(19) OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 685 781**

(51) Int. CI.:

A61K 8/34 (2006.01)
A61K 8/365 (2006.01)
A61Q 19/00 (2006.01)
A61K 8/06 (2006.01)

(12) TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA T3

(86) Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **15.12.2010 PCT/US2010/060386**

(87) Fecha y número de publicación internacional: **30.06.2011 WO11078991**

(96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **15.12.2010 E 10839991 (6)**

(97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.05.2018 EP 2515828**

(54) Título: **Emulsiones de glicerina en aceite estabilizadas**

(30) Prioridad:

22.12.2009 US 289047 P

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
11.10.2018

(73) Titular/es:

AVON PRODUCTS, INC. (100.0%)
777 Third Avenue
New York, NY 10017, US

(72) Inventor/es:

BINDER, DAVID ALLAN;
MEI, BING C.;
DO, THI N.;
WILLMS, GEORGE y
BAGHDADI, HOSSEIN A.

(74) Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

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

Emulsiones de glicerina en aceite estabilizadas

CAMPO DE LA INVENCIÓN

La presente invención se relaciona con métodos y composiciones para estabilizar las emulsiones de glicerina-en-aceite. Más específicamente, la invención se relaciona con composiciones terapéuticas y cosméticas estabilizadas para la aplicación tópica en la superficie exterior y piel de la cara y el cuerpo, con inclusión de los labios.

ANTECEDENTES DE LA INVENCIÓN

Los alcoholes polihídricos, como glicerina tiene propiedades humectantes cuando se aplican a la piel y labios. Como tales, los lápices labiales tradicionales y productos para labios agrietados han incluido alcoholes polihídricos como glicerina en sus formulaciones. Dichos productos son generalmente sólidos cerosos en base a agentes espesantes, como ozoquerita, cera de abejas y cera de candelilla. Por ejemplo, la Patente de los Estados Unidos N.º 6.090.386 y la Patente de los Estados Unidos N.º 6.325.995 cada una describe lápices labiales que contienen aproximadamente 2-20% de glicerina u otro humectante hidrofílico. Sin embargo, los productos descriptos en la presente están basados en cera, y mantienen una consistencia dura o persistente.

Las emulsiones de glicerina en aceite que puede proporcionar mayores cantidades de glicerina en comparación con los productos basados en cera y formulaciones suaves para mayor comodidad en los labios se sabe que pueden tener problemas de estabilidad. Por ejemplo, véase la Patente de los Estados Unidos N.º 4.254.104, que describe la falla de intentos anteriores de la técnica de proporcionar emulsiones de glicerina-en-aceite estables con aceite de oliva y agentes activos de superficie. Se cree que los problemas de estabilidad de las emulsiones de glicerina-en-aceite se deben al menos en parte a la mayor diferencia en densidad entre la glicerina y el aceite en comparación con el agua y el aceite. En consecuencia, las formulaciones suaves proporcionaron una alternativa a la falla de los lápices labiales duros o persistentes tradicionales de incorporar glicerina u otros humectantes hidrofílicos. Por ejemplo, véase la Patente de los Estados Unidos N.º 4.996.044, que describe formulaciones suaves para aplicar a los labios que están libres de glicerina u otros componentes hidrofílicos.

El documento JP 2008-239550 A divulga cosméticos gelificados de alcohol polihídrico en aceite que comprenden glicerina y aceite de ricino hidrogenado.

Las emulsiones de glicerina-en-aceite son particularmente inestables cuando se exponen a extremos de temperatura y, en particular en temperaturas más altas y temperaturas oscilantes que implican frío y calor. Estas temperaturas extremos y cambios pueden dar por resultado la separación de fases o quiebre de la emulsión. Dichos problemas de estabilidad disminuyen la aceptación del consumidor de productos basados en glicerina, ya que el consumidor generalmente puede considerar que un producto con fases separadas o con lixiviación entre fases es insatisfactorio.

Por lo tanto, un objetivo de la presente invención es proporcionar composiciones cosméticas y terapéuticas para la aplicación en la superficie externa y piel de la cara y el cuerpo, con inclusión de los labios, en donde las composiciones con emulsiones de glicerina-en-aceite con estabilidad mejorada en el tiempo o estabilidad mejorada cuando se exponen a altas temperaturas.

SÍNTESIS DE LA INVENCIÓN

De conformidad con los objetivos anteriores y otros, la presente invención proporciona composiciones y métodos para estabilizar las emulsiones para el uso tópico, particularmente, como cosméticos para la piel, la cara y labios. Las emulsiones son emulsiones de glicerina-en-aceite que pueden opcionalmente ser anhidras. Las emulsiones se estabilizan para proporcionar mayor duración al producto minorista, ya sea a temperatura ambiente o en temperaturas extremas que pueden enfrentar el producto minorista.

Cuando se incorporan en los productos del consumidor, las emulsiones de acuerdo con la invención pueden tener propiedades reológicas para proporcionar composiciones cremosas que pueden preferentemente administrarse a través de un recipiente flexible o aplicador cosmético adecuado. Dichas propiedades reológicas pueden incluir viscosidad, corte dependiente de viscosidad y/o constante elástica (G'). En una realización, se ha hallado sorprendentemente que dichos productos pueden estabilizarse para evitar el quiebre o separación entre la fase de glicerina y la fase de aceite mediante el agregado de una combinación de trihidroxiestearina y ácido 12-hidroxiesteárico en una cantidad adecuada para proporcionar una viscosidad para la emulsión a temperatura ambiente entre aproximadamente 2000 centipoise y aproximadamente 3 millones centipoise como se midió mediante un Viscosímetro Brookfield (por ejemplo, Modelo DV-E, Brookfield Engineering Laboratories, Inc.). En una realización, se ha hallado que los productos pueden realizarse con una fase continua que presenta una constante elástica (G') > 0 que es esencialmente independiente de temperatura a temperaturas entre aproximadamente 20˚C a aproximadamente 45˚C, o preferentemente 20˚C a aproximadamente 60˚C, o más preferentemente 20˚C a aproximadamente 80˚C. Por lo tanto, con una mayor estabilización, es posible formular una variedad de productos en la forma de una emulsión que tienen atributos estéticos y funcionales mejorados en el tiempo.

En un aspecto de la invención, se proporciona una emulsión de glicerina-en-aceite. La emulsión incluye (i) una fase continua que comprende uno o más aceites tópicamente aceptables, (ii) una fase discontinua que comprende glicerina como el principal componente, y (iii) una combinación de trihidroxiestearina y ácido 12-hidroxiesteárico. Cuando se compara con una emulsión de otro modo idéntica que carece de trihidroxiestearina y/o ácido 12-hidroxiesteárico, una emulsión de acuerdo con la invención tiene estabilidad mejorada en el tiempo o cuando se la enfrenta con temperaturas más altas. La estabilidad mejorada puede hallarse en una realización luego del calentamiento a aproximadamente 49°C durante dos días. En forma alternativa, la composición de la invención puede presentar estabilidad mejorada luego de una semana a aproximadamente 49°C. En una realización, el desafío de la estabilización puede ocurrir a aproximadamente 60°C durante doce horas o, en forma alternativa, durante una semana.

A los fines de alcanzar la estabilización deseada de la emulsión de glicerina-en-aceite, la cantidad de trihidroxiestearina y ácido 12-hidroxiesteárico en combinación es adecuada para proporcionar una viscosidad para la emulsión a temperatura ambiente entre aproximadamente 2000 centipoise y aproximadamente 3 millones centipoise como se midió mediante un Viscosímetro Brookfield (por ejemplo, Modelo DV-E). En una realización las propiedades reológicas son tales que la emulsión tiene una consistencia adecuada para extraerla de un tubo flexible o un recipiente similar. En una realización, la trihidroxiestearina están presente en un rango desde aproximadamente 0,5% a aproximadamente 2,5% en peso de la emulsión, y dicho ácido 12-hidroxiseteárico está presente en una rango desde aproximadamente 0,2% a aproximadamente 1,5% en peso de la emulsión. Generalmente, la emulsión además comprende uno o más emulsionantes en un rango total desde aproximadamente 0,5% a aproximadamente 6,0% en peso de la emulsión.

