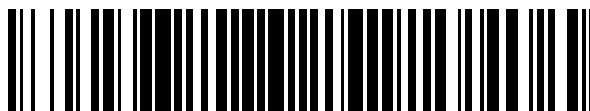


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 390 008**

51 Int. Cl.:

A61K 8/55

(2006.01)

A61Q 17/04

(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **09780595 .6**

96 Fecha de presentación: **15.07.2009**

97 Número de publicación de la solicitud: **2320865**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **18.05.2011**

54 Título: **Uso de (etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico para suprimir la decoloración en composiciones tópicas**

30 Prioridad:
16.07.2008 EP 08012833

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
05.11.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
05.11.2012

73 Titular/es:
DSM IP ASSETS B.V. (100.0%)
Het Overloon 1
6411 TE Heerlen, NL

72 Inventor/es:
MENDROK-EDINGER, CHRISTINE;
SMITH, KIMBERLY y
VOLLHARDT, JÜRGEN

74 Agente/Representante:
LEHMANN NOVO, María Isabel

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 2 390 008 T3

DESCRIPCIÓN

Uso de (etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico para suprimir la decoloración en composiciones tópicas

La presente invención se refiere al uso de (etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico para suprimir la decoloración en composiciones cosméticas que comprenden ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo. Adicionalmente, la invención se refiere a un método para reducir la decoloración de composiciones tópicas que contienen ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo, que comprende preparar una composición tópica que comprende ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo, (etilendiamina)-tetrametilenfosfonato pentasódico y un vehículo cosméticamente aceptable.

El ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo como sustrato de filtro UVB en composiciones cosméticas protectoras de la luz es bien conocido. Sin embargo, en composiciones tópicas que contienen ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo se ha observado decoloración durante el almacenamiento.

Según la presente invención, se ha encontrado sorprendentemente que la decoloración de composiciones tópicas que contienen ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo se puede suprimir mediante adición de (etilendiamina)-tetrametilenfosfonato pentasódico.

De este modo, en un aspecto, la presente invención se refiere al uso de (etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico para suprimir la decoloración en composiciones tópicas que comprenden ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo.

En otra realización, la invención se refiere a un método para reducir la decoloración de composiciones tópicas que contienen ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo, que comprende preparar una composición tópica que comprende ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo, (etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico y un vehículo cosméticamente aceptable.

En un aspecto adicional, la invención se refiere al uso de una combinación de (etilendiamina)-tetrametilenfosfonato pentasódico y ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo para la preparación de una composición tópica estable durante el almacenamiento. Las composiciones muestran en particular una excelente estabilidad en el almacenamiento a la vista de que previene/suprime la decoloración.

(Etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico (INCI etilendiamina tetrametilen fosfonato pentasódico [CAS 7651-99-2]) es un agente quelante que está comercialmente disponible como, por ejemplo, Dequest 2046 de Monsanto.

La cantidad de (etilendiamina)-tetrametilenfosfonato pentasódico en todas las realizaciones de la invención es adecuadamente de alrededor de 0,001 a alrededor de 15% en peso, preferiblemente de alrededor de 0,01 a alrededor de 10% en peso, en particular de 0,05 a alrededor de 5% en peso, basado en el peso total de la composición tópica.

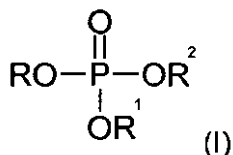
Las sales adecuadas del ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico son sales alcalinas, tales como sales de sodio o de potasio, sales de amonio, sales de morfina, sales de aminas primarias, secundarias y terciarias como sales de monoetanolamina, sales de dietanolamina, y sales de aminoácidos básicos, tales como arginina, lisina, ornitina e histidina, y similares. Las sales se pueden usar como tales, o se pueden preparar in situ neutralizando ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico en la fase acuosa durante el procedimiento de preparación de la composición tópica.

La concentración de ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo en la composición tópica según la invención se selecciona preferiblemente en el intervalo de alrededor de 0,5 a 5% en peso, más preferiblemente en el intervalo de alrededor de 1 a 3% en peso.

La relación de ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo al (etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico no es crítica. Por ejemplo, la relación es 10 a 1 a 3 a 1, tal como 6 a 1.

En otro aspecto, la presente invención se refiere a composiciones tópicas estables durante el almacenamiento que comprenden (etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico, ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo, y un vehículo cosméticamente aceptable. Las composiciones muestran en particular una excelente estabilidad durante el almacenamiento a la vista de la prevención/supresión de la decoloración.

