

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 540 577**

51 Int. Cl.:

A61K 8/97	(2006.01)	A61Q 19/08	(2006.01)
A61K 8/99	(2006.01)		
A61K 8/11	(2006.01)		
A61K 31/07	(2006.01)		
A61K 8/14	(2006.01)		
A61K 8/41	(2006.01)		
A61K 8/55	(2006.01)		
A61K 8/67	(2006.01)		
A61K 8/73	(2006.01)		
A61Q 19/00	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **13.07.2012 E 12745428 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **25.03.2015 EP 2731579**

54 Título: **Cosmético con síntesis de colágeno I mejorada**

30 Prioridad:

14.07.2011 EP 11173985

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

10.07.2015

73 Titular/es:

**COTY GERMANY GMBH (100.0%)
Rheinstrasse 4E
55116 Mainz, DE**

72 Inventor/es:

**DOUCET, OLIVIER;
BERNINI, DOROTHÉE;
ROBERT, CÉCILE y
PUJOS, MURIEL**

74 Agente/Representante:

ESPIELL VOLART, Eduardo María

ES 2 540 577 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**COSMÉTICO CON SÍNTESIS DE COLÁGENO I MEJORADA**

- 5 La invención se refiere a un cosmético que comprende dos sistemas diferentes para la obtención de compuestos activos en la piel humana y la mejora de la síntesis de colágeno I.
La patente EP 2.113.241 A1 describe un producto cosmético con ciertos sistemas de transporte con compuestos activos que comprenden ciclodextrina, microcápsulas de quitosano/carboximetil celulosa, sistemas lamelares y liposomas de proteína de soja y que muestran una liberación retardada del retinol.
- 10 La patente DE 10 210 030 001 A1 se refiere a una composición cosmética para teñir el cabello y el uso de un sistema de transporte de compuestos de amonio cuaternario cargados positivamente de sales de triamonio C₁₈-C₂₈ para tintes directos.
El objetivo de la presente invención es mejorar la síntesis de colágeno I en la piel humana. Un objeto adicional es la mejora de la síntesis de colágeno I mediante pequeñas cantidades de compuestos activos.
- 15 La invención se consigue mediante un cosmético con una síntesis de colágeno I mejorada que comprende del 0,001 al 2 % en peso, preferiblemente del 0,01 al 1 % en peso, más preferiblemente del 0,1 a 0,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un primer sistema que contiene retinol que comprende retinol encapsulado en una cápsula de quitosano y carboximetil celulosa (CMC), del 0,001 al 3,5 % en peso, preferiblemente del 0,3 al 2,5 % en peso, más preferentemente del 1,5 a 2,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un segundo sistema que contiene
- 20 retinol que comprende liposomas catiónicos compuestos de fosfolípidos y una monoamina de ácido graso cuaternario con un resto alquilo C₂₁-C₂₃ y la diferencia hasta el 100 % en peso de adyuvantes cosméticos.
La solicitante ha comprobado que ya cantidades muy pequeñas de retinol en combinación con los dos sistemas de transporte muestran un efecto notable sobre la síntesis de colágeno I en comparación con una o más combinaciones conocidas distintas de derivados de retinol o sistemas encapsulados. Por ejemplo, en una concentración del 0,5 al 15 × 10⁻⁵ % de retinol puro equivalente, la síntesis de colágeno I se mejoró de 10 veces aproximadamente a 15 veces aproximadamente. Las razones de esta mejora no están completamente claras pero parece que desempeña un papel importante una influencia mutua no previsible de los dos sistemas de transporte en particular seleccionados.
- 25 En el primer sistema que contiene retinol de acuerdo con la invención el retinol se encuentra encapsulado en una cápsula de quitosano/carboximetil celulosa y el contenido de retinol preferiblemente se encuentra en el intervalo del 0,1 al 2,0 % en peso, más preferentemente del 0,1 al 1,5 % en peso, con respecto al peso total del sistema de transporte.
Un producto ventajoso que se puede usar es Retinol-Primasphere[®] L2 de Cognis, Alemania (INCI: Aqua (y) Soja de Glicina (y) Retinol (y) Polímero reticulado de acrilatos/ acrilato de alquilo C₁₀₋₃₀ (y) Quitosano (y) Goma de celulosa (y) Ácido glicólico (y) Polisorbato 20 (y) Oleato de sorbitán (y) Fenoxietanol (y) Metilparabeno (y) Etilparabeno (y) Butilparabeno (e) Isobutilparabeno (y) Propilparabeno (y) BHT). El contenido de retinol en el Retinol-Primasphere[®] L2 es
- 30 del 1,1 al 1,3 % en peso, con respecto al peso total de Retinol-Primasphere[®] L2.
En el segundo sistema que contiene retinol de la invención, el retinol está contenido en liposomas que se forman mediante fosfolípidos, preferiblemente mediante lecitina. Los liposomas adicionalmente poseen vehículos de carga positiva de fórmula general R-N(R₁R₂R₃)⁺, en la que R₁, R₂ y R₃ son independientemente entre sí metilo o etilo, preferiblemente metilo, y R representa un alquilo C₂₁-C₂₃, preferentemente CH₃(CH₂)₂₁-. Los contra-iones preferiblemente son iones cloruro. El contenido de retinol del segundo sistema que contiene retinol está preferiblemente
- 40 en el intervalo del 0,1 al 3 % en peso, más preferiblemente del 1,0 al 3,0 % en peso.
En una realización particularmente preferida de la invención los liposomas catiónicos comprenden cloruro de docosiltrimetilamonio como vehículo de carga.
Los liposomas catiónicos se preparan disolviendo la sal de la amina cuaternaria en una solución alcohólica del fosfolípido y añadiendo el retinol a esta solución. A continuación, la solución resultante se añade a una fase acuosa y el valor de pH de la emulsión resultante se ajusta de 6 a 7 mediante la adición de una base. La denominación INCI de este producto es Agua (y) Alcohol (y) Lecitina (y) Retinol (y) Polisorbato 20 (y) Cloruro de Behentrimonio (y) Fosfato de Potasio (y) Alcohol isopropílico. Estos liposomas contienen del 1,5 al 2,2 % en peso de retinol y del 1 al 5 % en peso de cloruro de docosiltrimetilamonio, con respecto al peso total de los liposomas catiónicos.
- 45 Se ha comprobado que contenidos de retinol preferidos en el intervalo del 0,000114 al 0,0095 % en peso, con respecto al peso total del cosmético y contenidos en el sistema de transporte combinado de la invención ya presentan efectos notables sobre la síntesis de colágeno I.
Los adyuvantes cosméticos que puede comprender el cosmético de la invención son, por ejemplo, captadores de radicales, agentes emulsionantes, agentes de gelificación, agentes de formación de película, protectores solares,
- 55 estabilizantes, potenciadores para el factor de protección solar (FPS), sustancias humectantes, colorantes, pigmentos, perfumes, agentes acondicionadores, agentes quelantes, reguladores del valor de pH, agentes antiinflamatorios activos naturales, humectantes, agentes reparadores del ADN, etc.
En una realización preferida de la invención, el cosmético comprende captadores de radicales, filtros UV, agentes emulsionantes, sustancias hidratantes, formadores de geles, potenciadores del FPS, emolientes, aceites de silicona,
- 60 estabilizantes de emulsiones, reguladores del pH, conservantes, agentes de reparación del ADN y/o pigmentos.