En una realización, los aceites tópicamente aceptables están presentes en un rango desde aproximadamente 40% a aproximadamente 90% en peso de la emulsión, la glicerina está presente en un rango desde aproximadamente 5% a aproximadamente 60% en peso de la emulsión, la trihidroxiestearina está presente en un rango desde aproximadamente 0,5% a aproximadamente 2,5% en peso de la emulsión, el ácido 12-hidroxiesteárico está presente en un rango desde aproximadamente 0,2% a aproximadamente 1,5% en peso de la emulsión, y uno o más emulsionantes están presentes en un rango total desde aproximadamente 0,5 a aproximadamente 6,0% en peso de la emulsión.

Generalmente, la fase continua de la emulsión de acuerdo con la invención comprende una o más aceites tópicamente aceptables y la fase discontinua comprende glicerina como el componente principal. El agua puede estar presente en la emulsión, generalmente en la fase discontinua. En una realización, la emulsión es esencialmente anhidra. Las emulsiones de acuerdo con la invención pueden utilizarse en las composiciones cosméticas, y como tales componentes adicionales generalmente están presentes. Dichos componentes pueden incluir uno o más pigmentos, ceras, emolientes, humectantes, conservantes, saborizantes, antioxidantes, extractos botánicos y mezclas de los mismos. Los componentes adicionales pueden estar presentes en cualquiera o ambas fases de la emulsión, o pueden formar parte de una fase separada.

La emulsión de la invención puede ser útil para un variedad de productos, con inclusión de productos cosméticos para labios y cara, productos tópicos para la piel, como lociones para la piel y pantallas solares y productos terapéuticos, como cremas hemorroidales o lociones de administración de fármaco tópicas. En una realización, la emulsión de acuerdo con la invención forma una composición adecuada para la aplicación a los labios, como un humectante de labios. Cuando se empaqueta como un producto del consumidor, como un producto para labios, las composiciones de acuerdo con la invención, generalmente, se empaquetan en un recipiente que puede cerrarse nuevamente que tiene una cámara al menos parcialmente cargada con dicha composición cosmética y una tapa unida en forma reversible dicho recipiente para el sellado de los contenidos de la cámara cuando en están en una posición cerrada y para permitir que dichos contenidos se dispersen cuando está en una posición abierta. Los productos para labios de acuerdo con la invención incluyen crema para labios, bálsamo para labios, brillo para labios, tratamiento para labios medicado, humectante para labios, cosméticos para labios, pantalla soplar para labios, y saborizante para labios, y similares.

Estos y otros aspectos de la presente invención serán evidentes para aquellos con experiencia en la técnica de acuerdo con la presente descripción, con inclusión de las reivindicaciones.

BREVE DESCRIPCIÓN DE LOS DIBUJOS

La Figura 1 muestra un gráfico de la viscosidad versus la temperatura de varias muestras de acuerdo con el Ejemplo 4.

La Figura 2 muestra un gráfico de la constante elástica (G') versus la temperatura de varias muestras de acuerdo con el Ejemplo 4.

La Figura 3 muestra un gráfico de la constante elástica (G') versus la temperatura de varias muestras en escala lineal de acuerdo con el Ejemplo 4.

La Figura 4 muestra un gráfico de la constante elástica (G') versus la temperatura de varias ceras de acuerdo con el Ejemplo 4.

DESCRIPCIÓN DETALLADA

La presente invención proporciona composiciones y métodos para estabilizar las emulsiones de glicerina-en-aceite para uso tópico, particularmente como cosméticos para la piel, la cara y labios. Una emulsión de glicerina-en-aceite estabilizada de acuerdo con la invención que comprende (i) una fase continua que comprende uno o más aceites tópicamente aceptables, (ii) una fase discontinua que comprende glicerina como el componente principal, y (iii) una combinación de trihidroxiestearina y ácido 12-hidroxiesteárico en una cantidad adecuada para proporcionar una viscosidad para la emulsión a temperatura ambiente entre aproximadamente 2000 centipoise y aproximadamente 3 millones centipoise como se midió mediante un Viscosímetro Brookfield (por ejemplo, Modelo DV-E). Sin desear estar limitados por la teoría, se cree que la combinación específica de trihidroxiestearina y ácido 12-hidroxiesteárico resuelve el problema de proporcionar una viscosidad suficientemente baja a temperatura ambiente de manera que la emulsión de glicerina-en-aceite puede administrarse en un tubo flexible o dispositivo similar mientras que también proporciona estabilidad física para la emulsión al momento de la exposición a temperaturas más altas. Las composiciones de acuerdo con la invención pueden presentar una constante elástica (G') que es esencialmente independiente de temperatura a temperaturas entre aproximadamente 20ºC a aproximadamente 45ºC, o preferentemente 20ºC a aproximadamente 60ºC, o más preferentemente 20ºC a aproximadamente 80ºC.

Como se utiliza en la presente, las emulsiones estabilizadas de la invención poseen estabilidad mejorada en comparación con una emulsión de otro modo idéntica que no contiene trihidroxiestearina y/o ácido 12-hidroxisteárico. La estabilidad puede medirse mediante una variedad de métodos de acuerdo con las técnicas cosméticas. Por ejemplo, una prueba de estabilidad puede llevarse a cabo mediante el calentamiento de la composición de prueba a aproximadamente 49°C durante un periodo de tiempo, como una noche, un día, dos días, tres días, cuatro días, cinco días, seis días, dos semanas, tres semanas, un mes o similares. En forma alternativa, una prueba de estabilidad puede llevarse a cabo mediante el calentamiento de la composición de prueba a aproximadamente 60°C durante una hora, seis horas, doce horas, 18 horas, un día, dos días, tres días, cuatro días, cinco días, seis días, una semana, dos semanas, tres semanas, un mes o similares. En una realización, la estabilidad se evalúa mediante la realización de uno o más ciclos de congelamiento/ descongelamiento, a pesar de que las emulsiones de glicerina-en-aceite generalmente no poseen el grado de inestabilidad de congelamiento/ descongelamiento de las emulsiones de agua-en-aceite, porque la glicerina no cristaliza como agua con una expansión de volumen. La evaluación de la estabilidad puede ser mediante la inspección visual cualitativa o puede ser calibrada numéricamente mediante la medición del tamaño de separación entre fases o través del crecimiento de las bandas de separación. En una realización, una emulsión estable no tiene separación visible. Mediante la frase "de otro modo idéntica" se hace referencia a que los componentes individuales y las cantidades de los componentes son las mismas con la excepción del material excluido, que puede reemplazarse proporcionalmente por todos los componentes restantes, o reemplazarse en su totalidad mediante el componente portador predominante, por ejemplo, glicerina en la fase discontinua.

En una realización, una emulsión de glicerina-en-aceite estabilizada de acuerdo con la invención comprende un fase continua que comprende uno o más aceites tópicamente aceptables, una fase discontinua que comprende glicerina como el componente principal, y una fase continua que presenta una constante elástica (G') > 0 que es esencialmente independiente de temperatura a temperaturas entre aproximadamente 20˚C a aproximadamente 45˚C, o preferentemente 20˚C a aproximadamente 60˚C, o más preferentemente 20˚C a aproximadamente 80˚C.