En todas las realizaciones de la invención, las composiciones tópicas comprenden preferiblemente además un tensioactivo de éster de fosfato. Los tensioactivos de ésteres de fosfato adecuados tienen la fórmula I



El tensioactivo de éster de fosfato tiene la estructura general en la que R, R¹ y R² pueden ser hidrógeno, un alquilo de 1 a alrededor de 22 carbonos, preferiblemente de alrededor de 12 a 18 carbonos, o un alquilo alcoxlado de 1 a alrededor de 22 carbonos, preferiblemente de alrededor de 12 a 18 carbonos, y que tiene 1 o más, preferiblemente de alrededor de 2 a alrededor de 25, lo más preferible 2 a 12, moles de óxido de etileno, con la condición de que al menos uno de R, R¹ y R² sea un alquilo o un alquilo alcoxlado como se define previamente, pero que tenga al menos 6 carbonos alquílicos en dicho grupo alquilo o alquilo alcoxlado.

Se prefieren los monoésteres en los que R¹ y R² son hidrógeno, y R se selecciona de alquilos de 10 a 18 carbonos y alcoholes grasos alcoxlados de 10 a 18 carbonos y 2 a 12 moles de óxido de etileno. Entre los tensioactivos de éster de fosfato preferidos, se puede hacer mención de fosfato de Pareth-6 de C12-16, fosfato de etilo y alquilo de C8-10, fosfato de alquilo de C9-15, fosfato de Cetareth-2, fosfato de Cetareth-4, fosfato de Cetareth-5, fosfato de Cetareth-10, fosfato de Ceteth-8, fosfato de Ceteth-10, fosfato de cetilo, fosfato de Pareth-4 de C6-10, fosfato de Pareth-10 de C12-13, fosfato de Pareth-2 de C12-15, fosfato de Pareth-3 de C12-15, fosfato de Pareth-6 de C12-15, fosfato de Pareth-8 de C12-15, fosfato de Pareth-10 de C12-15, fosfato de Pareth-6 de C12-16, fosfato de DEA-Cetareth-2, cetilfosfato de DEA, fosfato de DEA-Oleth-3, fosfato de DEA-Oleth-5, fosfato de DEA-Oleth-10, fosfato de DEA-Oleth-20, fosfato de cetilo y potasio, fosfato de Deceth-9, fosfato de Deceth-4 y fosfato de Deceth-6. Los tensioactivos de éster de fosfato particularmente preferidos según la invención son fosfato de cetilo, fosfato de cetilo y potasio y/o cetilfosfato de DEA.

El tensioactivo de éster de fosfato está presente generalmente en las composiciones tópicas según la invención en proporciones que oscilan de 0,1 a 5% en peso, preferiblemente de 0,5 a 5% en peso, lo más preferible de 2 a 3% en peso, con respecto al peso total de la composición tópica.

La expresión "composición tópica", como se usa aquí, se refiere en particular a composiciones cosméticas que se pueden aplicar tópicamente al tejido queratinoso de mamíferos, tal como, por ejemplo, piel o cabello humano, particularmente piel humana.

La expresión "composición cosmética", como se usa en la presente solicitud, se refiere a composiciones cosméticas como se define en el encabezado "Kosmetika" en Römpf Lexikon Chemie, 10ª edición 1997, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Nueva York, así como a preparaciones cosméticas como se describen en A. Domsch, "Cosmetic Preparations", Verlag für chemische Industrie (ed. H. Ziolkowsky, 4ª edición, 1992).

La expresión vehículo cosméticamente aceptable se refiere a todos los vehículos y/o excipientes y/o diluyentes usados convencionalmente en composiciones o preparaciones tópicas.

Preferiblemente, las preparaciones tópicas según la presente invención están en forma de una suspensión o dispersión en disolventes o sustancias grasas, o como alternativa en forma de una emulsión o microemulsión (en particular de tipo O/W o W/O), emulsión de PIT, emulsión múltiple (por ejemplo tipo O/W/O o W/O/W), emulsiones de Pickering, hidrogel, gel alcohólico, lipogel, disolución de una o más fases o dispersión vesicular u otras formas habituales, que también se pueden aplicar mediante lápices, como máscaras o como pulverizaciones. Si la preparación tópica es o comprende una emulsión, también puede contener uno o más tensioactivos aniónicos, no iónicos, catiónicos o anfóteros.

