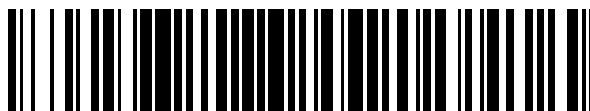


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 390 192**

51 Int. Cl.:
A61Q 15/00 (2006.01)
A61K 8/365 (2006.01)
A61K 8/44 (2006.01)
A61K 8/86 (2006.01)
A61K 8/20 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **08784833 .9**
96 Fecha de presentación: **17.07.2008**
97 Número de publicación de la solicitud: **2183029**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **12.05.2010**

54 Título: **Estabilización de una formulación cosmética o dermatológica con ácido mandélico**

30 Prioridad:
24.07.2007 DE 102070035742

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
07.11.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
07.11.2012

73 Titular/es:
**BEIERSDORF AG (100.0%)
UNNASTRASSE 48
20253 HAMBURG, DE**

72 Inventor/es:
**BIEL, STEFAN y
WEINERT, KATRIN**

74 Agente/Representante:
ISERN JARA, Jorge

ES 2 390 192 T3

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).

DESCRIPCION

Estabilización de una formulación cosmética o dermatológica con ácido mandélico

5 La invención se refiere a una formulación cosmética o dermatológica que comprende ácido mandélico, antitranspirantes y sustancias auxiliares para mejorar su estabilización.

En la patente DE 102005017032 se dan a conocer microemulsiones que contienen una sustancia activa antitranspirante, ácido mandélico y emulsionantes O/W polietoxilados.

10 En la patente WO 2005105026 se dan a conocer formulaciones cosméticas y/o formulaciones dermatológicas transparentes, las cuales por lo menos contienen una sustancia activa antitranspirante y/o una sustancia activa desodorante, por lo menos un ácido α -hidroxicarboxílico y agua. Como ácido hidroxílico se escoge de preferencia el ácido mandélico.

15 Con ayuda de la tecnología gel del ácido mandélico, como se describe en la patente WO 2005 105026, es posible en primer lugar obtener sistemas para aplicación "roll-on", en particular transparentes, en los cuales debido a los límites de fluidez de estas formulaciones pueden introducirse por ejemplo también efectos visuales como por ejemplo partículas en suspensión, perlas, etc..

20 La patente EP 1787629 A1 da a conocer una formulación cosmética y/o dermatológica que comprende por lo menos una sustancia activa antitranspirante, ácido mandélico, agua y aceite de ricino hidrogenado con PEG-40.

25 En la misma se muestra que estos sistemas de ácido mandélico bajo particulares condiciones de almacenamiento (almacenamiento a la luz, almacenamiento a 40 °C) no permanecen estables durante mucho tiempo, sin que tengan lugar precipitaciones o cristalizaciones.

30 Es deseable por lo tanto preparar geles de ácido mandélico, en particular transparentes y en particular como productos antitranspirantes o desodorantes, que tengan una mejor estabilización a la irradiación solar y/o a elevada temperatura.

La presente invención comprende una formulación cosmética que contiene por lo menos una sustancia activa antitranspirante de ácido mandélico, agua, cloruro de magnesio y/o cloruro de calcio y una o varias sustancias auxiliares.

35 Como sustancias auxiliares se escogen los compuestos ya mencionados:

- a.) Aceites de ricino hidroxilados polietoxilados, aceite de ricino hidrogenado con PEG-40, aceite de ricino hidrogenado con PEG-60,
- 40 b.) Antioxidantes fenólicos, como por ejemplo el producto comercial Tinogard TS, Tinogard TT, Tinogard NOA, de la firma Ciba, y/o
- c.) Uno o varios disulfitos, en particular el disulfito de sodio.

45 Son preferidos los aceites de ricino hidrogenados polietoxilados, en particular el aceite de ricino hidrogenado con PEG-40. El aceite de ricino hidrogenado con PEG-40 puede obtenerse como producto comercial bajo el nombre de Solor, Eumulgin, o Fancol.

50 Como ejemplos preferidos pueden citarse el aceite de ricino hidrogenado con PEG-40 y el aceite de ricino hidrogenado con PEG-60. El aceite de ricino hidrogenado con PEG-40 puede emplearse además ventajosamente en combinación con un perfume.

55 Se exceptúan como sustancias auxiliares las nombradas en la patente DE 102005017032 como emulsionantes, los ésteres de ácido grasos con polietilenglicol glicerina, el glicerilaurato de polietilenglicol (15) y/o el monoestearato de glicerilo.

