

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 553 132**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/06** (2006.01)

**A61Q 19/00** (2006.01)

**A61K 8/37** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **22.04.2008 E 08154948 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.08.2015 EP 2111850**

54 Título: **Utilización de ésteres de ácido cítrico como emulsionantes W/O**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**04.12.2015**

73 Titular/es:

**AZELIS DEUTSCHLAND KOSMETIK GMBH  
(100.0%)  
Galmesweg 65  
47445 Moers, DE**

72 Inventor/es:

**SEIDEL, HOLGER**

74 Agente/Representante:

**UNGRÍA LÓPEZ, Javier**

ES 2 553 132 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

Utilización de ésteres de ácido cítrico como emulsionantes W/O

- 5 La invención se refiere a una emulsión W/O que contiene al menos una fase acuosa, emulsionada en al menos una fase de aceite, y uno o varios ésteres de monoglicéridos y/o diglicéridos de ácidos grasos presentes en el aceite de girasol, siendo del 70 al 97,5 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>18</sub> y del 2,5 al 20 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>16</sub> y siendo como máximo el 10 % en peso de los ácidos grasos diferentes a estos y
- 10 siendo los ácidos grasos C<sub>18</sub> mezclas de C18:0, C18:1, C18:2 y C18:3 y siendo los ácidos grasos C<sub>16</sub> mezclas de C16:0 y C16:1, con ácido cítrico, pudiendo estar neutralizados los ésteres completa o parcialmente, como emulsionante W/O, en una cantidad en el intervalo del 1 al 20 % en peso, referida al total de la emulsión, siendo la cantidad en volumen de la fase o fases acuosas en la emulsión W/O del 50 al 85 % así como a una composición cosmética o farmacéutica que contiene esta emulsión W/O.
- 15 La utilización de ésteres de monoglicéridos y/o diglicéridos de ácidos grasos con ácido cítrico en composiciones cosméticas es en sí conocida. Por ejemplo, el documento DE-A-103 31 760 se refiere a un emulsionante W/O que contiene del 70 al 90 % en peso de citrato de gliceril-oleato y del 10 al 30 % en peso de un modificador de viscosidad con una viscosidad en el intervalo de 1 a 10000 mPas. El emulsionante se utiliza especialmente en composiciones cosméticas para el cuidado de la piel o en composiciones médicas dermatológicas.
- 20 El documento DE-A 198 02 206 se refiere a preparados reducidos en lípidos, capaces de fluir. Los preparados muy fluidos, cosméticos o dermatológicos, contienen uno o varios ésteres de monoglicéridos y/o diglicéridos parcialmente neutralizados de ácidos grasos saturados con ácido cítrico junto a alcoholes grasos, una fase acuosa y una fase lipídica.
- 25 El documento EP-A-1 000 603 se refiere a la utilización de ésteres de ácido cítrico con actividad superficial para la estabilización de flavonas o sustancias similares así como a los preparados cosméticos y dermatológicos que contienen los mismos. A este respecto se utilizan ésteres de monoglicéridos y/o diglicéridos parcialmente neutralizados de ácidos grasos saturados con ácido cítrico.
- 30 El documento US 2007/0207133 se refiere a una composición de emulsionante para la preparación de un producto de agua en aceite. Para ello se mezcla un componente hidrófobo con una emulsión de agua en aceite, para formar el producto. La composición puede ser una composición cosmética o farmacéutica. Grindsted®Citrem 2-en-1 se utiliza en composiciones de manteca de cacahuete.
- 35 El documento GB-A-2 361 927 se refiere a una emulsión que no es susceptible de verterse, especialmente una grasa para freír comestible. La grasa para freír presenta emulsionantes en una fase acuosa y en una fase de grasa, respectivamente, en la fase acuosa ésteres de ácido cítrico de mono- y diglicéridos de ácidos grasos y en la fase de grasa mono- y diglicéridos de ácidos grasos. El contenido en agua de las composiciones ilustrativas se encuentra por debajo del 30 % en peso.
- 40 El documento US 2007/092478 A1 se refiere a emulsiones como preparados cosméticos con un contenido en 1,2-alcanodiolos y componentes de aceite polares. Las formulaciones presentan buenas propiedades sensoriales que, entre otras cosas, dan como resultado eficacias mejoradas *in vivo*.
- 45 El documento US 2002/0146375 se refiere a geles cosméticos o farmacéuticos que contienen lecitina o microemulsiones O/W. Entre los emulsionantes adecuados consta también citrato de gliceril-linoleato.
- 50 Es un objetivo de la presente invención proporcionar un emulsionante W/O que sea soluble en una fase de aceite y estabilice gotas de agua, genere una baja tensión interfacial y configure una interfase mecánicamente estable. El emulsionante debe tener efecto en una amplia relación de fase-volumen de la fase de aceite a la fase acuosa. El emulsionante debe ser compatible con un gran número de emulsiones W/O y mostrar un espectro ventajoso de propiedades en la utilización en composiciones cosméticas o farmacéuticas, especialmente composiciones cosméticas. Debe ser especialmente ventajoso en composiciones cosméticas que están previstas para aplicar sobre
- 55 la piel. Un objetivo más es proporcionar un emulsionante W/O que sea compatible con un gran número de aceites de diferente polaridad. Debe poder utilizarse en aceites no polares, polares y de polaridad mixta.
- 60 Los objetivos se solucionan de acuerdo con la invención mediante una emulsión W/O que contiene al menos una fase acuosa, emulsionada en al menos una fase de aceite, y uno o varios ésteres de monoglicéridos y/o diglicéridos de ácidos grasos presentes en aceite de girasol, siendo del 70 al 97,5 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>18</sub> y siendo del 2,5 al 20 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>16</sub>, y siendo como máximo el 10 % en peso de los ácidos grasos diferentes a estos y siendo los ácidos grasos C<sub>18</sub> mezclas de C18:0, C18:1, C18:2 y C18:3 y siendo los ácidos grasos C<sub>16</sub> mezclas de C16:0 y C16:1, con ácido cítrico, pudiendo estar neutralizados los ésteres completa o parcialmente, como emulsionante W/O, en una cantidad en el intervalo del 1 al 20 % en peso,
- 65 referida al total de la emulsión, siendo la cantidad en volumen de la fase o fases acuosas en la emulsión W/O del 50 al 85 %.