En una realización particular, las composiciones tópicas según la invención son emulsiones de O/W. Preferiblemente, el tensioactivo de la emulsión de O/W se selecciona del grupo de estearato de glicerilo en combinación con cetareth-20 y/o cetareth-25, cetareth-6 en combinación con alcohol estearílico, alcohol cetilestearílico en combinación con PEG-40-aceite de ricino y cetilestearilsulfato de sodio, fosfato de tricetareth-4, estearato de glicerilo, cetilestearilsulfato de sodio, fosfato de lecitina trilaureth-4, fosfato de laureth-4, ácido esteárico, estearato de propilenglicol SE, PEG-25-aceite de ricino hidratado, PEG-54-aceite de ricino hidratado y/o glicéridos de ácido caprílico/ácido caprílico de PEG-6, oleato de glicerilo en combinación con propilenglicol, estearato de PEG-9, estearato de PEG-20, estearato de PEG-30, estearato de PEG-40, estearato de PEG-100, ceteth-2, ceteth-20, polisorbato-20, polisorbato-60, polisorbato-65 y/o polisorbato-100, estearato de glicerilo en combinación con estearato de PEG-100, miristato de glicerilo, laurato de glicerilo, peroleato de PEG-40-sorbitán, Laureth-4, Cetareth-3 y/o isoestearilgliceriléter, alcohol cetilestearílico en combinación con cetilestearilsulfato de sodio, laureth-23 y/o steareth-2, estearato de glicerilo en combinación con estearato de PEG-30, estearato de PEG-40, diestearato de glicol, copolímero de PEG-22-dodeciliglicol, estearato de poliglicerilo-2-PEG-4, cetareth-12, cetareth-20, cetareth-30, sesquiestearato de metil-glucosa, steareth-10 y/o estearato de PEG-20, steareth-2 en combinación con diestearato de PEG-8, steareth-21, steareth-20, isosteareth-20, copolímero de PEG-45/dodeciliglicol, copolímero de metoxi-PEG-22/dodeciliglicol, peroleato de PEG-40-sorbitán, perisoestearatos de PEG-40-sorbitán, estearatos de PEG-20-glicerilo, estearatos de PEG-20-glicerilo, PEG-8-cera de abejas, poligliceril-2-laurato, succinato de isoestearildiglicerilo, fosfato de cloruro de estearamidopropil-PG-dimonio, ceteth-20, estearato de glicerilo SE, citrato de trietilo, sesquiestearato de PEG-20-metilglucosa, fosfato de cetilo, citrato de estearato de glicerilo, sulfato de cetearilo, sesquioleato de sorbitán, tricetareth-4-fosfatos, trilaureth-4-fosfato, diestearato de poliglicerilmetilglucosa, cetilfosfato de potasio, diestearato de poligliceril-3 metilglucosa, isosteareth-10, poligliceril-2-sesquisoestearato, ceteth-10, oleth-20 y/o isoceteth-20, estearato de glicerilo en combinación con cetareth-20, cetareth-12, alcohol cetilestearílico y/o palmitato de cetilo, alcohol cetilestearílico en combinación con estearato de PEG-20, estearato de PEG-30, estearato de PEG-40 y/o estearato de PEG-100. Los tensioactivos de

O/W particularmente preferidos son tensioactivos de ésteres de fosfato tales como fosfato de cetilo, cetilfosfato de potasio y/o cetilfosfato de DEA, estearato de glicerilo, estearato de PEG-40, estearato de PEG-100 en combinación con estearato de glicerilo, diestearato de triglicerilmetilglucosa, diestearato de poligliceril-3 metilglucosa, cetearilglucósido, polietilenglicol(21)esteariléter, polietilenglicol(2)esteariléter, citrato de estearato de glicerilo, cetearil-sulfato de sodio, alcohol cetearílico, ácido esteárico y/o estearato de sorbitán.

Los tensioactivos de O/W particularmente preferidos según la invención son tensioactivos de éster de fosfato, en particular seleccionados de fosfato de cetilo, cetilfosfato de potasio y/o cetilfosfato de DEA, y/o estearato de PEG-100 en combinación con estearato de glicerilo. Los tensioactivos O/W más preferidos según la invención son los tensioactivos de éster de fosfato: fosfato de cetilo, cetilfosfato de potasio y/o cetilfosfato de DEA.

La fase oleosa de las emulsiones de O/W según la invención comprende preferiblemente aceites seleccionados de dicaprilato/dicaprato de butilenglicol, éter dicaprílico, benzoato de alquilo de C₁₂₋₁₅, triglicérido de ácido graso de C₁₈₋₃₈, adipato de dibutilo, ciclometicona, benzoato de 2-feniletilo, lauroilsarcosinato de isopropilo, así como sus mezclas. La cantidad del aceite (uno o varios) en la emulsión de O/W según la invención se selecciona generalmente en el intervalo de alrededor de 0,1 a 40% en peso, en particular en el intervalo de alrededor de 1,0 a 30% en peso, más en particular en el intervalo de alrededor de 5% a 20% en peso, con respecto al peso total de la composición tópica.

