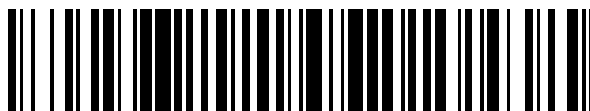


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 428 839**

51 Int. Cl.:

A61K 8/67 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

A61K 8/88 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **10.06.2009 E 09772287 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **07.08.2013 EP 2296617**

54 Título: **Composiciones cosméticas que contienen niacinamida con propiedades de sensación en la piel mejoradas**

30 Prioridad:

30.06.2008 US 164138

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

11.11.2013

73 Titular/es:

**UNILEVER N.V. (100.0%)
Weena 455
3013 AL Rotterdam, NL**

72 Inventor/es:

**POLONKA, JACK;
WEI, XIAOLING y
BARTOLONE, JOHN, BRIAN**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 428 839 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).

DESCRIPCIÓN

Composiciones cosméticas que contienen niacinamida con propiedades de sensación en la piel mejoradas

Antecedentes de la invención

Campo de la invención

- 5 La invención se refiere a mejoras en la sensación en la piel de composiciones cosméticas que contienen niacinamida que incorporan estructurantes funcionalizados como espesantes.

Técnica relacionada

- 10 Invariablemente, las composiciones cosméticas se formulan con uno o más estructurantes para espesar el sistema. Un número significativo de fórmulas usan estructurantes que tienen grupos funcionales de ácido carboxílico (o una sal del mismo). Estructurantes ilustrativos son ácidos grasos de C₁₂-C₂₀, polímeros funcionalizados con ácido acrílico y sales derivadas que son el resultado de la neutralización de los grupos de ácido carboxílico.

- 15 La niacinamida es una sustancia hallada en muchos cosmético como decolorantes de la piel y/o agentes hidratantes. Pueden surgir problemas por la interacción de niacinamida con los estructurantes portadores de ácido carboxílico o de sal. Por ejemplo, la niacinamida y los ácidos/sales poliacrílicos pueden interaccionar de forma adversa y dar como resultado separación de fases entre estos materiales. En muchos casos se puede producir cristalización. La niacinamida y el estructurante de ácido carboxílico/sal pueden formar cristales mixtos o un complejo. Este disminuye la capacidad de dispersión de agua del polímero que contiene ácido carboxílico o el ácido graso de cadena larga. De interés particular son las cremas ultraligeras. Estas se formulan con niveles altos de ácido esteárico suspendido en agua mediante un agente emulsionante tal como un jabón de metal alcalino. La niacinamida puede convertir a la crema hidratante ultraligera en una sustancia endurecida estéticamente inaceptable.

- 20 Procter & Gamble han informado sobre las composiciones cosméticas con niacinamida en una serie de documentos de patente que incluyen: US 5 833 998; US 5 939 082; US 5 962 482; US 5 968 528; US 5 980 921; US 5 997 890; US 5 997 887; US 6 024 942; US 6183761 B1; US 6 224 888; US 6 309 657 B2; y US 6 447 647 B1. Unilever ha investigado particularmente las cremas hidratantes ultraligeras. Documentos relacionados incluyen US 3 938 810; US 4 096 240; US 6 939 552 B2; GB 2 230186; y EP 0 396 422.

- 30 La presente invención está centrada en composiciones cosméticas con niacinamida y estructurantes de ácido carboxílico/sal que superan los problemas de la mala sensación en la piel producidos por el endurecimiento de la composición y la separación de fases. También es un centro de atención de la presente invención mejorar los niveles de fotoprotección para las composiciones cosméticas del tipo mencionado anteriormente que contienen sustancias.

Sumario de la invención

Se proporciona una composición cosmética que incluye:

- (i) de 0,5 a 10 % en peso de niacinamida;
- 35 (ii) de 0,1 a 30% en peso de un estructurante seleccionado del grupo que consiste en ácido graso de C₁₂-C₂₀ o una sal del mismo, un polímero con varias unidades monoméricas de ácido carboxílico o sales del mismo, y mezclas de las mismas; y
- (iii) de 0,1 a 20% en peso de partículas que comprenden una poliamida polimerizada de condensación, teniendo la poliamida un valor de amina no inferior a 0,3 y un valor HLB de 16 o superior, en el que un agente protector solar se solubiliza o se dispersa de forma uniforme dentro de la poliamida polimerizada de condensación para formar partículas compuestas.
- 40

Descripción detallada de la invención

- 45 En la actualidad se ha descubierto que partículas de ciertas poliamidas polimerizadas de condensación pueden inhibir la interacción adversa de niacinamida con polímeros de peso molecular más altos funcionalizados con ácido carboxílico o sal o de ácidos grasos. Se pueden conseguir buenas estéticas de sensación en la piel. La poliamida debe ser un material que tiene un valor de amina no inferior a 0,3 y un valor de HLB de 16 o mayor.

Niacinamida

La niacinamida también se conoce como vitamina B3. Las cantidades de niacinamida dentro de las composiciones de la presente invención variarán de 0,5 a 10%, preferentemente de 1 a 8% y, óptimamente, de 3 a 7 % en peso de la composición.

- 50 Estructurante carboxílico

Las composiciones de la presente invención tendrán un estructurante carboxílico que funcione como espesante. El estructurante se puede seleccionar de ácidos grasos de C₁₂-C₂₀ o sales de los mismos, polímeros con unidades monoméricas que tienen al menos un ácido carboxílico o sal del mismo y combinaciones de los mismos. Con el término "sal" se quiere significar un catión de metal alcalino, amonio u organoamonio. Cationes ilustrativos son

5 cationes de sodio, potasio, litio, amonio, trimetilamonio y trietanolamonio.

