

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 583 165**

51 Int. Cl.:

A61K 8/49	(2006.01)	A61K 9/00	(2006.01)
A61K 8/97	(2006.01)		
A61K 45/00	(2006.01)		
A61K 47/34	(2006.01)		
A61P 17/00	(2006.01)		
A61Q 19/00	(2006.01)		
A61K 8/86	(2006.01)		
A61Q 17/04	(2006.01)		
A61K 31/575	(2006.01)		
A61K 47/28	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **25.12.2008 E 08868137 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **04.05.2016 EP 2226066**

54 Título: **Composición que contiene agua y que comprende una triazina solubilizada**

30 Prioridad:

27.12.2007 JP 2007336112

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

19.09.2016

73 Titular/es:

**SHISEIDO COMPANY, LTD. (100.0%)
5-5 GINZA 7-CHOME CHUO-KU
TOKYO 104-8010, JP**

72 Inventor/es:

**TESHIGAWARA, TAKASHI;
MIYAHARA, REIJI y
OKA, TAKASHI**

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

Observaciones :

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

ES 2 583 165 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

Composición que contiene agua y que comprende una triazina solubilizada

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a una composición que contiene agua que se puede emplear como una composición para uso externo (que se puede denominar en adelante "composición de uso externo") en forma de composición cosmética o agente de uso externo.

10

Antecedentes de la invención

Entre las muchas sustancias que son difíciles de disolver en agua (tal sustancia se puede denominar en adelante "sustancia poco soluble en agua"), bastantes sustancias son útiles en el campo de las composiciones de uso externo para la piel, que incluyen las composiciones de uso externo para el cuero cabelludo o el pelo (por ejemplo, composiciones cosméticas o agentes de uso externo). Se han proporcionado diversas técnicas para incorporar de forma fiable tal sustancia poco soluble en agua en una composición de uso externo. Ejemplos normales de tales técnicas incluyen la emulsificación y la solubilización. La dispersión en agua o solubilización se puede emplear como técnica que consigue extender una sustancia poco soluble en agua sobre la piel con una favorable sensación refrescante.

15

20

25

En particular, la solubilización es una técnica esencial para usar una sustancia poco soluble en agua en forma, por ejemplo, de una loción. En general, una sustancia poco soluble en agua se solubiliza mediante el uso de un tensioactivo tal como un alquil éter polioxietileno o aceite de ricino hidrogenado y polioxietileno. Sin embargo, cuando se usa una sustancia poco soluble en agua que tiene un alto peso molecular (en particular, una sustancia poco soluble en agua que tiene una estructura voluminosa) resulta muy difícil solubilizar una cantidad suficiente de la sustancia poco soluble en agua mediante el uso de un tensioactivo.

Documento de patente 1: Solicitud de patente japonesa abierta al público (*kokaï*) No. 2005-511586.

30

Divulgación de la invención**Problemas que ha de resolver la invención**

El documento de patente 1 divulga el uso de un fitoesterol o un fitoestanol etoxilado como medio para disolver un principio activo farmacéutico poco soluble en agua. El fitoesterol etoxilado se usa como agente solubilizante, pero debido a su escasa capacidad para solubilizar el fármaco, este agente plantea el problema de que requiere una gran cantidad de tensioactivo para solubilizar el fármaco.

35

El documento JP 54 129114 A divulga composiciones solubilizadas que comprenden un éster de vitamina B6 soluble en grasa (por ejemplo, dicaprilato de piridoxina, dilaurato de piridoxina o dipalmitato de piridoxina) junto con (A) un aducto de fitoestanol y óxido de alquileo (por ejemplo, un aducto de fitoestanol y óxido de etileno (contenido de óxido de etileno: 10-50 (20-40) % molar) o un aducto de fitoestanol y óxido de etileno y óxido de propileno (contenido de óxido de etileno: 10-40 (15-30) % molar; contenido de óxido de propileno: 4-20 (6-16) % molar)) y (B) un éster de sorbitán de ácido graso (por ejemplo, monooleato de sorbitán o sesquiolato de sorbitán).

40

45

A la vista de lo anterior, un objetivo de la presente invención es proporcionar medios para mejorar la capacidad de solubilización de una sustancia poco soluble en agua o de dispersión de la sustancia en agua.