Los ejemplos ilustrativos adecuados de aceites para la fase continua incluyen aceites naturales y sintéticos, con inclusión de aceite animal, vegetal, y de petróleo; triglicéridos de ácidos grasos; ésteres de ácidos grasos, como octil palmitato, isopropil miristato e isopropil palmitato; éteres, como dicapril éter; alcoholes grasos, como alcohol cetílico, alcohol estearílico y alcohol behenílico; esteroles; hidrocarburos, como isooctano, isododecano, isohexadecano, decano, dodecano, tetradecano, tridecano, isoparafinas C_{8-20}, aceite mineral, petrolato, isoeicosano y poliisobuteno; ésteres colesterol C_{10-30}/lanosterol; lanolina; y similares. Los hidrocarburos representativos incluyen hidrocarburo parafínicos disponibles de Exxon bajo la marca ISOPARS, y de Permethyl Corporation. Asimismo, los hidrocarburos parafínicos C_{8-20}, como isoparafina C_{12} (isododecano) fabricados por Permethyl Corporation que tienen el nombre comercial Permethyl 99A™ también se contemplan como adecuados. Varias isosparafinas C_{16} disponibles en el comercio, como isohexadecano (que tienen el nombre comercial Permethyl R™) también son adecuadas. Los aceites de silicona, como dimeticonas, siliconas cíclicas, y polisiloxanos también puede incluirse en la fase continua. En una realización, los aceites de silicona están presentes en una cantidad inferior a aproximadamente 5% en peso de la fase continua.

En una realización preferida, la fase continua incluye lanolina de bajo olor. Mientras que no se intenta estar limitados por la teoría, se cree que la lanolina proporciona una barrera no soluble en agua cuando se aplica tópicamente que limita la pérdida de agua transepidérmica. Otros componentes que pueden proporcionar beneficios similares y que también pueden ser adecuados para la fase continua incluyen aceite de linaza, aceite de jojoba, petrolato, aceite mineral, lanosterol, ésteres de colesterol, escualeno, aceites de triglicéridos, y ceras de baja fusión.

En sus aspectos más amplios, la fase discontinua puede comprender en su porción principal uno o más alcoholes polihídricos, por ejemplo, a título ilustrativo glicoles C_{3-8}, con inclusión de glicerina, propilenglicol, butilenglicol, pentilenglicol, neopentilglicol, o carpilil glicol. En forma alternativa, la fase discontinua puede comprender en su porción principal polietilenglicoles, como etoxidiglicol.

La fase discontinua comprende glicerina, como el componente principal. En una realización, la glicerina es glicerina del grado USP. La glicerina utilizada para la fase discontinua puede incluir algo de agua. En algunas realizaciones, el solvente para la fase discontinua puede consistir esencialmente de glicerina, lo que significa que no se agregan en forma intencional solventes adicionales a la fase discontinua, a pesar de que debe reconocerse que una composición que consiste esencialmente de glicerina puede contener una cantidad menor de agua, por ejemplo, desde aproximadamente 0,1% a aproximadamente 4% en peso de agua, que puede estar presente en una glicerina de grado cosmético.

Mediante la expresión componente principal se hace referencia a glicerina que está presente en más de 50% en peso de la fase discontinua. Generalmente, la fase discontinua será al menos aproximadamente 55% de glicerina, al menos aproximadamente 60% en peso de glicerina, al menos aproximadamente 65% de glicerina, al menos aproximadamente 70% de glicerina, al menos aproximadamente 75% glicerina, al menos aproximadamente 80% de glicerina, al menos aproximadamente 85% de glicerina, al menos aproximadamente 90% de glicerina, o al menos aproximadamente 95% de glicerina. Generalmente, la cantidad total de glicerina en la emulsión variará entre aproximadamente 5% a aproximadamente 50% en peso de la emulsión. Por ejemplo, la cantidad de glicerina en la emulsión puede ser aproximadamente 10%, aproximadamente 15%, aproximadamente 20%, aproximadamente 25%, aproximadamente 30%, aproximadamente 35%, aproximadamente 40%, o aproximadamente 45% en peso de la emulsión, o valores intervinientes, como aproximadamente 26%, aproximadamente 27%, aproximadamente 28%, y aproximadamente 29%.

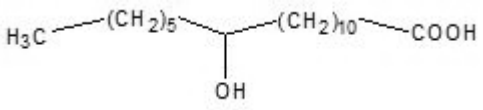
Puede incluirse agua en la fase discontinua a menos del 50% en peso de la fase discontinua. En ciertas realizaciones, la cantidad total de agua en la emulsión será menos de aproximadamente 20% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 15% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 10%, menos de aproximadamente 9% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 8% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 7% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 6% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 5% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 4% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 3% en peso de la emulsión total, menos de aproximadamente 2% en peso de la emulsión total, o menos de aproximadamente 1% en peso de la emulsión total. En algunas realizaciones, el contenido de agua varía desde aproximadamente 0,03% a aproximadamente 1,2% en peso de la emulsión.

En una realización, la emulsión es esencialmente anhidra. Mediante la expresión esencialmente anhidra se hace referencia a que el agua puede estar presente solamente en aquellas cantidades que no tengan un impacto significativo mesurable en la estabilidad de la emulsión. Generalmente, la emulsión no contiene agua agregada, pero no se llevan a cabo etapas de procesamiento adicionales para eliminar el agua de los componentes con anterioridad o posterioridad, y no se llevan a cabo etapas de procesamiento adicionales para eliminar el agua residual o atmosférica, o para eliminar agua que puede recolectarse durante el almacenamiento. Mientras que no se intenta estar limitados por la teoría, la exclusión de cantidades apreciables de agua puede proporcionar en forma ventajosa estabilidad adicional en el tiempo a medida que se minimizan los cambios debido a la evaporación del agua en el tiempo.

Se pueden incluir componentes adicionales que proporcionan propiedades humectantes y/o hidratantes con glicerina en la fase discontinua. Dichos componente adicionales puede incluir propilenglicol, butilenglicol o caprilil glicol, o cualquiera de los glicoles o polioles mencionados anteriormente.

La fase continua generalmente comprenderá desde aproximadamente 40% a aproximadamente 95% de la emulsión, mientras que la fase discontinua generalmente comprenderá desde aproximadamente 5% a aproximadamente 60% de la emulsión. Todas las proporciones dentro de los límites anteriores también se contemplan. Por ejemplo, la fase continua puede comprender aproximadamente 45%, aproximadamente 50%, aproximadamente 55%, aproximadamente 60%, aproximadamente 65%, aproximadamente 70%, aproximadamente 75%, aproximadamente 80%, aproximadamente 85%, aproximadamente 90%, o cualquier valor dentro de este rango. En forma similar, la fase discontinua puede comprender aproximadamente 10%, aproximadamente 15%, aproximadamente 20%, aproximadamente 25%, aproximadamente 30%, aproximadamente 35%, aproximadamente 40%, aproximadamente 45%, aproximadamente 50%, aproximadamente 55%, o cualquier valor dentro de este rango.

Un requisito de las emulsiones de acuerdo con un aspecto de la invención es una combinación de trihidroxiestearina y ácido 12-hidroxiesteárico. Esta combinación está presente en una cantidad adecuada para proporcionar una viscosidad para la emulsión a temperatura ambiente entre aproximadamente 2000 centipoise y aproximadamente 3 millones centipoise como se midió mediante un Viscosímetro Brookfield (por ejemplo, Modelo DV-E) de manera que la emulsión tiene una consistencia adecuada para ser extraída de un tubo flexible. La trihidroxiestearina, también conocida como gliceril tri(12-hidroxiestearato), es el triéster de glicerina y ácido 12-hidroxiesteárico, mientras que el ácido 12-hidroxiesteárico, también conocido como ácido hidroxiesteárico o ácido 12-hidroxi-octadecanoico, tiene la fórmula general:



La trihidroxiestearina generalmente estará presente en un rango desde aproximadamente 0,1% a aproximadamente 2,5% en peso de la emulsión, opcionalmente en un rango desde aproximadamente 0,25 a aproximadamente 1,0% en peso de la emulsión. Por ejemplo, la cantidad de trihoidroxiestearina puede ser aproximadamente 0,1%, aproximadamente 0,2%, aproximadamente 0,3%, aproximadamente 0,4%, aproximadamente 0,5%, aproximadamente 0,6%, aproximadamente 0,7%, aproximadamente 0,8%, aproximadamente 0,9%, aproximadamente 1,0%, aproximadamente 1,1%, aproximadamente 1,2%, aproximadamente 1,3%, aproximadamente 1,4%, aproximadamente 1,5%, aproximadamente 1,6%, aproximadamente 1,7%, aproximadamente 1,8%, aproximadamente 1,9%, aproximadamente 2,0%, aproximadamente 2,1%, aproximadamente 2,2%, aproximadamente 2,3%, o aproximadamente 2,4%, o cualquier otro valor para proporcionar la viscosidad necesaria u otra propiedad reológica, como la constante elástica (G') en combinación con ácido hidroxiesteárico. El ácido hidroxiesteárico generalmente estará presente en un rango desde aproximadamente 0,1% a aproximadamente 3,0% en peso, opcionalmente en un rango desde aproximadamente 0,5 a aproximadamente 1,5% en peso de la emulsión. Por ejemplo, la cantidad de ácido hidroxiesteárico puede ser aproximadamente 0,1% en peso, aproximadamente 0,2% en peso, aproximadamente 0,3% en peso, aproximadamente 0,4% en peso, aproximadamente 0,5% en peso, aproximadamente 0,6% en peso, aproximadamente 0,7% en peso, aproximadamente 0,8% en peso, aproximadamente 0,9% en peso, aproximadamente 1,0% en peso, aproximadamente 1,1% en peso, aproximadamente 1,2% en peso, aproximadamente 1,3% en peso, aproximadamente 1,4% en peso, aproximadamente 1,5% en peso, aproximadamente 2,0% en peso, o aproximadamente 2,5% en peso, o cualquier otro valor para proporcionar la viscosidad necesaria u otra propiedad reológica deseada, como la constante elástica (G') en combinación con trihidroxiestearina.

La relación de peso de trihidroxiestearina a ácido 12-hidroxiesteárico es desde 5/1 a 1/2. Dentro de este rango, las relaciones de aproximadamente 4/1, aproximadamente 3/1, aproximadamente 2/1, y aproximadamente 1/1 también se contemplan como útiles.

En una realización, las composiciones de acuerdo con la invención esencialmente excluyen los modificadores reológicos distintos de trihidroxiestearina y ácido 12-hidroxiesteárico. Mediante la frase esencialmente excluye se hace referencia a que los agentes de reología adicionales no se incluyen en cantidades que tendrían un impacto significativo mensurable en la viscosidad de la emulsión.

Mediante constante elástica (G') independiente de temperatura se hace referencia a que la varianza promedio en el rango de temperatura indicado desde la G' promedio en los 5 grados máximos es menos del 50%, pero más típicamente menos de 30%, incluso menos del 15%. Por ejemplo, para los datos que se muestra en la Figura 3, la varianza promedio se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$Varianza\ promedio = \frac{1}{T_2 - T_1}\sum_{T_1}^{T_2}\frac{\sqrt{\left(G'_i - \frac{\sum_{T_3}^{T_2} G'_j}{T_2 - T_3}\right)^2}}{\frac{\sum_{T_3}^{T_2} G'_j}{T_2 - T_3}} \times 100$$

donde G'_x indica la constante elástica (G') a temperatura x, T_1=25˚C, T_2=80˚C y T_3=75˚C

Generalmente, las emulsiones de acuerdo con la invención además comprenden uno o más emulsionantes. Por ejemplo, uno o más emulsionantes pueden estar presentes en un rango total desde aproximadamente 0,01% a aproximadamente 10,0% en peso de la emulsión. En algunas realizaciones, la cantidad total de emulsionantes varía desde aproximadamente 0,1% a aproximadamente 6,0% en peso, o desde aproximadamente 0,5% a aproximadamente 4,0% en peso. En algunas realizaciones, la cantidad total de emulsionante es aproximadamente 2% en peso, o aproximadamente 4% en peso de la emulsión.

Los emulsionantes que tienen un valor HLB inferior pueden ser adecuados para el uso en emulsiones de glicerina-en-aceite. Por ejemplo, dichos emulsionantes pueden tener un HLB bajo de menos de 10, o menos de 8,5. En ciertas realizaciones, se prefieren los valores HLB entre 2 y 5. En una realización, uno o más emulsionantes de HLB bajo se utiliza en combinación con un emulsionante de HLB más alto. Los ejemplos de emulsionantes incluyen

compuestos de poliglicerilo, como poligliceril-6-poliricinoleato, poligliceril pentaoleato, poligliceril-isostearato, y poligliceril-2-diisostearato; ésteres de glicerol, como glicerol monostearato o glicerol monooleato; fosfolípidos y ésteres de fosfato, como lecitina y trilauret-4-fosfato (disponible bajo el nombre comercial Hostaphat® KL-340-D); ésteres que contienen sorbitán (con inclusión de ésteres SPAN®), como laurato de sorbitán, oleato de sorbitán, estearato de sorbitán, o sesquioleato de sorbitán; polioxietilen fenoles, como polioxietilen octil fenol; éteres de polioxietileno, como éter cetílico de polioxietileno y éter esterarílico de polioxietileno; emulsionantes de polietilen glicol, como PEG-30-polihidroxiestearato o alquilpolietilenglicoles; emulsionantes de polipropilenglicol, como PPG-6-lauret-3; dimeticona polioles y emulsionantes de polisiloxano; y similares. Las combinaciones de emulsionantes, como la combinación de lecitina y sorbitán se contemplan. Se proporcionan emulsionantes adicionales en INCI Ingredient Dictionary and Handbook, 12° Edición, 2008, la descripción del cual se incorpora a la presente a modo de referencia.

En una realización, las emulsiones de acuerdo con la invención pueden contener uno o más aceites tópicamente aceptables en la fase continua, generalmente presente en un rango desde aproximadamente 40% a aproximadamente 95% en peso de la emulsión, más típicamente desde aproximadamente 55% a aproximadamente 75%; la glicerina generalmente está presente en un rango desde aproximadamente 5% a aproximadamente 60% en peso de la emulsión, más típicamente desde aproximadamente 20% a aproximadamente 40%; la trihidroxiestearina está presente en un rango desde aproximadamente 0,1% a aproximadamente 2,5% en peso de la emulsión, más típicamente desde aproximadamente 0,25% a aproximadamente 1,0% en peso; y el ácido 12-hidroxiesteárico está presente en un rango desde aproximadamente 0,1% a aproximadamente 3,0% en peso de la emulsión, más típicamente desde aproximadamente 0,5% a aproximadamente 1,5%. Generalmente, la emulsión además contiene uno o más emulsionantes en un rango total desde aproximadamente 0,5 a aproximadamente 3,0% en peso de la emulsión.

Las emulsiones de acuerdo con la invención son particularmente adecuadas para composiciones cosméticas con aplicación tópica. Cuando se formulan como composiciones cosméticas, las emulsiones generalmente incluyen componentes adicionales opcionalmente distribuidos en cualquiera o ambas fases de la emulsión. Dichos componentes pueden seleccionarse del grupo que consta de pigmentos, ceras, emolientes, humectantes, conservantes, saborizantes, antioxidantes, extractos botánicos y mezclas de los mismos. La mención particular puede hacerse de extractos botánicos altamente purificados o agentes sintéticos que pueden ser curadores de heridas, antiinflamatorios o tener otros beneficios útiles para el tratamiento de la piel o los labios. Las composiciones pueden incluir uno o más formadores de películas para aumentar la sustancia del producto. En ciertas realizaciones, las composiciones de acuerdo con la invención proporcionan lecturas de humectación altas al momento de la aplicación tópica debido a la presencia de altos niveles de glicerina mientras que también logran la aceptación del consumidor debido a una mayor estabilidad.

Las composiciones de la invención generalmente comprenderán menos cera que la que habitualmente se encuentran en los productos para labios. En algunas realizaciones, menos de aproximadamente 10% en peso de la composición es cera. Más típicamente, las composiciones contienen menos de aproximadamente 5% en peso de cera, e incluso pueden comprender menos de aproximadamente 1% en peso de cera, o estar libres de cera.