Cuando se usa el ácido graso de C₁₂-C₂₀ como estructurante, se puede seleccionar de, entre otros, ácido esteárico, ácido oleico, ácido isoesteárico, ácido linoleico, ácido palmítico, ácido cetéarico, ácido mirístico y ácido behénico. Las sales de ácido graso de C₁₂-C₂₀ adecuadas incluyen estearato de sodio, estearato de potasio, estearato de amonio, estearato de trietanolamonio, behenato de sodio, palmitato de sodio, oleato de potasio y miristato de

10 potasio. Particularmente preferido es el ácido esteárico. Las cantidades de ácido graso pueden variar de 5 a 30 %, preferentemente de 7 a 28 %, más preferentemente de 10 a 25 %, óptimamente de 12 a 20 % en peso de la composición.

Las composiciones cosméticas de cremas hidratantes ultraligeras son particularmente relevantes para la presente invención. Estas cremas hidratantes ultraligeras tienen niveles relativamente altos de ácido graso (p. ej., por encima del 7% y habitualmente del 12 – 20%). En general, las cremas hidratantes ultraligeras incluirán un ácido graso de C₁₂-C₂₀ y también, en menores cantidades, una sal de metal alcalino del ácido graso, como a niveles de 0,1 a 20% pero preferentemente de 0,5 a 4% en peso de la composición.

15

Los estructurantes de acuerdo con la presente invención pueden estar en forma polimérica. Estos polímeros contendrán al menos una funcionalidad de ácido carboxílico o sal del mismo en una o más de las unidades monoméricas que constituyen el polímero. El polímero puede ser un homo o copolímero. El peso molecular promedio en peso puede variar de 800 a 5 millones, preferentemente de 2.000 a 1 millón, óptimamente de 5.000 a 100.000. Normalmente, las unidades monoméricas se pueden seleccionar de ácido acrílico, ácido metacrílico, ácido maleico, ácido protónico, ácido adípico, así como las sales ácidas de los mismos, y combinaciones de los mismos. Ilustrativos son, entre otros, ácidos/sales poliacrílicos, ácidos/sales polimetacrílicos y ácido polivinilmetiléter/maleico, todos los cuales pueden estar reticulados o no reticulados.

20

Ejemplos de polímeros de ácido carboxílico disponibles comercialmente útiles en el presente documento incluyen los carbómeros, que son homopolímeros de ácido acrílico reticulado con éteres de alilo de sacarosa o pentaeritritol. Los carbómeros están disponibles como la serie Carbopol® 900 de Noveon Corporation (p. ej., Carbopol® 954). Además, otros agentes poliméricos de ácido carboxílico adecuados incluyen copolímeros de acrilatos de alquilo C₁₀-₃₀ con uno o más monómeros de ácido acrílico, ácido metacrílico, o uno de sus ésteres de cadena corta (es decir, alcohol C₁₋₄) en los que el agente de reticulación es un éter de alilo de sacarosa p pentaeritritol. Estos copolímeros se conocen como crosopolímeros de acrilatos/acrilato de alquilo C₁₀₋₃₀ y están disponibles comercialmente como Carbopol® 1342, Carbopol® 1382, Ultrez® 21, Pemulen® TR-1, y Pemulen® TR-2 de Noveon division of Lubrizol Corporation.

30

Adicionalmente, copolímeros útiles se ilustran, entre otros, mediante los ejemplos siguientes: Acrilato de hidroxietilo/taurato de acriloidimetilsódico (p. ej., Simulgel® NS y INS 100) y acrilato/taurato de acriloidimetilsódico (p. ej., Simulgel® EG). Las cantidades de estructurantes que contienen ácido carboxílico polimérico/sal pueden variar de 0,1 a 10%, preferentemente de 0,3 a 5 % e incluso más preferentemente de 0,25 a 4 % en peso de la composición.

35

40 **Partículas de poliamida**

Un componente importante de las composiciones de la presente invención es el de las partículas de una poliamida polimerizada de condensación (en ocasiones denominada en el presente documento, resina). Una realización preferida de la resina es una polialquilenoxipoliamida (denominada resina de PAOPA) y también un poli(ésteramida) terminado en éster (denominado resina EPTEA). La resina PAOPA se puede preparar haciendo reaccionar un ácido monocarboxílico, un compuesto diamina y un ácido dibásico. La resina EPTEA se puede preparar haciendo reaccionar un ácido dibásico, una diamina, un poliol y un monoalcohol. Preferentemente, la resina EPTEA se puede formar a partir de la reacción de: (a) al menos 50 por ciento equivalente del ácido dibásico que comprende ácido graso polimerizado; (b) al menos por ciento equivalente de la diamina que comprende etilendiamina; (c) 10 – 60 por ciento equivalente del total de los equivalentes de hidroxilo y amina proporcionados por diamina, el poliol y el monoalcohol se proporcionan por el monoalcohol; y (d) no más de 50 por ciento equivalente del total de los equivalentes de hidroxilo y amina proporcionados por diamina, el poliol y el monoalcohol se proporcionan mediante poliol. La preparación y descripción de estas resinas se encuentran en los documentos US 7 329 71982 y US 6 492 458. Particularmente preferidas son las resinas de la marca Sylvaclear PA 1200V, identificada por el nombre INCI de Potyamide-3, y Sylvaclear AF 1900V, ambos comercializados por Arizona Chemical Company, Jacksonville, Florida.