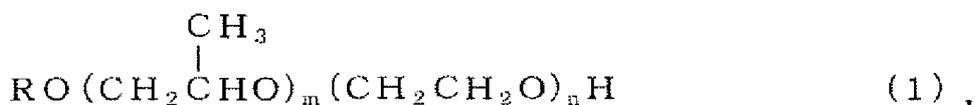
Medios para resolver los problemas

A fin de conseguir el objetivo mencionado anteriormente, los presentes inventores han llevado a cabo estudios sobre un ingrediente que muestra una excelente capacidad para solubilizar una sustancia poco soluble en agua o para dispersar la sustancia en agua, y han descubierto que el fitoesterol o el fitoestanol con polioxietileno-polioxipropileno añadido muestra una excelente capacidad para solubilizar una sustancia poco soluble en agua o para dispersar la sustancia en agua. La presente invención se ha realizado sobre la base de este descubrimiento.

50

55

De acuerdo con ello, la presente invención proporciona una composición que contiene agua y que comprende agua; al menos un fitoesterol o un fitoestanol con polioxietileno-polioxipropileno añadido representado por la siguiente fórmula (1):



60

en la que R representa un residuo de fitoesterol o un residuo de fitoestanol, m es un número de 5 a 50 y n es un número de 10 a 50, siendo la relación de m respecto de n de 1:5 a 5:1, siendo la cantidad de fitoesterol o fitoestanol con polioxietileno-polioxipropileno añadido (1) de un 10 % en masa o inferior basada en la totalidad de la

composición; y

al menos una sustancia poco soluble en agua que tiene, en la estructura química de la misma, dos o más anillos de 6 miembros, siendo la sustancia poco soluble en agua un agente absorbente de UV de triazina,

5 en la que la sustancia poco soluble en agua está en un estado de solubilización (la composición que contiene agua se puede denominar en adelante "la composición que contiene agua de la presente invención"). Tal y como se usa en el presente documento, la expresión "composición que contiene agua" se refiere a una composición que contiene agua. Tal y como se usa en el presente documento, el término "estado disuelto" se refiere al caso en el que, cuando se observa visualmente una sustancia poco soluble en agua contenida en una composición sin la influencia de otros ingredientes, se encuentra que la sustancia está presente uniformemente en la misma en un estado transparente o
10 semitransparente. El "estado transparente o semitransparente" puede ser, por ejemplo, un estado en el que una sustancia poco soluble en agua es termodinámica estable (es decir, "un estado de solubilización"), o un estado en el que la sustancia poco soluble en agua está dispersa en forma de partículas finas en la fase acuosa (es decir, "un estado de dispersión en agua").

15 Normalmente, la composición que contiene agua de la presente invención se puede emplear como una composición de uso externo que se puede aplicar a la piel, el cuero cabelludo, o el pelo, o se puede emplear como base de la composición. Formas de producto específicas de tal composición de uso externo incluyen composiciones cosméticas y agentes de uso externo. Tanto "la composición cosmética" como "el agente de uso externo" están en una forma que se puede aplicar a la piel, el cuero cabelludo, o el pelo, y los conceptos de estas palabras se solapan mutuamente (en particular, la expresión "composición cosmética" incluye "un agente de uso externo"). El caso en el que la composición de uso externo se emplea como agente de uso externo más que como composición cosmética corresponde al caso en el que el agente de uso externo no es un "producto cosmético" con un finalidad principal de belleza, sino como un "fármaco" o "cuasi-fármaco" con una finalidad principal de cuidado de la salud.

25 **Efectos de la invención**

De acuerdo con la presente invención, se proporcionan medios muy excelentes para solubilizar una sustancia poco soluble en agua.

30 **Mejores modos de llevar a cabo la invención**

Tal y como se ha descrito anteriormente, la composición que contiene agua de la presente invención contiene el compuesto (1) junto con agua y una sustancia poco soluble en agua. Tal y como se describe más adelante en el presente documento, el compuesto (1) contenido en la composición que contiene agua de la presente invención
35 puede ser un solo compuesto representado por la fórmula (1), o una mezcla de dos o más compuestos diferentes representados por la siguiente fórmula (1):



40 [en la que R representa un residuo de fitoesterol o un residuo de fitoestanol; m es un número de 5 a 50; y n es un número de 10 a 50].

No se impone ninguna limitación al fitoesterol, que es un compuesto que proporciona un residuo de fitoesterol representado por R en el compuesto (1), y es un esteroles derivado de plantas (F. D. Gunstone y B. G. Herslof, "A Lipid Glossary", *The Oily Press, Air*, 1992). Ejemplos del residuo de fitoesterol representado por R incluyen un residuo de sitosterol, un residuo de campesterol, un residuo de estigmasterol, un residuo de brassicasterol, un residuo de avenasterol y un residuo de ergosterol. Tal y como se ha descrito anteriormente, el compuesto (1) contenido en la composición que contiene agua de la presente invención puede ser una mezcla de dos o más compuestos que tienen diferentes residuos de fitoesterol representados por R.