Pueden agregarse componentes adicionales para proporcionar funcionalidad adicional. Por ejemplo, el material particulado puede agregarse para la absorción de luz ultravioleta (UV) o esparcimiento, como particulados de dióxido de titanio y óxido de zinc, o para características estéticas, como color (por ejemplo, pigmentos), esencia de perla (por ejemplo, mica), o similares. Las realizaciones adicionales pueden incluir antioxidantes, como tocoferol. En forma alternativa, las emulsiones de acuerdo con la invención pueden utilizarse como el vehículo de administración para un producto farmacéutico activo tópicamente, por ejemplo, en un tratamiento hemorroidal.

En una realización, las emulsiones de acuerdo con la invención se proporcionan como productos minoristas para la aplicación a los labios. Por consiguiente dichos productos para labios pueden incluir crema para labios, bálsamo para labios, brillo para labios, tratamiento para labios medicado, humectante para labios, cosméticos para labios, pantalla soplar para labios, y saborizante para labios. En una realización, el producto para labios es un producto para labios fluido, cremoso. En ciertas realizaciones, los productos de acuerdo con la invención pueden tener la consistencia de un líquido semiviscoso o pasta.

Cuando se formula como productos para labios, las emulsiones de acuerdo con la invención pueden empaquetarse en un recipiente que puede cerrarse nuevamente. Dichos recipientes pueden incluir un compartimiento o cámara cargada con la emulsión formulada como una composición cosmética y una tapa extraíble unida al recipiente o configurada en forma reversible en el recipiente. En una realización, una tapa puede unirse a un compartimiento flexible de manera que la pata pueda extraerse del orificio del compartimiento flexible, y reemplazarse al momento de la finalización de la administración de la composición. Una tapa puede unirse al cuerpo de un compartimiento flexible para facilitar el resellado del compartimiento flexible para el almacenamiento entre usos. En una realización, la tapa está reversiblemente unida al recipiente para el sellado de los contenidos cuando se encuentra en una posición cerrada y para permitir que los contenidos del recipiente se dispensen cuando se encuentran en una posición abierta. Los diversos recipientes se contemplan, con inclusión a título ilustrativo, lapiceras retráctiles, bombas, bombas sin aire, paquetes presurizados, recipientes flexibles que se aprietan con la mano, aplicador cosmético, y similares.

Los componentes adicionales pueden incorporarse como rellenos o para varios fines funcionales como es usual en las técnicas cosméticas. Sin embargo, mientras que pueden incluirse componentes adicionales consistentes para formular las composiciones cosméticas anteriores, la inclusión de ingredientes adicionales se limita a aquellos ingredientes que no interfieren con la formación de una emulsión de glicerina-en-aceite.

Ejemplos

Las emulsiones de glicerina-en-aceite de acuerdo con la invención pueden preparase de acuerdo con el siguiente procedimiento general. Los aceites y ceras (si están presentes) se agregan al recipiente de lote y se calientan hasta que todos los componentes se derriten, generalmente a aproximadamente 85°C. Los polvos se agregan con el molido (homogenización) individualmente hasta que se dispersen bien, seguido por el agregado de pigmentos y/o molidos de pigmentos, y agregado de otros componentes funcionales no sensibles a temperatura. La fase de glicerina se calienta a aproximadamente 85°C, y se agrega lentamente al lote principal con homogenización. La mezcla combinada se enfría con molido a una temperatura de aproximadamente 60°C, seguida del agregado de activos sensibles a fragancia y temperatura. La composición se enfría a aproximadamente 55°C con mezcla lenta y se colocan en equipo de prueba o se empaquetan para la evaluación. La estabilidad puede evaluarse para la separación entre fases y la presencia de agrupamiento.

Ejemplo 1

Las formulaciones de emulsión A-D se prepararon de acuerdo con la siguiente tabla. Todas las cantidades se proporcionan en porcentaje en peso de todos los componentes.

TABLA 1

Nombre/ descripción	A	B	C	D
Ésteres de colesterol C_{10-30}/lanosterol	27,0	29,0	28,0	27,5
Lanolina de bajo olor	30,0	30,0	30,0	30,0
glicerina	30,0	30,0	30,0	30,0
trihidroxiestearina	1,0	1,0	--	1,0
Ácido hidroxiesteárico	0,5	0,5	0,5	--
poligliceril-6-poliricinoleato, poligliceril-2-isostearato, hectorita de disteardimonio ,y antioxidante de traza	2,0	--	2,0	2,0
Agente de pantalla solar	9,0	9,0	9,0	9,0
caprilil glicol	0,5	0,5	0,5	0,5
total	100,0	100,0	100,0	100,0

Al momento de la inspección visual para la estabilidad, la formulación A no mostró separación luego de una noche de tratamiento en un horno a 60°C. Las formulaciones B y C mostraron algo de separación, y D mostró un poco menos de separación en comparación con B y C bajo las mismas condiciones. Luego de una semana a 60°C, la formulación A continuó sin presentar separación, la formulación B no presentó separación adicional en comparación del resultado durante la noche, y las formulaciones C y D mostraron mayor separación en comparación con sus resultados durante a noche, respectivamente. Los resultados sugieren que las formulaciones C y D se considerarían inaceptables para un producto comercial.

En una prueba de estabilidad alternativa, la formulación A no presentó separación luego de dos días o una semana a aproximadamente 49°C (120ºF). La formulación B mostró algo de separación a los dos días con un aumento mínimo en la separación luego de una semana en las mismas condiciones. La formulación C presentó una separación significativa a los dos días y una semana. La formulación D mostró una separación menor a los dos días y un aumento mínimo en la separación a una semana en las mismas condiciones. Los resultados sugieren que las formulaciones C y D se considerarían inaceptables para un producto comercial.

Ejemplo 2

La formulación de emulsión E se preparó de acuerdo con la siguiente tabla. Todas las cantidades se proporcionan en porcentaje en peso de todos los componentes.

TABLA II

Nombre/ descripción	E
Ésteres de colesterol C_{10-30}/lanosterol	25,0
lanolina	30,0
glicerina	30,0
trihidroxiestearina	0,5
Ácido hidroxiesteárico	1,0
poligliceril-6-poliricinoleato, poligliceril-2-isostearato, hectorita de disteardimonio ,y antioxidante de traza	4,0
petrolato	9,0
caprilil glicol	0,5
total	100,0

Ejemplo 3

La formulación de emulsión F se preparó de acuerdo con la siguiente tabla. Todas las cantidades se proporcionan en porcentaje en peso de todos los componentes.

TABLA III

Nombre/ descripción	F
Agentes de acondicionamiento de piel	7,40
Extractos botánicos	8,00
lanolina	30,00
glicerina	28,80
trihidroxiestearina	2,00
Ácido hidroxiesteárico	1,00
poligliceril-6-poliricinoleato, poligliceril-2-isostearato, hectorita de disteardimonio ,y antioxidante de traza	2,00
conservante	0,50
Formador de película	5,00
antioxidantes	1,20
Pigmentos y polvo cosmético	13,50
saborizante	0,60
total	100,00

La emulsión F se expuso a pruebas con tres ciclos de congelamiento/ descongelamiento. Al momento de la observación, no había separación en la emulsión luego del tercer ciclo. No se observó separación para la formulación F luego de tres semana a temperatura ambiente o una semana a 49°C (120ºC).

Ejemplo 4

La fase de aceite se preparó de acuerdo con la siguiente tabla.

