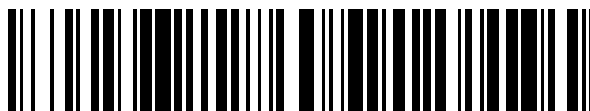


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 765 871**

51 Int. Cl.:

A61K 8/67	(2006.01)
A61Q 17/04	(2006.01)
A61Q 19/00	(2006.01)
A61Q 19/02	(2006.01)
A61Q 19/08	(2006.01)
A61Q 19/10	(2006.01)
A61K 8/365	(2006.01)
A61K 8/368	(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **28.06.2017 PCT/EP2017/025185**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **04.01.2018 WO18001573**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **28.06.2017 E 17749365 (7)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **04.12.2019 EP 3478260**

54 Título: **Composición para el cuidado de la piel y su uso**

30 Prioridad:

30.06.2016 GB 201611362

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

11.06.2020

73 Titular/es:

**THE BOOTS COMPANY PLC (100.0%)
1 Thane Road
Nottingham NG2 3AA, GB**

72 Inventor/es:

**HICKS, JAKE THOMAS y
TOMLINSON, PAUL JAMES**

74 Agente/Representante:

SÁEZ MAESO, Ana

ES 2 765 871 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 para el cuidado de la piel y su uso

Campo técnico

5 La tecnología divulgada se relaciona con una composición que comprende: 0.1 a 3 % en peso (o 0.5 a 2.5 % en peso) de un beta-hidroxiácido, 0.05 a 3 % en peso (o 0.09 a 2.5 % en peso) de un ácido ascórbico con sustitución en O o un derivado del mismo, y un medio cosméticamente aceptable que comprende una fase acuosa, en donde un beta-hidroxiácido está presente en una concentración más alta que el ácido ascórbico con sustitución en O o un derivado del mismo. La tecnología divulgada se refiere además al uso y método de mejorar la condición de la piel.

Antecedentes de la invención

10 La vitamina C y el ácido salicílico son ingredientes conocidos para uso en cosméticos y/o formulaciones para el cuidado personal.

Se sabe que el ácido salicílico mejora el grosor de la piel, la función de barrera y la producción de colágeno. El ácido salicílico también se conoce como un tratamiento para las imperfecciones o el acné, además de ser un agente antimicrobiano. Se cree que la efectividad del ácido salicílico es óptima en condiciones de pH más bajo.

15 Se sabe que las composiciones contienen ácido 3-O-etilo ascórbico y ácido salicílico, como lo demuestran los registros de Mintel, por ejemplo: el producto "Drops of Light Pure Healthy Brightening Serum" de The Body Shop (número de registro 3926549) y el producto Shiseido "Benefique AC Acne Spots Serum"(número de registro 3673921). La persona experimentada en la técnica sabe que para una composición que tiene una lista INCI, los ingredientes que figuran más arriba en una lista están presentes en concentraciones más altas que los ingredientes enumerados más abajo. Ambos registros de Mintel enumeran el ácido 3-O-etilo ascórbico más arriba en la lista que el ácido salicílico, lo que indica
20 que el ácido 3-O-etilo ascórbico está presente en una cantidad mayor que el ácido salicílico. Se cree que las composiciones como estas tienen un pH más alto ya que las composiciones contienen menos ácido salicílico.

25 Sin embargo, a medida que disminuye el pH de la composición, se cree que la estabilidad de las composiciones que comprenden vitamina C, o un derivado de este (como ascorbil fosfato y glucósido de ascorbilo) se vuelve menos estable. Como resultado, las composiciones que contienen mayores concentraciones de ácidos fuertes exacerban el problema de estabilidad de la vitamina C o sus derivados.

30 Sin embargo, dados los beneficios de la vitamina C y diversos derivados en formulaciones cosméticas y/o de cuidado personal que incluyen una síntesis mejorada de colágeno, o como un antioxidante y se ha utilizado en composiciones para combatir el envejecimiento (a través de la reducción de arrugas, líneas finas o mejora de la firmeza de la piel) y proporcionando una piel más brillante/radiante. También se ha sugerido que las composiciones que contienen vitamina C o sus derivados reducen la aparición de manchas marrones y otros tipos de daño solar, y mejoran la respuesta curativa natural de la piel. En una realización, sería deseable usar una forma de vitamina C en composiciones que pueden tener un pH bajo. El documento de patente EP 1106175 se refiere a composiciones antiinflamatorias que comprenden compuestos de ácido ascórbico con sustitución en 3-O.

