soja y lanosterol, así como mezcla de dos o más de estos esteroides. De forma típica, la composición contiene de aproximadamente 0,5% a 10,0% del esteroles, preferiblemente de aproximadamente 0,5% a 5%, más preferiblemente de aproximadamente 0,5% a 1%, y con máxima preferencia de aproximadamente 0,6% a 0,8%.

45 El alcohol graso de cadena larga funciona por lo general como un “constructor de paredes” formando las paredes de la membrana de la vesícula y proporcionando propiedades hidratantes. Preferiblemente, los alcoholes grasos tienen por lo general longitudes de cadena de C16 a C30, preferiblemente de C18 a C24. Los alcoholes grasos adecuados incluyen alcohol estearílico, alcohol araquidílico, alcohol lignocerílico, alcohol de behenilo, y mezclas de dos o más de estos alcoholes. De forma típica, la composición contiene de aproximadamente 0,5% a 20% del alcohol graso, preferiblemente de aproximadamente 1% a 10% y más preferiblemente de aproximadamente 2% a 3%.

50 Preferiblemente, el éster de poliol etoxilado de un ácido graso, el esteroles, y el alcohol graso de cadena larga se proporcionan en una relación en el intervalo de aproximadamente 1:0,2-0,5:1-2, preferiblemente 1:0,3-0,4:1,2-1,7. La relación se selecciona para asegurar una emulsión adecuada de los ingredientes hidrófobos y conseguir la estabilidad estructural de la emulsión, así como para proporcionar al producto el “cuerpo” y el tacto cosmético suficientes.

Entre las sustancias anfífilas que pueden formar parte de las bicapas se incluyen las siguientes:

monoésteres de polioles, p. ej., monoésteres de glicerilo, monoésteres de propilenglicol monoésteres de sorbitán, y monoésteres de sacarosa; otros alcoholes grasos etoxilados con un HLB bajo, por ejemplo, alcoholes grasos etoxilados con 2-4 unidades de etoxilo y una longitud de cadena grasa C12-18; amidas grasas p. ej., estearoilamida y cocoamida; y fosfolípidos. Por lo general, la composición puede incluir aproximadamente de 0,1% a 10,0% de estas sustancias anfífilas adicionales.

- 5
- 10 Las sustancias activas para el cuidado de la piel adecuadas incluyen vitaminas liposolubles e hidrosolubles; anti-irritantes, p. ej., bisabolol y ácido glicirricínico; y filtros solares orgánicos e inorgánicos, p. ej., metoxicinamato de octilo, benzofenona, avobenzona, salicilato de octilo, homosalato, dióxido de titanio y óxido de cinc. En algunas implementaciones, la composición incluirá de aproximadamente 0,1% a 20% de las sustancias activas totales para el cuidado de la piel. Si se desea que la composición tenga un SPF de 15, la composición de forma típica incluirá de aproximadamente 7% a 13% de un filtro solar orgánico, o de aproximadamente 5% a 10% de un filtro solar orgánico y aproximadamente de 0% a 3% de un filtro solar inorgánico. Los emolientes adecuados incluyen ésteres de alcoholes grasos lineales o ramificados y ácidos grasos con una longitud de cadena de ácido graso de C6 a C14, p. ej., isononanoato de isononilo, sebacato de dioctilo, isooctanoato de isooctilo y adipato de dioctilo; hidrocarburos, p. ej., escualano, vaselina y aceite mineral; ceras naturales, p. ej., cera de carnaúba, cera de candelilla y cera de abeja; aceites vegetales, p. ej. aceite de girasol, aceite de sésamo y aceite de oliva; y siliconas, p. ej. ciclometicona y dimeticona. La composición puede incluir cualquier cantidad deseada de estos ingredientes que no perjudiquen el efecto del comportamiento, estética o estabilidad de la composiciones, de forma típica de aproximadamente 0% a 20%, preferiblemente de aproximadamente 0,5% a 5%, más preferiblemente de aproximadamente 1% a 2%.
- 15
- 20 En algunas implementaciones, la composición también puede incluir un espesante soluble en agua, p. ej. una poliacrilamida, un polisacárido y/o un espesante liposoluble, p. ej., tetrastearato de pentaeritrilo. La composición puede incluir además otros ingredientes cosméticos convencionales tales como conservantes, colorantes, fragancias y aceites esenciales.
- 25 Se incluye el agua suficiente para proporcionar una emulsión y proporcionar a la composición la viscosidad deseada. Las composiciones preferidas por lo general contienen de aproximadamente 60% a 90% de agua, lo que producirá, de forma típica, una crema ligera con una viscosidad (Viscosímetro Brookfield, vástago RVT n.º 5, 10 rpm, 5ª revolución) de aproximadamente 10.000 cps a 30.000 cps en las condiciones de procesamiento descritas anteriormente.