45

No todas las poliamidas polimerizadas de condensación serán resinas adecuadas para los fines de la presente invención. Los inventores han hallado que solo muestran actividad las poliamidas que tienen un número de amina no inferior a 0,3, más preferentemente entre 0,3 y 6,0, todavía más preferentemente entre 0,4 y 4,0, y óptimamente entre 1,0 y 3,0. El número de amina se determina mediante titulación con ácido perclórico en ácido acético glacial. El punto final se determina mediante un procedimiento potenciométrico usando un pHmetro de vidrio/electrodo. El

55

procedimiento se describe en Myers RT "Impurities In High Molecular Weight Amine Products", the Ohio Journal of Science 58(1) January (1958) página 34.

Otro parámetro físico necesario para las poliamidas eficaces de la presente invención es un valor HLB de al menos 16, preferentemente de 16,2 a 20, más preferentemente de 17 a 20. El término "HLB" indica el equilibrio hidrófilo/lipófilo. Este factor mide el grado hasta el cual un tensioactivo es hidrófilo o lipófilo. La determinación del HLB se realiza calculando los valores para diferentes regiones de una molécula tensioactivo. Las referencias al cálculo mediante el procedimiento se pueden hallar en Griffin "Classification of Surface-Active Agents by 'HLB' ", Journal of the Society of Cosmetic Chemists 1 (1949) página 311; Griffin WC "Calculation of HLB Values of Non-Ionic Surfactants", Journal of the Society of Cosmetic Chemists 5 (1954) página 259; Davies JT "A Quantitative Kinetic Theory of Emulsion Type, I. Physical Chemistry of the Emulsifying Agent", Gas/Liquid and Liquid/Liquid Interface, Proceedings of the International Congress of Surface Activity (1957) páginas 426 - 438.

Las cantidades de las partículas dentro de la composición cosmética pueden variar de 0,1 a 20 %, preferentemente de 2 a 15 %, óptimamente de 4 a 10 % en peso de la composición cosmética.

El tamaño medio de partícula de las partículas puede variar de 10 a 2.000 nm, preferentemente de 100 a 1.500 nm y, óptimamente, de 200 a 1.000 nm.

Normalmente, las partículas de poliamida de la presente invención se encontrarán dispersas dentro de una fase acuosa de una emulsión cosmética de agua y aceite. Estas partículas generalmente no estarán dentro de la fase oleosa de las emulsiones. Dado que la niacinamida se encuentra en fases acuosas de emulsiones, la introducción de las partículas de poliamida en la misma fase (agua) permitirá la interacción con niacinamida para alcanzar los beneficios de la presente invención.

A las composiciones de la presente invención se añaden protectores solares. El agente protector solar se solubiliza o se dispersa de forma uniforme dentro de la poliamida polimerizada de condensación para formar partículas compuestas. Los agentes protectores solares también se pueden formar como núcleo que rodea las partículas de poliamida.

La proporción en peso relativa del agente protector solar orgánico y la poliamida puede variar de 5:1 a 1:10, preferentemente de 3:1 a 1:8, más preferentemente de 2:1 a 1:7, óptimamente de 1:1 a 1:3. Las cantidades de la poliamida pueden variar de 10 % a 99,5 % en peso de las partículas compuestas. Más preferentemente, el peso de la poliamida puede variar de 30 % a 98%, óptimamente 50 a 85 % en peso de las partículas compuestas. Las cantidades del agente protector solar pueden variar de 0,5 a 90 %, preferentemente de 2 a 70 %, óptimamente de 30 a 50 % en peso de las partículas compuestas.

Los agentes protectores solares de acuerdo con la presente invención tendrán al menos un grupo cromofórico que absorbe en la luz ultravioleta desde 290 a 400 nm. Los agentes protectores solares orgánicos cromofóricos se pueden dividir en las categorías siguientes (con ejemplos específicos), incluyendo: ácido p-aminobenzoico, sus sales y sus derivados (ésteres de etilo, isobutilo, glicerilo; ácido p-dimetilaminobenzoico); antranilatos (o-aminobenzoatos; ésteres de metilo, mentilo, fenilo, bencilo, feniletilo, linalilo, terpinilo y ciclohexenilo); salicilatos (ésteres de octilo, amilo, fenilo, bencilo, metilo, glicerilo y dipropilenglicol); derivados de ácido cinnámico (ésteres de metilo y bencilo, alfa-fenilol cinnamonitrilo; piruvato de butilcinnamoilo); derivados de ácido dihidroxycinnámico (umbeliferona, metilumbeliferona y metilaceto-umbeliferona); derivados de ácido trihidroxycinnámico (esculetina, metilesculetina, dafnetina y los glucósidos, esculina y dafnina); hidrocarburos (difenilbutadieno y estilbeno); dibenzalacetona y benzalacetofenona; naftolsulfonatos (sales de sodio de ácido 2-naftol-3,6-disulfónico y 2-naftol-6,8-disulfónico); ácido dihidroxi-naftoico y sus sales; o- y p-hidroxibifenildisulfonatos; derivados de coumarina (7-hidroxi, 7-metilo y 3-fenilo); diazoles (2-acetil-3-bromindazol, fenil benzoxazol, metil naftoxazol y varios aril benzotiazoles); sales de quinina (bisulfato, sulfato, cloruro, oleato y tannato); derivados de quinolina (sales de 8-hidroxiquinolina y 2-fenilquinolina); benzofenonas hidroxi- o metoxi-sustituidas; ácidos úrico y vilóurico; ácido tánico y sus derivados (p. ej., hexaetiléter); (butil carbitilo) (6-propilpiperonilo) éter; hidroquinona; benzofenonas (oxibenzona, sulisobenzona, dioxibenzona, benzoescorcinol, 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona, 2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetoxibenzofenona y octabenzona); 4-isopropildibenzoilmetano; butilmetoxidibenzoilmetano; etocrileno; y 4-isopropil-dibenzoilmetano.