50 Análogamente, no se impone ninguna limitación particular al fitoestanol, que es un compuesto que proporciona un residuo de fitoestanol representado por R en el compuesto (1), y se obtiene mediante hidrogenación (o saturación) del fitoesterol correspondiente. Ejemplos del residuo de fitoestanol representado por R incluyen sitostanol, campestanol, estigmastanol, brassicastanol, avenastanol y ergostanol. Tal y como se ha descrito anteriormente, el compuesto (1) contenido en la composición que contiene agua de la presente invención puede ser una mezcla de
55 dos o más compuestos que tienen diferentes residuos de fitoestanol representados por R.

El compuesto (1) contenido en la composición que contiene agua de la presente invención puede ser una mezcla de al menos un compuesto que tiene un residuo de fitoesterol representado por R y al menos un compuesto que tiene un residuo de fitoestanol representado por R.

60 En el compuesto (1), m (es decir, el número que representa la longitud de la cadena de polioxipropileno) es de 5 a 50, y n (es decir, el número que representa la longitud de la cadena de polioxietileno) es de 10 a 50.

La relación de m con respecto a n es de 1:5 a 5:1, desde el punto de vista de suprimir la pegajosidad de la composición que contiene agua de la presente invención (es decir, de proporcionar una sensación favorable cuando se usa la misma) y de lograr una mejor estabilidad a lo largo del tiempo.

5 El compuesto (1), que tiene la estructura química anteriormente mencionada, se puede producir mediante un método habitual. Por ejemplo, el compuesto (1) se puede producir fácilmente mediante el procedimiento siguiente: se añade óxido de propileno a fitoesterol en presencia de un catalizador (es decir, primera etapa de la reacción de adición); se retira la materia sin reaccionar; se añade óxido de etileno al producto resultante (es decir, segunda etapa de la reacción de adición); y se retira de nuevo la materia sin reaccionar, seguido de neutralización, deshidratación, desodorización y filtración.

10 La cantidad de compuesto (1) contenido en la composición que contiene agua de la presente invención es de un 10 % en masa o inferior, preferentemente de un 3 % en masa o inferior, basada en la totalidad de la composición. La cantidad de compuesto (1) depende en gran medida de la relación entre la cantidad del mismo y la de la sustancia poco soluble en agua contenida en la composición. La relación en masa del compuesto (1) con respecto a la sustancia poco soluble en agua es preferentemente de 1 o superior, particularmente preferente de 3 o superior (el límite superior de esta relación se determina en función del límite superior de la cantidad del compuesto (1)). Un límite inferior adecuado de la cantidad del compuesto (1) se puede determinar en función de esta relación en masa.

15 La composición que contiene agua de la presente invención debe contener al menos una sustancia poco soluble en agua, que se ha de solubilizar, teniendo dicha sustancia poco soluble en agua, en la estructura química de la misma, dos o más anillos de 6 miembros en la que dicha sustancia poco soluble en agua es un agente absorbente de UV de triazina.

20 Tal y como se usa en el presente documento, la expresión "sustancia poco soluble en agua" se refiere literalmente a una sustancia que es insoluble o difícil de disolver en agua. No se impone ninguna limitación particular a la solubilidad de la sustancia poco soluble en agua en un disolvente distinto al agua.

25 La sustancia poco soluble en agua es un agente absorbente de UV de triazina (por ejemplo, bisresorcilniltiazina, bisetilhexiloxifenol metoxifeniltiazina, (2,4-bis[[4-(2-etilhexiloxi)-2-hidroxi]fenil]-6-(4-metoxifenil)1,3,5-triazina) y octil triazona, (2,4,6-tris[4-(2-etilhexiloxicarbonil)anilino]1,3,5-triazina).

30 De acuerdo con la presente invención, se emplea una sustancia poco soluble en agua que tiene, en la estructura química de la misma, dos o más anillos de 6 miembros. Ejemplos de tal sustancia poco soluble en agua incluyen agentes absorbentes de UV tales como bisetilhexiloxifenol metoxifeniltiazina y octil triazona.

35 De estos, el bisetilhexiloxifenol metoxifeniltiazina exhibe un excelente efecto en cuanto a promover la solubilización cuando se usa en combinación con el compuesto (1).

40 No se impone ninguna limitación particular a la cantidad de la sustancia poco soluble en agua contenida en la composición que contiene agua de la presente invención, siempre que la sustancia poco soluble en agua pueda mantenerse en estado solubilizado en la composición a temperatura ambiente.