Los objetivos se solucionan además de acuerdo con la invención mediante una composición cosmética o farmacéutica que contiene una emulsión W/O, que contiene al menos una fase acuosa, emulsionada en al menos una fase de aceite, y uno o varios ésteres de monoglicéridos y/o diglicéridos de ácidos grasos presentes en el aceite de girasol, siendo del 70 al 97,5 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>18</sub> y del 2,5 al 20 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>16</sub> y siendo como máximo el 10 % en peso de los ácidos grasos distintos a estos y siendo los ácidos grasos C<sub>18</sub> mezclas de C18:0, C18:1, C18:2 y C18:3 y siendo los ácidos grasos C<sub>16</sub> mezclas de C16:0 y C16:1, con ácido cítrico, pudiendo estar los ésteres completa o parcialmente neutralizados, como emulsionante W/O, en una cantidad en el intervalo del 1 al 20 % en peso, referida al total de la emulsión, siendo la cantidad en volumen de la fase o fases acuosas en la emulsión W/O del 50 al 85 %, conteniendo la composición cosmética o farmacéutica el emulsionante W/O, como se mencionó anteriormente, en una cantidad en el intervalo del 1 al 20 % en peso, referida al total de la emulsión.

Se encontró de acuerdo con la invención que los ésteres presentes son emulsionantes W/O especialmente ventajosos y con ello permiten emulsionar una fase acuosa en forma de gotas en una fase de aceite, sin que se produzca una coalescencia de las gotas de la fase acuosa digna de mención. Los emulsionantes utilizados de acuerdo con la invención permiten especialmente la configuración de interfases mecánicamente estables, de modo que puede llegarse a emulsiones W/O muy estables. A este respecto, el emulsionante W/O se puede utilizar con éxito en un gran número de aceites, pudiendo ser los aceites no polares, polares o de polaridad mixta.

Los emulsionantes W/O utilizados de acuerdo con la invención se derivan de monoglicéridos y/o diglicéridos de ácidos grasos presentes en el aceite de girasol. Los monoglicéridos y/o diglicéridos se extraen a este respecto típicamente del aceite de girasol, por ejemplo a partir de aceite de girasol comestible, purificado o refinado.

Pueden utilizarse de acuerdo con la invención monoglicéridos, diglicéridos o mezclas de monoglicéridos y diglicéridos. Preferentemente se utilizan mezclas de monoglicéridos y diglicéridos, que también se denominan monodiglicéridos. La relación de monoglicéridos a diglicéridos puede seleccionarse libremente. El contenido es con ello, respectivamente, del 0 al 100 % en peso. Siempre que estén presentes monoglicéridos y diglicéridos, el contenido es, respectivamente, del 1 al 99 % en peso, completándose la cantidad total, respectivamente, al 100 % en peso.