Agentes protectores solares particularmente útiles son: p-metoxicinnamato de 2-etilhexilo, metoxidibenzoilmetano de 4,4'-t-butilo, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, ácido octildimetil p-aminobenzoico, digaloltrioleato, 2,2-dihidroxi-4-metoxibenzofenona, 4-[bis(hidroxipropil)]aminobenzoato de etilo, 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenilacrilato, 2-etilhexilsalicilato, glicerilp-aminobenzoato, 3,3,5-trimetilciclohexilsalicilato, metilantranilato, ácido p-dimetilaminobenzoico o aminobenzoato, p-dimetilaminobenzoato de 2-etilhexilo, ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfónico, ácido 2-(p-dimetilaminofenil)-5-sulfoniobenzoxazoico, 4-metilbencilidenalcanfor, bis-etilhexiloxifenol metoxifenol triazina, metilbis-benzotriazolilo, tetrametilbutilfenol, dimeticodietilbenzal malonato, metoxicinnamato de isoamilo, octiltriazona, ácido de tereftalididencamfor sulfónico y mezclas de los mismos.

Las composiciones cosméticas de la presente invención puede que no solo tengan en su interior un agente protector solar sino que una cantidad del agente protector solar se puede formular libre de poliamida dentro de la composición. Cuando está presente fuera del compuesto, el agente protector solar puede estar disponible en

cantidades de 0,1 a 25%, particularmente de 2 a 15% en peso de la composición. Algunas realizaciones preferidas de la presente invención se pueden formular sin ningún agente protector solar externo a los compuestos o únicamente con una cantidad relativamente pequeña externa a las partículas compuestas. Por ejemplo, la cantidad del agente protector solar externo puede variar desde 0% hasta 5%, preferentemente desde 0,01 a 2% y, posiblemente, de 0,01 a 0,8% en peso de la composición.

La composición de la presente invención puede contener varios otros componentes para potenciar las propiedades físicas y el rendimiento.

Las composiciones de la presente invención pueden incluir un vehículo cosméticamente aceptable. El vehículo puede ser un material líquido o sólido. Los vehículos pueden estar presentes en cantidades que varían de 5 a 98%, preferentemente de 20 a 95%, óptimamente de 40 a 80% en peso de las composiciones cosméticas. El agua es el vehículo más habitual para la presente invención. Los vehículos oleosos en presencia de agua y un emulsionante formarán sistemas de emulsión como vehículos. Estos sistemas pueden ser emulsiones de agua en aceite o de aceite en agua. Además del agua, clases de vehículos adecuados incluyen siliconas, alcoholes polihídricos, alcoholes grasos, hidrocarburos, triglicéridos y polvos espesantes.

Las siliconas, cuando están presentes, pueden variar de 5% a 60%, más preferentemente de 5% a 40% en peso de la composición. Estas siliconas pueden ser orgánicas, que contienen silicona o que contienen flúor, volátiles o no volátiles, polares o apolares.

Aceites de silicona volátiles particularmente preferidos son siliconas volátiles cíclicas en las que la unidad repetidora varía de 3 a 5; y siliconas lineales en las que la unidad de repetición varía de 1 a 7. Ejemplos muy preferidos de aceites de silicona volátil incluyen ciclometiconas de viscosidades variables, por ejemplo Dow Corning 200, Dow Corning 244, Dow Corning 245, Dow Corning 344 and Dow Corning 345 (disponible comercialmente en Dow Corning Corp.); SF-1204 y SF-1202 Silicone Fluids, GE 7207 y 7158 (disponibles comercialmente en G.E. Silicones) y SWS-03314 (disponible comercialmente en SWS Silicones Corp).

Los hidrocarburos pueden ser útiles como vehículos cosméticamente aceptables para composiciones de la presente invención. Pueden incluir aceite mineral, vaselina y polialfa-olefinas. Ejemplos de hidrocarburos volátiles preferidos incluyen polidecanos tales como isododecano e isodecano (p. ej., Permethyl-99A que está disponible en Presperse Inc.) y las isoparafinas C₇-C₈ a C₁₂-C₁₅ (tales como la serie Isopar Series disponible en Exxon Chemicals).

Los alcoholes polihídricos pueden servir como vehículos. Ilustrativos de este grupo son propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol polietilenglicol, sorbitol, hidroxipropilsorbitol, hexilenglicol, 1,3-butilenglicol, isopropilenglicol, 1,2,6-hexanotriol, glicerol etoxilado, glicerol propoxilado y mezclas de los mismos. El más preferido es glicerol conocido también como glicerina.

Los alcoholes grasos también pueden ser vehículos útiles. El término "graso" hace referencia a longitudes de la cadena de carbono que varían de 10 a 30 átomos de carbono. Son ilustrativos de esta categoría alcohol laurílico, alcohol cetílico, alcohol estearílico, alcohol isoestearílico y combinaciones de los mismos.