35 Sumario de la invención

40 Sería ventajoso preparar una composición que comprenda un beta-hidroxiácido y una forma de vitamina C para mejorar la condición del cuidado de la piel (esto también puede denominarse condición de la piel). El cuidado mejorado de la piel puede incluir al menos uno de los siguientes: mejorar la exfoliación de la piel, mejorar la humidificación, reducir la formación de arrugas o líneas finas, reducir la flacidez o hiperpigmentación de la piel (como los lentigos solares), aumentar la firmeza o la laxitud de la piel y reducir las imperfecciones. La composición también puede proporcionar eficacia para prevenir o aliviar los síntomas de la piel sensible o hacia agentes sensibilizadores de la piel al mejorar su resistencia a los factores desencadenantes.

45 Sin embargo, debido a la diferencia en las condiciones funcionales consideradas óptimas descritas anteriormente, sería ventajoso tener una composición que tenga una estabilidad mejorada debido a la estabilidad mejorada de la forma de vitamina C en una composición que comprende un beta-hidroxiácido.

50 Como se usa aquí, el término de transición "que comprende", que es sinónimo de "que incluye", "que contiene" o "caracterizado por", es inclusivo o abierto y no excluye elementos adicionales no recitados o etapas del método. Sin embargo, en cada recitación de "que comprende" aquí, se pretende que el término también abarque, como realizaciones alternativas, las frases "que consiste esencialmente en" y "que consiste en", donde "que consiste en" excluye cualquier elemento o etapa no especificada y "que consiste esencialmente en" permite la inclusión de elementos o etapas adicionales no recitadas que no afectan materialmente las características básicas, esenciales y novedosas de la composición, método o uso bajo consideración.

A menos que se indique lo contrario, las ratas de tratamiento se basan en el peso en relación con la composición total divulgada aquí.

A menos que se indique lo contrario, diversos ingredientes divulgados aquí pueden ser compuestos individuales o en una mezcla de compuestos.

5 En una realización, la tecnología divulgada se relaciona con una composición que comprende: 0.1 a 3 % en peso (o 0.5 a 2.5 % en peso) de un beta-hidroxiácido, 0.05 a menos del 3 % en peso (o 0.09 a menos del 2.5 % en peso) de un ácido ascórbico con sustitución en O o un derivado del mismo, y un medio cosméticamente aceptable que comprende una fase acuosa, en donde un beta-hidroxiácido está presente en una concentración más alta que el ácido ascórbico con sustitución en O o un derivado del mismo.

El medio cosméticamente aceptable puede estar en forma de una emulsión o un gel. La emulsión puede ser agua en aceite, aceite en agua o agua en silicona.

10 Si la composición divulgada aquí está en forma de un gel, el gel puede ser un gel monofásico o un gel multifásico.

La composición puede tener una proporción en peso de beta-hidroxiácido a ácido ascórbico sustituido en O o un derivado de este de 1: a menos de 1, a 1:0.01, o la proporción en peso puede ser 1:0.7 a 1:0.5, o la proporción en peso puede ser 1:0.5 a 1:0.1.

La composición divulgada aquí puede tener un pH que varía de 3 a 7, o de 4.0 a 5.5.

15 En una realización, la tecnología divulgada se relaciona con una composición que comprende ácido salicílico como el beta-hidroxiácido y ácido 3-O-etilo ascórbico como el ácido ascórbico con sustitución en O o un derivado de este.

La composición puede estar en forma de gel, crema, loción o suero, típicamente una crema, suero, loción. En una realización, la composición puede ser un suero.

La composición puede ser una emulsión o gel.

20 En una realización, la tecnología divulgada se relaciona con un método para mejorar el cuidado de la piel que comprende aplicar a la piel (tal como aplicación tópica) la composición divulgada aquí. Mejorar el cuidado de la piel puede incluir mejorar (i) la exfoliación o humidificación de la piel, o (ii) disminuir o prevenir al menos uno de los siguientes: formación de arrugas o líneas finas, flacidez de la piel o hiperpigmentación (como lentigos solares), o (iii) aumentar la firmeza de la piel o la laxitud de la piel.

25 En una realización, la tecnología divulgada se relaciona con un método para tratar la piel sensible o alérgica aplicando a la piel (tal como aplicación tópica) la composición divulgada aquí.

