

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 569 218**

51 Int. Cl.:

A61K 31/60 (2006.01)
A61K 33/30 (2006.01)
A61K 33/00 (2006.01)
A61P 17/10 (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)
A61Q 1/02 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **16.12.2009 E 09836905 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **10.02.2016 EP 2379082**

54 Título: **Base de polvo para tratamiento del acné**

30 Prioridad:

17.12.2008 US 138436 P

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

09.05.2016

73 Titular/es:

**EI, INC. (100.0%)
2865 N. Cannon Blvd.
Kannapolis, NC 28083, US**

72 Inventor/es:

**MALONEY, JOHN D. y
BARGER, KATHERINE NATALIE**

74 Agente/Representante:

LAZCANO GAINZA, Jesús

Observaciones :

Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 569 218 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

Base de polvo para tratamiento del acné

Antecedentes de la invención

5 El acné es el trastorno de la piel más común en los Estados Unidos, y aunque esta condición se asocia generalmente con la pubertad, no está confinada a la adolescencia y puede persistir hasta la adultez. La condición del acné es compleja, impactada por un número de factores intrínsecos y extrínsecos y, como tal, se debe tratar con una aproximación multifacética. El tratamiento se debe dirigir a la sobreproducción de sebo, la hiperqueratinización, el sobrecrecimiento del *P. acnes*, y el bloqueo final y la irritación del folículo pilosebáceo. Los factores extrínsecos, que exacerban la condición del acné, involucran la exfoliación por vía de abrasivos severos o restregado mecánico, la exposición a la luz UV, y algunas sustancias tóxicas y orales.

15 El ácido salicílico es un ácido beta-hidroxilado relativamente débil, que ha probado ser efectivo para corregir la descamación anormal, el desprendimiento natural de las células más exteriores del estrato corneo. Los beneficios de su tratamiento se extienden más allá de la condición del acné para incluir la soriasis, la queratosis, y la ictiosis. Al penetrar en el folículo, el ácido salicílico anima el desprendimiento de las células muertas de la piel y otros desechos celulares y, finalmente, despeja los bloqueos. Beneficios adicionales de su acción exfoliante son las mejoras en la textura y la hiperpigmentación de la piel

20 Aunque existe una amplia variedad de productos en el mercado que contienen ácido salicílico para tratar la condición del acné, la mayoría están en la forma de lociones, cremas, y líquidos, que incluyen maquillaje de base líquida. La incorporación del ácido salicílico en bases de color es ventajosa, en la medida en que ésta ayuda a limpiar los brotes habituales mientras los disimula. Adicionalmente, su uso continuo ayudará a evitar futuros brotes. Las bases de polvo suelto gozan habitualmente de mucha popularidad, en la medida en que ellas le imparten una sensación ligera, natural sobre la piel mientras que mejora el gran cubrimiento, la extensa portabilidad, la absorción del aceite y difunde la apariencia de manchas y otras imperfecciones de la piel. Al suministrar una base de polvo suelta con el tratamiento del acné los beneficios representarían una mejora sobre el ya popular tipo de producto.

25 Sin embargo, la presencia de ácido salicílico libre puede servir para irritar la piel. De acuerdo con esto, sería ventajoso suministrar una base de polvo suelta que suministre los beneficios del ácido salicílico, aunque minimice el grado de irritación de la piel. La presente invención suministra tal base.

Resumen de la invención

30 La presente invención se relaciona con una composición cosmética, en la forma de una base de polvo seca, que incluye una composición de ácido salicílico de liberación sostenida, una cantidad reguladora efectiva de uno o más iones salicilato, y uno o más óxidos de zinc y titanio. La composición también puede incluir otros activos y excipientes cosméticamente aceptables encontrados en las bases de polvo seco. La composición se puede utilizar como base que suministra tanto tratamiento para el acné como la prevención y protección de bloqueador solar.

35 Ya que la composición suministra ácido salicílico en la forma de una composición de liberación sostenida, el ácido salicílico permanece efectivo durante un periodo extenso de tiempo. El Poly Pore 450SA una formulación polimérica que incluye ácido salicílico en un polímero reticulado de alil metacrilato, es una forma de liberación sostenida polimérica representativa del ácido salicílico, aunque también se pueden utilizar otras formulaciones de liberación sostenida. Además, como aditivos antiacné, la formulación incluye uno o más salicilatos, idealmente aislados como un extracto de corteza de sauge y/o corteza de álamo temblón. Además del ácido salicílico y uno o más salicilatos, la formulación también puede incluir otros agentes antiacné, que incluyen azufre, peróxido de benzoilo y resorcinol.

40 Además de los excipientes normales encontrados en las bases de polvo seco, la formulación incluye óxido de zinc y/o dióxido de titanio como agentes bloqueadores solares. La formulación también puede incluir otros agentes bloqueadores solares o pantallas de sol para evitar el foto envejecimiento y la quemadura solar, tal como la avobenzona, y la 3-benzofenona.

45 La formulación base típicamente incluye colorantes/pigmentos, por ejemplo, colorantes/pigmentos inorgánicos, cuyo ejemplo es una mezcla de óxido de hierro, oxiclورو de bismuto, y mica.

En una realización, la composición además incluye uno o más componentes adicionales, tales como gluconato de zinc, "Active Powder Purity LS 9695", un polvo de perla, tal como el polvo de perla PPP-100.

50 En un aspecto de esta realización, la formulación tiene los siguientes ingredientes, en los rangos de porcentajes en peso suministrados adelante en la Tabla 1.

Tabla 1- Rangos de Formulación Representativos

Ingrediente	Rango % p/p
Óxido de hierro, Oxicloruro de bismuto y mezcla de Mica	40 – 75
Dióxido de Titanio	5 – 40
Óxido de Zinc	5 – 35
Poly-Pore 450SA Ácido Salicílico y Polímero reticulado y Alil Metacrilato	0.10 – 12.00
Extracto de Corteza de Salix Nigra (Sauce) en Polvo de Extracto de Corteza de Sauce blanco ABS	0.10 – 10.00
Extracto de Corteza de Populus Tremuloides (Álamo Temblón) Polvo de Extracto de corteza de Álamo Temblón Fitocida	0.10 – 10.00
Gliconato de Zinc de Gzn de Givobio	0.10 – 10.00
Active Powder Purity LS 9695	0.10 – 10.00
Polvo de Tallo de Bambú Bambusa Arundinacea Exfoliance	0.10 – 10.00
Polvo de Perla Polvo de Perla PPP-100	0.10- 10.00

5 Las formulaciones base combinan los beneficios del tratamiento del acné y la protección UV con cubrimiento ligero. Las formulaciones base combaten el acné al reducir y regular la producción de sebo, suministrando una exfoliación suave, destruyendo el P. acnés y otros microbios dañinos, suavizando la irritación y la inflamación, y restableciendo la función de barrera. La incorporación de las pantallas solares también ayuda a mejorar el acné, ya que la exposición a la luz UV es conocida por exacerbar la condición.

10 En algunas realizaciones, la formulación puede tener un factor de protección solar (SPF) de 15 o más. La formulación puede ayudar a sanar las manchas y a evitar futuros brotes, despejar bloqueos, y ayuda a la mejora de la textura de la piel y a la hiperpigmentación que permanece después de los brotes. La combinación de ácido salicílico/salicilato reduce y absorbe el sebo superficial, suministra una exfoliación suave y estimula la exfoliación natural, y suministra actividad antimicrobiana. La formulación puede suministrar actividad antioxidante, conforta la piel y mitiga la irritación, suministra una apariencia moderna, natural, suministra excelente cubrimiento y portabilidad, y dispersa la apariencia de las manchas y la pigmentación no homogénea.

15 La presente invención se entenderá mejor con referencia a la siguiente descripción detallada.

Descripción detallada

20 La presente invención se define en y mediante las reivindicaciones. Se describe una formulación base de polvo seco. La formulación base de polvo seco incluye ingredientes de base convencional, así como también agentes bloqueadores solares y aditivos antiacné. La formulación suministra liberación controlada de ácido salicílico, e incluye extractos que contienen una o más sales de salicilato.

Definiciones

Las siguientes definiciones serán útiles en el entendimiento de la invención descrita aquí.

25 En esta divulgación, el término “ion salicilato” incluye iones salicilato de ocurrencia natural y hechos por el hombre, y específicamente incluye extractos de corteza de sauce y de corteza de álamo temblón, que incluye salicilatos naturales. El término “cantidad reguladora efectiva” se refiere a una cantidad de ion salicilato capaz de neutralizar, al menos en parte, la naturaleza ácida del ácido salicílico. Por ejemplo, la presencia de 10 por ciento o más de la cantidad molar de salicilatos, con relación al ácido salicílico, puede ser efectiva.

Los términos “cosméticos” o “productos cosméticos” o “composiciones cosméticas” tal como se utilizan aquí significan (I) artículos destinados a ser restregados, aplicados con una brocha, o aplicados de otra manera a la cara de un humano para limpieza, embellecimiento, promover la atracción o alterar la apariencia, y (II) artículos destinados para uso como un componente de uno cualquiera de tales artículos, por ejemplo, composiciones de pantallas solares, composiciones medicinales, y similares.

I. Componentes de formulación.

La base incluye componentes de formulación en polvo seco convencional, agentes antiacné, y agentes bloqueadores del sol, y también puede incluir una variedad de otros agentes diseñados para suministrar tratamientos benéficos a la piel del usuario.

En la base de polvo para el tratamiento del acné es un producto multipropósito, que combina los beneficios del tratamiento del acné con la protección a la luz UV con un cubrimiento superior liviano comparado con las bases de polvo sueltas tradicionales. La base combate el acné al reducir & regular la producción de sebo, suministrar una exfoliación suave, destruir el P. acnés y otros microbios dañinos, suavizar la irritación a la inflamación, y restablecer la función de barrera. La incorporación de las pantallas solares también ayuda a mejorar el acné, en la medida en que la exposición a la luz UV es conocida por exacerbar la condición.

Como las bases de polvo seco convencionales, la formulación base descrita aquí también incluye colorantes/pigmentos. En una realización, la composición además incluye uno o más componentes adicionales, tales como el gluconato de zinc, el Active Powder Purity LS 9695, y el polvo de perla, tal como el polvo de perla PPP-100. Pueden estar presentes agentes activos adicionales así como también agentes no activos (excipientes) Los diversos agentes activos y los componentes opcionales se describen con más detalle adelante.

Tratamiento del acné

Los aditivos antiacné incluyen una combinación de una composición de ácido salicílico de liberación sostenida, y salicilatos, en la forma de un extracto natural o de un compuesto puro. Los ejemplos de los extractos que incluyen salicilatos incluyen corteza de sauce y corteza de álamo temblón. La cantidad de composición de ácido salicílico de liberación sostenida, en porcentaje en peso, típicamente varía entre aproximadamente 0.10 a aproximadamente 12.0, lo que suministra entre aproximadamente 0.05 a aproximadamente 6.00 de ácido salicílico libre. La cantidad de los salicilatos, en porcentaje en peso, típicamente varía entre aproximadamente 0.10 a aproximadamente 10.00, el cual puede estar presente en la forma de un extracto de un producto natural que incluye salicilatos, tal como corteza de sauce y corteza de álamo temblón. Cuando está en la forma de un extracto, el extracto mismo está típicamente presente en el rango de entre aproximadamente 0.055 a aproximadamente 5.50 de ácido salicílico libre.