Las composiciones tópicas preferidas según la invención son preparaciones para el cuidado frente al sol.

Las composiciones tópicas según la invención pueden estar en forma de un líquido, loción, loción espesada, un gel, una crema, una leche, un ungüento, una pasta, un polvo, un maquillaje, o una barrita de tubo sólido, y se pueden envasar opcionalmente como un aerosol y se pueden proporcionar en forma de un mus tal como un mus de aerosol, una espuma o una espuma de pulverización, una pulverización, una barrita.

Las composiciones cosméticas tópicas de la invención también pueden contener adyuvantes y aditivos cosméticos habituales, tales como, por ejemplo, otras sustancias que filtran la radiación UV, conservantes, antioxidantes, sustancias grasas, aceites, agua, alcoholes, polioles, disolventes orgánicos, electrolitos, siliconas, espesantes, agentes formadores de películas, suavizantes, emulsionantes, agentes complejantes, agentes antiespumantes, humectantes, componentes estéticos tales como fragancias, tensioactivos, cargas, agentes secuestrantes, polímeros aniónicos, catiónicos, no iónicos o anfóteros, o sus mezclas, propelentes, agentes acidificantes o basificantes, tintes, colores/colorantes, abrasivos, absorbentes, aceites esenciales, sensibilizadores de la piel, astringentes, agentes antiespumantes, pigmentos o nanopigmentos, ingredientes cosméticamente activos o cualesquiera otros ingredientes, vehículos y/o excipientes o diluyentes formulados convencionalmente en composiciones cosméticas. Tales ingredientes cosméticos usados habitualmente en la industria del cuidado de la piel, que son adecuados para uso en las composiciones de la presente invención, se describen por ejemplo en el CTFA Cosmetic Ingredient Handbook, Segunda Edición (1992), sin estar limitado a él.

Las cantidades necesarias de los adyuvantes y aditivos cosméticos y dermatológicos pueden ser escogidas fácilmente – basándose en el producto deseado – por una persona experta en este campo, y se ilustrarán en los ejemplos, sin estar limitadas a ellos.

Preferiblemente, las composiciones tópicas según la invención comprenden otras sustancias filtrantes de la radiación UV que se seleccionan preferiblemente de sustancias filtrantes de UVA y/o UVB y/o UV de amplio espectro, que se sabe que se añaden en composiciones tópicas tales como productos cosméticos o dermatológicos para el cuidado contra el sol. Tales sustancias filtrantes de radiación UV comprenden todos los grupos que absorben luz en el intervalo de longitudes de onda 400 nm a 320 nm (UVA) y 320 nm a 280 nm (UVB) o de longitudes de onda incluso más cortas (UVC), y que son o que se pueden usar como sustancias filtrantes de radiación UV cosméticamente aceptables. Tales sustancias filtrantes de UV se dan, por ejemplo, en el CTFA Cosmetic Ingredient Handbook o "The Encyclopedia of Ultraviolet Filters" (ISBN: 978-1-932633-25-2) de Nadim A. Shaath.

Las sustancias filtrantes de UV adecuadas pueden ser compuestos orgánicos o inorgánicos. Las sustancias filtrantes de UV orgánicas ejemplares engloban, por ejemplo, acrilatos tales como por ejemplo 2-ciano-3,3-difenilacrilato de 2-etilhexilo (octocrileno, PARSOL® 340), 2-ciano-3,3-difenilacrilato de etilo; derivados alcanfor tales como, por ejemplo, 4-metil bencilidenalcanfor (PARSOL® 5000), 3-bencilidenalcanfor, metosulfato de canfobenzalconio, poliacrilamidometil bencilidenalcanfor, sulfobencilidenalcanfor, sulfometil bencilidenalcanfor, ácido tereftaliliden dicanfósulfónico (Mexoryl® SX); derivados de cinamato tales como, por ejemplo, metoxicinamato de etilhexilo (PARSOL® MCX), metoxicinamato de etoxietilo, metoxicinamato de isoamilo, así como derivados de ácido cinámico enlazados a siloxanos; derivados de ácido p-aminobenzoico tales como, por ejemplo, ácido p-aminobenzoico, p-dimetilaminobenzoato de 2-etilhexilo, p-aminobenzoato de etilo N-oxipropilenado, p-aminobenzoato de glicerilo; benzofenonas tales como, por ejemplo, benzofenona-3, benzofenona-4, 2,2',4,4'-tetrahidroxi-benzofenona, 2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetoxibenzofenona; ésteres de ácido benzalmalónico tales como, por ejemplo, 4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo); compuestos organosiloxánicos que poseen grupos cromóforos tales como, por ejemplo, polisiliconas-15 (PARSOL® SLX), drometrizol trisiloxano (Mexoryl® XL); derivados de salicilato tales como, por ejemplo, salicilato de isopropilbencilo, salicilato de bencilo, salicilato de butilo, salicilato de etilhexilo (PARSOL® EHS, Neo Heliopan® OS), salicilato de isooctilo o salicilato de homomentilo (homosalato, PARSOL® HMS, Neo Heliopan® HMS); derivados de triazina tales como, por ejemplo, etilhexil triazona (Uvinul® T-150),