30 En una realización, la tecnología divulgada se relaciona con el uso de la composición divulgada aquí para mejorar el cuidado de la piel. El cuidado mejorado de la piel puede incluir mejorar (i) la exfoliación o humidificación de la piel, o (ii) disminuir o prevenir al menos uno de los siguientes: formación de arrugas o líneas finas, flacidez de la piel o hiperpigmentación (como lentigos solares), o (iii) aumentar la firmeza de la piel o la laxitud de la piel. El cuidado mejorado de la piel puede incluir la reducción de alergias.

El uso y el método divulgados aquí son conocidos por la persona experimentada como que no abarca el tratamiento terapéutico o médico, es decir, el uso o método divulgado se relaciona con un uso o método no terapéutico.

En una realización, la piel es una piel de mamífero tal como piel humana.

35 Descripción detallada de la invención

La tecnología divulgada proporciona una composición, métodos y usos como se divulgó anteriormente y en las reivindicaciones.

Beta-hidroxiácido

Las composiciones divulgadas comprenden un beta-hidroxiácido, o una sal o derivado del mismo.

40 El término "beta-hidroxiácido" (o β -hidroxiácido (BHA)) se usa para definir un compuesto orgánico que contiene un grupo funcional de ácido carboxílico y un grupo funcional hidroxil separado por dos átomos de carbono.

El BHA puede estar en forma de una sal, o éster, o amida, o ácido. En diferentes realizaciones, el BHA puede ser un éster o un ácido.

El BHA es aromático. En una realización, el BHA es aromático.

45 El BHA puede incluir ácido salicílico o sales de este. Las sales del ácido salicílico pueden incluir salicilato de calcio, salicilato de magnesio, salicilato de MEA, salicilato de potasio, salicilato de sodio, salicilato de TEA).

Un ejemplo de BHA incluye ácido salicílico.

Ácido ascórbico con sustitución en O

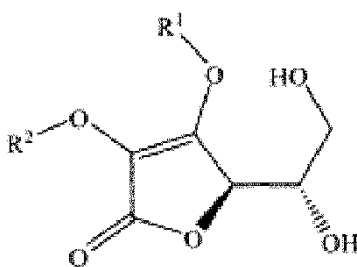
El ácido con sustitución en O o un derivado de este puede ser un ácido ascórbico O-alqu(en)ilo o un derivado de este. Como se usa aquí, "alqu(en)ilo" significa alquilo o alquenoilo (típicamente alquilo).

5 El alqu(en)ilo puede ser acíclico o cíclico, típicamente acíclico. El grupo acíclico puede ser lineal o ramificado, típicamente lineal.

Típicamente, el ácido ascórbico con sustitución en O o un derivado de este puede ser un ácido ascórbico O-alquilo, o un derivado de este.

El ácido ascórbico con sustitución en O, o un derivado de este, es conocido en la técnica y se describe en la solicitud de patente EP EP2722043 A1 y en el documento US 2014/0155633 (ambos Lin et al., Solicitante Corum).

10 En una realización, el ácido ascórbico con sustitución en O, o un derivado de este, puede estar representado por la fórmula:



15 en donde los grupos R¹ y R² pueden ser independientemente H, alquilo C1-20, cicloalquilo C3-20, alcoxi C1-20, acilo C2-20, arilo C6-20, aromático heterocíclico C1-20, no aromático heterocíclico C1-20, o cicloalquenoilo C3-20, con la condición de que tanto R¹ como R² no puedan ser H (es decir, con la condición de que el ácido ascórbico con sustitución en O no pueda ser ácido ascórbico en su forma no sustituida).

20 El ácido ascórbico con sustitución en O o un derivado de este puede tener un grupo sustituido que puede ser de naturaleza de hidrocarburo, es decir, compuesto de carbono e hidrógeno. En una realización, los grupos R¹ y R² pueden ser independientemente H, alquilo C1-20, cicloalquilo C3-20, arilo C6-20 o cicloalquenoilo C3-20, con la condición de que tanto R¹ como R² no puedan ser H.

En una realización, el ácido ascórbico con sustitución en O puede ser ácido ascórbico 3-alquilo, o mezclas de estos. Típicamente, el grupo alquilo puede ser un C1-20, o C1-10, o C2-8, o C2-4.