45 La relación entre la cantidad de sustancia poco soluble en agua y la del compuesto (1) es tal como se ha descrito anteriormente. La cantidad específica de la sustancia poco soluble en agua se puede determinar considerando, además de la relación descrita anteriormente, la cantidad apropiada de la sustancia de acuerdo con la naturaleza de la misma.

50 La cantidad de agua contenida en la composición que contiene agua de la presente invención es el balance de la composición completa que contiene el compuesto (1) y la sustancia poco soluble en agua, o el balance de la composición completa que contiene el compuesto (1), la sustancia poco soluble en agua y un ingrediente común incorporado a la composición.

55 Una realización de la composición que contiene agua de la presente invención contiene los ingredientes esenciales mencionados anteriormente; es decir, agua, una sustancia poco soluble en agua y un compuesto (1). Gracias a la presencia del compuesto (1), la sustancia poco soluble en agua, que originalmente es difícil de disolver en agua, se solubiliza con facilidad. Preferentemente, la composición que contiene agua de la presente invención se produce, por ejemplo, disolviendo la sustancia poco soluble en agua en el compuesto (1) para preparar de este modo una porción y mezclar esta porción con agua para la solubilización de la sustancia poco soluble en agua.

60 La composición que contiene agua de la presente invención que contiene solo los ingredientes esenciales anteriormente mencionados se puede proporcionar en forma de una composición de uso externo usada en forma de una composición cosmética o un agente de uso externo. La composición de uso externo se puede aplicar a la piel (incluyendo el cuero cabelludo y el pelo) para proporcionar uno o más efectos de la sustancia poco soluble en agua solubilizada (por ejemplo, un efecto terapéutico y un efecto absorbente de UV).

65 La composición que contiene agua de la presente invención que contiene solamente los ingredientes esenciales anteriormente mencionados se puede emplear como base para preparar una composición de uso externo en la que

se incorpora un ingrediente común distinto de los ingredientes esenciales.

Específicamente, una composición final para uso externo de interés se puede producir preparando en primer lugar la composición que contiene agua de la presente invención y, en segundo lugar, incorporando un ingrediente común a la composición.

5 Tal ingrediente común se selecciona teniendo en cuenta, por ejemplo, la provisión de efectos terapéuticos, la coloración, la regulación de los parámetros de producción, el ajuste de la fuerza iónica, el ajuste del pH, o la estabilidad de un producto farmacológico. Ejemplos del ingrediente común incluyen un excipiente, un tampón, una sal, un antioxidante, un conservante, un perfume, un colorante, un tensioactivo, una vitamina soluble en agua y un fármaco soluble en agua. El ingrediente común empleado es, por lo general, una sustancia soluble en agua. No obstante, el ingrediente común empleado puede ser una sustancia poco soluble en agua dependiendo de la forma del producto final. Por ejemplo, el ingrediente común puede ser un ingrediente oleoso líquido que no tiene un anillo de 6 miembros en su estructura.

15 Una composición final para uso externo de interés se puede producir sin usar el proceso de producción descrito anteriormente para una realización de la composición que contiene agua de la presente invención que contiene solamente los ingredientes esenciales. En tal caso, la composición final para uso externo de interés se puede producir, por ejemplo, mediante el siguiente proceso: un ingrediente soluble en agua seleccionado como ingrediente común se disuelve en agua para preparar de este modo una fase acuosa; y la fase acuosa se mezcla con una porción preparada mediante disolución de una sustancia poco soluble en agua en el compuesto (1), para solubilizar de este modo la sustancia poco soluble en agua. Sin embargo, el método para producir la composición final para uso externo de interés no está limitado a este proceso de producción y se puede seleccionar o elaborar apropiadamente teniendo en cuenta la naturaleza de un ingrediente esencial o de un ingrediente común seleccionado. Tal y como se ha descrito anteriormente, la composición que contiene agua de la presente invención se puede proporcionar en forma de dispersión en agua en la que partículas finas de la sustancia poco soluble en agua están dispersas en una fase acuosa.

Ejemplos

30 La presente invención se describirá a continuación con más detalle por medio de ejemplos, los cuales no se deben interpretar como que la invención está limitada a los mismos. A menos que se especifique lo contrario, la cantidad de un ingrediente se representa en "% en masa" con respecto a la cantidad total de una composición en la que se incorpora el ingrediente.