dietilhexil butamido triazona (Uvasorb® HEB), bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina (Tinosorb® S); derivados de benzotriazol tales como, por ejemplo, 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutilfenol (Tinosorb® M); filtros de la radiación ultravioleta encapsulados, tales como, por ejemplo, metoxicinamato de etilhexilo encapsulado (perlas Eusolex® UV) o microcápsulas cargadas con filtros contra la radiación UV, como se describe por ejemplo en el documento EP 1471995; derivados de dibenzoilmetano tales como, por ejemplo, 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoil-metano (PARSOL® 1789), dimetoxidibenzoilmetano, isopropildibenzoilmetano; ácidos fenilen-1,4-bis-benzimidazolsulfónicos o sales tales como, por ejemplo 2,2-(1,4-fenilen)bis-(ácido 1H-benzimidazol-4,6-disulfónico) (Neoheliopan AP); hidroxibenzofenonas amino sustituidas tales como, por ejemplo éster hexílico del ácido 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil)-benzoico (aminobenzofenona, Uvinul® A Plus); derivados de benzoxazol tales como, por ejemplo, 2,4-bis-[5-1 (dimetilpropil)benzoxazol-2-il-(4-fenil)-imino]-6-(2-etilhexil)-imino-1,3,5-triazina [Uvasorb® K2A];

Las sustancias filtrantes de la radiación UV inorgánicas engloban pigmentos tales como, por ejemplo, óxido de cinc o dióxido de titanio en micropartículas (por ejemplo disponible comercialmente como PARSOL® TX). La expresión "en micropartículas" se refiere a un tamaño de partículas de alrededor de 5 nm a alrededor de 200 nm, particularmente de alrededor de 15 nm a alrededor de 100 nm. Las partículas también se pueden revestir mediante otros óxidos metálicos tales como, por ejemplo, óxidos de aluminio o circonio o mediante revestimientos orgánicos tales como, por ejemplo, polioles, meticona, estearato de aluminio, alquilsilano. Tales revestimientos son bien conocidos en la técnica.

A fin de mejorar la fotoestabilidad de los productos para el cuidado contra el sol, puede ser deseable añadir un fotoestabilizante. Los fotoestabilizantes ejemplares conocidos por una persona experta en la técnica engloban, por ejemplo, derivados de 3,3-difenilacrilato tales como, por ejemplo, octocrileno (PARSOL® 340) o Poliéster-8 (Polycrylene®); derivados de bencilidenalcanfor tales como, por ejemplo, 4-metil bencilidenalcanfor (PARSOL® 5000); derivados de benzalmalonato tales como, por ejemplo, polisiliconas-15 (PARSOL® SLX) o siringiliden malonato de dietilhexilo (OxyneX ST liquid); naftalatos de dialquilo tales como naftalato de dietilhexilo (Corapan TQ), sin estar limitados a ellos. Un repaso de otros estabilizantes se da, por ejemplo, en "SPF Boosters & Photostability of Ultraviolet Filters", HAPPI, Octubre 2007, p. 77-83, que se incluye aquí como referencia. Los fotoestabilizantes se usan generalmente en una cantidad de 0,05 a 10% en peso con respecto al peso total de la composición tópica.

Generalmente, la cantidad de cada sustancia filtrante de la radiación UV en las composiciones tópicas según la invención se seleccionan en el intervalo de alrededor de 0,1 a 10% en peso, preferiblemente en el intervalo de alrededor de 0,2 a 7% en peso, lo más preferible en el intervalo de alrededor de 0,5 a 5% en peso, con respecto al peso total de la composición tópica.