Los triglicéridos son otro grupo de materiales útiles como vehículos. Ilustrativos, aunque no limitantes, son aceite de semilla de girasol, aceite de algodón, aceite de canola, aceite de soja, aceite de ricino, aceite de borraja, aceite de oliva, manteca de karité, aceite de jojoba y mezclas de los mismos. También pueden ser útiles los mono y diglicéridos. Ilustrativos de estas categorías son monoestearato de glicerilo y diestearato de glicerilo.

Los componentes opcionales, cuando se incorporan en la composición, deberían ser adecuados para usar en contacto con tejido queratinoso humano sin toxicidad indebida, incompatibilidad, inestabilidad, respuesta alérgica y similares, dentro del alcance del juicio sólido. El CTFA Cosmetic Ingredient Handbook, Second Edition (1992) describe una amplia variedad de ingredientes cosméticos farmacéuticos no limitantes de uso habitual en la industria de los cuidados de la piel, que son adecuados para usar en las composiciones de la presente invención. Ejemplos de estas clases incluyen: Abrasivos, absorbentes, componentes estéticos tales como fragancias, pigmentos, aceites esenciales, agentes de sensaciones de la piel, astringentes etc. (p. ej., aceite de trébol, mentol, alcanfor, aceite de eucaliptos, eugenol, lactato de mentilo y destilado de hamamelis), agentes anti-acné, agentes anti-aglomerantes, agentes antiespumantes, agentes antimicrobianos, antioxidantes, aditivos biológicos, agentes tampón, agentes espesantes, agentes quelantes, aditivos químicos, colorantes, astringentes cosméticos, biocidas cosméticos, desnaturalizantes, astringentes farmacológicos, analgésicos externos, polímeros formadores de película, agentes opacificantes, ajustadores del pH, propelentes, agentes reductores, secuestrantes, blanqueantes de la piel y agentes decolorantes, agentes acondicionadores de la piel, agentes suavizantes y/o cicatrizantes de la piel, agentes de tratamiento de la piel y vitaminas y derivados de los mismos.

En cualquier realización de la presente invención, las sustancias activas útiles en el presente documento se pueden clasificar por el beneficio que proporcionan o por su modo de acción postulado. No obstante, debe entenderse que las sustancias activas útiles en el presente documento pueden, en algunos casos, proporcionar más de un beneficio u operar mediante más de un modo de acción. Por tanto, las clasificaciones en el presente documento se realizan por comodidad y no se pretende que limiten la sustancia activa a dicha aplicación o aplicaciones concretas indicadas.

Las composiciones pueden comprender un agente decolorante de la piel. Cuando se usan, las composiciones comprenden, preferentemente, de 0,5 % a 10 %, más preferentemente de 1% a 8% y, óptimamente, de 3 % a 7% en peso de la composición de un agente decolorante de la piel. Agentes decolorantes de la piel adecuados además de la niacinamida ya presente pueden incluir además ácido kójico, arbutina, ácido tranexámico, extracto de palcenta, ácido ascórbico y derivados de los mismos (p. ej., ascorbil fosfato de magnesio, ascorbil fosfato de sodio, ascorbilglucósido y tetraisopalmitatos de ascorbilo). Otras materiales decolorantes de la piel adecuados para usar en el presente documento incluyen Actiwhite® (Cognis), Emblica® (Rona), Azeloglicina (Sinerga) y extractos (p. ej., extracto de mora). La más preferida es la niacinamida, también conocida como vitamina B3.

Una cantidad segura y eficaz de un antioxidante/secuestrante de radicales se puede añadir de cantidades de 0,01% a 10%, más preferentemente de 0,1% a 5% en peso de la composición.

Se pueden usar antioxidantes/secuestrantes de radicales tales como ácido ascórbico (vitamina C) y sus sales, ésteres de ascorbilo de ácidos grasos, derivados de ácido ascórbico (p. ej., fosfato de ascorbilo de magnesio), tocoferol (vitamina E), sorbato de tocoferol, acetato de tocoferol, otros ésteres de tocoferol, ácidos hidroxibenzoicos butilados y sus sales, ácido 6-hidroxi-,5,7,8-tetrametilcroman-2-carboxílico (disponible comercialmente con la marca Rotor®), aminas (p. ej., N,N-dietilhidroxilamina, amino-guanidina), ácido nordihidroguairacético, bioflavonoides, aminoácidos, silimarina, extractos de té y extractos de piel/semilla de uva. Los antioxidantes/secuestrantes de radicales preferidos se seleccionan de ésteres de tocoferol, más preferentemente acetato de tocoferol.

Las composiciones de la presente invención pueden comprender, opcionalmente, un compuesto flavonoide. Los flavonoides se divulgan en los documentos US 5 686 082 and US 5 686 367. Ejemplos de flavonoides particularmente adecuados son flavonas, isoflavonas, coumarinas, cromonas, discoumaroles, cromanones, cromanoles, isómeros (p. ej., isómeros cis/trans) de los mismos y mezclas de los mismos.

Preferidas para usar son flaonas e isoflavonas, en particular daidzeína (7,4'-dihidroxi isoflavona), genisteína (5,7,4'-trihidroxi isoflavona), equol (7,4'-dihidroxi isoflavona), 5,7-dihidroxi-4'-metoxi isoflavona, isoflavonas de soja (una mezcla extraída de la soja) y mezclas de los mismos. Los compuestos flavonoides útiles en el presente documento están disponibles comercialmente en una serie de fuentes, por ejemplo Indofine Chemical Company Inc. Stearoids, Inc. y Aldrich Chemical Company Inc. Los compuestos flavonoides descritos en el presente documento están presentes, preferentemente, de 0,01% a 20%, más preferentemente de 0,1% a 10%, e incluso más preferentemente de 0,5% a 5% en peso.