TABLA IV

Nombre/ descripción	
Ésteres de colesterol C_{10-30}/lanosterol	40,91
Lanolina de bajo olor	45,45
Agente de pantalla solar	13,64
total	100,0

Las composiciones de prueba se prepararon de acuerdo con la siguiente tabla:

TABLA V

Nombre/ descripción	CTR	1	2	3	4	5
Fase de aceite	97,78	97,78	97,78	97,78	97,78	97,78
trihidroxiestearina	1,48	2,22				
Ácido hidroxiesteárico	0,74		2,22			
carnaúba				2,22		
ozoquerita					2,22	
Polietileno-lineal						2,22
total	100	100	100	100	100	100

Método: Cada muestra se cargó en un reómetro (Reómetro AR G2; TA Instruments, Inc.; Geometría: 40 mm placas paralelas, con un espacio de un 1 mm entre las dos placas). La muestra se cargó entre dos placas a 80°C y el material en exceso se retiro. Luego de que se cargó la muestra, se precortó durante 1 minuto a una tasa de corte de 5 Hz. Este paso de acondicionamiento se llevó a cabo para asegurar la carga de reproductibilidad. La muestra luego se midió en un rango de temperatura a medida que se enfriaba desde 80ºC a 25ºC a una tasa de enfriamiento de 5 grados por minuto. Durante la medición, la muestra osciló a 1 Hz y a una tendencia controlada de 1%.

La figura 1 muestra un gráfico de viscosidad versus la temperatura de la fase de aceite, la composición 1, la composición 2, y la composición CTR. La figura 1 muestra que la combinación de trihidroxiestearina y ácido hidroxiesteárico (marcado CTR) es más independiente de temperatura en comparación con la fase de aceite combinada con el ácido hidroxiesteárico solo (marcado 2).

La figura 2 muestra un gráfico de la constante elástica (G') versus la temperatura para la fase de aceite, la composición 1, composición 2, y composición CTR. La figura 2 muestra que la muestra con ácido hidroxiesteárico y trihidroxiestearina (marcado CTR) presenta un efecto beneficioso en comparación con los componentes incorporados a la composición individualmente. La muestra CTR presenta una constante elástica (G') que es relativamente insensible a temperatura, y más alta en valor en temperaturas más altas en comparación con otras fórmulas. Los puntos de datos de la fase de aceite sola y la fase de aceite con trihidroxiestearina (marcada 1) no son visibles en la Figura 2, porque la figura se grafica en escala log, que no presenta números negativos.

La figura 3 muestra un gráfico de constante elástica (G') versus la temperatura de la fase de aceite, la composición 1, la composición 2, y la composición CTR. La figura 3 se presente en escala lineal para verificar que la constante elástica (G') de la fase de aceite y la fase de aceite con trihidroxiestearina (marcada 1) fueron esencialmente cero.

La figura 4 presenta un gráfico de constante elástica (G') versus la temperatura con varias ceras de acuerdo con composiciones de la TABLA V. Las mediciones respecto de las fases de aceite con ceras utilizadas como materiales que proporcionan estructura no muestran el comportamiento como se demuestra mediante la fase de aceite con trihidroxiestearina y ácido hidroxiesteárico (marcado CTR). La fase de aceite con trihidroxiestearina y ácido hidroxiesteárico pueden verse para proporcionar una composición que presentó una constante elástica independiente de temperatura mayor de 0,1 Pa. Las ceras que se evaluaron para la comparación fueron carnaúba, ozoquerita y polietileno, y estas ceras no proporcionaron un beneficio como se observó en la fase de aceite con ácido hidroxiesteárico y trihidroxiestearina combinada. La fase de aceite que tiene ácido hidroxiesteárico y trihidroxiestearina en combinación formó una composición visco-elástica estructurada que presentó una constante elástica (G') independiente de temperatura. Este beneficio no se observó mediante la incorporación de solo uno de estos dos componentes ni las ceras comunes de acuerdo con la TABLA V.

La invención descripta y reivindicada en la presente no debe limitarse en su alcance por las realizaciones específicas descriptas en la presente dado que estas realizaciones se presentan como ilustraciones de varios aspectos de la invención.

REIVINDICACIONES

1. Una emulsión de glicerina-en-aceite estabilizada que comprende:

(i) una fase continua que comprende uno o más aceites tópicamente aceptables,

(ii) un fase discontinua que comprende glicerina como el componente principal, y

(iii) una combinación de trihidroxiestearina y ácido 12-hidroxiesteárico en una cantidad adecuada para proporcionar una viscosidad para la emulsión a temperatura ambiente entre 2000 centipoise y 3 millones centipoise;

en donde la relación de peso de trihidroxiestearina a ácido 12-hidroxiesteárico es desde 5:1 a 1:2,

en donde dicha emulsión tiene estabilidad mejorada en comparación con una emulsión de otro modo idéntica que no contiene trihidroxiestearina y/o ácido 12-hidroxiesteárico.

2. Una emulsión de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicha emulsión además comprende uno o más emulsionantes en un rango total desde 0,5% a 6,0% en peso.

3. Una emulsión de acuerdo con la reivindicación 2, en donde dicha trihidroxiestearina está presente en un rango desde 0,5% a 2,5% en peso, y dicho ácido 12-hidroxiesteárico está presente en una rango desde 0,2% a 1,5% en peso.

4. Una emulsión de acuerdo con la reivindicación 3, en donde dicha emulsión es estable como una emulsión luego del calentamiento a 49°C durante dos días.

5. Una emulsión de acuerdo con la reivindicación 3, en donde dicha emulsión es estable como una emulsión luego del calentamiento a 49°C durante una semana.

6. Una emulsión de acuerdo con la reivindicación 3, en donde dicha emulsión es estable como una emulsión luego del calentamiento a 60°C durante doce horas.

7. Una emulsión de acuerdo con la reivindicación 3, en donde dicha emulsión es estable como una emulsión luego del calentamiento a 60°C durante una semana.

8. Una emulsión de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en dicha emulsión puede haber presente agua solamente en cantidades tales que no tengan impacto material medible en la estabilidad de la emulsión.

9. Una composición cosmética que comprende

(i) una emulsión de glicerina-en-aceite estabilizada de acuerdo con la reivindicación 1;

y

(ii) opcionalmente uno o más componentes distribuidos en cualquiera o ambas fases de dicha emulsión, dichos componentes seleccionados del grupo que consta de pigmentos, ceras, emolientes, humectantes, conservantes, saborizantes, antioxidantes, extractos botánicos, y mezclas de los mismos;

en donde dicha emulsión tiene estabilidad mejorada en comparación con una emulsión de otro modo idéntica que no contiene trihidroxiestearina y/o ácido 12-hidroxiesteárico.

10. Una composición cosmética de acuerdo con la reivindicación 9, en donde dicha composición cosmética es adecuada para la aplicación a los labios.

11. Un producto para labios que comprende:

(A) una composición cosmética adecuada para la aplicación a los labios que comprende

(i) una emulsión de glicerina-en-aceite estabilizada de acuerdo con la reivindicación 1; y

(ii) opcionalmente uno o más componentes distribuidos en cualquiera o ambas fases de dicha emulsión, dichos componentes seleccionados del grupo que consta de pigmentos, ceras, emolientes, humectantes, conservantes, saborizantes, antioxidantes, extractos botánicos, y mezclas de los mismos;

en donde dicha emulsión tiene estabilidad mejorada en comparación con una emulsión de otro modo idéntica que no contiene trihidroxiestearina y/o ácido 12-hidroxiesteárico; y

(B) un recipiente que puede cerrarse nuevamente que tiene una cámara al menos parcialmente cargada con dicha composición cosmética y una tapa reversiblemente unida a dicho recipiente para el sellado de los

contenidos de la cámara cuando se encuentra en una posición cerrada y para permitir que dichos contenidos se dispensen cuando se encuentra en una posición abierta.