La cantidad total de sustancia o sustancias filtrantes de la radiación UVA, en particular de butil metoxidibenzoilmetano, en las composiciones tópicas según la invención se selecciona preferiblemente en el intervalo de alrededor de 2 a 8% en peso, en particular en el intervalo de alrededor de 4 a 6% en peso, lo más particular en el intervalo de alrededor de 4 a 5% en peso, con respecto al peso total de la composición tópica.

La cantidad total de las sustancias filtrantes de UV en las composiciones tópicas según la invención está preferiblemente en el intervalo de alrededor de 1 a 40% en peso, preferiblemente en el intervalo de alrededor de 5 a 30% en peso, en particular en el intervalo de 20 a 30% en peso, con respecto al peso total de la composición tópica.

Las sustancias filtrantes de UVB adicionales preferidas a usar en las composiciones tópicas según la invención engloban polisiliconas-15, octocrileno, metoxicinamato de etilhexilo, hexilsalicilato de etilo y/u homosalato.

Las sustancias filtrantes de radiación UV de banda ancha preferidas a usar en las composiciones tópicas según la invención engloban derivados no simétricos de s-triazina, tales como 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxil]-fenil]-6-(4-metoxifenil-1,3,5-triazina, ciertas benzofenonas tales como, por ejemplo, 2-hidroxil-4-metoxi-benzofenona, 2,2'-metilenbis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-fenol), y/o dióxido de titanio.

La sustancia filtrante de radiación UVA preferida a usar en las composiciones tópicas según la invención es butil metoxidibenzoilmetano.

Las composiciones tópicas preferidas según la invención comprenden uno o varios antioxidantes. Los antioxidantes adecuados para la incorporación en las composiciones tópicas según la invención son todos los antioxidantes adecuados para aplicaciones cosméticas. Son particularmente preferidos los antioxidantes solubles en agua tales como vitaminas, tales como por ejemplo ácido ascórbico, así como sus derivados, tales como por ejemplo fosfato de ascorbilo, tal como Stay C (ascorbilmonofosfato de sodio) de DSM Nutritional Products Ltd.

Otros antioxidantes preferidos son BHT, vitamina E y sus derivados, así como vitamina A y sus derivados.

La cantidad de antioxidante (uno o varios) en las composiciones tópicas según la invención se seleccionan preferiblemente en el intervalo de alrededor de 0,001 a 30% en peso, en particular en el intervalo de alrededor de 0,05 a 20% en peso, lo más particular en el intervalo de alrededor de 0,1 a 10% en peso, con respecto a la cantidad total de la composición tópica.

Si se usa un derivado de vitamina E en las composiciones tópicas según la invención, preferiblemente se usa acetato de tocoferilo. El acetato de tocoferilo puede estar presente en las preparaciones tópicas en una cantidad de alrededor de 0,05 a 25% en peso, en particular 0,5 a 5% en peso. Otro derivado de vitamina E de interés es linoleato de tocoferilo. El linoleato de tocoferilo puede estar presente en la composición para el cuidado de la piel en una cantidad de alrededor de 0,05 a 25% en peso, en particular 0,5 a 5% en peso.

La vitamina A y/o sus derivados, en particular derivados de retinoide, tales como palmitato de retinilo o propionato de retinilo, se usan preferiblemente en las preparaciones tópicas según la invención en una cantidad de 0,01 a 5% en peso, en particular 0,01 a 0,3% en peso.

Preferiblemente, las composiciones tópicas según la invención comprenden además un alcohol graso, tal como en particular alcohol cetílico, alcohol cetearílico y/o alcohol behenílico. La cantidad total de uno o varios alcoholes grasos en las composiciones tópicas según la invención se seleccionan preferiblemente en un intervalo de alrededor de 0,1 a 10,0% en peso, en particular en el intervalo de alrededor de 0,5 a 6,0% en peso, con respecto al peso total de la composición tópica.

Los ingredientes adecuados cosméticamente activos según la invención engloban agentes adecuados par el aclaramiento de la piel; la prevención del bronceado; el autobronceado; el tratamiento de la hiperpigmentación; para prevenir o reducir el acné; para el tratamiento de arrugas, líneas, atrofia y/o inflamación; para el tratamiento de celulitis (por ejemplo ácido fitánico), para dar firmeza, para dar energía, para calmar la piel, así como agentes para mejorar la elasticidad de la piel y la barrera de la piel.

Los ingredientes cosméticamente activos útiles aquí pueden proporcionar en algunos casos más de un beneficio u operar vía más de un modo de acción.