Los agentes antiinflamatorios útiles en el presente documento incluyen alantoína y compuestos de reglaiz (el género/especie vegetal Glycyrrhiza glabra), incluyendo ácido glicirrético, ácido glicirrónico y derivados de los mismos (p. ej., sales y ésteres).

Las composiciones pueden comprender una sustancia activa de bronceado. Cuando está presente, es preferible que las composiciones comprendan de 0,1 a 20%, más preferentemente de 2% a 7% en peso de la composición. Una sustancia activa de bronceado preferida es dihidroxiacetona.

Las composiciones pueden comprender una sustancia activa antimicrobiana o antifúngica. Dichas sustancias activas son capaces de destruir microbios, prevenir el desarrollo de microbios o prevenir la acción patogénica de los microbios. Una cantidad segura y eficaz de una sustancia activa antimicrobiana o antifúngica se puede añadir a las presentes composiciones, preferentemente de 0,001% a 10%, más preferentemente de 0,01% a 5% e incluso más preferentemente de 0,05% a 2% en peso de la composición.

Ejemplos preferidos de sustancias activas incluyen las seleccionadas del grupo que consiste en ácido salicílico, peróxido de benzoilo, ácido 3-hidroxibenzoico, ácido glicólico, ácido láctico, ácido 4-hidroxibenzoico, ácido acetilsalicílico, ácido 2-hidroxibutanoico, ácido 2-hidroxipentanoico, ácido 2-hidroxihexanoico, ácido cis-retinoico, ácido trans-retinoico, ácido fítico, N-acetil-L-cisteína, ácido lipoico, ácido azelaico, ácido araquidónico, benzoilperóxido, tetraciclina, ibuprofeno, naproxeno, hidrocortisona, acetaminofén, resorcinol, fenoxietanol, fenoxipropanol, fenoxiisopropanol, 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxidifeniléter, 3,4,4'-triclorocarbanilida, octopirox, ciclopírox, lidocaína clorhidrato, dotrimazol, climbazol, miconazol, ketoconazol, neocicina sulfato y mezclas de los mismos.

Las composiciones pueden comprender un agente acondicionador seleccionado del grupo que consiste en humectantes, hidratantes o acondicionadores de piel. Se pueden usar varios de estos materiales y cada uno puede estar presente a un nivel de 0,01% a 40%, más preferentemente de 0,1% a 30%, e incluso más preferentemente de 0,5% a 15% en peso de la composición. Estos materiales incluyen, entre otros, guanidina; urea; ácido glicólico y sales glicolato (p. ej., amonio y alquilamonio cuaternario; ácido láctico y sales lactato (p. ej., amonio y alquilamonio cuaternario)); aloe vera en cualquiera de sus formas (p. ej., aloe vera en gel); compuestos de polihidroxi tales como sorbitol, manitol, glicerol, hexanotriol, butanotriol, propilenglicol y hexilenglicol, polietilenglicoles; azúcares y derivados de almidón (p. ej., glucosa alcoxilada, fructosa, sacarosa, trehalosa); ácido hialurónico; lactamida monoetanolamina; acetamida monoetanolamina; poliéster de sacarosa; vaselina y mezclas de los mismos.

El término "comprende" no pretende limitar a ningún elemento citado posteriormente sino abarcar elementos no especificados de mayor o menor importancia funcional. En otras palabras las listas de etapas, elementos u opciones no necesitan ser exhaustivas. Siempre que se usan las expresiones "que incluye incluido" o "que tiene", con estos

términos se pretende que sean equivalentes a “que comprende” como se definió en lo que antecede.

Los ejemplos siguientes ilustrarán más extensamente las formas de realización de la presente invención. Todas las partes, los porcentajes y las proporciones a las que se hace referencia y en las reivindicaciones adjuntas estén en peso a menos que se ilustre otra cosa.

5 Ejemplos 1-15

Se realizó una serie de experimentos de comparación para evaluar las propiedades de sensación en la piel en una serie de composiciones de cremas hidratantes ultraligeras. Para muchas de las composiciones, la fórmula contenía un agente protector solar; por tanto, también se evaluó la eficacia del agente protector solar (SPF). En la tabla 1 se exponen fórmulas de estas composiciones.

10

Tabla 1

INGREDIENTE	EJEMPLO (% en peso)							
	1	2	3	4	5	6	7	8
Glicerina	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00
Hidróxido potásico (Ensayo 85%)	0,57	0,57	0,57	0,57	0,57	0,57	0,57	0,57
EDTA Disódico	0,04	0,04	0,04	0,04	0,04	0,04	0,04	0,04
Metilparaben	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Ácido esteárico	17,90	17,90	17,90	17,90	17,90	17,90	17,90	17,90
Alcohol cetílico	0,53	0,53	0,53	0,53	0,53	0,53	0,53	0,53
Propilparaben	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10
Miristato de isopropilo	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75
Metoxicinnamato de octilo	1,20	1,20	-	-	-	-	-	-
Dimeticona	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50
Dióxido de titanio micronizado	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Niacinamida	1,25	5,00	1,25	5,00	1,25	5,00	1,25	5,00
Alantoína	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Fenoxietanol	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Ascorbilfosfato sódico	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Sylvadear PA 1200 V TM (1:1 con OMC) ¹	-	-	-	-	2,4	2,4	-	-
Sylvadear PA 1200 V TM Sin OMC)	--	-	-	-	-	-	2,4	2,4
Sylvadear PA 1200 V TM (1:1 con OMC) ²	-	-	-	-	-	-	-	-
Sylvadear PA 1200 V TM (1:1 con OMC) ³	-	-	-	-	-	-	-	-