Como restos de ácido graso se contemplan tales restos de ácido graso como los que están presentes en el aceite de girasol. En el aceite de girasol están presentes los correspondientes ácidos grasos en forma de éster de glicerina. De acuerdo con la invención pueden utilizarse ácidos grasos de la composición que se prefiera, siempre que en esta forma estén también presentes en el aceite de girasol. A este respecto son del 70 al 97,5 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>19</sub> y del 2,5 al 15 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>16</sub>. A este respecto son diferentes como máximo el 10 % en peso, especialmente como máximo el 5 % en peso de los ácidos grasos presentes en total en los monoglicéridos y/o diglicéridos o restos de ácido graso de ácidos grasos C<sub>16</sub> y ácidos grasos C<sub>16</sub>.

De manera especialmente preferida se presentan del 3 al 11 % en peso de los ácidos grasos como ácidos grasos C<sub>16</sub> y del 85 al 97 % en peso de los ácidos grasos como ácidos grasos C<sub>16</sub>.

Los ácidos grasos C<sub>19</sub> son mezclas de C18:0, C18:1, C18:2 y C18:3. A este respecto, la última cifra significa la cantidad de grupos etilénicamente insaturados en los ácidos grasos. Los ácidos grasos C<sub>16</sub> son mezclas de C16:0 y C16:1.

Un espectro típico de ácidos grasos de aceite de girasol está compuesto como sigue (a este respecto se indican las amplitudes de oscilación así como los valores medios más frecuentes en % en peso del total de ácidos grasos):

50	C < 14	< 0,4
	C14:0	< 0,5
	C16:0	3 a 10 (6,5)
	C16:1	< 1,0
	C18:0	1 a 10 (5)
	C18:1	14 a 65 (24)
55	C18:2	20 a 75 (63)
	C18:3	< 0,7
	C20:0	< 1,5
	C20:1	< 0,5

60 Con ello, el aceite de girasol presenta como componentes de ácidos grasos especialmente ácido oleico (C18:1), ácido linoleico (C18:2), ácido esteárico (C18:0) y ácido linolénico (C18:3).

65 Los monoglicéridos y/o diglicéridos están esterificados con ácido cítrico, siendo en los ésteres el contenido en ácido cítrico del 5 al 25 % en peso, preferentemente del 10 al 20 % en peso. El grado de acidez se encuentra preferentemente en el intervalo de 15 a 25, en especial aproximadamente 20. El grado de saponificación es preferentemente de 250 a 350, especialmente de 285 a 315. La cantidad de yodo es preferentemente 60 a 80, de

manera especialmente preferida, aproximadamente 72.

Los ésteres utilizables de acuerdo con la invención pueden tomarse de diferentes fuentes. Por ejemplo, puede tomarse el éster como Grindsted® CITREM 2-en-1 Kosher de Danisco ([www.danisco.com](http://www.danisco.com)).

5 La preparación de los ésteres es posible mediante esterificación de los monoglicéridos y/o diglicéridos de los ácidos grasos presentes en el aceite de girasol con ácido cítrico. Los procedimientos correspondientes son conocidos por el experto en la técnica.

10 De acuerdo con la invención se utilizan los ésteres como emulsionantes W/O, para la preparación de tales emulsiones W/O, tal como se utilizan en composiciones cosméticas o farmacéuticas. A este respecto se trata preferentemente de composiciones cosméticas para la piel o composiciones farmacéuticas dermatológicas.

15 La fase de aceite puede contener, por ejemplo, un aceite mineral, aceite de silicona, aceite vegetal o mezclas de los mismos. Ejemplos de aceites apropiados farmacológicamente inocuos son los aceites de silicona y derivados de los mismos, que pueden ser lineales o cíclicos, aceites de ésteres naturales como aceite de girasol, aceite de pepita de uva o aceite de oliva, aceites de ésteres sintéticos, tales como aceites neutros, que pueden ser lineales o ramificados, aceites de parafina y aceites de isoparafina, aceites de ésteres tales como citrato, lactato, aleato, salicilato o cinamato. Además pueden utilizarse lípidos y estructuras similares a lípidos, por ejemplo di y triglicéridos de los ácidos grasos saturados de cadena lineal con 12 a 30 átomos de carbono, tales como ácido láurico, ácido mirístico, ácido palmítico, ácido esteárico, ácido aráquico, ácido behénico, ácido lignocérico, ácido cerótico, ácido melésico, así como sus ésteres con otros alcoholes grasos saturados con 4 a 22, preferentemente 12 a 22 átomos de carbono, tales como alcohol laurílico, alcohol miristílico, alcohol cetílico, alcohol estearílico, alcohol araquidílico, alcohol behenílico, alcoholes de cera saturados con 24 a 30 átomos de carbono, tales como alcohol lignocerílico, alcohol cerílico, alcohol cerotílico, alcohol miricílico. Se prefieren di- y triglicéridos, alcoholes grasos, sus ésteres o éteres, ceras, aceites de silicona, tales como polidimetilsiloxano. Son triésteres de ácidos grasos y glicerina adecuados, por ejemplo trilaurato de glicerina, miristato de glicerina, tripalmitato de glicerina, triestearato de glicerina o tribehenato de glicerina. Ceras apropiadas son, por ejemplo, palmitato de cetilo y cera alba (cera blanqueada).