El ácido salicílico es un agente moderadamente queratolítico, el cual promueve la descamación. La formulación base de polvo para el tratamiento del acné descrita aquí utiliza un sistema de liberación de ácido salicílico de liberación prolongada. Los sistemas de suministro de liberación prolongada/liberación sostenida representativos incluyen, pero no están limitados a Poly Pore 450 SA, MultiSal™ Salicylic Acid 10, MultiSal™ SAL 20, MultiSal™ Salicylic Acid 30, Biogenic Salicylic Acid, y Lipo CD-SA. Esta liberación sostenida lenta de los activos permite una disponibilidad de larga duración y ayuda a minimizar la irritación.

El Poli Pore 450 SA es una formulación polimérica que incluye ácido salicílico y un polímero reticulado de alil metacrilato. El MultiSal™ consiste de nanoesferas hidrófobas sólidas encapsuladas en agua o de microesferas sensibles al pH. El Biogenic Salicilica Acid es un material protegido que encapsula ácidos salicílicos, y tiene una concentración de aproximadamente 25 % de ácido salicílico. El lipo CD- SA es un material protegido que comprende 5 % de ácido salicílico en forma de polvo encapsulado.

Para suplementar la acción del ácido salicílico, los salicilatos naturales, White Willow Bark and Aspen Bark Extracts se agregan para mejorar la actividad antiacné al suministrar exfoliación adicional y acción antimicrobiana. El White Willow Bark ha mostrado que acelera la renovación de las células más efectivamente comparado con el ácido salicílico libre, mientras que el Aspen Bark trabaja como un preservante ideal, que inhibe el crecimiento de mohos, levaduras, y un amplio espectro de bacterias.

El ácido salicílico es un agente queratolítico; promueve la descamación, despeja los bloqueos, ayuda a evitar nuevas lesiones, y mejora la textura de la piel y la hiperpigmentación después de los brotes. La forma de liberación sostenida de ácido salicílico ayuda a minimizar la irritación y suministra una disponibilidad de larga duración del ingrediente activo. La irritación se mitiga al minimizar la concentración de ácido salicílico que contacta la piel en cualquier momento dado. La presencia de salicilatos también ayuda a reducir la acides del ácido salicílico, al suministrar un regulador. Esto es, cuando un ácido (en este caso, ácido salicílico) y su base conjugada (en este caso salicilato) están presentes en la formulación, cada uno amortigua el otro, de acuerdo con la ecuación bien conocida de Henderson – Hasselbach ($\text{pH} = \text{pKa} + \log(\text{concentración de ácido/concentración de base})$).

5 Cualquier sal cosméticamente aceptable de ácido salicílico (es decir salicilato) se puede utilizar en las formulaciones descritas aquí. Las sales representativas incluyen, pero no están limitadas a, sales con cationes de amonio, sodio, potasio, magnesio, calcio, estroncio, vario, aluminio, hierro, zinc, bismuto y aminas orgánicas. Es preferible una sal con al menos uno de estos cationes. Más preferible es una sal de sodio, potasio, magnesio o zinc o aún más preferible es una sal de sodio, potasio o zinc, y particularmente preferible es una sal de sodio.

El ácido salicílico y los salicilatos se pueden utilizar en concentraciones de desde aproximadamente 0.05 % a aproximadamente 12.0 % en peso, donde la cantidad de ácido salicílico libre varía desde aproximadamente 0.10 a aproximadamente 6.0 en peso.

10 Otros agentes antiacné representativos que se pueden utilizar, además del ácido salicílico y los salicilatos, incluyen azufre, peróxido de benzoilo, resorcinol, y monoacetato de resorcinol. Cuando está presente, el azufre está típicamente en una cantidad de entre 0.1 y 10.0 % p/p; el peróxido de benzoilo está típicamente en una cantidad de entre 0.5 y 5.0 % p/p, el resorcinol está típicamente en una cantidad de entre 0.1 y 2.0 % p/p, y el monoacetato de resorcinol esta típicamente en una cantidad de entre 0.1 y 3.0 % p/p.

Agentes antiacné opcionales adicionales

15 Además del ácido salicílico, los salicilatos, y los otros agentes antiacné listados anteriormente, otros agentes antiacné se pueden incluir en la base de polvo seco descrita aquí. Ejemplos no limitantes de activos antiacné útiles incluyen los queratolíticos tales como el ácido salicílico (ácido O-hidroxibenzoico), derivados de ácido salicílico tales como el ácido 5-octanoil salicílico y el ácido 4-metoxisalicílico; retinoides tales como el ácido retinoico y sus derivados (cis y trans); aminoácidos D y L que contienen azufre y sus derivados y sales, particularmente sus derivados N-acetilo, un ejemplo preferido de los cuales es N-acetil-L-cisteína; el ácido lipoico; los seboestatos tales como flavonoides y bioflavonoides; las sales biliares tales como el sulfato de escimnol y sus derivados, desoxicolato, y colato; ácido abietico; adapaleno; alantoina; extractos de aloe; ácido arbiético y sus sales; derivados de aril-2,4-dioxo oxazolidina; ASEBIOL (disponible de Laboratories Serobiologiques, ubicada en Somerville, N.J.); ácido azaleico; extractos de agracejo; extractos de gayuba; belamcanda chinensis; benzoquinolinonas; peróxido de benzoilo; barberina; BIODERMINE (disponible de Sederma, ubicada en Brooklyn, N.Y.); bioflavonoides; bisabolol; S-carboximetilcisteína; extractos de zanahoria; aceite de casina; extractos de clavo; citral, citronela, climazol, completech MBAC-OS (disponible de lipo); CREMOGEN M82 (disponible de Dragoco, ubicada en Totowa, N.J.); extractos de cohombro; ácido deshidroacético y sus sales; salicilato de deshidroplandersterona; diclorofenil imidazoldioxolano que está comercialmente disponible como COMPLETECH MBAC-OS (de Lipo, ubicada en Paterson, N.J.); DL valina y sus ésteres; DMDM hidantoina; Epicutin TT (disponible de CLR); eritromicina; escinol; etil hexil monogliceril eter; etil 2-hidroxi undecanoato; farnesol; acetate de farnesol; geraniol; glabridina; ácido glucónico; gluconolactona; monocaprato de glicerilo; ácido glicólico; Extracto de semilla de toronja; lípido gugu; Hederagenina (disponible de Maruzen); hesperitina; hinoquitol; extracto de lupulo; rosina hidrogenada; ácido 10 hidroxil decanoico; ictiol; antagonistas de alfa de interleucina 1; yodo-2-propinil butil carbamato; Capilarina (disponible de Greentech); quetoconazol; ácido láctico; aceite de limonaria; Lichochalcone LR15 (disponible de Maruzen); ácido linoleico; LIPACIDE C8CO (disponible de Seppic, ubicado en Paris, Francia); lovastatina; ácido 4 metoxisalicílico; metronidazol; minociclina; mukurossi; aceite de semilla de neem; compuestos de vitamina B3 (tales como niacinamida y ácido nicotínico); nisina; ácido 5-octanoil salicílico; octopirox; pantenol; 1-pentadecanol; Extracto de peonia; extracto de hierbabuena; extracto de phelladendron; derivados de 2-fenil-benzotiofeno; floretina; PHLOROGINE (disponible de Secma); fosfatidil colina; enzimas proteolíticas; quercetina; extracto de sándalo rojo; resorcinol; extracto de romero; rutina; extracto de salvia; salicina; ácido salicílico; extracto de escutelaria; extracto de siber hegner; Extracto de saxifraga siberiana; silicol; lauril sulfato de sodio; sulfoacetamida de sodio; Extracto de Sofora (disponible de Maruzen); ácido sórbico; azufre; Extracto de sunder vati; aceite del árbol del té; tetraciclina; ácido tetra hidroabiético; extracto de timo; tioxelona; tocoferol; trehalosa 6-undecilenoato; 3 trideceno-2-ol; triclosan; tropolona; UNITRIENOL T27 (disponible de Uniqem ubicado en Gouda, Holanda); vitamina D3 y sus análogos; aceite de timo blanco; extracto de corteza de sauce; wogonina; Ylang Ylang; glicerolato de zinc; linoleato de zinc; óxido de zinc; piritona de zinc; sulfato de zinc y mezclas de los mismos.

Protección UV

50 Los agentes de pantalla solares y/o bloqueadores solares están presentes en la base de polvo seco descrita aquí. El término "agente de pantalla solar" como se utiliza aquí define compuestos que bloquean los rayos ultravioleta que exhiben absorción dentro de la región de longitud de onda entre aproximadamente 290 y aproximadamente 400 nm.

La formulación incluye, como agentes bloqueadores de sol, uno o más de óxido de zinc y dióxido de titanio, y, más preferiblemente, una combinación de estos dos agentes. El rango de estos ingredientes en las formulaciones está típicamente entre aproximadamente 8.10 y aproximadamente 35.00 % en peso para el dióxido de titanio, y entre aproximadamente 10 y aproximadamente 25.65 % en peso para óxido de zinc.

55 El óxido de zinc y el dióxido de titanio son pigmentos minerales a menudo utilizados para fotoprotección, en la medida en que ellos son opacos tanto a la radiación UVA como UVB. Aunque ambos suministran opacidad a la luz UV, el dióxido de titanio suministra 3 a 4 veces mejor cubrimiento y fotoprotección. El dióxido de titanio es una pantalla solar física que

5 suministra polvo de cubrimiento y protección UV. El óxido de zinc es una pantalla solar física que suministra polvo de cubrimiento y protección UV; reduce la producción de sebo, puede promover la curación de heridas, y tiene potente actividad antioxidante. El óxido de zinc también suministra beneficios adicionales más allá de la protección UV. El zinc es un componente de al menos 70 metaloenzimas y también es necesario en síntesis de proteína, ADN y ARN. Además, es un cofactor para la Superóxido Dismutasa (SOD), y la enzima suministra actividad antioxidante crucial y alivia la tensión oxidativa en las células. El óxido de zinc se clasifica como un protector de la piel categoría 1, suministra actividad antimicrobiana, y se cree que está implicado en reducir la producción de sebo y promover la curación de heridas.

Utilizar una combinación de estos dos compuestos suministrará una amplia protección UV, aunque también suplementando el tratamiento de acné y mejorando la condición de la piel.

10 Idealmente, los tamaños de partícula de estos agentes están en el tamaño de micra o menos. El óxido de zinc y el dióxido de titanio en micropartículas (también conocidas como microfina) son ingredientes de pantallas solares en partículas que absorben y radiación ultravioleta (UV) de amplio espectro.

Activos de Pantalla Solar Opcionales Adicionales /Absorbedores UV

15 Además del dióxido de titanio y el óxido de zinc, otras pantallas solares orgánicas se pueden utilizar. También, los absorbedores UV, tales como la 3-benzofenona y la avobenzona pueden estar presentes en la formulación. Cuando están presentes, la 3-benzofenona está típicamente presente en una concentración de entre aproximadamente 0.1 y aproximadamente 10 % en peso, y la avobenzona está típicamente presente en una concentración de entre aproximadamente 0.1 y aproximadamente 5 % en peso.

20 Otras pantallas solares representativas y agentes bloqueadores solares incluyen óxido de hierro y partículas de polímero tales como aquellos de polietileno, polimetilmetacrilatos y poliamidas A una amplia variedad de agentes de pantalla solares convencionales o adecuados para el uso en la presente invención como se describió en Segarin et al., at Chapter VIII, Pages 189 et seq., "Cosmetics Science and Technology", cuya descripción se incorpora aquí mediante referencia.