Los porcentajes anteriormente proporcionados son en peso, en base de sólidos.

30 **Ejemplo**

Se preparó una composición con la siguiente formulación:

Ingrediente	% en peso
Agua	78,2750
Metoxicinamato de octilo	5,0000
Ciclometicona	3,0000
Isononanoato de isononilo	3,0000
Benzophenone-3	2,0000
Poliacrilamida & CI3-14	
Isoparafina & Laureth-7	1,4000
Laurato de glicerilo PEG-20	1,8000
Alcohol behenílico	1,1300
Alcohol estearílico	1,1200
Alcohol de araquidilo	0,2500
Colesterol	0,7000
Estearato de glicerilo	1,0000

Ingrediente	% en peso
Dimeticona	0,7500
Lecitina	0,2000
EDTA disódico	0,0500
Conservante	0,3000
Fragancia	0,0250

5 Los materiales lipófilos se mezclaron entre sí y se calentaron a 75 °C para proporcionar una mezcla lípida transparente. El agua y los solutos estables frente a la temperatura se calentaron a 75 °C. Las fases oleosa y acuosa se combinaron a continuación con la agitación adecuada y se mantuvieron a 75 °C durante 30 min. La emulsión aceite/agua resultante se enfrió a 55 °C y se homogenizó brevemente (2 min) usando un cabezal homogenizador.

10 Al examen con el microscopio óptico, la emulsión resultante tenía apariencia de microvesículas con un tamaño inferior a 500 nm de diámetro. Los materiales sensibles a la temperatura (vitaminas, conservantes, fragancias, extractos vegetales y aceites esenciales) se agregaron posteriormente a 40 °C con agitación. Las siliconas se agregaron a 40 °C, seguido por la adición de un espesante y de una corta homogeneización (2 min). A temperatura ambiente, el producto tenía el aspecto de una crema ligera de color blanco con una viscosidad de 15.000 cps-30.000 cps.

15 Se han descrito diversas realizaciones de la invención. No obstante, se entenderá que es posible llevar a cabo varias modificaciones sin abandonar el ámbito de la invención. Por tanto, otras realizaciones están incluidas en el ámbito de las siguientes reivindicaciones.

REIVINDICACIONES

1. Una composición hidratante que comprende:
de 60% a 90% de agua, y
como una sustancia activa hidratante, una pluralidad de microvesículas bicapa;
- 5 en donde las microvesículas bicapa comprenden un éster de poliol etoxilado de un ácido graso de 10 a 16 átomos de carbono, un estero, y un alcohol graso de cadena larga en donde dicho poliol se selecciona de glicerina, butilenglicol, pentilenglicol, propilenglicol y mezclas de los mismos.
2. La composición de la reivindicación 1, que comprende además una sustancia activa para el cuidado de la piel.
- 10 3. La composición de la reivindicación 2, en donde la sustancia activa para el cuidado de la piel se selecciona del grupo que consiste en vitaminas, anti-irritantes y filtros solares.
4. La composición de la reivindicación 1, que comprende además uno o más emolientes.
5. La composición de cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3 ó 4, en donde cada una de las microvesículas bicapa incluye una pluralidad de bicapas.
- 15 6. La composición de la reivindicación 1, que comprende de 0,5% a 15% de éster de poliol etoxilado de un ácido graso de 10 a 16 átomos de carbono, de 0,5% a 10% de estero, y de 0,5% a 20% de alcohol graso de cadena larga.
7. La composición de la reivindicación 6, en donde la relación de éster de poliol etoxilado de un ácido graso, respecto del estero, y del alcohol graso de cadena larga, se encuentra en el intervalo de aproximadamente 1:0,2-0. 5:1-2.
- 20 8. La composición de la reivindicación 1, en donde la relación de éster de poliol etoxilado de un ácido graso, respecto del estero, y del alcohol graso de cadena larga, se encuentra en el intervalo de aproximadamente 1:0,3-0,4:1,2-1,7.
9. La composición de la reivindicación 7 u 8, en donde las microvesículas bicapa tienen un tamaño de partículas de aproximadamente 100 nm a 1 micrómetro.
- 25 10. La composición de la reivindicación 1, 2, 3, 4, 6, 7 u 8, en donde el éster de poliol etoxilado de un ácido graso tiene un intervalo de etoxilación de aproximadamente 7 a 30 unidades de etoxilo.
11. La composición de la reivindicación 10, en donde el éster de poliol etoxilado de un ácido graso comprende laurato de glicerilo PEG-20.
- 30 12. La composición de la reivindicación 1, 2, 3, 4, 6, 7, u 8, en donde el estero se selecciona del grupo que consiste en colesterol, fitosteroles, lanosterol y mezclas de dos o más de estos esteroides.
13. La composición de la reivindicación 12, en donde el alcohol graso de cadena larga se selecciona del grupo que consiste en alcohol estearílico, alcohol de araquidilo, alcohol de behenilo, y mezclas de dos o más de estos alcoholes.
- 35 14. La composición de la reivindicación 1, 2, 3, 4, 6, 7 u 8, en donde el alcohol graso de cadena larga tiene una longitud de cadena de C16-C30.
15. La composición de la reivindicación 14, en donde el alcohol graso de cadena larga se selecciona del grupo que consiste en alcohol estearílico, alcohol de araquidilo, alcohol de lignocerilo, alcohol de behenilo, y mezclas de dos o más de estos alcoholes.
- 40 16. La composición de la reivindicación 13, en donde el éster de poliol etoxilado de un ácido graso tiene una longitud de cadena de acilo graso de C10 a C16 y un intervalo de etoxilación de aproximadamente 7 a 30 unidades de etoxilo.
17. La composición de la reivindicación 1, 2, 3, 4, 6, 7, u 8, que comprende además una sustancia anfífila seleccionada del grupo que consiste en monoésteres de polioles, alcoholes grasos etoxilados de bajo HLB, amidas grasas y fosfolípidos.
- 45