30 Otras fases de aceite y lipídicas apropiadas están descritas en el documento EP-A-1 000 603 en los párrafos [0048] a [0094].

35 Como fase acuosa se utiliza por regla general agua. La fase acuosa puede además de eso contener glicerina, polietilenglicol, propilenglicol, etilenglicol y compuestos similares, así como derivados de los mismos. Se pueden utilizar además soluciones acuosas o mezclas de agua con líquidos miscibles en agua tales como glicerina, alcoholes y otros polioles. Posibles sustancias aditivas son, por ejemplo, fructosa, manosa, xilosa, manitol, sorbitol y xilitol. Además pueden añadirse electrolitos tales como cloruro sódico.

40 La invención se refiere también a una emulsión W/O que contiene al menos una fase acuosa, emulsionada en al menos una fase de aceite, y al menos un emulsionante W/O, como se define anteriormente, siendo la cantidad en volumen de la fase o fases acuosas en la emulsión W/O del 30 al 85 %, de manera especialmente preferida del 50 al 85 %, lo que corresponde a viscosidades de aproximadamente 5000 a 300000 mPas, preferentemente 5800 a 255000 mPas.

45 En la composición cosmética se trata preferentemente de una composición para el cuidado de la piel y en la composición farmacéutica, de una composición dermatológica. La composición cosmética o farmacéutica contiene el emulsionante W/O, preferentemente en una cantidad en el intervalo del 1 al 20 % en peso, especialmente del 1 al 5 % en peso, referida al total de la emulsión.

50 La cantidad puede, a este respecto, seleccionarse según los requisitos prácticos, entre otros también según la estabilidad en almacenamiento de las composiciones.

55 La cantidad de emulsionante necesaria depende también de la relación fase-volumen y del tamaño de las gotas entre la fase de aceite y fase acuosa. El emulsionante W/O puede utilizarse a este respecto en composiciones cosméticas y farmacéuticas apropiadas que se prefieran en combinación con otros emulsionantes y en combinación con principios activos.

60 Adicionalmente al emulsionante W/O pueden utilizarse también otros emulsionantes W/O apropiados, tales como polioles de silicona, ésteres de poliglicerilo o monolaurato de sorbitán. Los ésteres de acuerdo con la invención hacen a este respecto preferentemente del 25 al 100 % en peso, de manera especialmente preferida del 50 al 100 % en peso, especialmente del 70 al 100 % en peso del total de los emulsionantes W/O utilizados. El experto en la materia conoce emulsionantes W/O adicionales.

65 Las composiciones pueden contener sustancias que elevan la viscosidad y/o modificadoras de la reología, tales como ceras, jabones de metales, polialquilvinilpirrolidona, polímeros reticulados de silicona, derivados de dextrina o ésteres de sacarosa.

Además pueden utilizarse en su caso polioles conjuntamente. Polioles apropiados son propilenglicol, butilenglicol, etilenglicol, polialquilenglicol, glicerina, poliglicerina, glicósido, sorbitol, manitol, pentaeritritol, dimetilolpropano o mezclas de los mismos. Como polialquilenglicoles pueden utilizarse, por ejemplo, polietilenglicol y polipropilenglicol. Además pueden utilizarse poliolésteres conjuntamente, que pueden derivarse de glicerina o alquilenglicoles.

5 En las composiciones puede elevarse la capacidad de extensión y adherencia mediante adición de silicona tal como dimeticona, ciclometicona o derivados de silicona. A través de ello puede elevarse también la resistencia al agua. Derivados de silicona apropiados son, a este respecto, siliconas con sustituyente alquilo y arilo, copolios de silicona con alquilpoliglucósidos, aceites de silicona con sustituyente amino, así como otros aceites de silicona modificados.

10 Son coadyuvantes cosméticos utilizables además de acuerdo con la invención, por ejemplo, conservantes, bactericidas, perfumes, sustancias para evitar la formación de espuma, colorantes, pigmentos, agentes espesantes, sustancias con actividad superficial, sustancias suavizantes, humectantes y/o mantenedoras de la humedad o formadores de complejos que inactivan iones metálicos perjudiciales mediante formación de complejos.