25 Las pantallas solares se clasifican típicamente en cinco grupos con base en su estructura química; para aminobenzoatos; salicilatos; cinamatos; benzofenonas; y químicos miscelaneos que incluyen mentil antranilato y digaloliltriolateo. Los Salicilatos están presentes en la composición como agentes antiacné, y así sirven aun papel doble como pantallas solares.

30 Los agentes de pantalla solar adecuados específicos incluyen, por ejemplo, ácido p- aminobenzoico, sus sales y derivados, antranilatos, salicilatos, derivados de ácido cinámico, derivados de ácido de dihidroxicinámico, derivados de ácido trihidroxicinámico, hidrocarburos, dibenzalacetona y benzalacetofenona, naftosulfonatos, ácido dihidroxi-naftoico y sus sales, o-y p-hidroxi-bifenildisulfonatos, derivados de cumarina, diazoles, sales de quinina, derivados de quinolina, benzofenonas hidroxiladas o metoxi sustituidas, ácido úrico y vilóurico, ácido tánico y sus derivados, hidroquinona, benzofenonas, y similares.

35 También son útiles aquí los activos de pantallas solares. Una amplia variedad de agentes de pantallas solares se describen en la Patente U. S. No. 5,087, 445, de Haffey et al. , emitida en Febrero. 11, 1992; la Patente U. S. No. 5,073, 372, de Turner et al., emitida en Diciembre 17,1991; la Patente U. S. No. 5,073, 371, de Turner et al. Emitida Diciembre. 17, 1991.

40 Ejemplos no limitantes de pantallas solares que son útiles en las composiciones de la presente invención son aquellas seleccionadas del grupo que consiste de 2-etilhexil p-metoxicinamato, 2-etilhexil N, N-dimetil-p-aminobenzoato, ácido p-aminobenzoico, ácido 2-fenilbenzimidazol- 5-sulfónico, octocrileno, oxibenzona, homomentil salicilato, octil salicilato, 4,4'-metoxi-t-butildibenzoilmetano, 4-isopropil dibenzoilmetano, 3-benzilideno alcanfor, 3- (4-metilbenzilideno alcanfor, dióxido de titanio, óxido de zinc, sílice, óxido de hierro y mezclas de los mismos. Aún otras pantallas solares útiles son aquellas descritas en la Patente U. S. No. 4,937, 370, de Sabatelli, emitida en Junio 26, 1990; y la Patente U. S. No. 4,999, 186, de Sabatelli et al. , emitida en Marzo, 12,1991; Estas dos referencias se incorporan mediante referencia aquí en su totalidad. Aún otras pantallas solares útiles incluyen ácido aminobenzoico (PABA), benzilideno alcanfor, butil metoxi dibenzoil metano, dietanolamina p-metoxicinamato, dioxibenzona, etil dihidroxipropil (PABA), gliceril aminobenzoato, homomentil salicilato, isopropil dibenzoil metano, lawsona y dihidroxiacetona, mentil antranilato, metil antranilato, metil benzilideno alcanfor, octocrileno, octil dimetil (PABA), octil metoxicinamato, oxibenzona, ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfónico, petrolato rojo, sulisobenzona, dióxido de titanio, salicilato de trietanolamina, óxido de zinc y mezclas de los mismos. Ejemplos especialmente preferidos de estas pantallas solares incluyen aquellas seleccionadas del grupo que consiste de éster de ácido 4-N, N- (2-etilhexil) metilaminobenzoico de 2,4- dihidroxibenzofenona, éster de ácido 4-N, N- (2-etilhexil) metilaminobenzoico con 4- hidroxidibenzoilmetano, éster de ácido 4-N, N- (2-etilhexil)-metilaminobenzoico de 2-hidroxi-4- (2-hidroxietoxi) benzofenona, éster de ácido 4-N, N- (2-etilhexil)-metilaminobenzoico de 4- (2-hidroxietoxi) dibenzoilmetano, y mezclas de los mismos.

Las cantidades exactas de las pantallas solares que se pueden utilizar variarán dependiendo de la pantalla solar seleccionada y del factor de protección solar deseado (SPF) a ser logrado. El SPF es una medición comúnmente utilizada

de fotoprotección de una pantalla solar contra eritema. Ver Registro Federal, Vol. 43, No. 166, pp. 38206-38269, Ago. 25, 1978, que se incorpora aquí mediante referencia en su totalidad.

SPF de las formulaciones resultantes

5 Se cree que las formulaciones pueden suministrar un SPF de alrededor de 15 particularmente cuando se frota en la piel en lugar de ser simplemente espolvoreada sobre la piel. El SPF se puede medir, por ejemplo, utilizando el analizador de transmitancia UV Labsfere UV-1000S UV, que es comúnmente utilizado para obtener datos SPF in vitro en productos cosméticos.

Componentes adicionales opcionales

10 Las formulaciones de base de polvo seco descritas aquí pueden incluir, además de los excipientes, el ácido salicílico y salicilatos, el óxido de zinc y/o dióxido de titanio otros agentes activos. Estos agentes, y sus porcentajes relativos en peso en la formulación, se listan en la Tabla 2 de adelante. Estos componentes pueden ayudar a fortalecer el tratamiento de la condición de acné, o pueden tener propiedades benéficas adicionales.

15 Un ejemplo de un componente adicional es Active® Powder Purity LS 9695 de Cognis Corporation. El Active® Powder Purity (también denominado aquí como AP Purity) está compuesto de vitamina B, pantenol, biotina, y niacinamida, y varios extractos para regular el sebo, inhibir la lipogénesis y suministrar un efecto antiinflamatorio. En un estudio clínico de 4 semanas que evaluó la fracción activa del Active® Powder Purity, los resultados mostraron un 16.6% de disminución en el número de glándulas sebáceas activas y 21.6% de disminución en el flujo seboreico después del tratamiento. Adicionalmente, los ensayos in vitro sobre fibroblastos humanos confirmaron que esta fracción activa reducía la secreción de sebo en exceso por vía de la inhibición de la enzima 5 α -reductasa, y este efecto se incrementó durante la duración y concentración del tratamiento. La 5 α -Reductasa convierte la dihidrotestosterona (DHT) en las células sebáceas. El DHT estimula la secreción del sebo, y, así, inhibiendo su producción reducirá los niveles de sebo.

20 El Active® Powder Purity incluye una cantidad significativa de activo a base de agua especialmente diseñado para controlar la regulación del sebo e inhibir la lipogénesis. En razón del proceso de encapsulación el AP Purity se puede formular en todos los sistemas anhidros tales como los polvos sueltos y prensados, barritas de vertido en caliente y sueros a base de silicona. Este se diseñó para tratar pieles grasosas, con problemas y/o manchadas y es perfectamente adecuado para las preparaciones para acné.

25 Aunque las cantidades exactas de cada activo no se listan aquí, los componentes incluyen agua, polímeros reticulados de lauril metacrilato/glicol dimetacrilato, dicaprilil eter, niacinamida, extracto de levadura, extracto de semilla Aesculus Hippocastanum (Castaño de India) dióxido de titanio, extracto de algas, glicirrizato de amonio, pantenol, gluconato de zinc, cafeína, goma xantano, poligliceril-2-dipolihiidroxiestearato, y biotina.

30 El gluconato de Zinc es otro componente opcional, y soporta además la regulación del sebo y la actividad antimicrobiana. Tanto los iones de zinc como de gluconato están íntimamente involucrados en el metabolismo de la piel y suministran un efecto de suavizamiento, antiinflamatorio.

35 También se puede utilizar polvo de perla. El polvo de perla incluye muchos ingredientes benéficos tales como aminoácidos, algunos de los cuales no se pueden sintetizar en el cuerpo humano, y minerales biodisponibles que incluyen calcio, magnesio, y selenio. Usado desde tiempos antiguos, particularmente en la medicina china, se cree que mejora la humectación, exfoliación, reparación de la piel y la protección UV. El polvo de perla se ha utilizado para ayudar a tratar manchas, trastornos de pigmentación, y restablecimiento de la función adecuada de barrera. Se ha mostrado que reduce la pérdida de agua transepidérmica (TEWL), la cantidad de agua que se difunde pasivamente a través del estrato corneo y una correlación directa con la integridad de barrera.

40 También se puede utilizar extracto de bambú. El extracto de bambú ofrece exfoliación suave al remover las células muertas y los desechos de la superficie de la piel. Un estudio clínico que evaluó la eficacia de los ingredientes mostró un efecto exfoliante significativo después de solo 14 días de uso.

Pigmentos/Colorantes

45 Otros aditivos que se pueden agregar a la presente invención incluyen inorgánicos dispersados (colorantes) y pigmentos. Tales inorgánicos dispersados y pigmentos incluyen, pero no están limitados a, sílice pirógena, pigmentos microfinos, en particular óxidos y silicatos por ejemplo, óxido de hierro, particularmente óxido de hierro recubiertos, y/o dióxido de titanio, y materiales cerámicos tales como nitrato de boro, u otros componentes sólidos tales como sulfato de bario, oxocloruro de bismuto y mica.

50 Formulación representativa

5 En una realización, la formulación incluye Óxidos de Hierro, Oxiclورو de Bismuto y Mica como colorantes, dióxido de titanio y óxido de zinc como pantallas solares físicas, Poly-Pore 450SA (ácido salicílico y polímero reticulado de y alil metacrilato) como una formulación de liberación sostenida de ácido salicílico, ABS White Willow Bark Extract Powder y PhytoCide Aspen Bark Extract Powder como fuentes de salicilato, gluconato de zinc, Active® Powder Purity LS 9695, Polvo de Tallo de Bambusa Arundinacea, Polvo de Perla PPP-100 y uno o más de dicaprilil éter, niacinamida, extracto de levadura, Extracto de Semilla de Aesculus Hippocastanum (Castaño de Indias) Extracto de algas, glicirrizato de amonio, pantenol, cafeína, goma xantano, poligliceril-2- dipolihidroxiestearato, y biotina.

Agentes activos opcionales adicionales

10 El Sistema de liberación controlado descrito aquí incluye ácido salicílico como agente activo primario, salicilatos de ocurrencia natural o purificados, y óxido de zinc y/o dióxido de titanio, agentes bloqueadores del sol en la forma de una base de polvo seco.

15 La base también puede incluir, además de estos agentes, otros agentes activos cosméticos dermatológicos y farmacéuticos, que incluyen, pero no están limitados a: antioxidantes; absorbedores de radicales libres; agentes de despigmentación; reflectivos, agentes antimicrobianos (por ejemplo antibacterianos); inhibidores de alergias; agentes antienviejimiento; agentes antiarrugas; antisépticos; analgésicos; agentes antiinflamatorios; refrescantes; agentes curativos; antiinfecciosos; inhibidores de la inflamación; vasoconstrictores; vasodilatadores; promotores de curación de heridas; péptidos, polipéptidos y proteínas; agentes aclarantes de la piel; antifúngicos; contrairritantes; preparaciones cosméticas; vitaminas; aminoácidos y sus derivados; extractos herbales; flavonoides; marcadores sensoriales (es decir, agentes enfriantes, agentes calentantes, etc.); acondicionadores de la piel; agentes quelantes; mejoradores de la rotación de células; agentes nutritivos; absorbedores de humedad; absorbedores de sebo y similares; mejoradores de penetración de la piel; y otros ingredientes activos.