18. La composición de la reivindicación 17, en donde la composición comprende de aproximadamente 0,1% a 10% de dicha sustancia anfífila.
19. La composición de la reivindicación 1, 2, 3, 4, 6, 7 u 8, que comprende además una sustancia activa para el cuidado de la piel.
- 5 20. La composición de la reivindicación 19, en donde dicha sustancia activa para el cuidado de la piel se selecciona del grupo que consiste en vitaminas liposolubles e hidrosolubles, anti-irritantes, y filtros solares orgánicos e inorgánicos.
- 10 21. La composición de la reivindicación 1, 2, 3, 4, 6, 7 u 8, que comprende además un filtro solar seleccionado del grupo que consiste en metoxicinamato de octilo, benzofenona, avobenzona, salicilato de octilo, homosalato, dióxido de titanio y óxido de cinc.
- 15 22. La composición de la reivindicación 4, en donde el emoliente se selecciona del grupo que consiste en ésteres de alcoholes grasos lineales o ramificados y ácidos grasos con una longitud de cadena de acilo graso de C6 a C14, hidrocarburos, ceras naturales, aceites vegetales, y siliconas.
23. La composición de la reivindicación 4 ó 23, en donde la composición comprende de aproximadamente 0,5% a 5% de dicho emoliente.
24. La composición de la reivindicación 1, 2, 3, 6, 7 u 8, que comprende además un espesante soluble en agua.
25. Una composición hidratante según la reivindicación 1, que comprende:
aproximadamente de 60%-90% de agua, y
como una sustancia activa hidratante, una pluralidad de microvesículas bicapa;
- 20 en donde las microvesículas bicapa comprenden un éster de poliol etoxilado de un ácido graso, un estero, y un alcohol graso de cadena larga en una relación en el intervalo de aproximadamente 1,0:0,4:1,7 a 1,0:0,3:1,2, incluyendo cada una de las microvesículas bicapa una pluralidad de bicapas.
- 25 26. Un método para preparar una composición hidratante que comprende: combinar una fase acuosa y una fase lipídica, incluyendo la fase lipídica un éster de poliol etoxilado de un ácido graso, en donde dicho poliol se selecciona de glicerina, butilenglicol, pentilenglicol, propilenglicol y mezclas de los mismos; un estero; y un alcohol graso de cadena larga, con la suficiente agitación para formar una emulsión.
27. El método de la reivindicación 26, que comprende además calentar los ingredientes antes o durante la etapa de combinación.
- 30 28. El método de la reivindicación 26 ó 27, en donde la etapa de combinación comprende en primer lugar mezclar el éster de poliol etoxilado de un ácido graso, el estero, y el alcohol graso de cadena larga y cualesquiera componentes restantes de la fase lipídica para formar una mezcla y, a continuación, agregar la fase acuosa a la mezcla.