Típicamente, el ácido ascórbico con sustitución en O puede ser ácido ascórbico 3-O-etilo.

En una realización, la composición divulgada aquí no incluye gluconolactona.

25 Otros ingredientes

La composición divulgada aquí puede comprender además opcionalmente otros ingredientes. Los otros ingredientes incluyen hibisco, un péptido, un inhibidor de la metaloproteinasas de matriz (MMPi), un agente blanqueador, un agente acondicionador de la piel, un agente protector solar, espesantes conservantes, agentes modificadores de la viscosidad y/o agentes gelificantes, agentes secuestrantes, cera, diluyentes, portadores, propulsores, perfumes o agentes de ajuste del pH.

30 En una realización, la composición divulgada aquí comprende además uno o más de hibisco, un péptido, un MMPi y un agente blanqueador.

El hibisco puede ser Hibiscus sabdariffa, Hibiscus Rosa-sinensis o Hibiscus Abelmoschus. Se sabe que las tres plantas de hibisco forman extractos utilizados en composiciones cosméticas. El hibisco puede estar en forma de un extracto.

35 Los péptidos se definen como compuestos que comprenden una secuencia ininterrumpida de aminoácidos. Por ejemplo, los péptidos son de origen natural. Un dipéptido comprende una secuencia ininterrumpida de dos aminoácidos. Los aminoácidos, tal como se emplean aquí, incluyen y abarcan todos los aminoácidos naturales, ya sea en configuración D o L. Los aminoácidos se indican comúnmente con referencia al código convencional de tres letras y la secuencia se lee de izquierda a derecha. La composición de la tecnología divulgada puede incluir un dipéptido elegido entre éster cetílico del acetil dipéptido 1, aminohexanoato acetil dipéptido 3, azelaoil bispéptido 10, cumaroil dipéptido 3, dicetil dipéptido 9, diaminobutiroil dipéptido bencilamida diacetato, dipeptido 1, dipéptido 10, dipéptido 11, dipéptido 12, dipéptido 15, dipéptido 16, dipéptido 17, dipéptido 18, dipéptido 19, dipéptido 2, dipéptido 20, dipéptido 3, dipéptido 4, dipéptido 5, dipéptido 6, dipéptido 7, dipéptido 8, dipéptido 8 HCL, dipéptido 9, hexanoil dipéptido 3 acetato de norleucina, metilundecilenoil dipéptido 16, nicotinoil dipéptido 22, nicotinoil dipéptido 23,

nicotinoil dipéptido 24, nicotinoil dipéptido 26, oleoil dipéptido 15, palmitoil dipéptido 10, palmitoil dipéptido 13, palmitoil dipéptido 17, palmitoil dipéptido 5 diaminobutiroil hidroxitreonina, palmitoil dipéptido 5 diaminohidroxitirato, palmitoil dipéptido 7 y mezclas de estos.

5 En una realización, la composición de la tecnología divulgada puede incluir un tripéptido o mezclas de estos. El tripéptido puede ser de origen natural o de origen sintético. Los compuestos tripéptidos adecuados incluyen tripéptido 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, derivados de estos, y mezclas de estos. El tripéptido comprende uno o más tripéptidos con base en His.

10 Las composiciones de la tecnología divulgada pueden comprender además un tetrapéptido. El tetrapéptido puede ser uno o más tetrapéptidos con base de rigina, uno o más tetrapéptidos ALAMCAT o mezclas de estos. El tetrapéptido puede ser de origen natural o de origen sintético. Los tetrapéptidos adecuados para uso en la presente composición incluyen los elegidos entre los tetrapéptidos 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 34, 35, derivados de estos y mezclas de estos.

15 Los tetrapéptidos con base de rigina de la tecnología divulgada pueden tener como base la estructura Gly-Gln-Pro-Arg (Rigina) e incluir sus análogos y derivados de los mismos. La rigina es un tetrapéptido típico.

20 Las composiciones de la tecnología divulgada pueden comprender además un pentapéptido, derivados de estos y mezclas de estos. Como se usa aquí, "pentapéptido" se refiere tanto al pentapéptido de origen natural como al pentapéptido sintetizado. También son útiles aquí composiciones de origen natural y comercialmente disponibles que comprenden pentapéptidos. Los pentapéptidos adecuados son los elegidos entre los pentapéptidos 1, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 33, 34, 35, 36, 38, 39, derivados de estos y mezclas de estos.