15 Formadores de complejos apropiados así como antioxidantes están descritos en el documento EP-A-1 000 603. Para los formadores de complejos puede remitirse a los párrafos [0070] a [0074]. Para los antioxidantes puede remitirse a los párrafos [0080] a [0081].

20 Las composiciones de acuerdo con la invención pueden contener además sustancias perfumantes y aromas.

25 Por sustancias perfumantes y aromas se entiende de acuerdo con la invención tanto aceites perfumantes (fragrance) como sustancias aromáticas (flavour). Se trata a este respecto de sustancias olorosas, especialmente sustancias perfumantes. Las sustancias base de las sustancias perfumantes son por regla general aceites esenciales, aceites de flores, extractos de drogas vegetales y animales, sustancias olorosas aisladas de productos naturales, modificadas químicamente (semisintéticas) así como obtenidas de manera puramente sintética.

30 Las sustancias perfumantes y los aromas pueden provenir a este respecto de un gran número de materiales de partida vegetales. Por ejemplo pueden citarse: flores, por ejemplo de lavanda, rosas, jazmín, neroli; tallos y hojas, por ejemplo de geranio, pachuli, petitgrain, frutos tales como anís, cilantro, comino, enebro; cáscaras de frutos, por ejemplo de agrumen tal como de bergamota, limones, naranjas; semillas tales como macis, angélica, apio, cardamomo; raíces como angélica, costus, iris, calmus; madera tal como madera de sándalo, guajak, cedro o palo rosa; hierbas y cespitosas tales como estragón, limoncillo, salvia, tomillo; acículas y ramificaciones, por ejemplo, de piceas, abetos, pinos, pino negro; resinas y bálsamos, por ejemplo de gálbano, Elemi, benjuí, mirra, olíbano, opopanax.

Materias primas animales son, por ejemplo, ámbar gris, almizcle, almizcle de civeta, castóreo.

40 Ejemplos de sustancias olorosas parcialmente sintéticas son isoeugenol, vainillina, hidroxicitronelal, citrionelol, acetato de geranilo, ionona y metilionona. Las sustancias olorosas o sustancias perfumantes totalmente sintéticas son muy diversas y se basan frecuentemente en sustancias naturales. Para una descripción de las sustancias perfumantes puede remitirse, por ejemplo, a Römpp, Chemielexikon, 9ª Edición, palabras clave "perfumes", "sustancias olorosas", "sustancias perfumantes". El experto en la materia conoce otras sustancias perfumantes y aromas apropiados.

Son principios activos cosméticos apropiados para la utilización en las emulsiones de acuerdo con la invención, por ejemplo, los antioxidantes.

50 Otros aditivos apropiados son pantenol y ácido pantoténico, que se conocen del ámbito médico para la cicatrización, así como de medios para el tratamiento del cabello y aditivos de alimentación animal.

55 Además son apropiados principios activos cosméticos que son especialmente sensibles a la oxidación o hidrólisis, tales como por ejemplo polifenoles. Aquí se citarían las catequinas (tales como la epicatequina, galato de 3-epicatequina, epigalocatequina, galato de 3-epigalocatequina), flavonoides (tales como luteolina, apigenina, rutina, quercetina, fisetina, campferol, ramnetina) isoflavonas (tales como genisteína, daidzeína, gliciteína, prunetina) cumarinas (tales como dafnetina, umbeliferona), emodina, resveratrol, oregonina.

60 Son apropiadas vitaminas tales como retinol, tocoferol, ácido ascórbico, riboflavina, piridoxina.

Apropiados son además extractos totales de plantas que, entre otras, contienen las moléculas o clases de moléculas anteriores.

65 En la composición de acuerdo con la invención puede tratarse de un agente fotoprotector. Son fotoprotectores a este respecto, por ejemplo, aceites solares, leche solar, crema solar, loción solar, pulverizador de aceite solar o pulverizador de emulsión solar.

En los principios activos se trata, de acuerdo con una forma de realización de la invención, de filtros fotoprotectores. Estos pueden presentarse como filtros fotoprotectores orgánicos a temperatura ambiente (25 °C) en forma líquida o sólida. Filtros fotoprotectores (filtros UV) adecuados son, por ejemplo, compuestos a base de benzofenona, cianacrilato de difenilo o ácido p-aminobenzoico. Ejemplos concretos son (nomenclatura INCI o CTFA) benzofenona-3, benzofenona-4, benzofenona-2, benzofenona-6, benzofenona-9, benzofenona-1, benzofenona-11, etocrileno, octocrileno, PEG-25 PABA, ácido fenilbencimidazolsulfónico, metoxicinamato de etilhexilo, etilhexil dimetil PABA, alcanfor 4-metilbencilideno, butilmetoxidibenzoilmetano, salicilato de etilhexilo, homosalato así como metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol (2,2'-metilen-bis-{6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol, ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenon-5-sulfónico y 2,4,6-trianilino-p-(carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina.