Adyuvantes cosméticos adicionales que se pueden usar en el cosmético de la invención incluyen, por ejemplo, agua, vitaminas, enzimas, extractos de plantas, polímeros, fosfolípidos, pantenol, alantoína, éteres y ésteres sintéticos, ácidos grasos, alcoholes monovalentes y multivalentes, siliconas, minerales, aceites, en particular aceites de plantas, ceras, extractos biotecnológicos. Los extractos biotecnológicos son, por ejemplo, el complejo reparador PF CLR o el complejo de levadura B (ambos de CLR, Lab. Quím. del Dr. Kurt Richter GmbH, Berlín, Alemania).

Los adyuvantes particularmente preferidos que pueden estar comprendidos en el cosmético de la invención son agua, extractos de plantas y sus mezclas, polímeros sintéticos, ésteres, éteres, ácidos grasos, alcoholes monovalentes y multivalentes, siliconas, silicatos, pigmentos tales como TiO₂, cuarzo y mica (nombre comercial: Timiron splendid copper) y/o ácido hialurónico y sus sales.

Un cosmético de la invención puede contener ventajosamente captadores de radicales tales como ácido fólico y sus derivados, ubiquinona tales como ubiquinona-10; flavonas o flavonoides; además de aminoácidos, tales como histidina, tirosina, triptofano, y sus derivados; imidazoles tales como ácido cis- o trans-urocanínico y sus derivados; péptidos tales como D,L-carnosina, D-carnosina, L-carnosina y sus derivados; ácido hialurónico; licopeno; ácido úrico y sus derivados; α-hidroxiácidos tales como ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico; α-hidroxiácidos grasos tales como ácido palmítico, ácido fitico, lactoferrina; manosa y sus derivados; ácido lipónico y sus derivados tales como el ácido dihidrolipónico; ácido ferúlico y sus derivados; tioles tales como glutatión, cisteína y cistina.

Se prefiere en particular la adición de la sal sódica del ácido hialurónico.

El término "captadores de radicales" significa para la presente invención aquellas sustancias que sean capaces de capturar radicales libres tales como el radical aniónico superóxido (O₂⁻), peróxido de hidrógeno (H₂O₂), el radical hidroxilo (OH^{*}), oxígeno singlete (¹O₂), radicales lipídicos centrados en el carbono (*CH-R) o radicales L*, etc.

Para la presente invención todos los captadores de radicales comprenden una mezcla especial de extractos de plantas de extractos de plantas liposómicos encapsulados del 1-4 % de extracto de hoja de Camellia Sinensis, el 1-4 % de extracto de semilla de café verde, el 1-4 % de extracto de semilla de Pongamia Pinnata, el 1-4 % de extracto de raíz de Angelica Archangelica, el 1-4-% de extracto de cáscara de Citrus Aurantium, el 2-10 % de fosfolípidos en una suspensión acuosa-alcohólica en la que el contenido de alcohol se encuentra en el intervalo del 4-12 %, en la que todas las concentraciones están referidas al peso de la mezcla captadora de radicales. Los extractos se preparan mediante extracción con un alcohol monovalente o multivalente o una mezcla de dicho(s) alcohol(es) con agua a temperatura ambiente (aproximadamente de 15 a 30 °C). Esta mezcla además puede comprender una mezcla de vitaminas E y C y sus derivados. Una mezcla de vitamina preferida en particular es PEG-8 y tocoferol y palmitato de ascorbilo y ácido cítrico y ácido ascórbico (marca comercial Oxynex K).