35 [Ejemplos de ensayo]

Una sustancia poco soluble en agua se mezcló y se disolvió con el compuesto (1) o bien con otro tensioactivo, mediante un método habitual. La porción resultante se mezcló con agua para preparar de este modo una muestra de ensayo mostrada en las Tablas 1 a 6 (Ejemplos o Ejemplos Comparativos). La mezcla se evaluó de acuerdo con los criterios que se describen a continuación. Los resultados de las muestras de cada sistema de ensayo se muestran en la tabla correspondiente. En cada tabla, los espacios en blanco en las filas correspondientes a las cantidades de ingredientes incorporados representan un "0 % en masa".

45 (1) Ensayo inmediatamente después de la preparación de la muestra de ensayo (a) Evaluación del estado disuelto.

El estado disuelto de cada muestra de ensayo se evaluó visualmente de acuerdo con los criterios siguientes:

50 AA: transparente;
BB: generalmente transparente;
CC: turbida a semitransparente; y
DD: separación de fases observada.

(b) Evaluación de la transparencia

55 La transparencia de cada muestra de ensayo se evaluó mediante la medición del valor L. El valor L se determinó mediante un espectrofotómetro (UV-160, producto de Shimadzu Corporation). La transparencia (valor L) de cada muestra de ensayo se evaluó sobre la base de la transparencia del agua destilada como control (valor L = 100) de acuerdo con los siguientes criterios:

60 90 o más: transparente;
70 a 90: generalmente transparente;
menos de 70: turbida a semitransparente; y
no determinada: separación de fases observada.

65

(c) Sensación durante el uso

La sensación durante el uso cada muestra de ensayo fue evaluada por 10 personas expertas de acuerdo con los criterios siguientes:

- O: 5 o más de las 10 personas expertas evaluaron que la muestra de ensayo no mostraba pegajosidad;
- Δ.: de 3 a 4 de las 10 personas expertas evaluaron que la muestra de ensayo no mostraba pegajosidad; y
- X: de 0 a 2 de las 10 personas expertas evaluaron que la muestra de ensayo no mostraba pegajosidad.

(2) Ensayo del cambio respecto al tiempo

Cada una de las muestras de ensayo preparada anteriormente se almacenó a 50 °C durante un mes y se midió el valor L de la muestra así almacenada de un modo similar al descrito anteriormente. Se evaluó la estabilidad a lo largo del tiempo para cada muestra de ensayo sobre la base de la diferencia entre el valor L determinado inmediatamente después de la preparación y el valor L determinado tras un mes de almacenamiento. Se usaron los siguientes criterios para la evaluación. Los valores L determinados después de un almacenamiento de un mes se muestran en las tablas correspondientes.

- AA: diferencia del valor L ≤ 2 (\pm);
- BB: diferencia del valor L ≤ 5 (\pm);
- CC: diferencia del valor L ≤ 10 (\pm); y
- DD: diferencia del valor L > 10 (\pm); o separación de fases observada.

<Sistema de ensayo 1>

[Tabla 1]

	Ej. Comp. 1	Ej. Comp. 2	Ej. Comp. 3	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3 ⁽¹⁾	Ej. 4 ⁽¹⁾
Agua intercambio iónico	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100
Aceite de ricino hidrogenado POE	0,3	-	-	-	-	-	-
Decil tetradecil éter con POE-POP añadido	-	0,3	-	-	-	-	-
Fitoesterol POE (30)	-	-	0,3	-	-	-	-
Fitoesterol POE (25) - POP (20)	-	-	-	0,3	1,5	0,4	1,0
Bisetilhexiloxifenol metoxifeniltriazina	0,1	0,1	0,1	0,1	0,1	-	-
Finasterida	-	-	-	-	-	0,1	0,1
Estado disuelto (inmediatamente después de la preparación)	DD	DD	CC	AA	AA	AA	AA
Valor L (inmediatamente después de la preparación)	6	4	42	96	99	97	98

⁽¹⁾ no cae dentro del alcance de la presente invención

Como se muestra en la Tabla 1, el tensioactivo contenido en la muestra de ensayo del Ejemplo Comparativo 1 o 2; que no tiene el esqueleto fitoesteroilo, exhibía una peor capacidad para solubilizar una sustancia poco soluble en agua; es decir, se encontró que el tensioactivo no era adecuado para la solubilización de la sustancia.

Si bien el tensioactivo contenido en la muestra de ensayo del Ejemplo Comparativo 3 tiene un esqueleto fitoesteroilo, el tensioactivo no tiene un esqueleto de polioxipropileno. Por tanto, el tensioactivo exhibía una peor capacidad para solubilizar una sustancia poco soluble en agua; es decir, el tensioactivo no consiguió solubilizar la sustancia a un nivel práctico.