El perfume es para muchos cosméticos un componente esencial, pero a menudo conduce a problemas e inestabilidades.

60 Con la o las sustancias auxiliares, en particular la sustancia auxiliar o solubilizador Solor (PEG-40), se pueden introducir perfumes según la invención en el gel de ácido mandélico sin que éste se enturbie o se vuelva inestable. Es decir, se añade además una ventajosa transparencia y estabilidad de los geles de ácido mandélico, como se describe en en la patente WO 2005 105026.

65 Las ventajas comunes en las sustancias auxiliares están presentes ventajosamente en el margen desde un 0,1 hasta un 10% del peso, en particular aproximadamente desde un 4 hasta un 7% del peso, de preferencia en el margen desde un 5 hasta un 6% del peso, cada vez referido a la masa total de la preparación.

Como sustancias auxiliares preferidas pueden escogerse por lo tanto, solubilizadores, en particular el PEG-40 HYDROGENATED CASTOR OIL ("aceite de ricino hidrogenado con PEG-40") (nombres comerciales: Solutor, Eumulgin, Fancol, Cremophor), en combinación con un perfume y/o sus componentes.

Los grupos de sustancias auxiliares de los antioxidantes fenólicos comprenden de preferencia el pentaeritritil tetra-di-t-butil ' hidroxihidrocinnato (nombre comercial: Tinogard TT, Ciba), el tetrabutyl etilidenobisfenol (nombre comercial: Tinogard NOA, Ciba) ó el di-t-butyl-4-hidroxihidrocinnato de octadecilo (nombre comercial: Tinogard TS, Ciba).

Como sustancias auxiliares pueden emplearse además ventajosamente los disulfitos, en particular el disulfito de sodio.

La adición de disulfito de sodio conduce a que se eviten las reacciones de decoloración y/o la formación de malos olores.

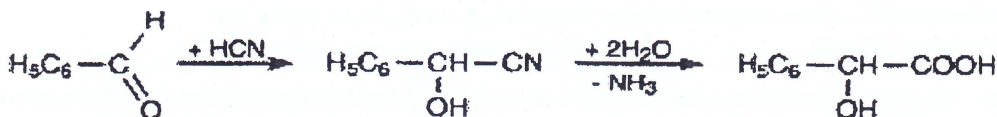
Los malos olores y las decoloraciones se forman por procesos de oxidación no deseados. Estos se producen por ejemplo mediante la luz y el calor. En el caso del ácido mandélico puede formarse benzaldehído durante el almacenamiento. Mediante la adición de sustancias auxiliares, en particular de disulfitos, en particular el disulfito de sodio, o combinaciones de EDTA y disulfito de sodio, estos procesos de oxidación se reprimen y con ello se minimiza la decoloración y la formación de malos olores. La proporción de disulfitos es ventajosamente de aproximadamente 0,1 a 0,2% en peso.

En combinación con EDTA, se añade EDTA de preferencia aproximadamente un 1% en peso.

La formulación según la invención se puede gelificar dando una formulación viscosa hasta pastosa, y hace posible la preparación de una preparación cosmética transparente y poco pegajosa, en particular una preparación antitranspirante o respectivamente desodorante como está descrito en la patente WO 2005105026. Como diferencia se minimizan temporalmente los problemas aparecidos por precipitaciones según la invención mediante el empleo de sustancias auxiliares.

El ácido hidroxifenilacético o también el ácido fenilglicólico de fórmula $H_5C_6-CH(OH)-NO_2$, $C_6H_5O_2$, es conocido con el nombre de ácido mandélico. El ácido mandélico se disuelve bien en agua, alcohol, éter y 2-propanol. Sintéticamente se obtiene el (±), el D- ó el ácido L-mandélico, a partir del benzaldehído y el ácido cianhídrico mediante el α -hidroxinitrilo (cianohidrina) y su hidrólisis ácida correspondiente a la figura 1:

Figura 1: Obtención del ácido mandélico



Mediante el ácido mandélico puede obtener sorprendentemente una preparación AT ó respectivamente una preparación desodorante pero también una preparación cosmética cualquiera, lo cual hace posible las ventajosas propiedades como la transparencia, escasa pegajosidad, ingredientes del perfume y además también el ajuste de un determinado límite de fluidez de la preparación. Además la formulación según la invención penetra con rapidez sin dejar residuo en la piel.