El péptido cuando está presente en la composición divulgada aquí puede estar presente en 0 o 0.01 % a 20 %, o 0.05 % a 15 %, o 0.05 a 10 % en peso de la composición.

Inhibidor de metaloproteinasa de matriz (MMPi)

25 El término "inhibidor de metaloproteinasa de matriz" se relaciona con todas las moléculas y/o extractos de plantas o bacterias que tienen una actividad inhibidora sobre al menos una de las metaloproteinasas de matriz expresadas, sintetizadas o activadas por o en la piel. La familia de las metaloproteinasas de la matriz está formada por varios grupos bien definidos en función de su parecido con respecto a la estructura y la especificidad del sustrato (Woessner J. F., Faseb Journal, vol. 5, 1991, 2145).

30 El MMPi puede estar presente en un nivel de desde 0 o 0.01 % a 10 %, o 0.1 % a 5 % o 0.25 % a 2.5 %, o 0.5 % a 1 % en peso de la composición.

Agente blanqueador

En una realización, la composición divulgada aquí comprende además un agente blanqueador/aclarante.

35 Cuando la composición comprende además el agente blanqueador/aclarante, puede estar presente en 0 o 0.001 a 10 % en peso, o 0.01 a 5 % en peso, o 0.1 a 2 % en peso, o 0.2 a 1 % en peso de la composición. Por ejemplo, el agente blanqueador/aclarante puede estar presente en 0 o 0.001 % a 3 % en peso, o 0.01 a 2 % en peso, o 0.05 a 1 % en peso, o 0.1 % a 0.5 % en peso de la composición.

El blanqueador/aclarante puede incluir al menos uno de los siguientes ingredientes: emblica, extracto de hoja de morera, mangostino, Sophora, un flavonoide, ácido hidroxifenoxipropiónico y dimetilmetoxicromanol.

40 En una realización, el agente blanqueador/aclarante puede ser una mezcla de ingredientes elegidos entre: Emblica y Sophora, opcionalmente en presencia de extracto de hoja de morera. Por ejemplo, el extracto de hoja de morera puede estar presente.

45 La emblica puede ser Emblica officinalis, por ejemplo, que comprende más del 40 % en peso (por ejemplo, 50-80 % en peso) de Emblicanina A, Emblicanina B, Pedunculagina y Punigluconina, y no más de aproximadamente 1 % en peso de flavonoides. La emblica puede ser Phyllanthus emblica.

La Sophora puede ser un extracto de un árbol pequeño y un arbusto de la familia de los guisantes Fabaceae.

Por ejemplo, la emblica puede ser Phyllanthus emblica y Sophora puede derivarse del extracto de raíz de Sophora angustifolia.

50 Se cree que la especie flavonoide tiene una actuación antioxidante y es un agente polifenólico vegetal antioxidante. Por el término agente polifenólico antioxidante vegetal nos referimos a un extracto de planta, o un derivado de este, que comprende especies de flavonoides, que incluyen flavonas, flavonoles, flavanonas, antrocianidinas flavonoles e isoflavonoides; especies de ácido fenólico; estilbenos; y lignanos, que proporcionan un beneficio antioxidante. El

beneficio antioxidante se mide usando el ensayo de capacidad antioxidante total (TAC) descrito aquí. Las plantas proporcionan una rica fuente de agentes polifenólicos y, por lo tanto, son una fuente eficiente de dichos antioxidantes. Activos similares pueden prepararse sintéticamente y, como tales, son análogos de dichos agentes polifenólicos vegetales.