El compuesto (1) contenido en cada una de las muestras de los Ejemplos 1 a 4 solubilizó una sustancia poco soluble en agua a un nivel prácticamente suficiente.

<Sistema de ensayo 2>

El sistema de ensayo mostrado en la Tabla 2 se centraba en la relación del número de unidades de OE (n) con respecto al de unidades de OP (m) en el compuesto (1). Por tanto, la relación se muestra también en la tabla.

5

[Tabla 2]

	Ej. 5(*)	Ej. 6	Ej. 7	Ej. 8	Ej. 9(*)	Ej. 10(*)
Agua intercambio iónico	hasta 100					
Fitoesterol POE (3) - POP (45)	0,5	-	-	-	-	-
Fitoesterol POE (15) - POP (30)	-	0,5	-	-	-	-
Fitoesterol POE (40) - POP (20)	-	-	0,5	-	-	-
Fitoesterol POE (20) - POP (5)	-	-	-	0,5	-	-
Fitoesterol POE (70) - POP (7)	-	-	-	-	0,5	-
Fitoesterol POE (100) - POP (2)	-	-	-	-	-	0,5
2,4,6-tris[4-(2-etilhexiloxicarbonil)anilino]1,3,5-triazina	0,1	0,1	0,1	0,1	0,1	0,1
Relación OE/OP del tensioactivo	1/15	1/3	2/1	4/1	10/1	50/1
Estado disuelto (inmediatamente después de la preparación)	AA	AA	AA	AA	AA	AA
Valor L (inmediatamente después de la preparación)	90	92	97	98	98	99
Sensación durante el uso (inmediatamente después de la preparación)	O	O	O	O	Δ	Δ
Estabilidad a lo largo del tiempo	BB	AA	AA	AA	AA	AA
Valor L tras 1 mes de almacenamiento a 50 °C	86	92	97	98	98	99
(*) no cae dentro del ámbito de protección						

10

Tal y como se muestra en la Tabla 2, la muestra de ensayo del Ejemplo 5, en la que el número (moles) de unidades de óxido de etileno añadido es 5 o inferior, y la relación del número (moles) de unidades de óxido de etileno añadido con respecto al de unidades de óxido de propileno añadido es de 1/50 o inferior, exhibía una estabilidad a lo largo del tiempo ligeramente peor.

15

La muestra de ensayo del Ejemplo 10, en la que el número (moles) de unidades de óxido de propileno añadido es 5 o inferior, y la relación del número (moles) de unidades de óxido de etileno añadido con respecto al de unidades de óxido de propileno añadido es de 50 o superior, exhibía pegajosidad durante el uso.

20

La muestra de ensayo del Ejemplo 9, en la que la relación del número (moles) de unidades de óxido de etileno añadido con respecto al de unidades de óxido de propileno añadido es de 5/1 o superior, exhibía pegajosidad durante el uso.

25

Las muestras de ensayo de los Ejemplos 6 a 8, en las que el número (moles) de unidades de óxido de etileno añadido es de 5 a 100, el número (moles) de unidades de óxido de propileno añadido es de 5 a 100, y la relación del número (moles) de unidades de óxido de etileno añadido con respecto al de unidades de óxido de propileno añadido es de 5/1 a 1/5, exhibía buen aspecto, buena sensación durante el uso y buena estabilidad a lo largo del tiempo.

<Sistema de ensayo 3>

30

El sistema de ensayo mostrado en la Tabla 3 se centró en la relación en masa del compuesto (1) con respecto a la sustancia poco soluble en agua. Por tanto, la relación se muestra también en la tabla.

[Tabla 3]

	Ej. 11 ⁽¹⁾	Ej. 12 ⁽¹⁾	Ej. 13 ⁽¹⁾	Ej. 14 ⁽¹⁾
Agua intercambio iónico	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100
Fitoesterol POE (40) - POP (30)	3,0	1,5	0,8	0,4
4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano	0,2	0,3	0,4	0,8
Relación de compuesto(1)/sustancia poco soluble en agua	15/1	5/1	2/1	2/1
Evaluación del aspecto	AA	AA	AA	BB
Valor L	98	99	96	85
Sensación durante el uso	O	O	O	O
Estabilidad a lo largo del tiempo	AA	AA	AA	BB
Valor L tras 1 mes de almacenamiento a 50 °C	98	99	95	81
⁽¹⁾ no cae dentro del alcance de la presente invención				

La muestra de ensayo del Ejemplo 14, en la que la relación en masa del compuesto (1) con respecto a la sustancia poco soluble en agua es 1 o inferior, exhibía un estado ligeramente semitransparente.