La proporción de dicha mezcla captadora de radicales en el cosmético de la invención se encuentra entre el 0,05 y el 2,0 % en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente entre el 0,1 y el 0,5 % en peso.

Adyuvantes preferidos adicionales que pueden estar comprendidos en el cosmético de la invención son harina de soja hidrolizada (marca comercial: Raffermine 2); una mezcla de castaño de indias y cafeína; hialuronato sódico; extracto de Euglena Gracilis; y fermento lisado de Bífida (marca comercial Complejo reparador PF CLR).

El contenido de dichos adyuvantes usualmente se encuentra en el intervalo del 0,09-0,2 % en peso para cada uno de ellos.

El cosmético de la invención se puede formular en forma de productos cosméticos diferentes al incluir los ingredientes correspondientes comunes para dichos productos tales como, por ejemplo, lociones, aceites, cremas, cremas de día, cremas de noche, productos de cuidado de día con protección UV, geles, máscaras, bálsamos, polvos, realce de ojos, cremas para los ojos, brillos bronceadores, cremas tintadas, cargas, máscaras de tejido, productos para antes de tomar el sol, productos solares, productos para después de tomar el sol, auto-bronceadores, maquillajes, polvos compactos, productos fotoprotectores, aerosoles, desmaquillantes, limpiadores, productos objetivo, bases, colorete, productos de baño, tales como geles o sales de ducha y baño, barras de labios, barras desodorantes.

La combinación preferida en particular de cafeína y extracto de castaño de indias (INCI: Glicerina y Agua y Extracto de semilla Aesculus Hippocastanum; marca comercial: Phytami Marron D'Inde) está dirigida a cremas para los ojos para estimular la microcirculación con el fin de actuar sobre las ojeras y la hinchazón.

El ingrediente del extracto de Euglena gracilis preferido en particular del alga Euglena gracilis es estimado para las cremas de noche de la invención para potenciar la síntesis de ATP en las células durante la noche y estimular la regeneración celular.

Los productos de emulsión incluyen emulsiones múltiples, microemulsiones y nanoemulsiones en forma de emulsiones de W/O, O/W, W/Si, Si/W, W/O/W, O/W/O, O/W/Si y W/Si/W (O = Aceite, W = Agua, Si = Silicona). También se incluyen otros productos tales como sistemas anhidros como Si/O.

Los productos para antes de tomar el sol son, por ejemplo, geles para antes de tomar el sol, lociones para antes de tomar el sol, cremas para antes de tomar el sol o aceites para antes de tomar el sol. Los productos solares son geles, cremas, lociones, aceites, aerosoles o productos protectores diarios para el cuidado de la piel con diferentes Factores de protección solar (FPS) en el intervalo de FPS 2 a FPS 50, por ejemplo, FPS 6, FPS 10, FPS 15, FPS 20, FPS 25, FPS 30, FPS 50 y FPS 50+. Los diferentes FPS dependen del tipo y cantidad de sustancias de filtración UV.

Los agentes formadores de gel cosméticos adecuados para la preparación de un gel son, por ejemplo, carbómero, goma de xantano, carragenina, goma arábiga, goma de guar, agar-agar, alginatos y tilosas, silicatos de magnesio y aluminio, carboximetil celulosa, hidroxietil celulosa, celulosa cuaternizada, guar cuaternizado, ciertos poliácridatos, tales como polímero reticulado de acrilatos/acrilato de alquilo C₁₀₋₃₀, alcohol polivinílico, polivinilpirrolidona.

De acuerdo con la invención son particularmente preferidos la goma de xantano, carbómero, acriloidimetiltaurato de

amonio/Copolímero VP de acriloldimetiltaurato de amonio/acrilatos de polímero reticulado de metacrilato de beheneth-25/copolímero de metacrilato de alquilo C₁₂₋₂₂, silicato de magnesio y aluminio, acrilato sódico/copolímero de acriloldimetiltaurato sódico, acrilato de hidroxietilo/copolímero de acriloldimetiltaurato sódico, poliéster-5 y polímero reticulado de acrilatos/neodecanoato de vinilo, poliacrilato o poliacrilamida de sodio/Isoparafina C₁₃₋₁₄/Laureth 7/Estireno/Copolímero de acrilato y Lauril sulfato sódico o sus mezclas.

Para la preparación de los productos solares además es ventajoso incluir en un producto cosmético de la invención filtros UVA o UVB solubles en agua y/o aceites correspondientes o ambos, junto con los sistemas de transporte de la invención. Los filtros UVB solubles en aceite ventajosos incluyen derivados del ácido 4-aminobenzoico tales como, por ejemplo, éster de (2-etilhexilo) del ácido 4- (dimetilamino)benzoico; ésteres del ácido cinámico tales como, por ejemplo, éster de (2-etilhexilo) del ácido 4-metoxi cinámico, derivados de benzofenona, tales como por ejemplo, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona o sus mezclas.