Otros filtros fotoprotectores orgánicos son octiltriazona, avobenzona, metoxicinamato de octilo, salicilato de octilo, benzotriazol y triazina. Para otros absorbentes UV, especialmente filtros UVB y filtros UVA, puede remitirse al documento EP-A-1 000 603, párrafos [0099] a [0108].

En los agentes fotoprotectores o agentes de protección solar pueden utilizarse además pigmentos inorgánicos tales como pigmentos de dióxido de titanio y óxido de cinc. Además pueden también utilizarse óxido de cerio y óxido de circonio como absorbentes UV. A este respecto puede tratarse, por ejemplo, de micropigmentos. Los micropigmentos o pigmentos pueden además recubrirse superficialmente con otros aditivos. En los micropigmentos, el tamaño medio de partícula es preferentemente de 5 a 100 nm, de manera especialmente preferida de 10 a 50 nm. Los micropigmentos con recubrimiento hidrófilo pueden introducirse en la fase acuosa, los micropigmentos con recubrimiento hidrófobo en la fase de aceite.

En composiciones farmacéuticas puede utilizarse un gran número de sustancias apropiadas activas farmacológicamente, que son solubles o dispersables en la fase de aceite o la fase acuosa. El experto en la materia conoce principios activos farmacológicos apropiados.

De manera especialmente preferida se trata en las composiciones de acuerdo con la invención de composiciones cosméticas que se aplican sobre la piel.

Las fases individuales de las emulsiones pueden presentar además ingredientes habituales conocidos para las fases individuales. Por ejemplo, las fases individuales pueden contener otros principios activos farmacéuticos o cosméticos solubles en estas fases. La fase acuosa puede, por ejemplo, contener filtros fotoprotectores solubles orgánicos, micropigmento con recubrimiento hidrófilo, electrolitos, alcoholes etc. Fases individuales o todas las fases pueden contener además sólidos que se seleccionan preferentemente de pigmentos o micropigmentos, microesferas, gel de sílice y sustancias similares. La fase de aceite puede contener, por ejemplo, minerales de arcilla orgánicamente modificados, (micro)pigmentos con recubrimiento hidrófobo, filtros fotoprotectores solubles en aceite orgánicos, principios activos cosméticos solubles en aceite, ceras, jabones de metal, tales como estearato de magnesio, vaselina, o mezclas de los mismos. Como (micro)pigmentos pueden citarse dióxido de titanio, óxido de cinc y sulfato de bario, así como wollastonita, caolín, talco, Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>, oxiclورو de bismuto, polietileno micronizado, mica, ultramarina, colorantes de eosina, colorantes azoicos. En especial el dióxido de titanio u óxido de cinc son habituales como filtros fotoprotectores en cosmética y se pueden aplicar sobre la piel de manera especialmente lisa y uniforme mediante las emulsiones de acuerdo con la invención. Se pueden utilizar microesferas o gel de sílice como portadores de principios activos.

Las emulsiones o dispersiones pueden, dependiendo de la composición, de la relación de fase-volumen y en su caso el contenido en sólido presente, prepararse y presentarse como emulsiones o dispersiones sólidas o capaces de fluir. A este respecto se trata de emulsiones o dispersiones muy estables que en condiciones normales de manipulación presentan una elevada estabilidad a largo plazo. Cumplen especialmente los requisitos de estabilidad habituales en el intervalo de temperaturas de -5 °C a + 45 °C. Las gotas o partículas presentes en la emulsión o dispersión son a este respecto, muy consistentes, por lo que las emulsiones o dispersiones son especialmente apropiadas como portadores para muchos tipos de principios activos.

Las emulsiones o dispersiones preparadas con ayuda de los emulsionantes citados se preparan preferentemente con un sistema rotor/estator, teniendo influencia determinante la energía del mecanismo de agitación aplicada y el tipo de herramienta de agitación sobre el tamaño de las gotas y con ello, la estabilidad de las emulsiones.

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden adaptarse a la aplicación respectiva mediante la introducción de los principios activos correspondientes. Ejemplos de otros aditivos apropiados son nutrientes, sustancias vitalizantes, minerales, vitaminas, oligoelementos, sustancias biológicamente activas y sustancias terapéuticamente activas. Por ejemplo pueden estar contenidas vitaminas y minerales.