5 Las muestras de ensayo de los Ejemplos 11 a 13, en las que la en la relación en masa del compuesto (1) con respecto a la sustancia poco soluble en agua es 1 o superior, exhibían buen aspecto, buena sensación durante el uso y buena estabilidad.

10 <Sistema de ensayo 4>

[Tabla 4]

	Ej. 15 ⁽¹⁾	Ej. 16 ⁽¹⁾	Ej. 17 ⁽¹⁾	Ej. 18 ⁽¹⁾	Ej. 19 ⁽¹⁾
Agua intercambio iónico	hasta 100				
Fitoesterol POE (40) - POP (30)	0,4	0,4	0,4	0,4	0,4
Acetato de vitamina E	0,2	-	-	-	-
p-Metoxicinamato de 2-etilhexilo	-	0,2	-	-	-
Dietilaminohidroxibenzoilbenzoato de hexilo	-	-	0,2	-	-
2-[2-Hidroxi-4-(2-etilhexil)fenoxi]-2H-benzotriazol	-	-	-	0,2	-
Acrilato de 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenilo	-	-	-	-	0,2
Evaluación del aspecto	AA	AA	AA	AA	AA
Valor L	95	97	94	98	96
Estabilidad a lo largo del tiempo	BB	BB	AA	AA	AA
Valor L tras 1 mes de almacenamiento a 50 °C	91	93	94	97	96
⁽¹⁾ no cae dentro del alcance de la presente invención					

15 Cada una de las muestras de ensayo de los Ejemplos 15 y 16, que contiene una sustancia poco soluble en agua que tiene solo un anillo de 6 miembros en la estructura química de la misma, exhibía un buen aspecto (es decir, la sustancia se solubilizó en el compuesto (1), pero no pudo conseguir los mejores resultados en términos de estabilidad a lo largo del tiempo.

20 Cada una de las muestras de ensayo de los Ejemplos 17 a 19, que contenía el compuesto (1) y una sustancia poco soluble en agua que tiene dos o más anillos de 6 miembros en la estructura química de la misma, exhibía buen aspecto y buena estabilidad.

<Sistema de ensayo 5>

25 El sistema de ensayo mostrado en la Tabla 5 empleó una formulación (agente de uso externo) que contenía ingredientes comunes, además de los ingredientes esenciales de la composición que contiene agua de la presente

invención. Para la preparación de cada muestra de ensayo, se mezclaron los ingredientes comunes correspondientes (ingredientes solubles en agua) con agua de intercambio iónico para preparar de este modo una porción de fase acuosa, y posteriormente esta porción de fase acuosa se mezcló con una porción preparada mediante disolución de la sustancia poco soluble en agua en el compuesto (1).

5

[Tabla 5]

	Ej. 20	Ej. 21	Ej. 22	Ej. 23
Agua intercambio iónico	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100
Etanol	5,0	5,0	5,0	5,0
Glicerina dinamita	3,0	3,0	3,0	3,0
Dipropilenglicol	2,0	2,0	2,0	2,0
Dimetil éter POE (14) - POP (7)	1,0	1,0	1,0	1,0
Fitoesterol POE (40) - POP (30)	0,4	0,4	0,4	0,4
Ácido cítrico	0,05	0,05	0,05	0,05
Citrato sódico	0,05	0,05	0,05	0,05
Ascorbato sódico	2,0	-	-	-
Ácido tranexámico	1,0	2,0	0,5	-
4-Metoxisalicilato de potasio	-	-	1,0	1,0
Fenoxietanol	0,5	0,5	0,5	0,5
Perfume	0,01	0,01	0,01	0,01
Rojo n.º 227	0,0001	0,0001	0,0001	0,0001
Bisetilhexiloxifenol metoxifeniltriazina	0,1	0,1	0,1	0,1
Evaluación del aspecto	AA	AA	AA	AA
Valor L	97	98	96	99
Sensación durante el uso	O	O	O	O
Estabilidad a lo largo del tiempo	AA	AA	AA	AA
Valor L tras 1 mes de almacenamiento a 50 °C	96	98	96	98

Como queda claro de los datos de las muestras de ensayo de los Ejemplos 20 a 23, los efectos originales de la composición que contiene agua de la presente invención no se ven impedidos incluso en un sistema que contiene ingredientes comunes.

10

<Sistema de ensayo 6>

El sistema de ensayo mostrado en la Tabla 6 empleó una formulación (composición cosmética para el pelo) que contenía ingredientes comunes, además de los ingredientes esenciales de la composición que contiene agua de la presente invención. Para la preparación de cada muestra de ensayo, se mezclaron los ingredientes comunes correspondientes (ingredientes solubles en agua) con agua de intercambio iónico para preparar de este modo una porción de fase acuosa, y posteriormente esta porción de fase acuosa se mezcló con una porción preparada mediante disolución de la sustancia poco soluble en agua en el compuesto (1).