Además, el ácido mandélico conduce mediante sus propiedades queratinolíticas a la regeneración de la piel axilar y actúa como bacteriostático en el medio ácido de las axilas. Debido a sus propiedades, el ácido mandélico es apropiado también como un excelente componente activo en los productos cosméticos y en particular en los productos Deo/AT.

El límite de fluidez o temperatura de fluidez es una denominación que se da al más pequeño esfuerzo de cizallamiento por encima del cual una sustancia plástica se comporta reológicamente como un líquido (DIN 1342-1: 1983-10). La determinación del límite de fluidez tiene lugar mediante el trazado de una curva de fluidez (DIN 53019: 1980-05., DIN 53214: 1982-02). El valor obtenido depende fuertemente de la escala de tiempo (velocidad de carga), en la cual se basa la medición. Este es independiente de si la medición se efectúa con un viscosímetro de esfuerzo cortante o de un viscosímetro regulado por el número de revoluciones. Las escalas de tiempo cortas (cargas rápidas) dan como resultado por regla general valores altos de límites de fluidez. Un límite de fluidez demasiado alto puede ser la causa de trastornos de fluidez. Por otra parte, con un valor apropiado de la fluidez, puede vencerse la inclinación de las formulaciones líquidas a escurrirse.

La preparación según la invención está presente ventajosamente como gel o respectivamente como hidrogel, y tiene un límite de fluidez mediante el cual el empleo y la aplicación respecto a las preparaciones del actual estado de la técnica es mucho mejor.

- 5 De preferencia, la cantidad total de ácido mandélico tiene según la invención un máximo de hasta un 4% en peso, ventajosamente un máximo de un 2,8% en peso, referido a la masa total de la preparación.

La combinación según la invención de una sustancia activa AT, ácido mandélico, una sustancia auxiliar y agua, hace posible mediante un mecanismo de espesamiento especial, la obtención de una preparación cosmética particularmente transparente. El usuario tiene con ello por primera vez en mano una preparación clara como el agua y sin embargo extremadamente activa. La preparación según la invención es en forma de gel, es cómoda de aplicar y tiene un agradable tacto con la piel debido a su falta de pegajosidad.

15 Como sustancias activas antitranspirantes, se pueden incorporar ventajosamente sales ácidas de aluminio y/o aluminio/zirconio en solución acuosa. A este respecto, los márgenes de concentración descritos se refieren a los contenidos activos mencionados de los complejos antitranspirantes: en los compuestos de aluminio a los complejos exentos de agua, en los compuestos de aluminio/zirconio a los complejos exentos de agua y tampón. Como tampón se emplea aquí habitualmente la glicina.

20 El siguiente listado de sustancias activas antitranspirantes para emplear ventajosamente, no pretende de ninguna manera ser limitativo.

Sales de aluminio (de fórmula empírica $[Al_2(OH)_mCl_n]$, en donde $m + n = 6$):

- 25 - Clorhidrato de aluminio $[Al_2(OH)_5Cl] \times H_2O$
Complejos estándar de Al: Locron L, Locron LIC, Locron LIF (Clariant), Chlorhydrol (Reheis), ACH-303 (Summit), Aloxicoll L (Giulini).
Complejos de Al activados: Reach 501 (Reheis), Aloxicoll 51 L
- 30 - Sesquiclorhidrato de aluminio $[Al_2(OH)_{4,5}Cl_{1,5}] \times H_2O$
Complejos estándar de Al: Aloxicoll 31 L (Giulini), Westhlor 186 (Westwood Chemicals)
Complejos de Al activados: Reach 301 (Reheis)
- Diclорhidrato de aluminio $[Al_2(OH)_4Cl_2] \times H_2O$

Sales de aluminio – zirconio:

- 35 - Triclorhidrex de aluminio/zirconio con glicina, complejos estándar de Al/Zr $[Al_4Zr(OH)_{13}Cl_3] \times H_2O \times Gly$:
Rezal 33 GC (Reheis), AZG-7164 (Summit)
- Tetraclorhidrex de aluminio-zirconio con glicina, complejos estándar de Al/Zr : $[Al_4Zr(OH)_{12}Cl_4] \times H_2O \times Gly$:
Rezal 36, Rezal 36 G, Rezal 36 GC (Reheis), AZG-368 (Summit), Zirconal L435G (Giulini), Westchlor ZR
40 35 BX5, Westchlor ZR 41 (Westwood Chemicals)
- Pentaclorhidrex de aluminio-zirconio con glicina, complejos estándar de Al/Zr: $[Al_5Zr(OH)_{23}Cl_5] \times H_2O \times Gly$:
Rezal 67 (Reheis), Zirconal L540, Zirconal L530PG (Giulini), Westchlor ZR 80 B, (Westwood Chemicals)
- Octaclorhidrex de aluminio-zirconio con glicina $[Al_8Zr(OH)_{20}Cl_8] \times H_2O \times Gly$: Westchlor ZR 82 B