Los ejemplos preferidos de ingredientes cosméticamente activos para la incorporación en composiciones tópicas según la invención engloban vitamina B₆, vitamina B₁₂, biotina, coenzima Q10, EGCG, ácido alfa-lipónico, fiteno, hidroxitirosol y/o extracto de oliva, manteca de karité, extracto de algas, manteca de cacao, extracto de aloe, aceite de jojoba, extracto de echinacea, extracto de manzanilla, alfa-glucosilrutina, carnitina, carnosina, isoflavonoides naturales y/o sintéticos, creatina, taurina, alanina, ácido glicirretínico, Glycyrrhiza glabra y/o Glycyrrhiza inflata.

El ingrediente cosméticamente activo se incluye típicamente en una cantidad de al menos 0,001% en peso basado en el peso total de la preparación tópica. Generalmente, se usa una cantidad de alrededor de 0,001% en peso a alrededor de 30% en peso, preferiblemente de alrededor de 0,001% en peso a alrededor de 10% en peso de un agente cosméticamente activo adicional. Adicionalmente preferido, las composiciones tópicas según la invención comprenden además un humectante. Los humectantes son agentes químicos diseñados especialmente para hacer más suaves y más apilables las capas externas de la piel (epidermis), incrementando su hidratación (contenido en agua), que se puede determinar, por ejemplo, midiendo la pérdida de agua transepidérmica (TEWL). Los humectantes adecuados según la invención son, por ejemplo, glicerina, ácido láctico y/o lactato, tal como en particular lactato de sodio, butilenglicol, propilenglicol, biosacárido goma-1, soja de glicina, etilhexiloxiglicerina, ácido pirrolidoncarbónico y/o urea.

Los conservantes adecuados según la invención engloban, por ejemplo, compuestos químicos que liberan formaldehído, tales como por ejemplo DMDM hidantoína (por ejemplo Glydant de Lonza), yodopropilbutilcarbamato (por ejemplo como Glycakil-L, Glycakil-S de Lonza y/o Dekaben LMB de Jan Dekker), parabenos (por ejemplo éster alquílico de ácido p-hidroxibenzoico, tal como metil-, etil-, propil- y/o butilparabeno), fenoxietanol, etanol, ácido benzoico, sin limitarse a ellos.

Preferiblemente, las composiciones tópicas según la invención comprenden un espesante, en particular si la composición tópica está en forma de una emulsión, para ayudar a obtener la consistencia adecuada de un producto. Los espesantes preferidos son silicatos de aluminio, goma de xantana, hidroxipropilmetilcelulosa, poliacrilatos tales como Carbopole® (por ejemplo Carbopole 980, 981, 1382, 2984, 5984), o sus mezclas. Otros espesantes preferidos engloban copolímeros de acrilato/alquilC₁₀₋₃₀ acrilato (tales como, por ejemplo, Pemulen TR 1, Pemulen TR 2, Carbopol 1328 de NOVEON) así como Aristoflex AVC (INCI: copolímero de acrilóildimetiltaurato de amonio/VP).

Por supuesto, el experto en esta técnica tendrá cuidado de seleccionar el compuesto o compuestos adicionales opcionales mencionados anteriormente y/o sus cantidades de manera que las propiedades ventajosas intrínsecamente asociadas a la combinación según la invención no se vean afectadas, o no se vean sustancialmente afectadas, o no se vean perjudicialmente afectadas por la adición o adiciones previstas.

Las composiciones cosméticas y/o dermatológicas según la invención tienen un pH en el intervalo de 3-10, preferiblemente en el intervalo de pH de 4-8, lo más preferible en el intervalo de pH 4-7.

El siguiente ejemplo se proporciona para ilustrar adicionalmente las composiciones y efectos de la presente invención. Estos ejemplos son sólo ilustrativos, y no pretenden limitar de ninguna manera el alcance de la invención.

Ejemplo

Se preparó una formulación que comprende (etilendiamina)tetrametilenfosfonato de pentasodio como se esquematiza anteriormente, y se almacenó durante 4 meses a 43°C. Como referencia, se preparó la misma composición que comprende sal disódica del ácido etilendiaminotetraacético (EDTA) como agente quelante.