- 5 Los agentes polifenólicos antioxidantes (diferentes del compuesto que tiene dos o más grupos hidroxilo, en donde el compuesto tiene una masa molar de al menos 150 g/mol) pueden incluir extractos de plantas elegidas de morera (por ejemplo, *Morus alba*), ginseng (por ejemplo, *Panax ginseng*), frambuesa, orégano (por ejemplo, *Origanum vulgare*), té verde (por ejemplo, hojas verdes de *Camellia sinensis*), té blanco (por ejemplo, *Camellia sinensis*), extracto de arándano azul (por ejemplo, *Vaccinium cyanococcus*), corteza de pino marítimo francés (por ejemplo, *Pinus pinaster*, vendido bajo el nombre comercial Pycnogenol), romero (por ejemplo, *Rosmarinus officinalis*), uva, incluida la semilla de uva (por ejemplo, *Vitis vinifera*), hinojo (por ejemplo, *Foeniculi fructus*), Caragana sinica, mejorana (por ejemplo, *Origanum majorana*), azafrán (por ejemplo, *Crocus sativus*), manzana (por ejemplo, *Malus domestica*), café, café verde, cereza (por ejemplo, *Prunus avium*), algas de nieve (por ejemplo, *Chlamydomonas nivalis*), emblica (por ejemplo, *Phyllanthus emblica*), ginkgo (por ejemplo, *Ginkgo biloba*), moringa (por ejemplo, *Moringa oleifera*), jengibre (por ejemplo, zingiberaceae), magnolia (por ejemplo, *Magnolioideae virginiana*), azafrán francés, flor de las nieves (por ejemplo, *Leontopodium alpinum*), loto blanco (por ejemplo, *Nymphaea alba*), raíz de cúrcuma, malvavisco (por ejemplo, *Althaea officinalis*), bardana (por ejemplo, *Arctium lappa*), mirtilo (por ejemplo, *Vaccinium myrtillus*), arándano (por ejemplo, *Vaccinium oxycoccus*), néctar de granada (por ejemplo, *Punica granatum*), salvia (por ejemplo, *Salvia officinalis*), tomillo (por ejemplo, *Thymus vulgaris*), girasol (por ejemplo, *Helianthus annuus*), zanahoria silvestre (por ejemplo, *Daucus carota*), lúpulo (por ejemplo, *Humulus lupulus*), avellano de bruja (por ejemplo, *hamamelis*), roble (por ejemplo, *Quercus*), camelia (por ejemplo, *theacea*), trébol rojo (por ejemplo, *Tritolium pratense*), linaza (por ejemplo, *Linium usitatissimum*), limón (por ejemplo, *Citrus limon*), abedul (por ejemplo, *betula*), aciano, (por ejemplo, *Centaurea cyanus*), geranio, polígono, soja (por ejemplo, *Glycine max*), y sus mezclas.

25 En una realización, el agente polifenólico antioxidante puede ser un extracto de una planta elegida entre morera, ginseng, uva, orégano, uva, salvia, girasol, corteza de pino marítimo, romero, mejorana, azafrán, azafrán francés, zanahoria silvestre, lúpulo, café, café verde, avellano de bruja, roble, camelia, trébol rojo, linaza, jengibre, magnolia, aciano, bardana y sus mezclas.

30 Las especies polifenólicas activas procedentes de la lista de plantas anterior incluyen las elegidas entre apigenina, luteolina, quercetina, kaempferol, naringenina, hesperetina, catequina, galocatequina, cianuración, pelargonidina, daidzeína, ácido cafeico, ácido clorogénico, ácido romsmarínico, ácido gálico, resveratrol, ácido ferúlico, galato de epigalocatequina, piceatannol, secoisolariciresinol, isotaxiresinol, miyabenol c, luteolina y sus mezclas.

35 Las cantidades de agentes polifenólicos antioxidantes vegetales usados en la tecnología actualmente divulgada se expresan como pesos secos del extracto, como entiende una persona experimentada en la técnica. El agente polifenólico antioxidante vegetal (extracto de plantas) puede estar presente en un 0.005 a 10 % en peso, o un 0.01 a 7 % en peso, o un 0.01 a 5 % en peso de la composición.

Cuando está presente, el cromano se puede elegir entre: metilo, di-, tri- y tetra-alquilo C1-C6, alcoxicromanol C1-C6; pentametilcromanol, metilo, di, tri y tetraalquilo C1-C6, PARR65 alcoxi C1-C6 cromanol C14-C20 éster y sus mezclas.

40 El cromano se puede elegir dimetil metoxicromanol, tetrametil metoxicromanol, pentametil cromanol, palmitato de dimetilmetoxicromanilo, dialquil metoxicromanol miristato, dimetil metoxicromanol estearato, dimetil metoxicromanol oleato, dimetil metoxicromanol linoleato y sus mezclas.

En una realización, el cromano puede ser dimetil metoxicromanol (disponible comercialmente bajo el nombre comercial Lipochroman 6 vendido por Lipotec).