45 También pueden emplearse ventajosamente las sales de aluminio – zirconio exentas de glicina.

Las sustancias activas antitranspirantes se emplean en las formulaciones según la invención en una cantidad desde un 1 hasta un 35% en peso, de preferencia desde un 1 hasta un 20% en peso.

50 Ventajosamente, la sustancia activa AT se escoge de las sales de aluminio, en particular, el clorhidrato de aluminio, activado o sin activar.

Ventajosamente, pueden añadirse también desodorantes a las preparaciones según la invención. Los desodorantes cosméticos habituales se basan en diferentes principios activos.

55 Mediante el empleo de sustancias antimicrobianas en los desodorantes cosméticos puede reducirse la flora bacteriana sobre la piel. A este respecto, en el caso ideal, pueden reducirse eficazmente solamente los microorganismos causantes del olor. El propio sudor no es influido por ellos, en el caso ideal solamente se interrumpe la descomposición microbiana del sudor, temporalmente. También es habitual la combinación de astringentes con sustancias activas antimicrobianas en una y la misma composición.

60 Todas las sustancias activas desodorantes habituales pueden ser empleadas ventajosamente, por ejemplo los enmascaradores del olor, como los perfumes habituales o los componentes del perfume, los absorbedores del olor, por ejemplo los filosilicatos descritos en la patente DE 40 09 347, entre los cuales en particular la montmorillonita, la caolinita, la beidellita, la nontronita, la saponita, la hectorita, la bentonita, la esmectita, además por ejemplo las sales de zinc del ácido ricinoleico, los medios inhibidores de gérmenes son igualmente apropiados para ser incorporados

en las preparaciones según la invención. Substancias ventajosas son por ejemplo, el 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxidifeniléter (Irgasan), 1,6-di-(4-clorofenilbiguanido)-hexano (Chlorhexidin), 3, 4, 4'-triclorocarbanilida, compuestos de amonio cuaternario, esencia de clavo, esencia de menta, esencia de tomillo, citrato de trietilo, farnesol (3, 7, 11-trimetil-2, 6, 10-dodecatrien-1-ol) así como los agentes activos descritos en las patentes DE 37 40 186, DE 39 38 140, DE 42 04 321, DE 42 29 707, DE 42 29 737, DE 42 37 081, DE 43 09 372, DE 43 24 219. También el bicarbonato de sodio puede emplearse ventajosamente.

De preferencia, la preparación según la invención comprende uno o varios perfumes y/o sus componentes.

10 La cantidad de desodorantes (uno o más compuestos) en las preparaciones es de preferencia desde un 0,01 hasta un 10% en peso, de preferencia desde un 0,05 hasta un 5% en peso, referidos al peso total de la preparación.

Al sistema según la invención pueden añadirse además adicionalmente:

- 15 - co-espesantes, como por ejemplo la polivinilpirrolidona (por ejemplo el Luviskol 30, BASF).
 - polímeros que contienen ácido maleico o anhídrido maleico (por ejemplo el Gantrez S ó los tipos de Gantrez AN, ISP Internationale Specialty Products) y/o
 - celulosas hidrófobas modificadas (Natrosol 250 HHX Pharm, Hercules)
 20 - sales, en particular sales bivalentes como por ejemplo, el cloruro de magnesio o el cloruro de calcio, en concentraciones desde un 10,1% hasta un 5%, solas, o en combinación.

Estos co-espesantes, polímeros o respectivamente celulosa y sales, tienen también una influencia estabilizadora adicional sobre los geles de ácido mandélico según la invención.

25 La adición de sales conduce por ejemplo a una elevación de la estabilidad al cizallamiento de los geles de ácido mandélico.

Las sales neutrales bivalentes de cloruro de magnesio y de cloruro de calcio conducen a una estabilidad al cizallamiento de las preparaciones según la invención, pudiendo aparecer sin la adición de las mismas, turbideces blancas cuando la formulación por ejemplo se agita fuertemente, o cuando la fórmula se aplica con un rodillo o eventualmente cuando se envasa demasiado tarde. Con la adición de las sales esto ya no ocurre más.