20

[Tabla 6]

	Ej. 24 ⁽¹⁾	Ej. 25	Ej. 26
Agua intercambio iónico	hasta 100	hasta 100	hasta 100
Etanol	10	10	10
Propilenglicol	2,0	2,0	2,0
Dipropilenglicol	1,0	1,0	1,0
Dimetil éter POE (14) - POP (7)	1,0	1,0	1,0

ES 2 583 165 T3

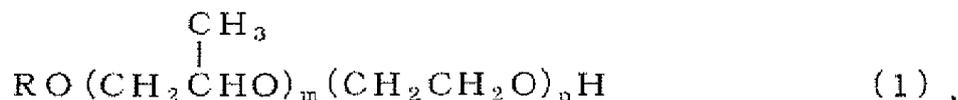
Fitoesterol POE (20) - POP (10)	0,8	0,8	0,8
Ácido cítrico	0,05	0,05	0,05
Citrato sódico	0,05	0,05	0,05
Finasterida	0,1	0,1	-
Cloruro de esteariltrimetilamonio	0,1	0,1	0,1
Fenoxietanol	0,5	0,5	0,5
Perfume	0,01	0,01	0,01
Bisetilhexiloxifenol metoxifeniltriazina	-	0,1	0,1
Evaluación del aspecto	AA	AA	AA
Valor L	99	99	97
Sensación durante el uso	O	O	O
Estabilidad a lo largo del tiempo	AA	AA	AA
Valor L tras 1 mes de almacenamiento a 50 °C	99	98	97
(1) no cae dentro del alcance de la presente invención			

Como queda claro de los datos de las muestras de ensayo de los Ejemplos 24 a 26, los efectos originales de la composición que contiene agua de la presente invención no se ven impedidos incluso en un sistema que contiene ingredientes comunes.

REIVINDICACIONES

1. Una composición que contiene agua, que comprende agua;

5 al menos un fitoesterol o un fitoestanol con polioxietileno-polioxipropileno añadido representado por la siguiente fórmula (1):



10 en la que R representa un residuo de fitoesterol o un residuo de fitoestanol, m es un número de 5 a 50 y n es un número de 10 a 50, siendo la relación de m respecto de n de 1:5 a 5:1, siendo la cantidad de fitoesterol o de fitoestanol con polioxietileno-polioxipropileno añadido (1) de un 10 % en masa o inferior basada en la totalidad de la composición; y

15 al menos una sustancia poco soluble en agua que tiene, en la estructura química de la misma, dos o más anillos de 6 miembros, siendo la sustancia poco soluble en agua un agente absorbente de UV de triazina, en la que la sustancia poco soluble en agua está en un estado de solubilización.

20 2. La composición que contiene agua de acuerdo con la reivindicación 1, que consiste en agua; el fitoesterol o el fitoestanol con polioxietileno-polioxipropileno añadido representado por la fórmula (1); y una sustancia poco soluble en agua.

3. La composición que contiene agua de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2, en la que la relación en masa del fitoesterol o del fitoestanol con polioxietileno-polioxipropileno añadido (1) con respecto a la sustancia poco soluble en agua es 1 o superior.

25 4. La composición que contiene agua de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en la que el residuo de fitoesterol es uno o más residuos de fitoesterol seleccionados entre el grupo que consiste en un residuo de sitosterol, un residuo de campesterol, un residuo de estigmasterol, un residuo de brassicasterol, un residuo de avenasterol y un residuo de ergosterol.

30 5. La composición que contiene agua de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en la que el residuo de fitoestanol es uno o más residuos de fitoestanol seleccionados entre el grupo que consiste en un residuo de sitostanol, un residuo de campestanol, un residuo de estigmastanol, un residuo de brassicastanol, un residuo de avenastanol y un residuo de ergostanol.

35 6. La composición que contiene agua de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en la que el agente absorbente de UV de triazina es bisetilhexiloxifenol metoxifenil triazina o (2,4,6-tris[4-(2-etilhexiloxicarbonil)anilino]-1,3,5-triazina).

40 7. La composición que contiene agua de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, que es una composición de uso externo.

8. La composición que contiene agua de acuerdo con la reivindicación 7, en donde la composición de uso externo es una composición cosmética.

45 9. La composición que contiene agua de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, que es una base para producir una composición de uso externo.