Fragancias y marcadores sensoriales

25 La formulación descrita aquí también suministra la sincronización de la liberación de los marcadores sensoriales tales como las fragancias, sabores, agentes enfriantes, tales como los derivados de mentol, y agentes calentantes, tales como la capsaicina. La liberación de marcadores sensoriales también se puede utilizar para llevar al consumidor el desempeño del producto, suministrar olor de larga duración o percepción del sabor, y señalar que se requiere una nueva aplicación del producto.

30 Los ingredientes de fragancias convencionales e ingredientes de perfumes se pueden utilizar en el sistema de liberación de la presente invención. La selección de cualquier componente de perfume, o la cantidad de perfume, se basa en consideraciones funcionales y estéticas. Ejemplos de fragancias útiles y compuestos de sabor discutidos posteriormente, junto con sus características de olor, y sus propiedades físicas y químicas, se dan en "Perfume and Flavor Chemicals (Aroma Chemicals)", Steffen Arctander, publicada por el autor, 1969, y en "Common Fragrance and flavor Materials-Preparation, Properties and Uses", Kurt Bauer y Dorotea Garbe, publicada por VCH Verlagsgesellschaft mbH, 1985, incorporada aquí mediante referencia.

35 Los extractos botánicos son extracto de corteza de roble, extracto de nogal, tintura de árnica, extracto de hamamelis, extracto de plantago, extracto de pensamiento, extracto de timo o salvia; para el tratamiento de piel dañada o afectada, por ejemplo, tintura de hierba de San Juan, tintura de flores de cono, extracto de flores de chamomil o tintura de flores de caléndula; y para el cuidado de la piel agotada y dañada, por ejemplo, extracto de hojas de abedur, extracto de ortiga, extracto de uña de caballo, tintura de consuelda, extracto de cola de caballo, o extracto de aloe vera. Las preparaciones vegetales también se pueden liberar de la capa de película para el tratamiento intradérmico de las enfermedades, por ejemplo, extractos de castaño de indias y rusco en caso de enfermedades de las venas, o extractos y tintura de árnica, caléndula, y capsico en el caso de contusiones, distorsiones, y hemorragias. Preparaciones vegetales en el sistema de acuerdo con la presente invención también se pueden utilizar en terapia transdérmica, por ejemplo, extracto de ginseng en el caso de quejas geriátricas; tintura de valeriana; extractos de melisa y lúpulo para originar un efecto sedante en caso de superexcitación, trastornos del sueño, y tensión; extractos de cola y té para lograr un efecto estimulante; o extracto de espino para estabilizar el sistema circulatorio.

Preservantes

50 Los preservantes pueden ser deseablemente incorporados en la base de polvo seco descrita aquí para proteger contra el crecimiento de microorganismos potencialmente dañinos. Aunque los microorganismos tienden a crecer en la fase acuosa, los microorganismos también pueden residir en la fase anhidra o aceitosa. Como tales, los preservantes que tienen solubilidad tanto en agua como en aceite son empleados de manera preferible en las presentes composiciones. Los preservantes adecuados para las composiciones de la presente invención son ésteres de alquilo de ácido para hidroxibenzoico. Otros preservantes, que se pueden utilizar incluyen derivados de hidantoina, sales de propionato, y una variedad de compuestos de amonio cuaternario.

Los preservantes apropiados se pueden seleccionar para satisfacer el ensayo de desafío de preservante y para suministrar estabilidad al producto. Los preservantes particularmente preferidos son metilparabeno, imidazolidinil urea, deshidroacetato de sodio, propilparabeno, etilendiamina tetraacetato trisodio (EDTA), y benzil alcohol. Los preservantes se pueden seleccionar con base en la consideración de posibles incompatibilidades entre los preservantes y otros ingredientes en el sistema de liberación.

Los preservantes se emplean preferiblemente en cantidades que varían desde aproximadamente 0.01% a aproximadamente 2% en peso de la composición.

Vitaminas

Se pueden incluir diversas vitaminas en la base de polvo seco descrito aquí. Por ejemplo, se pueden utilizar vitamina A y derivados de los mismos, vitamina B2, biotina, ácido pantoténico, vitamina K, vitamina D, vitamina E y mezclas de los mismos.

Activos antimicrobianos y antifúngicos.

Los activos antimicrobianos y antifúngicos pueden ser efectivos para prevenir la proliferación y el crecimiento de bacterias y hongos y se pueden utilizar en la base de polvo seco descrito aquí. Ejemplos no limitantes de activos antimicrobianos y antifúngicos incluyen fármacos beta-lactama, fármacos de quinolona, ciprofloxacina, norfloxacina, tetraciclina, eritromicina, amikacina, 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxi difenil éter, 3,4,4'-triclorobanilida, fenoxietanol, fenoxi propanol, fenoxiisopropanol, doxiciclina, capreomicina, clorhexidina, clortetraciclina, oxitetraciclina, clindamicina, etambutol, isetionato de hexamidina, metronidazol, pentamidine, gentamicina, kanamicina, lineomicina, metaciclina, metenamina, minociclina, neomicina, netilmicina, paromomicina, estreptomycin, tobramicina, miconazol, clorhidrato de tetraciclina, eritromicina, eritromicina de zinc, estolato de eritromicina, estearato de eritromicina, sulfato de amikacina, clorhidrato de doxiciclina, sulfato de capreomicina, gluconato de clorhexidina, clorhidrato de clorhexidina, clorhidrato de clortetraciclina, clorhidrato de oxitetraciclina, clorhidrato de clindamicina, clorhidrato de etambutol, clorhidrato de metronidazol, clorhidrato de pentamidina, sulfato de gentamicina, sulfato de kanamicina, clorhidrato de lineomicina, clorhidrato de metaciclina, hipurato de metenamina, mandelato de metenamina, clorhidrato de minociclina, sulfato de neomicina, sulfato de netilmicina, sulfato de paromomicina, sulfato de estreptomycin, sulfato de tobramicina, clorhidrato de miconazol, clorhidrato de amanfadina, sulfato de amanfadina, octopirox, paraclorometaxilenol, nistatina, tolnaftato, piritona de zinc; clotrimazol; alantolactona; isovalantolactone; extracto de onocleas (alanina); anís; extracto de árnica (acetato de helenalina y 11,13 dihidrohelenalina); extracto de Aspidium (flora, extracto que contiene lincolol); extracto de agracejo (cloruro de berberina); extracto de laurel dulce; extracto de corteza de arrayán (miricitrina); cloruro de benzalconio; cloruro de bencetonio; ácido benzoico y sus sales; benjuí; alcohol de bencilo; cardo bendito; tubérculo bletilla; sanguinaria; aceite de palo de rosa; lampazo; butil parabeno; aceite de cade; CAE (disponible de Ajinomoto, situado en Teaneck, N.J.); aceite de cayeputi; Cangzhu; extracto de capsicum frutescens; aceite de alcaravea; corteza de cascarilla (vendido bajo el nombre comercial de ESSENTIAL OIL); aceite de hoja de cedro; manzanilla; chaparral; gluconato de clorhexidina; clorofenesina; clorxileno; aceite de canela; aceite de citronela; aceite de clavo; Crinipan AD (disponible de Climbazol); 2,3-dihidro-farnesol; ácido deshidroacético y sus sales; aceite de semilla de eneldo; DOWICIL 200 (disponible de Dow Chemical, situada en Midland, Mich.); equinácea; ácido elenólico; epimedium; etil parabeno; Fo-Ti; galbanum; pimpinela de jardín; GERMALL 115 y GERMALL II (disponible de ISP-Sutton Labs, ubicadas en Wayne, N.J.); aceite de manzanilla alemana; centinodia gigante; GLYDANT (disponible de Lonza, situado en Fairlawn, N.J.); GLYDANT PLUS (disponible de Lonza); aceite de semilla de pomelo; 1,6 hexanodiol; diisetionato de hexamidina; hinoquitol; miel; flor de la madre selva; lúpulo; siempre viva; carbamato de yodopropinil butilo (disponible de Lonza); isobutil parabeno; isopropil parabeno; JM ACTICARE (disponible de Microbial Systems International, situado en Nottingham, NG); jbayas de enebro; KATHON CG (disponible de Rohm and Haas, ubicado en Filadelfia, Pa.); ácido kójico; ládano; lavanda; aceite de bálsamo de limón; limonaria; metilparabeno; menta; mume; mostaza; mirra; aceite de semilla de neem; orto fenil fenol; extracto de hoja de olivo (disponible de Bio Botanica); perejil; aceite de pachulí; raíz de peonía; 1,2 pentanodiol; PHENONIP (disponible de Nipa Labs, ubicados en Wilmington, Del.); fenoxietanol; fitoesfingosina; aceite de agujas de pino; PLANSERVATIVE (disponible de Campo Research); propilparabeno; verdolaga; quillay; ruibarbo; aceite de geranio rosa; romero; salvia; ácido salicílico; sasafrás; ajedrea; aleña de Sichuan; metabisulfito de sodio; sulfito de sodio; SOPHOLIANCE (disponible de Soliance, ubicado en Compiègne, Francia); ácido sórbico y sus sales; esfingosina; estevia; estoraque; ésteres de sacarosa; ácido tánico; té; aceite del árbol del té (aceite de melaleuca); tomillo; triclosán; triclocarbán; tropolona; trementina; umbeliferona (antifúngico); yuca; y sus mezclas.

Agentes antiinflamatorios Los antiinflamatorios pueden ser incluidos en la base de polvo seco descrito aquí para potenciar los beneficios de fotoprotección, en particular de los rayos UVA. Antiinflamatorios esteroidales adecuados incluyen hidrocortisona; antiinflamatorios no esteroidales tales como oxicanos, salicilatos, derivados de ácido acético, fenamatos, derivados de ácido propiónico, pirazoles, compuestos de fenilo sustituidos, compuestos que contienen 2-naftilo, y antiinflamatorios naturales tales como aloe vera. Ejemplos de antiinflamatorios se describen en la patente U.S. No. 5,487, 884, cuyo contenido completo se incorpora aquí por referencia.