(continuación)

INGREDIENTE	EJEMPLO (% en peso)							
	1	2	3	4	5	6	7	8
Sylvadear PA 1200 V™ (1:1 con OMC) ⁴	-	-	-	-	-	-	-	-
Nailon 6 (Ganzpearl GPA-550) ⁵	-	-	-	-	-	--	--	-
Nailon 6 (Orgasol Caresse) ⁶	--	-	-	--	-	-	-	-
Nylon-12 Covabead ⁷	--	-	--	--	-	-	-	-
Agua	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto
Valor SPF	3	3	1	1	15	15	1	1
Valor GAP a 103 segundos (mm x 10 ⁴)	301	898	253	506	295	208	290	209

¹ N° de amina = 1,0 y HLB = 20

² N° de amina = 0,4 y HLB = 20

³ N° de amina = 0,3 y HLB = 20

5 ⁴ N° de amina = 0,1 y HLB = 20

⁵ N° de amina = 3,0 y HLB = 16

⁶ N° de amina = 3,0 y HLB = 12

⁷ N° de amina = 2,5 y HLB = 6

Tabla 1 (continuación)

INGREDIENTE	EJEMPLO (% en peso)							
	9	10	11	12	13	14	15	
Glicerina	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00	
Hidróxido potásico (Ensayo 85%)	0,57	0,57	0,57	0,57	0,57	0,57	0,57	
EDTA Disódico	0,04	0,04	0,04	0,04	0,04	0,04	0,04	
Metilparaben	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	
Ácido esteárico	17,90	17,90	17,90	17,90	17,90	17,90	17,90	
Alcohol cetílico	0,53	0,53	0,53	0,53	0,53	0,53	0,53	
Propilparaben	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	
Miristato de isopropilo	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75	
Metoxicinnamato de octilo	-	-	-	-	-	-	-	
Dimeticona	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	

(continuación)

INGREDIENTE	EJEMPLO (% en peso)						
	9	10	11	12	13	14	15
Dióxido de titanio micronizado	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Niacinamida	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00
Alantoína	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Fenoxietanol	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Ascorbilfosfato sódico	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Sylvadear PA 1200 V™ (1:1 con OMC) ¹	-	-	-	-	-	-	-
Sylvadear PA 1200 V™ Sin OMC)	--	-	-	-	-	-	-
Sylvadear PA 1200 V™ (1:1 con OMC) ²	2,4	-	-	-	-	-	-
Sylvadear PA 1200 V™ (1:1 con OMC) ³	-	2,4	-	-	-	-	-
Sylvadear PA 1200 V™ (1:1 con OMC) ⁴	-	-	2,4	-	-	-	-
Nailon 6 (Ganzpearl GPA-550) ⁵	-	-	-	2,4	2,4	--	--
Nailon 6 (Orgasol Caresse) ⁶	--	-	-	--	-	2,4	-
Nylon-12 Covabead ⁷	--	-	--	--	-	-	2,4
Agua	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto
Valor SPF	15	15	15	1	1	1	1
Valor GAP a 103 segundos (mm x 10 ⁴)	231	337	401	199	201	376	526

¹ N° de amina = 1,0 y HLB = 20² N° de amina = 0,4 y HLB = 20³ N° de amina = 0,3 y HLB = 20⁴ N° de amina = 0,1 y HLB = 20⁵ N° de amina = 3,0 y HLB = 16⁶ N° de amina = 3,0 y HLB = 12⁷ N° de amina = 2,5 y HLB = 6**Ensayo de las propiedades de sensación en la piel**

10 En el presente documento se usó un procedimiento de "flujo al apretar con fuerza constante" para estudiar la

facilidad con la que se exprime una loción/crema durante la aplicación sobre la piel. Cuanto mayor es el valor Gap (espesor de la muestra), más difícil es exprimir la muestra. El valor Gap se correlaciona con las propiedades de sensación en la piel tal como las experimenta un consumidor al aplicar la muestra de la loción/crema en la piel. Los valores Gap deben estar entre los límites de tolerancia de 175 a 350. Dentro del intervalo de tolerancia, cuando menor es el valor GAP mejor es la sensación en la piel.

El procedimiento se realiza usando un reómetro a Paar Physica MCR 300. Las muestras se comprimen entre platos paralelos concéntricos (diámetro de 25 mm para el plato superior) y el valor del hueco inicial (distancia vertical entre los dos platos) de 1 mm. Las mediciones se realizan exprimiendo las muestras con una fuerza constante de 12 Newton en condiciones ambientales (23 – 24 °C). La dependencia del tiempo del espesor de la muestra (valor GAP) se mide en el tiempo y, en particular, el valor Gap registrado a 103 segundos ($\text{mm} \times 10^4$).