Los filtros UV solubles en aceite preferidos son metoxibenzoilmetano de butilo, metoxicinamato de etilhexilo, salicilato de etilhexilo, y/o bis-etil hexil fenol metoxifenil triazina.

Los filtros UVB solubles en agua son, por ejemplo, derivados del ácido sulfónico de benzofenona o de 3-bencilidenalcanfor o sales, tales como sales de Na o K, del ácido 2-fenil bencimidazol-5-sulfónico.

Los filtros UVA que se pueden usar en el cosmético de la presente invención incluyen derivados de dibenzoilmetano, tales como metoxibenzoilmetano de butilo.

En particular se prefieren metoxibenzoilmetano de butilo, metoxicinamato de etilhexilo, salicilato de etilhexilo, octocrieno, metoxicinamato de etilhexilo, p-metoxicinamato de isoamilo, etilhexiltriazona, dietilhexil butamido triazona, metilen-bis-benzotriazolil tetrametilbutilfenol, fenil dibenzimidazol tetrasulfonato de disodio, bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina y/o benzofenona-3. Los pigmentos inorgánicos como filtros de protección solar son óxidos metálicos tales como TiO₂, SiO₂, Fe₂O₃, ZrO₂, MnO, Al₂O₃, los cuales pueden ser también usados en mezclas.

El cosmético de la invención también puede comprender agentes de bronceado. Dichos agentes de bronceado son, por ejemplo, isatina, aldehído de glicerina, aldehído del ácido meso-tartárico, glutaraldehído, eritrola, derivados de pirazolin-4,5-diona, dihidroxiacetona (DHA) y/o derivados de 4,4-dihidroxi pirazolin-5-diona.

El cosmético de la invención también puede comprender humectantes tales como por ejemplo, glicerina, butilenglicol, propilenglicol o sus mezclas.

El cosmético de la invención también puede comprender hidratantes, agentes reafirmantes o para cerrar los poros, la mayoría procedentes de plantas y algas, por ejemplo, agua de hamamelis, extracto de Pisum sativum (guisante).

Otros ingredientes que puede comprender el cosmético de la presente invención son aceites, emulsionantes, ésteres y pigmentos.

Los aceites usados para la invención pueden ser usuales aceites cosméticos, tales como por ejemplo, aceite mineral, poliisobuteno hidrogenado, escualeno procedente de fuentes sintéticas o naturales, aceites vegetales saturados o insaturados, o mezclas de dos o más de los mismos.

Especialmente aceites adecuados son, por ejemplo, aceites de silicona, aceites minerales, poliisobuteno hidrogenado, poliisopreno, escualeno, trideciltrimelitato, triisosteato de trimetilpropano, isodecilcitrato, diheptanoato de neopentilglicol, éter estearílico de PPG-15, aceite de caléndula, aceite de jojoba, aceite de aguacate, aceite de nuez de macadamia, aceite de ricino, manteca de cacao, aceite de Inca inchi, aceite de coco, aceite de maíz, aceite de semilla de algodón, aceite de oliva, aceite de almendra de palma, aceite de colza, aceite de semilla de cártamo, aceite de semilla de sésamo, aceite de soja, aceite de semilla de girasol, aceite de germen de trigo, aceite de semilla de uva, aceite de nuez de kukui, aceite Cameline, aceite de Buriti, aceite de caléndula, aceite de cardo o sus mezclas.

Dependiendo de los aceites seleccionados, se pueden ver afectadas las propiedades cosméticas de un cosmético sólido de la invención, tales como la suavidad, la dureza o los efectos de propagación.

Los ésteres usados en el cosmético de la presente invención pueden ser ésteres de polioles. Los ésteres de polioles adecuados son ésteres de ácidos grasos C₁₀-C₁₅ y alcoholes, ésteres de ácidos grasos C₁₀-C₁₅ y glicoles, o ésteres de ácidos grasos hidroxilados. Los ésteres de alquilo C₁₂-C₁₅ ramificados junto con otros ésteres tales como di- o tri-ésteres de polioles son particularmente ventajosos en la fase oleosa, siendo particularmente favorables los ésteres de alcoholes de ácidos de cadena lineal y ramificada. Todos estos ésteres adecuados son derivados de alcoholes primarios. Los ésteres preferidos son carbonato de dicaprililo, cocoato de decilo, sebacato de diisopropilo, adipato de dibutilo y palmitato de isopropilo.