Es posible según la invención, mejorar la estabilidad de las preparaciones cosméticas que contienen ácido mandélico mediante la adición de una o varias sustancias auxiliares. Como mejora de la estabilidad se entiende a este respecto en particular el evitar precipitaciones, turbideces o cristalizaciones, la estabilización en presencia de radiación solar y/o temperatura elevada, el evitar reacciones de decoloración y/o la formación de malos olores así como el aumento de la estabilidad al cizallamiento de las preparaciones con ácido mandélico.

Es posible el empleo de sustancias activas escogidas del grupo de los aceites de ricino hidrogenados polietoxilados, el aceite de ricino hidrogenado con PEG 40, el aceite de ricino hidrogenado con PEG-60, los antioxidantes fenólicos, y/o los sulfitos, para la estabilización de las preparaciones conteniendo ácido mandélico, las cuales contienen cloruro de magnesio y/o cloruro de calcio.

La estabilización es particularmente ventajosa cuando en la preparación están contenidos como se ha mencionado anteriormente un perfume o uno o varios de sus componentes.

Las preparaciones cosméticas y dermatológicas según la invención pueden contener aditivos cosméticos, como los que se emplean habitualmente en dichas preparaciones, por ejemplo agentes conservantes, bactericidas, filtros de UV, antioxidantes, vitaminas solubles en agua, sustancias minerales, partículas sólidas en suspensión, perfumes, EDTA, sustancias inhibidoras de la espuma, colorantes, pigmentos, que tienen una acción colorante, agentes espesantes, sustancias humectantes y/o mantenedores de la humedad, u otros componentes habituales de una formulación cosmética o dermatológica como por ejemplo, alcoholes, polioles, polímeros, estabilizadores de la espuma, o derivados de la silicona.

55 Estos aditivos deben diferenciarse de las sustancias auxiliares mencionadas según la invención.

Ventajosamente, para la obtención de las preparaciones según la invención, pueden añadirse en primer lugar una o varias sustancias auxiliares y eventualmente un perfume. La sustancia activa y el perfume se dispersan a continuación aproximadamente a partes iguales sobre las soluciones acuosas de ácido mandélico y ACH, antes de que éstos se añadan con fines gelificantes.

REIVINDICACIONES

- 5
1. Formulaci3n cosm3tica y/o dermatol3gica que comprende por lo menos una sustancia activa antitranspirante, 3cido mand3lico, agua y por lo menos una sustancia auxiliar, escogida del grupo:
- aceites de ricino hidrogenados polietoxilados, aceite de ricino hidrogenado con PEG-40, aceite de ricino hidrogenado con PEG- 60,
 - antioxidantes fen3licos y/o
 - uno o varios disulfitos, caracterizada porque la formulaci3n contiene cloruro de magnesio y/o cloruro de calcio.
- 10
2. Formulaci3n seg3n la reivindicaci3n 1, caracterizada porque la o las sustancias auxiliares se escogen del grupo formado por la pentaeritritil tetra-di-t-butil hidroxihidrocinaurato, tetrabutil etilidenbisfenol, octadecil di-t-butil-4-hidroxihidrocinaurato y/o disulfito de sodio.
- 15
3. Formulaci3n seg3n la reivindicaci3n 1 3 2, la cual comprende uno o varios perfumes y/o sus componentes.
4. Formulaci3n seg3n una de las precedentes reivindicaciones, caracterizada porque, el disulfito de sodio se ha escogido en combinaci3n con el 3cido etilendiamintetraac3tico (EDTA), como sustancia auxiliar.
- 20
5. Formulaci3n seg3n una de las precedentes reivindicaciones, caracterizada porque. la sustancia activa antitranspirante se escoge del grupo formado por las sales de aluminio, de preferencia el clorhidrato de aluminio o las sales de aluminio-zirconio.
- 25
6. Empleo de sustancias auxiliares escogidas del grupo de los aceites de ricino hidrogenados polietoxilados, aceite de ricino hidrogenado con PEG-40, aceite de ricino hidrogenado con PEG-60, antioxidantes fen3licos y/o uno o varios disulfitos para la estabilizaci3n de las preparaciones que contienen 3cido mand3lico, caracterizado porque, la formulaci3n contiene cloruro de magnesio y/o cloruro de calcio.
- 30
7. Empleo seg3n la reivindicaci3n 6, caracterizado porque en la preparaci3n, est3n contenidos adicionalmente un perfume o uno o varios de sus componentes.