Activos antiarrugas, antiatrofia de la piel y reparación de la piel Los activos antiarrugas, antiatrofia de la piel y de reparación de la piel pueden ser efectivos en la reposición o el rejuvenecimiento de la capa epidérmica y pueden ser

incluidas en bases de polvo seco descritas aquí. Estos activos generalmente proporcionan estos beneficios deseables de cuidado de la piel promoviendo o manteniendo el proceso natural de descamación. Ejemplos no limitantes de activos antiarrugas y antiatrofia de la piel incluyen compuestos de vitamina B3 (tales como niacinamida y ácido nicotínico), ácido salicílico y derivados de los mismos (tales como ácido 5-octanoil salicílico, ácido heptiloil 4 salicílico, y ácido 4-metoxi salicílico); aminoácidos D y L azufre y sus derivados y sales, en particular los derivados N-acetilo, un ejemplo preferido de los cuales es N-acetil-L-cisteína; tioles, e. gramo. etanotiol; hidroxiaácidos, ácido fítico, ácido lipoico; ácido lisofosfatídico; agentes exfoliantes de la piel (por ejemplo fenol y similares); Actein 27-desoxiactein Cmicifugoside (disponible de Cirmigoside); adapaleno; ademetionina; adenosina; extracto de aletris; ésteres de glutatión alquilo; alcoxicoxi alcoxin benzoico y derivados; lectinas derivadas de aloe; ácido aminopropano fosfórico; 3-aminopropil dihidrógeno fosfato; Amadorine (disponible de Barnet Products); extractos de anís; AOSINE (disponible de Secma); benzoato de amino arginina; ASC III (disponible de E. Merck, situado en Darmstadt, Alemania); ácido ascórbico; palmitato de ascorbilo; ácido asiático; asiaticosides; ARLAMOL GEOTM (disponible de ICI, ubicado en Wilmington, Del.); ácido azelaico; derivados del ácido benzoico; extractos de Bertholletia; ácido betulínico; BIOCHANIN A AND BIOPEPTIDE CL (disponible de Sederma, ubicado en Brooklyn, N.Y.); BIOPEPTIDE EL (disponible de Sederma); biotina; extracto de corteza de mora; extractos de lirio de la mora; extracto de cohosh negro; extracto de cohosh azul; ácido butanoil betulínico; carboximetil 1,3 beta glucano; catecolaminas; chalconas; ésteres de ácido cítrico; extracto del árbol casto; extractos de trébol; cumestrol; CPC péptido (disponible Barnet Products); daidzeína; extracto de dang gui; darutoside; debromo laurinterol; ácido 1-decanoil-glicero-fosfónico; deshidrocolesterol; deshidrodicrosol; deshidroeuogenol; deshidroepiandrosterona; DERMOLLECTINE (disponible de Sederma); ácido deshidroascórbico; sulfato de deshidroepiandrosterona; dianetol; ácido hidroxil benzoico; ácido 2,4 dihidroxibenzoico; diglicol guanidina succinato; diosgenina; ascorbil fosfato de sodio; ácido dodecanodioico; Ederline (disponible de Seporga); Enderline (disponible de Laboratorios Seporga); equol; eriodictiol; estrógeno y sus derivados; ETF (disponible de Laboratorios Seporga); Ethocyn; ELESERYL SH (disponible de Laboratorios Serobiologiques, situados en Somerville, N.J.); ENDONUCLEINE (disponible de Laboratorios Serobiologiques); ergosterol; ácido eritórbico; extracto de hinojo; extracto de semilla de fenogreco; FIBRASTIL (disponible de Sederma); FIBROSTIMULINES S y P (disponible de Sederma); FIRMOGEN LS 8445 (disponible de Laboratorios Serobiologiques); formononetina; extracto de la fruta forsythia; ésteres de ácido gálico; ácido amino butírico gamma; GATULINE RC (disponible de Gattlefosse, situada en Priest, Francia); genisteína; genisteína; ácido gentsico; alcohol gentisílico; extractos de Gingko Biloba; extractos de ginseng; ginsenoside (RO, R6 1, R62, R6 3, Rc, RD, RE, RF, RF-2, RG-1, RG-2); gluco piranosil-L-ascorbato; glutatión y sus ésteres; gliciteína; hesperitina; hexahidro curcumina; inhibidores de la reductasa HMG-coenzima A; extractos de lúpulo; ácido 11 hidroxil undecanoico; ácido 10 hidroxil decanoico; 25-hidroxicolesterol; esteroides 7-hidroxilados; hidroxietil isosteariloil isopropanolamina; hidroxil-tetra metil piperidiniloil; hipotaurina; extracto de ibukijakou; SG 10 isoflavona (disponible de Barnet Productos); kinetina; extracto de Kohki; ésteres de ácido L-2-OXO-tiazolidin-4-carboxílico; inhibidores de lactato deshidrogenasa; 1-lauril,-liso fosfatidil colina; lectinas; lichochalcona LF15 (disponible de Maruzen); extractos de regaliz; lignanos; lumisterol; altramuces; luteolina; ácido lisofosfatídico; ascorbil fosfato de magnesio; margen; melatonina; melibiosa; inhibidores de la metaloproteínasa; metopreno; ácido metoprénico; ácido mevalónico; MPC COMPLEX (disponible de CLR); N metil serina; N metil taurina; N, NI-bis (lactil) cisteína; nauingenina; neotigogenina; o-desmethylangolensin; betaglucono de avena; ácido oleanólico; pantetina; fenilalanina; fotoaneton; piperidina; extractos de placenta; pratenseína; pregnenolona; acetato de pregnenolona; succinato de pregnenolona; premarin; ácido quillaico; raloxifeno; REPAIR FACTOR 1 y REPAIR FACTOR FCP (ambos disponibles de Sederma); retinoatos (ésteres de alcoholes C2-20); glucuronato de retinol; linoleato de retinol; S-carboximetil cisteína; SEANAMINE FP (disponible de Laboratorios Serobiologiques); ascorbil fosfato de sodio; extractos de soja; extractos de bazo; taquisterol; taurina; tazaroteno; tempol; Thymulen; extractos de timo; hormonas tiroideas; tigogenina; retinoato de tocoferol; toxifolin; ácido traumático; citrato de tricolina; trifoside; derivados de uracilo; ácido ursólico; vitamina D3 y sus análogos; vitamina K; extracto de vitex; extracto de ñame; yamogenina; zeatina; y sus mezclas.

Activos reparadores de barrera de la piel Activos reparadores de barrera de la piel son aquellos activos para el cuidado de la piel que pueden ayudar a reparar y reponer la función de barrera de humedad natural de la epidermis y pueden ser incluidos en bases de polvo seco descritas aquí. Ejemplos no limitantes de activos reparadores de barrera de la piel incluyen Alpha Lipid (disponible de Lucas Meyer); ácido ascórbico; biotina; ésteres de la biotina; brasicasterol; cafeína; campesterol; esteroides derivados de canola; Cennamides (disponibles de Ennagram); Ceramax (disponible de Alban Muller); CERAMAX (disponible de Quest, situado en Ashford, Inglaterra); CERAMIDE 2 y CERAMIDE H03TM (ambos disponibles de Sederma); CERAMIDE 11 (disponible de Quest); CERAMIDE III A y III B (ambas disponibles de Cosmoferm, situada en Deft, Holanda); CERAMIDE LS 3773 (disponible de Laboratorios Serobiologiques); CERAMINOL (disponible de Inocosm); Cerasol y Cephalip (ambos disponibles de Pentapharm); colesterol; hidroxistearato de colesterol; isoestearato de colesterol; 7 deshidrocolesterol; DERMATEIN BRC y DERMATEIN GSL (ambos disponibles de Hormel); ELDEW CL 301 y ELDEW PS 203 (ambos disponibles de Ajinomoto); Fitobroside (disponible de Pentapharm); galactocerebrosides; Generol 122 (disponible de Henkel); glicerol amida serina; hidroxietil isoestearil isopropanolamina; ácido láctico; Lactomide (disponible de Pentapharm); lanolina; alcoholes de lanolina; lanosterol; N laurilglucamida de ácido láurico; ácido lipoico; N-acetil cisteína; N-acetil-L-serina; N-metil-L-serina; Net Sterol-ISO (disponible de Barnet Products); compuestos de vitamina B₃ (por ejemplo, niacinamida y ácido nicotínico); ácido palmítico; pantenol; pantetina; inhibidores de la fosfodiesterasa; PHYTO/CER (disponible de Intergen); extracto de mijo fitoglicolípido (disponible de productos Barnet Products Distributer, ubicada en Englewood, N.J.); PHYTOSPHINGOSINE (disponible de Gist Brocades, ubicada en King of Prussia, Pa.); PSENDOFILAGGRIN (disponible de Brooks Industries, ubicada en South Plainfield, N. J.); QUESTAMIDE H (disponible de Quest); serina; sigmasterol; esitosterol; esteroides derivados de soja; esfingosina; esfingomielinasa; S-lactoil glutatión; ácido esteárico; Structurine (disponible de Silah); SUPER STEROL ESTERS (disponible de Croda);

ácido tióctico; THSC CERAMIDA OIL (disponible de Campo Research); trimetilglicina; nicotinato de tocoferol; vitamina D₃; Y2 (disponible de Ocean Pharmaceutical); y mezclas de los mismos.

5 Activos relajantes cosméticos no esteroideos Sustancias activas relajantes cosméticas pueden ser efectivas en la prevención o tratamiento de la inflamación de la piel y pueden ser incluidas en la base de polvo seco descrita aquí. La sustancia activa calmante potencia los beneficios del aspecto de la piel de la presente invención, por ejemplo, tales agentes contribuyen a un tono o color de piel más uniforme y aceptable. La cantidad exacta de agente antiinflamatorio que se utilizará en las composiciones dependerá del agente antiinflamatorio particular utilizado, ya que tales agentes varían ampliamente en potencia. Ejemplos no limitantes de agentes calmantes cosméticos incluyen las siguientes categorías: derivados de ácido propiónico; derivados de ácido acético; derivados de ácido fenámico; derivados de ácido bifencilcarboxílico; y oxicams. Todos estos activos calmantes cosméticos se describen completamente en la patente U.S. No. 4,985,459 de Sunshine et al. , otorgada en enero 15 de 1991, que se incorpora aquí como referencia en su totalidad. Ejemplos no limitantes de activos calmantes cosméticos útiles incluyen ácido acetil salicílico, ibuprofeno, naproxeno, benoxaprofeno, flurbiprofeno, fenoprofeno, fenbufeno, ketoprofeno, indoprofeno, piroprofeno, carprofeno, oxaprozina, pranoprofeno, miroprofeno, tiopropofeno, suprofeno, alminoprofeno, ácido tiaprofenico, fluprofeno, ácido buclóxico, absinthium, acacia, ACTIGEN Y (disponible de Active Organics), escina, agrimonia, extracto de espino cerval aliso, alantofina, aloe, angélica, APT (disponible de Centerchem), árnica, astrágalo, extracto de raíz de astrágalo, AVOCADIN HS-80 (disponible de Croda), aguacate, azuleno, Baicalina SR 15 (disponible de Barnet productos Dist.), escutelaria de Baikal, Baizhu, toronjil menta, toronjil de Gilead, bálsamo de Canadá, malta de cebada, albahaca, fruto baya de laurel, polen de abeja, alga negra común, BIODYNES TRF (disponible de Arch Personal Care), BIOPHYTEX (disponible de Laboratorios Serobiologiqués), bisabolol, cohosh negro, extracto de cohosh negro, cohosh azul, extracto de cohosh azul, , lirio azul, eupatorio, borraja, aceite de borraja, antagonistas de bradiquinina, raíz de bardana, petasita, caléndula, extracto de caléndula, Extracto de Corteza de Sauce canadiense (disponible de Fytokem), cera de candelilla, Cangzhu, fitoesteroles de canola, pimiento, carboxipeptidasa, semillas de apio, extracto del tallo de apio, CENTAURIUM (disponible de Sederma), extracto de centaurea, camazuleno, manzanilla, extracto de manzanilla, chaparral, árbol casto, extracto del árbol casto, pamplina, raíz de achicoria, extracto de raíz de achicoria, chirata, chi shao, harina de avena coloidal, fáfara, consuelda, extracto de consuelda, equinácea, aciano, CROMOIST CM GLUCAN (disponible de Croda), CYTOBIOL IRIS A (disponible de Gattefosse), Darutoside, angelica de hurian, garra del diablo, metales divalentes (tales como, magnesio, estroncio y manganeso), hierba del perro, cornejo, dong quai, Eashave (disponible de Pentapharm), eleutero, ELHIBIN (disponible de Pentapharm), ENTELINE 2 (disponible en Secma), efedra, epimedium, esculosida; ácido etacrínico, onagra, eufrasia, Extracto de LE-100 (disponible de Sino Lion), Fangfeng, extracto de semilla de hinojo, matricaria, ficina, agujas de abeto, fruto de la forsitia, Fytosterol 85 (disponible de Fytokem), ganoderma, gaoben, gardenia, Gatuline A (disponible de Gattefosse), genciana, extracto de germanio, extracto de Gingko Biloba, ginkgo, extracto de ginseng, GIVOBIO GZN (disponible de Seppic), sello de oro, extracto de gorgonia, centella asiática, extracto de pomelo, aceite de madera de guayacán, extracto de gugal, ésteres helenalina, henna, flor de la madre selva, lúpulo, extracto de marrubio, castaña de Indias, cola de caballo, huzhang, hipérico, musgo de Islandia, Ictiol, siempre viva, ipecacuana, IRICALMIN (disponible de Pentapharm), musgo irlandés, hiedra, té verde japonés, lágrimas de Job, jojoba, azufaifo, bayas de enebro, kava kava, kiwi, extracto de cola, kumquat, LANACHRYS 28 (disponible de Lana Tech), aceite de limón, LEMON SECRETS (disponible de Gattefosse), Lianqiao, raíz de regaliz, ligusticum, ligustrum, flor de lima, tilo, raíz de aleña, estropajo, macis, flor de magnolia, naanja mandarina, extracto de manjistha, margaspidin, malvavisco, matricin, reina de los prados, melatonina, MICROAT IRC (disponible de Nurture), mentas, muerdago, Modulene (disponible de Seporga), mono o diglucósidos de glabridina, mono o diglucósidos de gentisin, MTA (5'-desoxi-5'-metiltioadenosina), corteza de morera, gordolobo, extracto de frijol mungo, almizcle, mirra, N-metil arginina, ortiga, henna neutra, corteza de roble, beta glucano de avena, extracto de avena, naranja, flor de naranjo, pantenol, papaína, papaya, perejil, fruta de la pasión, pera, vincapervinca, piña del pino, ácido fenoxiacético, corteza de peonía, raíz de peonía, Phytopleenol (disponible de Bio Botánica), fitoesfingosina, plancton, Preregen (disponible de Pentapharm), corteza de fresno espinoso, verdolaga, QUENCH T (disponible en Centerchem), quillay, brote de trébol rojo, salvia roja, rehmannia, ruibarbo, salvado de arroz, manzanilla romana, rosa, romero, palmito ácido rosmarínico, jalea real, ruda, rutina, sándalo, el sanqi, zarzaparrilla, sierra, SENSILINE (disponible de Silab), SEPICALM S (disponible de Seppic), SEPICALM VG (disponible de Seppic), SIEGESBECKIA (disponible de Sederma), escutelaria, olmo resbaladizo, palo de jabón, menta verde, SPHINGANINE (disponible de Croda), estearil glicirretinato, StimuTex (disponible de Pentapharm) , estoraque, nitrato de estroncio, aceite de abedul dulce, asperilla dulce, tagetes, extracto de té, extracto de tomillo, ginseng Tienchi, tocoferol, acetato de tocoferol, triclosán, cúrcuma, urimei, ácido ursólico, VEDACALM (disponible de Gattefosse), violeta, lirio blanco, corteza de pino blanco, corteza de cerezo silvestre, hamamelis, milenrama, extracto de levadura, yuca, y mezclas de los mismos.