De acuerdo con la invención, las sustancias adecuadas para la fase oleosa incluyen isohexadecano, PEG-40-estearato, triestearato de sorbitán, alcohol behenílico, diheptanoato de neopentilglicol, dicaprilato de propilenglicol, adipato de dioctilo, cococaprilato/caprato, adipato de dietilhexilo, dilinoleato de diisopropilo dimérico, dilinoleato de diisosteato dimérico, isohexadecano, manteca de Butyrospermum parkii (karité), lactato de alquilo C₁₂₋₁₃, tartrato de di-alquilo C₁₂₋₁₃, citrato de tri-alquilo C₁₂₋₁₃, lactato de alquilo C₁₂₋₁₅, dioctanoato de PPG, dioctanoato de dietilenglicol, aceite de hierba de la pradera, aceite de babasú, aceite de jojoba, aceite de arroz, oleato de alquilo C₁₂₋₁₅, aceite de aguacate, neopentanoato de tridecilo, cera de abejas, alcohol cetearílico y Polisorbato 60, triglicéridos C₁₈₋₂₆, alcohol cetearílico y glucósido cetearílico, lanolina acetilada, copolímero de VP/eicoseno, hidroxiestearato de glicerilo, éster glicólico de ácido C₁₈₋₃₆, con sustancias tales como triglicéridos C₁₈₋₃₆, triglicérido caprílico/cáprico, hidroxiestearato de glicerilo y sus mezclas. También son adecuados y preferidos el alcohol cetílico y estearato de glicerilo y estearato de PEG 75 y Ceteth-20 y Steareth-20, lauril glucósido y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2, beheneth-25, poliamida-3 e hidroxicinamato de pentaeritritil tetra-di-t-butilo, poliamida-4, estearato de PEG-100, cetilfosfato de potasio, ácido esteárico, hectoritas, poliisobuteno hidrogenado, alcohol behenílico, carbonato de dicaprililo o mezclas de dos o más de

los mismos.

Los adyuvantes preferidos en particular en el cosmético de la presente invención son aceites y ésteres, éteres, ceras o alcoholes sintéticos tales como por ejemplo, aceites vegetales, dimeticona, manteca de karité, diisosteato de poliglicerilo-3, carbonato de dicaprililo, beheneth-10, poliisobuteno hidrogenado, cera de Candelilla, aceite mineral, vaselina, alcohol cetílico, estearato de PEG-100/estearato de glicerilo, estearil dimeticona, benzoato de alquilo C₁₂₋₁₅, triglicérido caprílico/cáprico y/o polideceno hidrogenado.

Las siliconas preferidas del cosmético de la presente invención son polímero reticulado de ciclopentasiloxano/dimeticona, dimeticona y ciclopentasiloxano y dimeticonol.

Los agentes formadores de película preferidos son, por ejemplo polímero reticulado de metacrilato de metilo, copolímero de acrilatos/acrilamida, polímero reticulado de acrilatos/VA, PVP, PVP butilado, quitosano, Poliquaternium-13 a -42, etc.

El cosmético según la invención puede preferiblemente existir como emulsión de O/W o W/O así como en emulsión de tipo múltiple, micro- o nano-emulsiones mencionadas anteriormente. Los emulsionantes adecuadas para emulsiones de O/W son, por ejemplo, productos de adición de 2-30 moles de óxido de etileno a alcoholes grasos lineales C₈-C₂₂, a ácidos grasos C₁₂-C₂₂ y a alquilfenoles C₈-C₁₅; monoésteres y diésteres de ácidos grasos C₁₂-C₂₂ de productos de adición de 1-30 moles de óxido de etileno a glicerina; monoésteres y diésteres de glicerina así como monoéster y diéster de sorbitán de ácidos grasos C₆-C₂₂, éster de poli-ol- y poliglicerina; productos de adición de óxido de etileno a aceite de ricino; así como agentes tensioactivos anfólicos.

Los emulsionantes adecuados para emulsiones de W/O son por ejemplo productos de adición de 2-15 moles de óxido de etileno a aceite de ricino, ésteres de ácidos grasos C₁₂-C₂₂ y glicerina, poliglicerina, glicoles, pentaeritrol, alcoholes de azúcar (por ejemplo, sorbitol), poliglucósidos (por ejemplo, celulosa), polialquilenglicoles, alcoholes de lana, copolímeros de poliéter polialquil polisiloxano.

Los emulsionantes adecuados para emulsiones múltiples y micro emulsiones son, por ejemplo, ésteres de PEG-20 tribehenina, polímero reticulado de PEG-12 dimeticona, lauril PEG/PPG-18/18 meticona, PEG-PPG-19/19 dimeticona incluyendo ciclopentasiloxano, dioleato de poliglicerilo-6 y glicéridos PEG-8 caprílicos/cápricos.

El cosmético de la invención también puede comprender pigmentos, mezclas de pigmentos o polvos con un efecto similar a un pigmento, incluyendo también aquellos con un efecto de brillo perlado. Pueden incluir, por ejemplo, óxidos de hierro, silicatos de aluminio tales como ocre, dióxido de titanio, caolín, arcillas que contienen manganeso, dióxido de silicio, cuarzo, óxido de cinc, carbonato de calcio, tiza francesa, cuentas de nailon, cuentas de cerámica, mica, polvos poliméricos sintéticos expandidos y no expandidos, compuestos pulverulentos orgánicos naturales tales como algas sólidas molidas, partes de plantas molidas, almidones de cereales encapsulados y no encapsulados.

Otros adyuvantes cosméticos que puede comprender el cosmético de la invención son ceras. Las ceras se pueden seleccionar entre ceras de plantas naturales, ceras animales, ceras minerales naturales y sintéticas y ceras sintéticas. El cosmético puede incluir cera de carnauba, cera de candelilla, ozoquerita, cera de abejas, cera de lignito, cera de lana, cerasina, micro ceras, ceras de parafina, vaselina, cera de silicio, ceras de polietilenglicol o ceras de polietilén glicoléster o sus mezclas.