La preparación de las composiciones tiene lugar según procedimientos conocidos mediante mezclado de los ingredientes. La configuración de la emulsión W/O se consigue típicamente mediante la introducción de la fase acuosa en la fase de aceite bajo aporte de energía.

65

La invención se explica más detalladamente mediante los siguientes ejemplos.

**Ejemplos**

5 Ejemplo 1

Los siguientes componentes de las fases A y B se mezclaron respectivamente entre sí. Entonces se puso la fase B lentamente bajo homogenización en la fase A. A continuación se homogeneizó durante un minuto.

10 El producto se examinó reológicamente y se llevó a cabo un ensayo de estabilidad. A este respecto se determinó la estabilidad en almacenamiento a temperatura ambiente, a 40 °C, 50 °C y se llevaron a cabo ciclos de descongelación-congelación (TGC). A este respecto se calentó en periodos de 24 horas de -18 °C hasta +40 °C y se enfrió de nuevo.

15 Las composiciones y los resultados se resumen en las siguientes tablas 1 y 2.

Tabla 1

Polaridad de las fases de aceite			polar	no polar	polaridad mixta	
Formulaciones			For 1	For 2	For 3	For 4
	CTFA/INCI	Fabricante	% en peso	% en peso	% en peso	% en peso
<b>Fase A</b>						
Grindsted Citrem 2-en-1 Kosher	citrato de gliceriloleato	Danisco	5,00	5,00	5,00	3,00
Lexol IP P	palmitato de isopropilo	Inolex	5,00	0,00	3,00	3,00
Palmil O	palmitato de octilo	Undesa	5,00	0,00	3,00	3,00
aceite de almendra dulce Blanova	aceite de <i>Prunus amygdalus dulcis</i> (almendra dulce)	S.Black	5,00	0,00	3,00	3,00
aceite de onagra Blanova	<i>Oenothera biennis</i>	S.Black	5,00	0,00	3,00	3,00
Isohexadecano	Isohexadecano	Lanxess	0,00	8,00	3,00	3,00
escualeno	escualeno	Worlee	0,00	6,00	2,00	2,00
Merkur White Oil Pharma 40 PB	Paraffinum Liquidum	Merck	0,00	6,00	3,00	3,00
<b>Fase B</b>						
agua desmin.	agua	-	63,00	63,00	63,00	65,00
glicerina	glicerina	Merck	5,00	5,00	5,00	5,00
etanol	etanol	Merck	6,00	6,00	6,00	6,00
NaCl	cloruro sódico	Merck	1,00	1,00	1,00	1,00
<b>Total</b>			<b>100,00</b>	<b>100,00</b>	<b>100,00</b>	<b>100,00</b>
* todavía no registrado como nomenclatura INCI						

Reología	For 2	For 3
Punto de fusión [mPa]	3061	3061
Viscosidad [mPas] a 1/s	40000	51000

Tabla 2

Ensayo de estabilidad		
N.º de formulación TA	For 2	For 3
1 día	1	1
1 semana	1	1
2 semanas	1	1
3 semanas	1	1
4 semanas	1	1
2 meses		
3 meses		
<b>40 °C</b>		
1 día	1	1
1 semana	1	1
2 semanas	1	1
3 semanas	1	1
4 semanas	1	3/O
2 meses	1	4/O 1%
3 meses	1	-
<b>50 °C</b>		
1 día	1	1
1 semana	1	1
2 semanas	1	1
3 semanas	1	1
4 semanas	1	4/O 2%
2 meses	4/O 1%	-
3 meses	-	-
<b>TGC</b>		
1 X	1	1
2 X	1	1
3 X	1	1
4 X	1	1
5 X	1	1
3/O: precipitación del aceite, no cuantificable		
4/O: precipitación del aceite, cuantificable		
1: sin inestabilidades		

**Ejemplo 2**

- 5 Se preparó una emulsión W/O según el procedimiento descrito en el ejemplo 1. A este respecto se ajustaron diferentes relaciones fase-volumen o volúmenes de fase internos, al variar las cantidades de las fases A y B. Para todas las emulsiones se examinaron puntos de fusión y viscosidades. Los resultados se representan en la tabla 3 siguiente.