55 Activos para aclarar la piel Activos para aclarar la piel pueden en realidad disminuir la cantidad de melanina en la piel o proveer un efecto tal por otros mecanismos y pueden ser incluidos en la base de polvo seco descrita aquí. Activos aclaradores de la piel adecuados para su uso se describen aquí en la solicitud de patente copendiente No. Ser. 08/479,935, presentada el 07 de junio 1995 en el nombre de Hillebrand, correspondiente a la solicitud PCT No. Ser. U. S. No. 95/07432, presentada el 12 de junio de 1995; y la solicitud de patente copendiente Ser. No. 08/390, 152, presentada el 24 de febrero de 1995 en los nombres de Kalla L. Kvalnes, Mitchell A. DeLong, Barton J. Bradbury, Curtis B. Motley, y John D. Carter, correspondiente a la solicitud PCT No. U.S. Ser. No. 95/02809, presentada el 1 de marzo 1995, publicado el 8 de septiembre 1995; todas incorporadas aquí por referencia. Ejemplos no limitantes de activos aclaradores de la piel útiles aquí incluyen ACTIWHITE LS 9808 (disponible de Cognis), adapaleno, extracto de almendras, extracto de aloe, ácido alfa-glicaril-L-ascórbico, amino tiroxina, lactato de amonio, derivados de anetol, extracto de manzana, arbutina , extracto de areca catechu L., ácido ascórbico, palmitato de ascorbilo, ácido azelaico, extracto de bambú, extracto de

5 gayuba, BELIDES (NP) (disponible de CLR Chemisches Laboratorium Dr. Kurt Richter GmbH), tubérculo bletilla, extracto de bupleurum falcatum, extracto de Burnet, Burnet Power (disponible de Barnet Productis), butil hidroxi anisol, butilhidroxitolueno, butil resoreinol, Chuanxiong, extracto de cola, de caballo Dang-Gui, desoxiarbutina, DERMAWHITE NFLS 9410 (disponible de Cognis), derivados de 1,3 difenil propano, ácido 2,5 dihidroxibenzoico y sus derivados, 2-(4-acetoxifenil)-1,3 ditano, 2-(4-hidroxifenil)-1, 3 ditano, flor de saúco, ácido elágico, EMBILICA (disponible de EMD / Rona), escinol, derivados de estragol, esculosida, esculetina, ETIOLINE (disponible de Croda), FADEOUT (disponible de Pentapharm), Fangfeng, extracto de hinojo, FISION SKIN LIGHT (disponible de Tri-K), ácido gálico y sus derivados, extracto de ganodenna, gaoben, GATULINE WHITENING (disponible de Gattfesse), ácido genístico y sus derivados, alcohol gentisílico, GIGAWHITE (disponible de Pentapharm), glabridina y sus derivados, gluco piranosyl- 1-ascorbato, 10 ácido glucónico, glucosamina, ácido glicólico, ácido glicirricínico, extracto de té verde, rábano picante, 4-hidroxi-5-metil-3 [2H]-furanona, hidroquinona, 4 hidroxianisol y sus derivados, derivados de ácido 4-hidroxi benzoico, ácido hidroxi caprílico, extracto de Hyptis, ascorbato de inositol, ácido kójico, dipalmitato kójico, ácido láctico, extracto de limón, extracto de regaliz, Licorice P-TH (disponible de Barnet Products), ácido linoleico, ascorbil fosfato de magnesio, MELACLEAR 2 (disponible de Croda), Melfade (disponible de Pentapharm), MELAWHITE (disponible de Pentapharm), Melanostatine DM (disponible de Laboratorios SEPORGA), extracto de morus alba, extracto de morera, NAB ASAFETIDA EXTRACT (disponible de Arch Personal Care), niacinamida, ácido 5- octanoil salicílico, papaya, extracto de perejil, extracto de Phellinus linteus, extracto de piñón blanco, extracto de piñón negro, extracto de piri-piri, derivados de pirogalol, ácido retinoico, retinol, ésteres de retinilo (acetato, propionato, palmitato, linoleato), derivados de 2,4 resorcinol, derivados de 3,5 resorcinol, extracto de rosa mosqueta, rucinol, ácido salicílico, SEPIWHITE MSH (disponible de Seppic), extracto de Song-Yi, Sophora Powder (disponible de Barnet Products), SYNERLIGHT (disponible de Gattfesse), 4-tioresoreina, derivados de 3,4,5 trihidroxibencilo, ácido tranexámico, tirostat (extracto de Rumex disponible de Fytokem), Tyroslat 10,11 (disponible de Fytokem), VAMAWHITE GT (disponible de Tri-K), derivados de vainilla, vitamina D3 y sus análogos, y mezclas de los mismos, WHITAMI (disponible de Alban Muller).

25 Estimuladores del sebo Los estimuladores de sebo pueden incrementar la producción de sebo por las glándulas sebáceas y pueden ser incluidos en la base de polvo seco descrita aquí. Estos activos para el cuidado de la piel son especialmente útiles para las mujeres postmenopáusicas que tienen deficiencia de sebo. Ejemplos no limitantes de activos estimulantes del sebo incluyen ácido brionólico, completech MBAC-DS, deshidroetiandrosterona (también conocida como DHEA), orizanol y mezclas de los mismos.

30 Inhibidores de sebo Los inhibidores de sebo pueden disminuir la producción de sebo por las glándulas sebáceas y pueden ser incluidos en la base de polvo seco descrita aquí. Ejemplos no limitantes de activos inhibidoras de sebo incluyen AC.NET (disponible de Croda), ALMETH (disponible de Tri-K), cloruro de hidroxi aluminio, ASEBIOL (disponible de Laboratorios Serobiologiques), BODERMINE (disponible de Croda), climbazol, COMPLETECH MBAC -OS (disponible de Lipo), corticosteroides, extractos de cohombro, ácido deshidroacético y sus sales, diclorofenil imidazoldioxolano (disponible de Elubiol), GIVOBIO GZN (disponible de Seppic), gugulipid, ketoconazol, Lichoalcone LR 15 (disponible de Maruzen), niacinamida, floretina, PHLOROGINE (disponible de Secma), Phycosaccharide anti-acné (disponible de Codif), PHYTOTAL OS (disponible de Croda), REGU-SEB (disponible de Pentapharm), S-carboximetil cisteína, SEBORAMI (disponible de Alban Muller), SEPICONTROL AS (disponible de Seppic), espironolactona, tioxolona, tocoferol, ácido tranexámico, LTNITRIENOL T27 (disponible de Unichem), INIREDUCE R _ #% (disponible de Induchem EE.UU.), zincidona (UC1B), y mezclas de los mismos.

40 Inhibidores de la proteasa También son útiles como ingredientes activos en la presente invención inhibidores de la proteasa. Ejemplos no limitantes de inhibidores de la proteasa que son útiles en las composiciones de la presente invención son los seleccionados del grupo que consiste de Coplejo A E (disponible de Barnet Products); ALE (disponible de SEPORGA); alicina; lupaline alfa; Aosaine (disponible de Secma); Aprotinina (disponible de Pentapharm); extracto de areca catechu (nuez de betel); extractos de areca catechu; Extracto de algas azules (disponible los laboratorios de Collaborative Labs); Centaurium (disponible de Sederma); sulfato de colesterol; CMST (disponible de Bioetica); Dermoprotectine (disponible de Sederma); Disacoside HF 60 (disponible de Barnet Products); Elhibin (disponible de Pentapharm); Fluid Out Colloid (disponible de Vegetech); Hipotaurine (disponible de Sogo Pharmaceutical); Inn Cyte Heathes (disponible de Collaborative Labs); Micromerol (disponible ed Collaborative Labs); Pefabloc SP (disponible de Pentapharm); Sepicontrol AS (disponible de Seppic); Siegesbeckia (disponible de Sederma); Sophorine (disponible de Barnet products); Thiotaïne (disponible de Barnet Products); extracto de uncaria gambis roxburgh; zinc y mezclas de los mismos.

55 Agentes de estiramiento de la piel También son útiles como ingredientes activos en la presente invención los agentes de estiramiento de la piel. Ejemplos no limitantes de agentes de estiramiento de la piel que son útiles en las composiciones de la presente invención son los seleccionados del grupo que consiste de Argatensyl LS 9735 (disponible de Cognis), Biocare SA (disponible de Amerchol); Easylift (disponible de Tri-K), albúmina de huevo; Fision Skin Lift (disponible de Tri-K), Fision Soy lift (disponible de Tri-K), Flexan 130 (disponible de National Starch); Gatuline Lifting (disponible de Gattfesse); Pentacare HP (disponible de Pentapharm); Pepha-Tight (disponible de Pentapharm), QuickLift (disponible de BASF), Sesafash (disponible de Seppic), Skin Tightening ST (disponible de Croda), Soytensor LS 9811 (disponible de Cognis), Tritisol (disponible de Croda), Vegeseryl (disponible de Laboratoires Serobiologiques) y mezclas de los mismos.