Partículas compuestas Sylvaclear

Las partículas compuestas que contenían el agente protector solar octilmetoxicinnamato (OMC) se formularon para alcanzar un nivel de protección solar de 1,2% en peso en la composición global. Estas partículas se fabricaron del siguiente modo para usar en los ejemplos. En el presente documento se describe un procedimiento típico para fabricar partículas compuestas de la presente invención. Agua, en una cantidad de 750 g, se carga en un vaso equipado con un batidor Escolabor™ (modelo de 1 litro fabricado en Riehn, Suiza) que tiene cuchillas de superficie para raspado (raspador). Después, el agua se calienta hasta 60 °C. Un vaso de precipitados se carga con 125 g de Sylvaclear PA1200V™ y 125 g de Parsol MCX® (2-etilhexil-p-metoxi cinnamato denominado "OMC"). El vaso de precipitados se introduce en un baño de agua. La mezcla de resina se calienta hasta 85 - 90 °C y se mezcla hasta que esté homogénea. La resina del vaso de precipitados se añade después lentamente al vaso de agua calentada con mezclado lento (20% de potencia en el raspador) seguido de un periodo de enfriamiento. Tras alcanzar los 36°C, se añade una mezcla conservante que incluye 2,5 g de Glydant Plus®, 4 g de fenoxietanol, 2 g de metil paraben y 2 g de propilparaben. Después, la combinación se mezcla y se enfría. Las partículas compuestas de resina/factor protector/conservante se separa (mediante centrifuga) como partículas de la fase acuosa.

Resultados

Los ejemplos 1 y 2 difieren únicamente en la cantidad de niacinamida presente. A medida que el nivel de niacinamida va de 1,25% hasta 5%, existe un incremento brusco del valor GAP de 301 a 898. Esto indica que la niacinamida y el ácido esteárico interaccionan de forma adversa para formar una composición estéticamente desagradable relativamente dura. El mismo principio se demuestra para los ejemplos 3 y 4. El valor GAP aumenta significativamente a medida que el contenido de niacinamida pasa de 1,25% a 5%. Estas muestras, al contrario que los ejemplos 1 y 2, no contienen ningún agente protector solar.

Los ejemplos 5 y 6 se formulan de un modo similar a los Ejemplos 1 y 2, a excepción de la incorporación de 2.4% de las partículas de poliamida compuesta (Sylvaclear PA 1200V™). Los valores GAP de 295 y 208, respectivamente revelan mejora de la reología subyacente para proporcionar una sensación en la piel más estética.

Los ejemplos 7 y 8 demuestran un efecto similar en el uso de las partículas de poliamida para disminuir los valores GAP. Los ejemplos 7 y 8 están desprovistos totalmente de cualquier agente protector solar, interna o externamente en las partículas.

Los ejemplos 9 y 10 evalúan el efecto del número de amina. La poliamida Sylvaclear™ que comprende las partículas compuestas tiene los respectivos números de amina de 0,4 y 0,3. El valor GAP se eleva de 231 a 337 a medida que el número de amina cambia de 0,4 a 0,3.

El ejemplo 11 ilustra el efecto de una poliamida que tiene el número de amina de 0,1. De nuevo, el valor GAP (401) ha aumentado más hasta una sensación en la piel todavía más estéticamente no deseable.

El ejemplo 12 revela el efecto del uso de una poliamida con un número de amina de 3,0. El valor GAP es 199 relativamente bajo. La secuencia de fórmulas con diferentes números de amina demuestran que se obtienen mejores resultados con poliamidas que tienen valores de amina de al menos 0,3 y superiores.

Los ejemplos 13 y 14 usan poliamidas que tienen números de amina idénticos de 3,0. No obstante, los respectivos valores de HLB son 16 y 12. Se observa que el ejemplo 14 con poliamida siendo el HLB 6 proporciona un valor de GAP significativamente mayor que aquella con HLB de 16. El mal rendimiento en sensación en la piel se confirma en el ejemplo 15. En este, la poliamida tenía un número de amina de 2,5 y un HLB de 6. El valor GAP fue un valor de 526 inaceptablemente grande.

En base a los resultados anteriores, parece que las partículas de poliamida pueden tener un efecto importante sobre la regulación de las propiedades reológicas de las composiciones de niacinamida espesadas con estructurantes de ácido carboxílico/sal. Además, la poliamida tiene que tener un número de amina de al menos 0,3 y un valor de HLB de al menos 16.

REIVINDICACIONES

1. Una composición cosmética que comprende:
- (i) de 0,5 a 10 % en peso de niacinamida;
 - (ii) de 0,1 a 30% en peso de un estructurante seleccionado del grupo que consiste en ácido graso de C₁₂-C₂₀ o una sal del mismo, un polímero con varias unidades monoméricas de ácido carboxílico o sales del mismo, y mezclas de las mismas; y
 - (iii) de 0,1 a 20% en peso de partículas que comprenden una poliamida polimerizada de condensación, teniendo la poliamida un valor de amina no inferior a 0,3 y un valor de HLB de 16 o mayor.
- en la que un agente protector solar se solubiliza o se dispersa de forma uniforme dentro de la poliamida polimerizada de condensación para formar partículas compuestas.
2. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1, en la que las partículas tienen un tamaño medio de partícula que varía de 10 a 2.000 nm.
3. Una composición de acuerdo con la reivindicación 2, en la que las partículas tienen un tamaño medio de partícula que varía de 100 a 1.500 nm.
4. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que la poliamida es polialquilenoxipoliamida.
5. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en la que la poliamida es un poli(ésteramida) terminada en éster.
6. Una composición cosmética de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que la niacinamida está presente en una cantidad de 1 a 8 % en peso de la composición.
7. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6, en la que la niacinamida está presente en una cantidad de 3 a 7% en peso de la composición.
8. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que el valor de amina varía de 0,3 a 6.