En un ensayo en uso con voluntarios de piel sensible y con especial sensibilidad a los productos de retinol, se sometió a ensayo una fórmula de crema de día con muy buenos resultados:

Textura: apreciado por el 91 %, sin efecto pegajoso, penetración rápida en la piel 91 %.

Es confortable para la piel: 91 % de valoraciones favorables; la piel se siente protegida y nutrida, confort inmediato.

Piel flexible: 100 % de valoraciones favorables; tiempo de uso muy agradable con acabado suave. Suavidad de la piel: 96 % de valoraciones favorables; tacto aterciopelado.

Un objetivo adicional de la presente invención es el uso de una composición para la preparación de un cosmético que mejora la síntesis de colágeno I en la piel humana, cuya composición comprende

del 0,001 al 2 % en peso, preferiblemente del 0,01 al 1 % en peso, más preferido del 0,1 al 0,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un primer sistema que contiene retinol que comprende retinol encapsulado en una cápsula de quitosano y carboximetil celulosa,

del 0,001 al 3,5 % en peso, preferiblemente del 0,3 al 2,5 % en peso, más preferido del 1,5 al 2,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un segundo sistema que contiene retinol que comprende liposomas catiónicos compuestos por fosfolípidos y una monoamina de un ácido graso cuaternario con un resto alquilo C₂₁-C₂₃.

Un objeto adicional de la presente invención es un cosmético para su uso en la mejora de la síntesis de colágeno I en la piel humana, cuyo cosmético comprende

del 0,001 al 2 % en peso, preferiblemente del 0,01 al 1 % en peso, más preferido del 0,1 al 0,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un primer sistema que contiene retinol que comprende retinol encapsulado en una cápsula de quitosano y carboximetil celulosa,

del 0,001 al 3,5 % en peso, preferentemente del 0,3 al 2,5 % en peso, más preferentemente del 1,5 al 2,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un segundo sistema que contiene retinol que comprende liposomas catiónicos compuestos por fosfolípidos y una monoamina de un ácido graso cuaternario con un resto alquilo C₂₁-C₂₃ y la diferencia hasta el 100 % en peso de adyuvantes cosméticos.

La invención se describirá ahora en detalle para la composición cosmética de la invención por medio de ejemplos. Todas las cifras proporcionadas como porcentajes son en % en peso si no se especifica lo contrario.

Los dibujos adjuntos muestran en

la Fig. 1 la estimulación de colágeno I en porcentaje de acuerdo con el ensayo de transferencia de Western Blot.

ES 2 540 577 T3

En los siguientes ejemplos se utilizan básicamente las denominaciones INCI de los ingredientes.

Ejemplos 1-3: Crema de día anti-edad

	Ejemplo 1	Ejemplo 2	Ejemplo 3
Fase I			
Agua	c.s.p. 100	c.s.p. 100	c.s.p. 100
Mica, sílice, TiO ₂	0,40	0,40	0,40
Glicerina	3,00	3,00	3,00
Butilenglicol	3,00	3,00	3,00
Goma de xantano	0,10	0,10	0,10
Copolímero de acriloldimetiltaurato de amonio/VP	0,30	0,30	0,30
Copolímero reticulado de metacrilato de metilo	2,00	2,00	2,00
Conservante	0,25	0,25	0,25
Fase II			
Carbonato de dicaprilo	4,00	4,00	4,00
Alcohol behenílico	1,00	1,00	1,00
Beheneth-10	3,00	3,00	3,00
Diisoestearato de Poliglicerilo-3	0,35	0,35	0,35
Poliisobuteno hidrogenado	3,50	3,50	3,50
Manteca de karité	3,80	3,80	3,80
Aceite vegetal y aceite vegetal hidrogenado y cera de candelilla	0,80	0,80	0,80
Fase III			
Dimeticona	3,50	3,50	3,50
Copolímero reticulado de ciclopentasiloxano y dimeticona	1,80	1,80	1,80
Ciclopentasiloxano y dimeticonol	4,00	4,00	4,00
Fase IV			
Microcápsulas de retinol 1 a base de quitosano y CMC (Retinol-Primasphere L2)	0,70	0,35	0,166
Liposomas de retinol 2 a base de compuesto de amonio cuaternario	2,12	2,33	0,375
Complejo RPF*	0,20	0,20	0,20
Harina de soja hidrolizada, Agua y Cuarzo y potasio	0,10	0,10	0,10
Sorbato y ácido sórbico y ácido fosfórico	0,10	0,10	0,10
Conservantes	1,10	1,10	1,10
Fragancia	0,30	0,30	0,30
Poliacrilamida y Agua e Isoparafina C ₁₃₋₁₄ y Laureth 7	0,95	0,95	0,95

5 * Complejo RPF:

Extracto de semilla de café verde (2 %), extracto de hoja de Camellia Sinensis (2 %), extracto de semilla de Pongamia Pinnata (2 %), extracto de la raíz de Angelica Archangelica (2 %), extracto de cáscara de Citrus Aurantium (1 %), todos en % en peso con respecto al peso del complejo RPF y encapsulados en liposomas de lecitina y que también comprende del 5 al 10 % en peso de un alcohol, y agua y agentes auxiliares.