12. Un producto para labios de acuerdo con la reivindicación 11, en donde

(i) dichos uno o más aceites tópicamente aceptables están presentes en un rango desde 40% a 90% en peso de dicha composición cosmética,

(ii) dicha glicerina está presente en un rango desde 5% a 60% en peso de dicha composición cosmética,

(iii) dicha trihidroxiestearina está presente en un rango desde 0,5% a 2,5% en peso de dicha composición cosmética, y

(iv) dicho ácido 12-hidroxiesteárico está presente en un rango desde 0,2% a 1,5% en peso de dicha composición cosmética;

en donde dicha composición cosmética además comprende:

(v) uno o más emulsionantes en un rango total desde 0,5 a 6,0% en peso de dicha composición cosmética.

13. Un producto para labios de acuerdo con la reivindicación 11, en donde dicho producto para labios se selecciona del grupo que consta de una crema para labios, bálsamo para labios, brillo para labios, tratamiento para labios medicado, humectante para labios, cosmético para labios, pantalla solar para labios, y saborizante para labios.

14. Una emulsión de glicerina-en-aceite estabilizada de acuerdo con la reivindicación 1, en donde la fase continua presenta una constante elástica (G') > 0 que es independiente de temperatura a temperaturas entre 25°C y 60°C.

15. Una emulsión de acuerdo con la reivindicación 14, en donde la fase continua presenta una constante elástica (G') que es independiente de temperatura a temperaturas entre 20°C y 80°C.

FIGURA 1

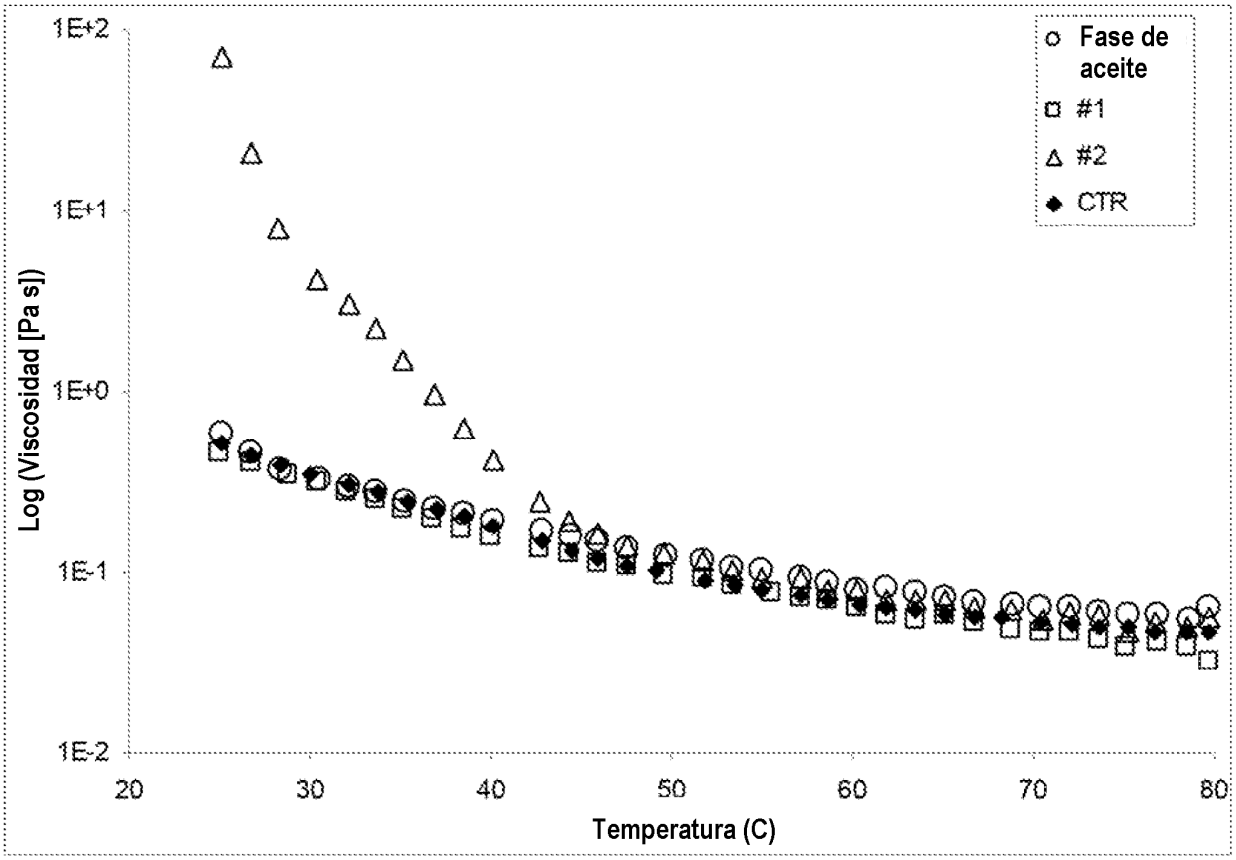

1E+2
1E+1
1E+0
1E-1
1E-2
Log (Viscosidad [Pa s])
20
30
40
50
60
70
80
Temperatura (C)
Fase de aceite
#1
#2
CTR

FIGURA 2

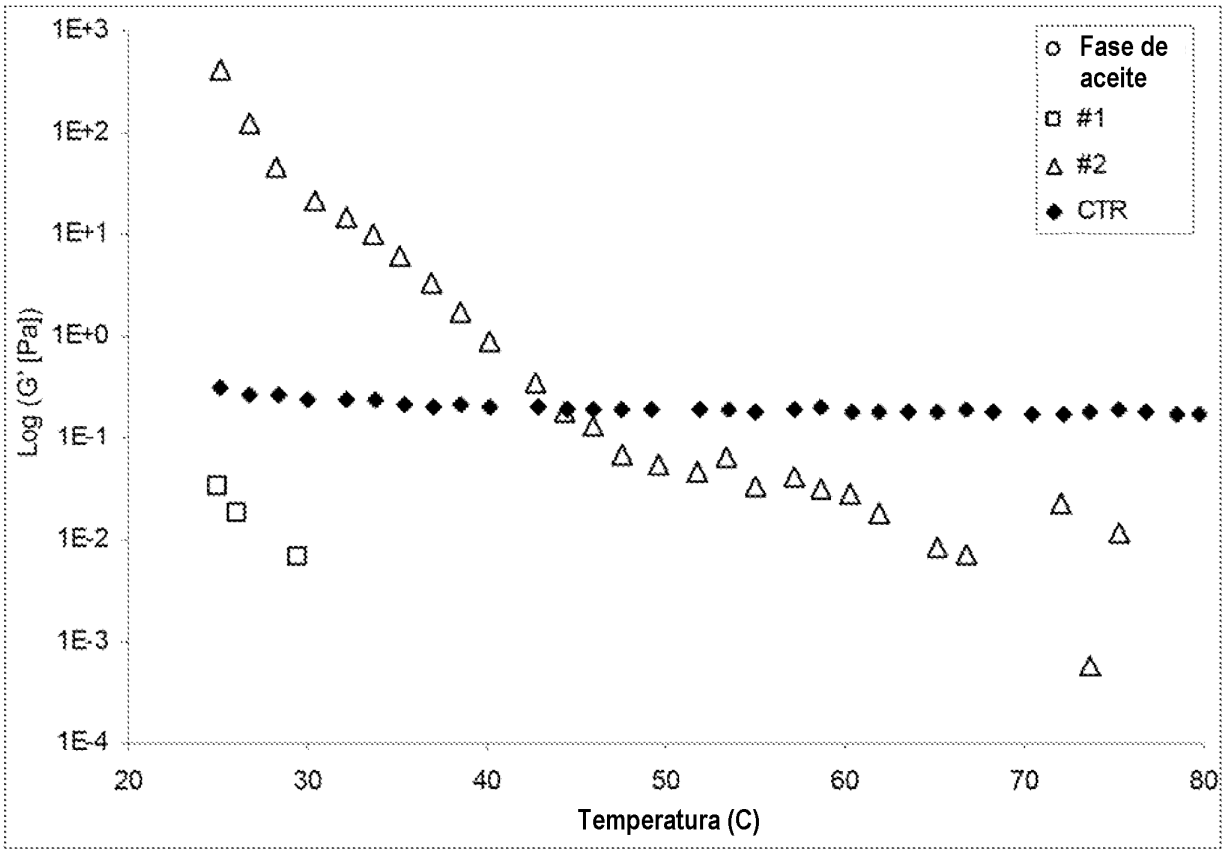

1E+3
1E+2
1E+1
1E+0
1E-1
1E-2
1E-3
1E-4
Log (G' [Pa])
20
30
40
50
60
70
80
Temperatura (C)
Fase de aceite
#1
#2
CTR