Fase	Nombre INCI	% en peso
A	Butil metoxidibenzoilmetano (Avobenzon; USAN)	4,00
	Polisilicona-15	3,00
	Miristato de glicerilo	4,00
	Alcohol cetílico	2,00
	BHT	0,05
	Dimeticona	2,00
	Fenoxietanol y Metilparabeno y Etilparabeno y Butilparabeno y Propilparabeno e	0,80
	Isobutilparabeno	
	Cetilfosfato de potasio	3,00
	Aceite mineral	3,60
	Sebacato de diisopropilo	12,00
	Adipato de dibutilo	10,00
	Copolímero VP/Eicoseno	2,00
B	Glicerina	3,00
	Goma xantana	0,30
	Agua	Hasta 100
	Etilendiamintetrametilenfosfonato pentasódico	0,50
C	Trietanolamina	0,30
D	Agua	10,00
	Trietanolamina	3,30
	Ácido fenilbencimidazol-sulfónico (Ensulizole; USAN)	4,00

5

Procedimiento

1 Calientese la parte A hasta 85°C mientras se agita.

2 Calientese la parte B hasta 80°C y añádase a la parte A mientras se agita, y homogenícese la emulsión.

3 Enfríese la emulsión hasta 55°C y añádase la parte C.

10 Asegúrese de que el pH de la emulsión es 7,0. Si quedan trazas, añádanse pequeñas cantidades de la base neutralizante usada, hasta que el valor del pH sea al menos 7,0.

4 Asegúrese de que el pH de la disolución de PARSOL® HS sea 7,0. Si quedan trazas, añádanse pequeñas cantidades de la base neutralizante usada, hasta que se disuelvan las partículas.

Añádase ahora la parte D, y homogenícese a conciencia nuevamente.

15 Enfríese después hasta la temperatura ambiente mientras se mezcla la emulsión.

Generalmente se recomienda usar vacío mientras se produce la emulsión.

Sorprendentemente, el intercambio del agente quelante EDTA (sal disódica del ácido etilendiaminotetraacético) por Dequest 2046 (etilendiaminotetrametilenfosfato pentasódico) resolvió el problema de la decoloración. El color de la formulación permaneció siendo blanco cremoso durante todo el tiempo de almacenamiento, mientras que la formulación que comprende EDTA se puso amarilla.

20

REIVINDICACIONES

1. Uso de (etilendiamina)tetrametilenfosfonato de pentasodio para suprimir la decoloración en composiciones tópicas que comprenden ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo.
- 5 2. El uso según la reivindicación 1, en el que la composición tópica comprende además un tensioactivo de éster de fosfato.
3. El uso según la reivindicación 2, en el que el tensioactivo de éster de fosfato se selecciona de fosfato de cetilo, cetilfosfato de potasio y/o cetilfosfato de DEA.
- 10 4. El uso según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que la cantidad del (etilendiamina)tetrametilenfosfonato de pentasodio está en el intervalo de alrededor de 0,05 a 5% en peso, basado en el peso total de la composición tópica.
5. El uso según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que la cantidad de la sustancia filtrante de UVB de tipo bencimidazol hidrófila se selecciona en el intervalo de alrededor de 1 a 3% en peso.
6. El uso según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que la composición tópica comprende al menos alguna otra sustancia filtrante de la radiación UVA y/o UVB y/o UV de amplio espectro.
- 15 7. El uso según la reivindicación 6, en el que la al menos alguna otra sustancia filtrante de radiación UVA y/o UVB y/o UV de amplio espectro se selecciona de polisiliconas-15, octocrileno, metoxicinamato de etilhexilo, hexilsalicilato de etilo, homosalato, 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxil-fenil]-6-(4-metoxifenil-1,3,5-triazina, 2-hidroxi-4-metoxi-benzofenona, 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-fenol), dióxido de titanio y/o butil metoxidibenzoilmetano.
- 20 8. Método para reducir la decoloración de composiciones tópicas que contienen ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo, que comprende preparar una composición tópica que comprende ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo, (etilendiamina)tetrametilenfosfonato pentasódico y un vehículo cosméticamente aceptable.
- 25 9. El método según la reivindicación 8, en el que la composición tópica comprende además un tensioactivo de éster de fosfato.
10. El método según la reivindicación 9, en el que el tensioactivo de éster de fosfato se selecciona de fosfato de cetilo, cetilfosfato de potasio y/o cetilfosfato de DEA.
- 30 11. El método según una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 10, en el que la cantidad del (etilendiamina)tetrametilenfosfonato de pentasodio está en el intervalo de alrededor de 0,05 a 5% en peso, basado en el peso total de la composición tópica.
12. El método según una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 11, en el que la cantidad del ácido 2-fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo se selecciona en el intervalo de alrededor de 1 a 3% en peso.
13. El método según una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 12, en el que la composición tópica comprende al menos alguna otra sustancia filtrante de radiación UVA y/o UVB y/o UV de amplio espectro.