10 Proceso:

Todos los ingredientes de la Fase 1 y Fase 2 se mezclaron por separado y se calentaron a 70 °C aproximadamente. Ambas fases se juntaron a 70 °C y se agitaron hasta homogeneidad de la emulsión. Se enfrió a 50 °C, añadiendo todos los ingredientes de la Fase 3, mientras se agita, y a continuación se enfrió a 30 °C, añadiendo todos los ingredientes de la Fase 4 mientras se agita hasta homogeneidad.

15

Ejemplo 4: Ensayo Comparativo

Colágeno I mediante transferencia de Western

Fibroblastos normales se trataron durante 6 días con los ingredientes E y G solos, diluidos en un medio de cultivo. A continuación se extrajo el colágeno y se detectó el colágeno I usando el método de inmunotransferencia con un kit de

detección de quimioluminiscencia. La intensidad de las bandas de colágeno I obtenido en las células tratadas se comparó con la intensidad de las bandas de las células no tratadas. Además, la intensidad de las bandas se cuantificó mediante el uso de un *software* de análisis de imagen.

Los resultados se presentan en la Fig. 1.

5

La síntesis *in vitro* de colágeno I mediante transferencia de Western muestra los siguientes resultados después de un análisis de imagen

10

(1) fibroblastos no tratados:

Sin actividad

(2) Ingredientes E = Mezcla de ciclodextrina con Retinol (marca comercial: CAVAMAX[®] W8) retinol lamelar almacenado (marca comercial: Probiol[®]) retinol encapsulado con quitosano/CMC (marca comercial: Retinol-Primasphere[®] L2) liposomas de proteína de soja con palmitato de retinol (marca comercial: Cytovector[™]) (INCI: proteína de soja hidrolizada de hidroxipropil laurdimonio).

La cantidad total de retinol puro equivalente es de $15,5 \times 10^{-5}$ %

8,6 %

(3) Ingredientes G (de acuerdo con la presente invención) = Mezcla de retinol encapsulado con quitosano/CMC (Retinol-Primasphere[®] L2) y cloruro de docosiltrimetilamonio/retinol encapsulado con lecitina (liposomas catiónicos)

La cantidad total de retinol puro es de $11,4 \times 10^{-5}$ %

116,5 %

Los resultados muestran una mejora de 13 veces desde el 8,6 % al 116,5 % cuando se comparan los resultados de la mezcla de ingredientes E con la mezcla de ingredientes G. Los resultados se muestran en Fig. 1. "U" = sin tratar (control), E y G son las mezclas de ingredientes.

En contraste con el liposoma catiónico usado cloruro de docosiltrimetilamonio/lecitina (4) de la invención, otros liposomas catiónicos tales como proteína de soja hidrolizada de hidroxipropil laurildimonio (5) (Cytovector[™]) no muestran casi ningún efecto sobre la estimulación de la síntesis de colágeno I. (4) y (5), cada uno cargado con $0,5 \times 10^{-5}$ % equivalente de retinol muestran una estimulación del

15

(4) = 30,6 %

(5) = 0,3 %

en comparación con fibroblastos no tratados.

REIVINDICACIONES

1. Cosmético con un potencial de retinol mejorado que comprende
- 5 del 0,001 al 2 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un primer sistema que contiene retinol que comprende retinol encapsulado en una cápsula de quitosano y carboximetil celulosa, del 0,001 al 3,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un segundo sistema que contiene retinol que comprende liposomas catiónicos compuestos de fosfolípidos y una monoamina de ácido graso cuaternario con un resto alquilo C₂₁-C₂₃
- 10 y la diferencia hasta el 100 % en peso de adyuvantes cosméticos.
2. Cosmético de acuerdo con la reivindicación 1, en el que el cosmético comprende harina de soja hidrolizada.
3. Cosmético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 ó 2, en el que el cosmético comprende lisado fermentado de Bífida.
- 15
4. Cosmético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que el cosmético comprende una mezcla de extractos de plantas siguientes: extracto de raíz de Angelica Archangelica, extracto de hoja de Camellia Sinensis, extracto de semilla de Pongamia Pinnata, extracto de semilla de Coffea Arabica encapsulados en liposomas y junto con un 5-10 % en peso de un alcohol, con respecto al peso de la mezcla.
- 20
5. Cosmético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en el que los adyuvantes se seleccionan entre antioxidantes, captadores de radicales, extractos de plantas, vitaminas, filtros UV, aceites cosméticos, ésteres cosméticos, agentes emulsionantes, pigmentos, conservantes, agua, formadores de gel, hialuronato sódico, minerales y sus mezclas.
- 25
6. Cosmético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que el intervalo del primer sistema que contiene retinol en el cosmético es del 0,01 al 1,0 % en peso, preferiblemente del 0,1 al 0,5 % en peso.
- 30
7. Cosmético de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 6, en el que el intervalo del segundo sistema que contiene retinol en el cosmético es del 0,3 al 2,5 % en peso, preferentemente del 1,5 al 2,5 % en peso.
8. Cosmético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el que el contenido de retinol en el cosmético se encuentra en el intervalo del 0,000114 al 0,0095 % en peso, con respecto al peso total del cosmético.
- 35
9. Cosmético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el que el cosmético es una loción, aceite, crema, gel, máscara, bálsamo, polvo, brillo bronceador, producto para antes de tomar el sol, producto solar, producto para después de tomar el sol, auto-bronceador, maquillaje, polvos compactos, producto fotoprotector o aerosol.
- 40
10. Uso de una composición para la preparación de un cosmético con una síntesis mejorada del colágeno I en la piel humana, cuya composición comprende
- 45 del 0,001 al 2 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un primer sistema que contiene retinol que comprende retinol encapsulado en una cápsula de quitosano y carboximetil celulosa, del 0,001 al 3,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un segundo sistema que contiene retinol que comprende liposomas catiónicos compuestos de fosfolípidos y una monoamina de ácido graso cuaternario con un resto alquilo C₂₁-C₂₃.
11. Uso de acuerdo con la reivindicación 10, en el que la composición se usa para la preparación de una loción, aceite, crema, gel, máscara, bálsamo, polvo, brillo bronceador, producto para antes de tomar el sol, producto solar, producto para después de tomar el sol, auto-bronceador, maquillaje, polvos compactos, producto fotoprotector o aerosol.
- 50
12. Cosmético para su uso en la mejora de la síntesis de colágeno I en la piel humana, cuyo cosmético que comprende
- 55 del 0,001 al 2 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un primer sistema que contiene retinol que comprende retinol encapsulado en una cápsula de quitosano y carboximetil celulosa, del 0,001 al 3,5 % en peso, con respecto al peso total del cosmético, de un segundo sistema que contiene retinol que comprende liposomas catiónicos compuestos de fosfolípidos y una monoamina de ácido graso cuaternario con un resto alquilo C₂₁-C₂₃
- 60 y la diferencia hasta el 100 % en peso de adyuvantes cosméticos.