FIGURA 3

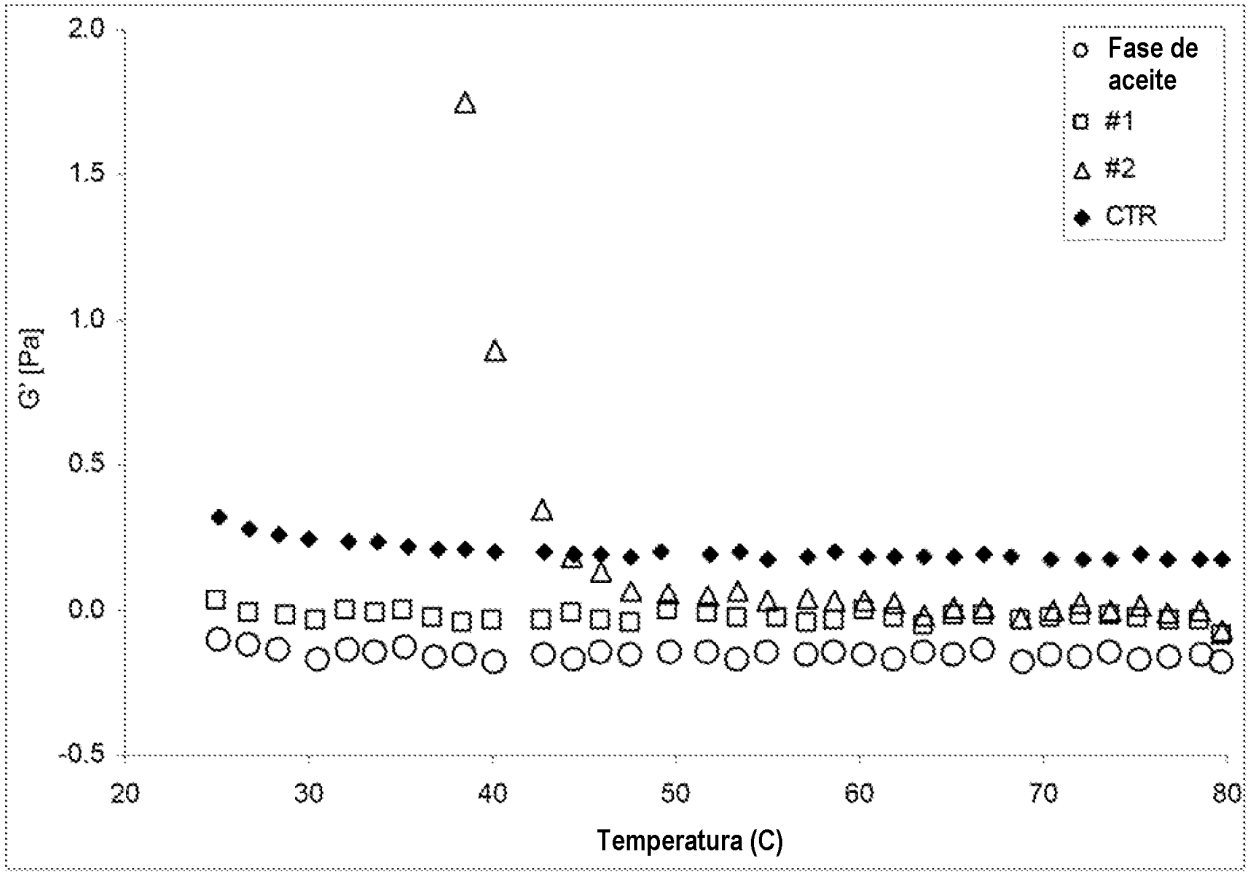
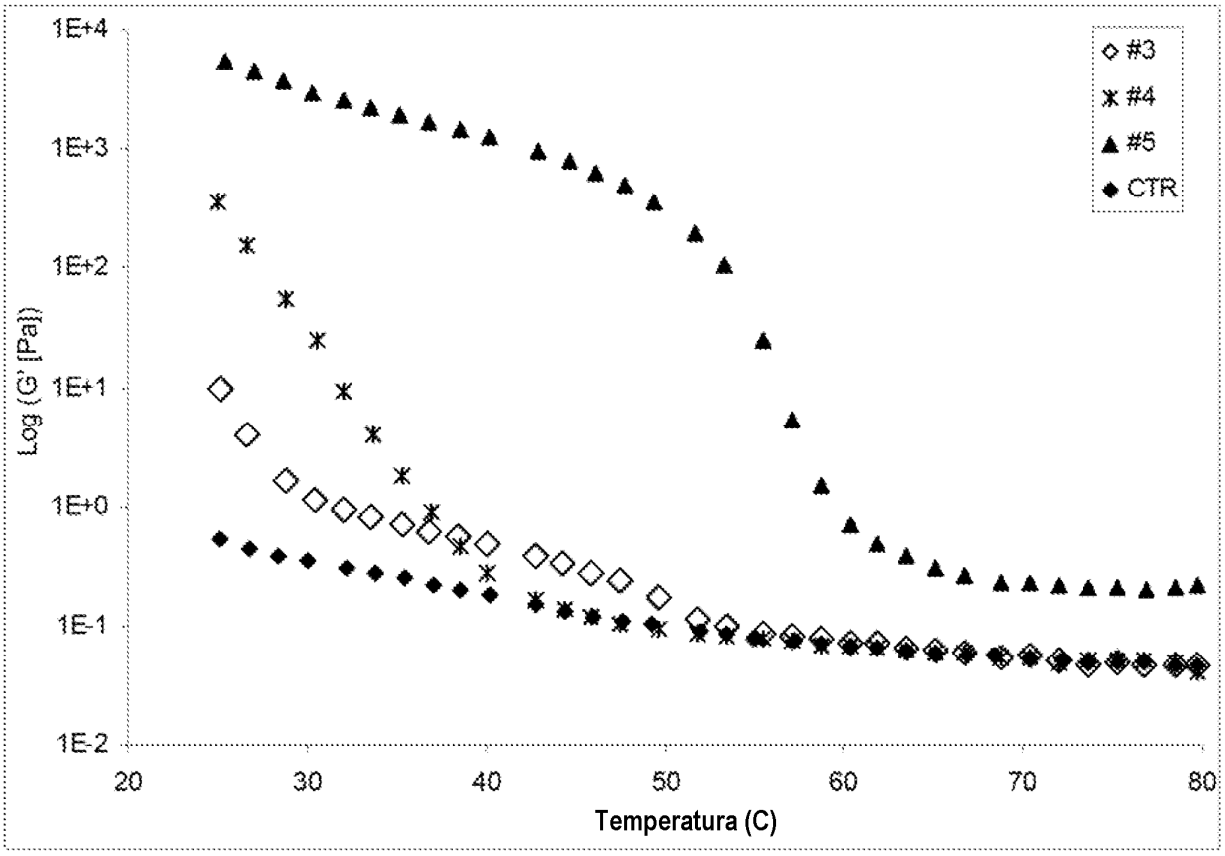

2.0
1.5
1.0
0.5
0.0
-0.5
G' [Pa]
20
30
40
50
60
70
80
Temperatura (C)
Fase de aceite
#1
#2
CTR

FIGURA 4


1E+4
1E+3
1E+2
1E+1
1E+0
1E-1
1E-2
Log (G' [Pa])
20
30
40
50
60
70
80
Temperatura (C)
#3
#4
#5
CTR