60 Ingredientes antipacazón También son útiles como ingredientes activos en la presente invención los ingredientes antipacazón. Ejemplos no limitantes de ingredientes antipacazón que son útiles en las composiciones de la presente invención son los seleccionados del grupo que consiste de aloe vera, bálsamo de Gilead, remolacha, poleo, menta,

jabonera, Stimu Tex (disponible de Pentapharm); Takanal (disponible de Ikeda-Distributer); Ichthyol (disponible de International Sourcing- Distributer); Triésteres de gliceril Oxigenados (disponibles de Seporgia) y mezclas de los mismos.

Antioxidantes Antioxidantes representativos incluyen vitamina E, acetato de tocoferol, beta glucano, coenzima Q10, hidroxitolueno butilado (BHT), hidroxianisol butilado (BHA), superóxido dismutasa, galato de propilo, y similares.

5 II. Método de Procesamiento

La formulación descrita aquí se puede preparar al combinar los diversos activos y excipientes, y combinar la mezcla resultante. La selección del tamaño de partícula se puede lograr al tamizar, la separación de corriente de aire y similares.

10 Un agente de flujo se agrega opcionalmente después de que se elabora el polvo. Los agentes de flujo que se pueden utilizar en la presente invención pueden ser sílice, arcilla, almidón, y similares que se pueden agregar a las partículas. Los materiales de sílice finos adecuados están comercialmente disponibles como sílice pirogénico o "fumed", tal como los materiales vendidos bajo los nombres comerciales de Cabosil elaborado por G. L. Cabot Inc., Aerogel 500 elaborado por J. M. Huber Corp., Syloid 244,-63,-65 elaborado por W. R. Grace y Co., Li-sil 233 elaborado por Pittsburg Plate Glass Co., y Sipernat D-17 elaborado por Degussa Co. Los materiales de arcilla adecuados incluyen caolinitas y bentonitas, como se describieron en la Patente Británica No. 1,460, 646.

15 La invención se puede además ilustrar mediante los siguientes ejemplos de las realizaciones preferidas de las mismas, aunque se entenderá que estos ejemplos están incluidos simplemente con el propósito de ilustración y no pretenden limitar el alcance de la invención a menos que se indique de manera específica de otra manera. Todos los porcentajes, proporciones y partes aquí, en la especificación, ejemplos, y reivindicaciones, son en peso y son aproximaciones a menos que se establezca otra cosa.

20 Ejemplo 1: ensayo de seguridad eficacia de la fórmula completa:

Tres estudios internos con tamaños de muestra pequeños se condujeron en los Harmony Laboratories, Inc., para recoger datos preliminares que se relacionan con la seguridad y eficacia de la base de polvo para el tratamiento del acné. Además, se recolectó retroalimentación subjetiva con relación a la estética y desempeño del producto.

Las formulaciones que se ensayaron cayeron dentro de la siguiente composición:

25 Tabla 2. Resumen de las fórmulas base de Pantalla Solar en Polvo para Acné desarrolladas y ensayadas.

Ingrediente	Rango % p/p
Óxido de Hierro, Oxidocloruro de Bismuto y Mezcla de Mica	48.75 - 68.75
Dióxido de Titanio	8.10 – 35.00
Óxido de Zinc	10.00 - 25.65
Poly-Pore 450SA Ácido Salicílico Polímero de reticulado y Alil Metacrilato	1.00
Extracto de Corteza de Salix Nigra (Sauce) en Polvo Extracto de Corteza de Sauce Blanco ABS	2.00
Extracto de Corteza de Populus Tremuloides (Álamo Temblón) Polvo de Extracto de corteza de Álamo Temblón Fitocida	0.50
Gluconato de Zinc GZn Givobio	1.00
Active Powder Purity LS 9695	0.25
Polvo de Tallo de Bambusa Arundinacea Bambú Exfoliance	0.50
Polvo de Perla Polvo de Perla PPP-100	1.0

ES 2 569 218 T3

Se ensayaron múltiples formulas, pero cada una cayó dentro de los rangos listados anteriormente. Las formulas individuales representativas se suministran adelante en los Ejemplos 2-4.

Estudio de irritación – Antebrazo volar

5 El primer estudio evaluó la irrigación que resulta del uso del producto y se evaluó sobre el antebrazo volar de los participantes en el estudio. 10 panelistas, con edades entre 20-55, con diversos tipos de piel y complejiones se seleccionaron para participar en este estudio aleatorizado controlado con línea base de 3 días. La base de polvo se aplicó en el mismo sitio de ensayo durante los 3 días consecutivos. Permitiendo que permaneciera en su lugar durante 6 horas, y dando como resultado que la irrigación se comparará con un sitio de control no tratado. Los participantes completaron un cuestionario sensorial inmediatamente después y 6 horas después de la aplicación del producto y se les solicitó comentar sobre cualquier sensación adversa, tal como de quemado, picazón o escozor. Adicionalmente, a los 10 participantes se les solicitó calificar el grado de reacción, que varía desde 0 (“ninguno”) hasta 3.0 (“severamente perceptible”). Además, para recoger los datos sensoriales, el coordinador del estudio revisó los sitios de control y ensayo en la línea base para confirmar que ambos sitios estaban claros. 6 horas después de la aplicación del producto se calificaron los sitios de control y ensayo utilizando la siguiente escala de calificación y grados en letras.

15 Calificación de grado:

0 = Sin reacción

+ = Eritema ligero, confluyente o irregular

1 = Eritema medio (rosa)

2 = eritema Moderado (rojizo definido)

20 3 = Eritema fuerte (rojizo muy intenso).

Grados en Letra:

E = Edema

P = Pápula

V = Vesícula

25 B = Vejiga

Tabla 3. Porcentaje de Panelistas con Irritación Visual

Signos Visuales de Irritación	Día 1	Día 2	Día 3
0	100 %	100 %	100 %
+	0 %	0 %	0 %
1	0 %	0 %	0 %
2	0 %	0 %	0 %
3	0 %	0 %	0 %

E	0 %	0 %	0 %
P	0 %	0 %	0 %

V	0 %	0 %	0 %
B	0 %	0 %	0 %

Tabla 4. Porcentajes de Panelistas con Irritación Sensorial

Signos Sensoriales de Irritación	Día 1	Día 2	Día 3
Ninguno	100 %	100 %	100 %
Quemado	0 %	0 %	0 %
Picazón	0 %	0 %	0 %
Escozor	0 %	0 %	0 %
Otros	0 %	0 %	0 %

5 En todo el curso de este estudio interno, ningún panelista presentó irritación ni hizo comentario sobre ninguna sensación que se relacionara con irritación. Adicionalmente, el coordinador del estudio no observó ningún signo visual de inicio en ningún tipo de tiempo durante este estudio de tres días.

Estudio de uso de cinco días - Cara

10 El Segundo estudio interno, pequeño, se llevó a cabo para determinar la capacidad del producto de originar irritación en forma de cambios visibles e incomodidad sobre la piel de la cara. Además, durante el día final del estudio, los panelistas completaron un cuestionario para recoger retroalimentación subjetiva con relación a la estética y desempeño del producto. Cinco mujeres, de edades entre 20 – 55, con tipos de piel normal a grasosa y grasosa completaron este estudio controlado de línea base. Cada panelista fue un usuario de la base de polvo suelta y estuvo de acuerdo con sustituir el producto de ensayo en lugar de su base usual. Los panelistas no tenían sensibilidad conocida al ácido salicílico y durante la duración del estudio, también una semana antes del estudio, a los panelistas no se les permitió utilizar ninguno de los productos faciales adicionales con Ácido Salicílico o Peróxido de Benzoilo, ni ninguno limpiador abrasivo ni exfoliante. Adicionalmente, los panelistas no eran usuarios habituales de Retin-A o ningún otro tratamiento tópico de prescripción para el acné. Finalmente, todos los panelistas estaban libres de cualquier dermatitis activa y no habían tenido quemadas por el sol recientes sobre la piel facial.

20 Cada mañana durante el estudio, los panelistas siguieron la rutina de limpieza y humectación usual, aplicaron el producto del ensayo con una brocha aplicadora suministrada, y siguieron con la aplicación de sus productos cosméticos de color usuales. Luego de la aplicación, los panelistas completaron un cuestionario para recoger cualquier dato sensorial que se relacione con irritación (es decir quemado, picazón, escozor, y similar). La base de polvo suelta era puesta durante un mínimo de ocho horas cada día y luego retirada con los productos de limpieza usuales de los panelistas. Antes de la remoción, los panelistas completaron el mismo cuestionario sensorial para comentar sobre cualquier irritación experimentada durante el día. Finalmente, en el día quinto y final del estudio, los panelistas completaron cuestionarios de autoevaluación para ofrecer datos subjetivos. En toda la duración del estudio, los panelistas fueron observados por el coordinador del estudio y se les revisó cualquier signo de irritación.

Tabla 5. Porcentaje de panelistas con irritación

Signos Sensoriales de Irritación	Día 1	Día 2	Día 3	Día 4	Día 5
Ninguno	100 %	100 %	100 %	100 %	100 %
Quemado	0 %	0 %	0 %	0 %	0 %
Picazón	0 %	0 %	0 %	0 %	0 %

Escozor	0 %	0 %	0 %	0 %	0 %
Otros	0 %	0 %	0 %	0 %	0 %

Tabla 6. Retroalimentación subjetiva sobre el desempeño del producto

Comentarios	Día 1
Menos Manchas/Complexión más Clara	40 %
Buen Cubrimiento	80 %
Mejor cubrimiento que la Base de Polvo Habitual	40 %
Mejor Control de la Grasa que la Base de Polvo Suelta Habitual	60%

5 Luego de cinco días de uso del producto, ninguno de los panelistas experimentó ninguna irritación, visual o sensorial. 60 % de los panelistas sintió que el producto ofrecía mejor control de grasa comparado con su base de polvo corriente, mientras que el 40 % vio menos manchas o una complexión más clara durante el estudio. 80 % sintió que el polvo ofrecía buen cubrimiento, mientras que el 40 % sintió que éste ofreció mejor cubrimiento que su base de polvo usual. La retroalimentación adicional proveniente de los participantes del estudio se relacionó con la sensación de claridad del polvo, larga portabilidad, y efecto aclarante sobre la piel.

10 Estudio para evaluar los cambios en los niveles de sebo superficial - frente

15 El tercer estudio interno se llevó a cabo para determinar la capacidad de la base del polvo para controlar los niveles de sebo superficial sobre la frente. El sebo, que está compuesto de triglicéridos, diglicéridos, ácidos grasos libres, ésteres de cera, escualeno, colesterol, y ésteres de colesterol, es producido por las glándulas sebáceas para mantener la piel y el pelo humectados. Éste es responsable por darle a la piel una apariencia grasa, y su remoción es una característica de desempeño importante en muchos cuidados para la piel y productos cosméticos. El exceso de sebo, que se exagera por altas condiciones de humedad, puede hacer la piel resistente a la aplicación de maquillaje, así como también conduce a la formación de espinillas.