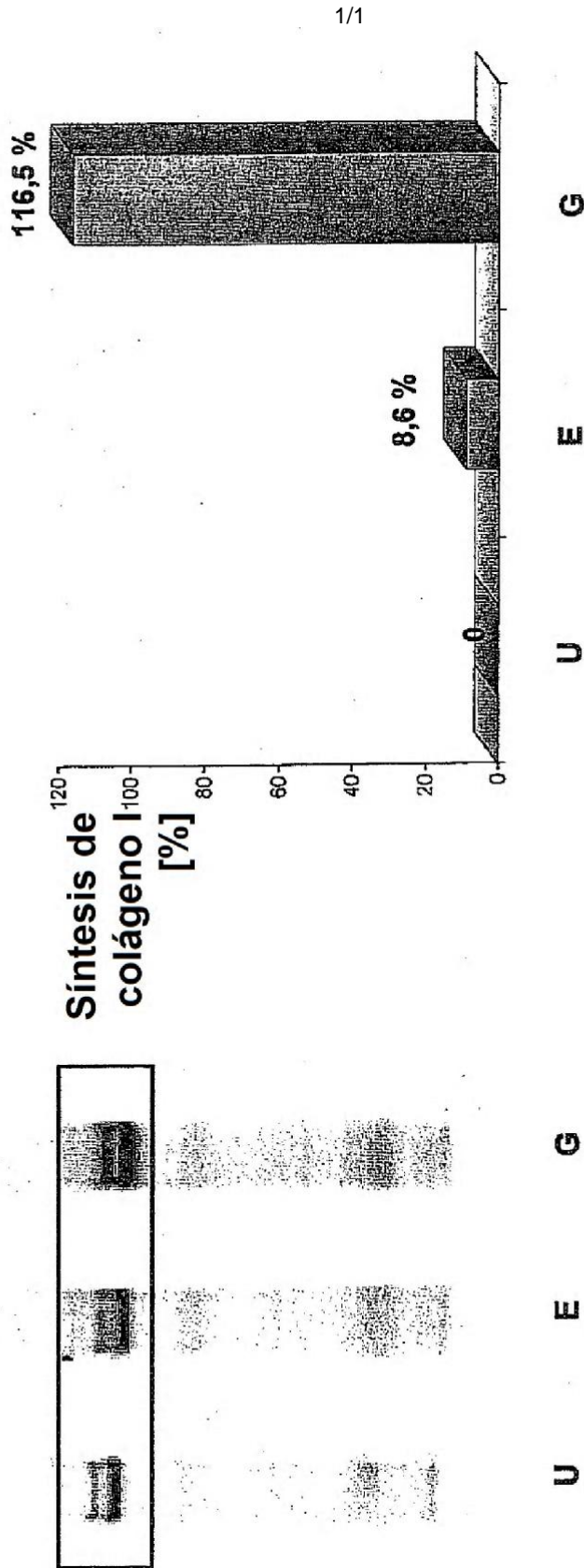


Fig. 1

DOCUMENTOS INDICADOS EN LA DESCRIPCIÓN

En la lista de documentos indicados por el solicitante se ha recogido exclusivamente para información del lector, y no es parte constituyente del documento de patente europeo. Ha sido recopilada con el mayor cuidado; sin embargo, la EPO no asume ninguna responsabilidad por posibles errores u omisiones.

Documentos de patente indicados en la descripción

- EP 2113241 A2 [0002]
- DE 102010030001 A1 [0003]