10

Tabla 3

Formulaciones			For 1	For 2	For 3	For 4	For 5
	CTFA/INCI	Fabricante	% en peso				
<b>Fase A</b>							
Miglyol 812	triglicérido cáprico	Sasol	16,67	13,33	10,00	6,67	5,00

Formulaciones			For 1	For 2	For 3	For 4	For 5
	CTFA/INCI	Fabricante	% en peso	% en peso	% en peso	% en peso	% en peso
<b>Fase A</b>							
	caprílico						
Sympatens ES	estearato de octilo	Kolb	16,67	13,33	10,00	6,67	5,00
Merkur White Oil Pharma 40 PB	Paraffinum Liquidum	Merkur	16,67	13,33	10,00	6,67	5,00
Grindsted Citrem 2-en-1 Kosher	citrato de gliceril-linoleato	Danisco	5,00	5,00	5,00	5,00	
<b>Fase B</b>							
agua desmin.	agua	-	33,00	43,00	53,00	63,00	68,00
glicerina	glicerina	Merck	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00
etanol	etanol	Merck	6,00	6,00	6,00	6,00	6,00
NaCl	cloruro sódico	Merck	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00
<b>Total</b>			<b>100,01</b>	<b>99,99</b>	<b>100,00</b>	<b>100,01</b>	<b>100,00</b>
<b>Volumen de fase interno [%]</b>			<b>50</b>	<b>60</b>	<b>70</b>	<b>80</b>	<b>85</b>
<b>Reología</b>							
Punto de fusión [mPa]			/	/	/	12200	24500
Viscosidad [mPas] a 1/s			5800	18500	43000	150000	255000
* todavía no registrado como nomenclatura INCI							

## Ejemplo 3

- 5 Se prepararon emulsiones W/O con diferentes concentraciones de emulsionante, según el procedimiento descrito en el ejemplo 1. De las emulsiones se determinaron puntos de fusión y viscosidades. Los resultados se resumen en la Tabla 4 siguiente. Todas las emulsiones en conjunto superaron tres ciclos de descongelación-congelación sin segregarse.

Tabla 4

Formulaciones			For 1	For 2	For 3	For 4
	CTFA/INCI	Fabricante	% en peso	% en peso	% en peso	% en peso
<b>Fase A</b>						
Miglyol 812	triglicérido cáprico caprílico	Sasol	10,00	10,00	10,00	10,00
Sympatens ES	estearato de octilo	Kolb	10,00	10,00	10,00	10,00
Paraffinum Perliquidum	Paraffinum Liquidum	Merkur	10,00	10,00	10,00	10,00
Grindsted Citrem 2-en-1 Kosher	citrato de gliceril-linoleato*	Danisco	5,00	1,00	3,00	7,00

ES 2 553 132 T3

Formulaciones			For 1	For 2	For 3	For 4
	CTFA/INCI	Fabricante	% en peso	% en peso	% en peso	% en peso
<b>Fase B</b>						
agua desmin.	agua	-	53,00	57,00	55,00	51,00
glicerina	glicerina	Merck	5,00	5,00	5,00	5,00
etanol	etanol	Merck	6,00	6,00	6,00	6,00
NaCl	cloruro sódico	Merck	1,00	1,00	1,00	1,00
<b>Total</b>			<b>100,00</b>	<b>100,00</b>	<b>100,00</b>	<b>100,00</b>
<b>Reología</b>						
Punto de fusión [mPa]				1020	1020	
Viscosidad [mPas] a 1/s			43000	10000	30000	55000
* todavía no registrado como nomenclatura INCI						

**REIVINDICACIONES**

1. Emulsión W/O que contiene al menos una fase acuosa, emulsionada en al menos una fase de aceite, y uno o varios ésteres de monoglicéridos y/o diglicéridos de ácidos grasos presentes en el aceite de girasol, siendo del 70 al 97,5 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>18</sub> y del 2,5 al 20 % en peso de los ácidos grasos, ácidos grasos C<sub>16</sub> y siendo como máximo el 10 % en peso de los ácidos grasos diferentes a estos y siendo los ácidos grasos C<sub>18</sub> mezclas de C18:0, C18:1, C18:2 y C18:3 y siendo los ácidos grasos C<sub>16</sub> mezclas de C16:0 y C16:1, con ácido cítrico, pudiendo estar neutralizados los ésteres completa o parcialmente, como emulsionante W/O, en una cantidad en el intervalo del 1 al 20 % en peso, referida al total de la emulsión, siendo la cantidad en volumen de la fase o fases acuosas en la emulsión W/O del 50 al 85 %.
2. Emulsión W/O según la reivindicación 1, **caracterizada por que** contiene el emulsionante W/O en una cantidad en el intervalo del 1 al 5 % en peso, referida al total de la emulsión.
3. Composición cosmética o farmacéutica que contiene una emulsión W/O según una de las reivindicaciones 1 o 2, conteniendo la composición cosmética o farmacéutica el emulsionante W/O, tal como está definido en una de las reivindicaciones 1 a 2, en una cantidad en el intervalo del 1 al 20 % en peso, referida al total de la emulsión.