20 Siete mujeres, con edades entre 20-55, con tipos de piel normal a grasa y grasa completaron este estudio controlado de línea base de un día. Los panelistas no tenían sensibilidad conocida al Ácido Salicílico no eran usuarios habituales de productos que contuvieran Ácido Salicílico, Peróxido de Benzilo o cualquier tipo de medicamentos de prescripción que contuvieran ácido retinoico, tal como Retin-A. Los participantes del estudio tenían que estar libres de cualquier irritación en la frente y no podían haber tenido una quemadura de sol reciente en la frente. Durante la duración del estudio, se tenía que tener seguridad sobre ausencia de golpes en cara y frente.

25 En este estudio clínico, el producto del ensayo se aplicó en tres sitios de ensayo sobre la frente, y cada sitio de ensayo tenía un sitio de control no tratado correspondiente. En varios puntos de tiempo durante este estudio de seis horas, un sitio del ensayo y su correspondiente sitio de control se evaluó para la producción de sebo utilizando los indicadores de Piel SEBUTAPE® (CuDerm Corporation, Dallas, TX). SEBUTAPE® se diseña para evaluar la producción de sebo y la distribución de las glándulas sebáceas activas. Este se hace de una película microporosa, hidrófoba con numerosas cavidades de aire. Una vez que se aplica la cinta a la piel, el sebo desplaza el aire en las cavidades y es absorbido sobre la cinta. La producción de sebo de cada folículo formará una mancha claramente definida y se puede evaluar visualmente para una medición cruda de la actividad del folículo y del volumen de sebo.

35 Los panelistas que cumplieron con los criterios del estudio se revisaron en la línea base para asegurar que el área de la frente estuviera libre de cualquier irritación. La frente completa se limpió con Jabón Dove para retirar el maquillaje, sebo, o desechos adicionales, y el área fue secada con palmaditas utilizando gasa. Seis sitios de ensayo totales (3 de control y 3 de ensayo) se identificaron en la frente utilizando la plantilla de estudio, compuesta de 6 sitios de ensayo que mide cada uno aproximadamente 1.5cm². El orden de los sitios de ensayo a través de la frente fue aleatorio entre el panel. A los 3 sitios de ensayo, aproximadamente 0.02g del producto se aplicó utilizando un aplicador con punta de esponja y se frotó suave y homogéneamente sobre la piel durante 5 segundos. Un sitio de control y uno de ensayo se midieron con SEBUTAPE® a las 1, 3, y 6 horas post aplicación del producto. Los indicadores de piel se aplicaron a los sitios de control y ensayo durante un total de 5 segundos y se retiraron. Se tuvo cuidado de aplicar el mismo grado de presión cuando se

recogieron las muestras de sebo. Los niveles de sebo superficiales de los sitios de control y ensayo fueron evaluados visualmente siguiendo las instrucciones incluidas y de la escala de graduación:

Escala de Graduación:

L = Bajo

5 M = Medio

H = Alto

Tabla 7. Porcentaje de panelistas con cambios en los niveles de sebo superficiales

	1 Hora post aplicación del producto	3 Horas post aplicación del producto	6 Horas post aplicación del producto
Sin Cambio	43 %*	43 %**	29 %
Reducción	57%	57 %	71 %
Incremento	0 %	0 %	0 %

*100 % de los panelistas fueron clasificados como L. Así, no se podría indicar una mejora de acuerdo con la escala de graduación.

10 **67 % de los panelistas fueron clasificados como L.

Tabla 8. Porcentaje de panelistas con reducción en los niveles de sebo superficial – mejora en el grado de grasa

	1 Hora post aplicación del producto	3 Horas post aplicación del producto	6 Horas post aplicación del producto
L	-	-	-
M	100 %	100 %	75 %
H	100 %	50 %	67 %

15 Los resultados muestran que todos los panelistas experimentaron una reducción en la producción de sebo al menos en un punto de tiempo durante este estudio de 6 horas. Una a 3 horas post aplicación del producto, 57% de los panelistas experimentaron una mejora en la producción de sebo, mientras que 71 % mostraron mejoras en el punto de tiempo de 6 horas. Ciento por ciento de aquellos panelistas con niveles medio a alto de sebo mostraron una reducción en el punto de tiempo de 1 hora. En el punto de tiempo de 3 horas, aquellos con un nivel medio de producción de sebo mostraron la misma mejora, mientras que el 50 % de aquellos con alto nivel mejoraron. 6 horas post aplicación del producto, el 75 % de aquellos con un nivel medio y 67 % con un nivel alto mostraron una reducción en la producción de sebo superficial. En los puntos de tiempo de 1 y 3 horas, cinco participantes se clasificaron por tener un bajo nivel de producción de sebo, y así, no hubo manera de evaluar visualmente ninguna mejora con base en la escala visual suministrada por CuDerm. Finalmente, ningún participante mostró un mayor grado de producción de sebo con el producto de ensayo en el lugar comparado con el sitio de control no tratado correspondiente.

Resumen

25 Mientras que existe una variedad de base de polvos sueltos en el mercado, la mayoría son promovidos con base solamente en sus atributos cosméticos tales como cubrimiento y portabilidad. La adición de ingredientes para ayudar a tratar la condición de acné y suministrar protección extendida para el sol de este producto pasa aquella de un simple cosmético. La base de polvo para el tratamiento del acné con SPF 15 combate el acné al reducir irregular la producción de sebo, suministrando exfoliación suave, combatiendo el P. acnés y otros microbios dañinos, suavizando la irritación en la inflamación, y restableciendo la función de barrera.

30

ES 2 569 218 T3

5

Los ensayos clínicos llevados a cabo sobre materias primas individuales seleccionadas para este producto demostraron su efectividad para combatir varios aspectos que contribuyen a la condición de acné, tales como la sobreproducción de sebo y el sobre crecimiento de P. acnés. Adicionalmente, estudios internos conducidos en el HLI confirmaron preliminarmente que el producto es no irritante, controla los niveles de sebo superficial, y suministra un buen cubrimiento y larga portabilidad.

Ejemplo 2-4: Formulaciones representativas: sombreados con polvo evaluados durante los estudios internos.

En el estudio de irritación (antebrazo volar) descrito anteriormente, hubo un ensayo de sombreado en este estudio. La formulación se suministra adelante.

Ingrediente	Rango % p/p
Óxido de Hierro, Oxidocloruro de Bismuto y Mezcla de Mica	54.25
Dióxido de Titanio	17.50
Óxido de Zinc	22.00
Poly-Pore 450SA Ácido Salicílico y Polímero reticulado y Alil Metacrilato	1.00
Extracto de Corteza de Salix Nigra (Sauce) en Polvo Extracto de Corteza de Sauce Blanco ABS	2.00
Extracto de Corteza de Populus Tremuloides (Álamo Temblón) Polvo de Extracto de corteza de Álamo Temblón Fitocida	0.50
Gluconato de Zinc GZn Givobio	1.00
Active Powder Purity LS 9695	0.25
Polvo de Tallo de Bambusa Arundinacea Bambú Exfoliance	0.50
Polvo de Perla Polvo de Perla PPP-100	1.0

10

Durante los Cinco Días del estudio de Uso – Cara, hubo tres ensayos de sombras en este estudio. La cantidad de óxido de hierro, oxidocloruro de bismuto, mezcla de mica, y óxido de titanio, y óxido de zinc variaron dependiendo de la sombra. La siguiente tabla muestra las variaciones en estas formulaciones.

Ingrediente	Rango % p/p
Óxido de Hierro, Oxidocloruro de Bismuto y Mezcla de Mica	48.75 – 60.00
Dióxido de Titanio	8.10 – 35.00
Óxido de Zinc	10.00 – 25.65
Poly-Pore 450SA Ácido Salicílico y Polímero reticulado y Alil Metacrilato	1.00
Extracto de Corteza de Salix Nigra (Sauce) en Polvo Extracto de Corteza de Sauce Blanco ABS	2.00
Extracto de Corteza de Populus Tremuloides (Álamo Temblón) Polvo de Extracto de corteza de Álamo Temblón Fitocida	0.50
Gluconato de Zinc GZn Givobio	1.00
Active Powder Purity LS 9695	0.25

ES 2 569 218 T3

Polvo de Tallo de Bambusa Arundinacea Bambú Exfoliante	0.50
Polvo de Perla Polvo de Perla PPP-100	1.00

En el estudio para Evaluar los Cambios en los Niveles de Sebo Superficial – Frente, hubo tres ensayos de sombras en este estudio, la cantidad de óxido de hierro, oxiclورو de bismuto, mezcla de mica, dióxido de titanio, y óxido de zinc varió dependiendo de la sombra. La siguiente tabla muestra las variaciones en estas formulaciones.

Ingrediente	Rango % p/p
Óxido de Hierro, Oxiclورو de Bismuto y Mezcla de Mica	54.25 – 68.75
Dióxido de Titanio	10.00 – 17.50
Óxido de Zinc	15.00 – 22.0
Poly-Pore 450SA Ácido Salicilico y Polímero reticulado y Alil Metacrilato	1.00
Extracto de Corteza de Salix Nigra (Sauce) en Polvo Extracto de Corteza de Sauce Blanco ABS	2.00
Extracto de Corteza de Populus Tremuloides (Álamo Temblón) Polvo de Extracto de corteza de Álamo Temblón Fitocida	0.50
Gluconato de Zinc GZn Givobio	1.00
Active Powder Purity LS 9695	0.25
Polvo de Tallo de Bambusa Arundinacea Bambú Exfoliante	0.50
Polvo de Perla Polvo de Perla PPP-100	1.00

Reivindicaciones

1. Una formulación de base de polvo seco para el cuidado de la piel, que comprende:
 - a) Una formulación de ácido salicílico de liberación sostenida;
 - b) Uno o más iones salicilato en una cantidad reguladora efectiva
 - 5 c) Óxido de zinc, y
 - d) Dióxido de titanio.
2. La formulación de la reivindicación 1, que comprende además gluconato de zinc.
3. La formulación de la reivindicación 1, que comprende además polvo de perla.
4. La formulación de la reivindicación 1, que comprende además extracto de bambú.
- 10 5. La formulación de la reivindicación 1, que comprende además uno o más pigmentos o colorantes, en donde el pigmento o colorante comprende uno o más de óxido de hierro, oxiclورو de bismuto, y mica; y adicionalmente comprende uno o más colorantes o pigmentos, en donde el rango de dichos colorantes o pigmentos es del 40-75 %.
6. La formulación de la reivindicación 1, que comprende además un absorbedor UV, en donde el absorbedor UV es 3-benzofenona o avobenzona.
- 15 7. La formulación de la reivindicación 1, en donde los iones salicilatos están presentes en un extracto de corteza de sauce o de corteza de álamo temblón.
8. La formulación de la reivindicación 1, en donde la cantidad de óxido de zinc varía entre aproximadamente 5 y aproximadamente 35 % en peso.
- 20 9. La formulación de la reivindicación 1, en donde la cantidad de dióxido de titanio está entre aproximadamente 5 y aproximadamente 40 % en peso.
10. La formulación de la reivindicación 1, en donde el rango de composición de liberación sostenida de ácido salicílico es de 0.1 – 12 %.
11. La formulación de la reivindicación 1, en donde los iones salicilatos están presentes en la forma de extractos de 1 o más de corteza de sauce y corteza de álamo temblón, y la cantidad de extractos es 0.1 – 10.0 %.
- 25 12. La formulación de la reivindicación 1, que comprende además uno o más agentes antiacné adicionales, seleccionados del grupo que consiste de azufre, peróxido de benzoilo, resorcinol y monoacetato de resorcinol.