Agente acondicionador de la piel

45 La composición divulgada aquí puede comprender opcionalmente un agente acondicionador de la piel. Los agentes acondicionadores de la piel pueden elegirse entre humectantes, emolientes, humidificantes o mezclas de estos. Donde esté presente, el agente acondicionador de la piel puede estar presente del 0.01 al 20 % en peso, o del 0.1 al 10 % en peso, o del 0.5 al 7 % en peso de la composición.

50 Los agentes acondicionadores de la piel pueden elegirse entre guanidina, urea, ácido glicólico y sales de glicolato, ácido láctico y sales de lactato, aloe vera, manteca de karité, polihidroxi-alcoholes, como sorbitol, manitol, xilitol, eritritol, glicerol, hexanotriol, butanotriol, (di) propilenglicol, butilenglicol, hexilenglicol, polietilenglicol, azúcares (por ejemplo, fructosa, glucosa, xilosa, miel, manosa, xilosa), gluconodelta-lactona y almidones y sus derivados, pirrolidona, ácido carboxílico, ácido hialurónico y sus sales, lactamida monoetanolamina, acetamida monoetanolamina, pantenol, alantoína y sus mezclas.

55 Por ejemplo, el agente acondicionador de la piel se puede elegir entre glicerina, arabinoglactano, butilenglicol, ácido hialurónico, manteca de karité, propilenglicol, etilhexilglicerina, hialuronato y mezclas de estos.

Protector solar

La composición divulgada aquí puede comprender opcionalmente un componente de protector solar. El protector solar puede incluir filtros solares orgánicos o inorgánicos o una combinación de ambos. Los filtros solares inorgánicos adecuados incluyen los elegidos entre dióxido de titanio microfino y óxido de zinc microfino, y sus mezclas.

5 Los protectores solares orgánicos adecuados incluyen los elegidos entre: a) ácidos p-aminobenzoicos, sus ésteres y derivados (por ejemplo, 2-etilhexil p-dimetilaminobenzoato), b) ésteres de metoxicinamato (por ejemplo, 2-etilhexil p-metoxicinamato, 2-etoxietil p-metoxicinamato o un, p-di-(p-metoxicinamoil)-a'-(2etilhexanoil) -glicerina, c) benzofenonas (por ejemplo oxibenzona), d) dibenzoilmetanos tales como 4-(tert-butil)-4'-metoxidibenzoilmetano, e) ácido 2-fenilbencimidazol-5 sulfónico y sus sales, f) alquil-ss, ss-difenilacrilatos, por ejemplo alquil a-ciano-ss, ss-difenilacrilatos como octocrileno, g) triazinas como 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2-etil-hexil-1-oxi)-1, 3,5 triazina, h) derivados de alcanfor tales como metilbencilideno alcanfor e i) mezclas de los mismos. Otros ingredientes de protectores solares incluyen los seleccionados de entre homosalato, salicilato de etilhexilo, triazona de dietilhexilbutamido, bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina, dietilamino hidroxibenzoil hexil benzoato, metoxidibenzoilmetano de butilo, bis-benzotriazoil tetrametilbutilfenol de metileno, Polisilicona-15 y mezclas de estos. Un agente de protección solar puede estar presente del 0 al 10 % en peso, o del 0.1 al 10 % en peso de la composición.

15 Otros ingredientes opcionales

Las composiciones divulgadas aquí también pueden comprender opcionalmente uno o más de los siguientes ingredientes opcionales. Se pueden agregar conservantes a la composición tales como ácido benzoico, benzoato de sodio, ácido sórbico, sorbato de potasio, 2-bromo-2-nitropropano-1,3-diol (bronopol, disponible comercialmente bajo el nombre comercial Myacide®), alcohol bencílico, diazolidinilurea, imidazolidinilurea, metilparabeno, fenoxietanol, etilparabeno, propilparabeno, metilparabeno sódico, deshidroacetato de sodio, clorhidrato de polihexametilenobiguanida, isotiazolona y propilparabeno de sodio y sus mezclas, adecuadamente en una cantidad de 0.01 a 10 % en peso de la composición.

20 Se pueden añadir agentes secuestrantes a la composición, tales como ácido etilendiaminotetraacético y sales del mismo, por ejemplo, en una cantidad de 0.005 a 0.5 % en peso de la composición.

25 La composición también puede incluir ceras tales como manteca de cacao adecuadamente en una cantidad de desde 0.1 a 10 % en peso de la composición.

La composición puede incluir diluyentes, portadores y/o propulsores adecuados, cosméticamente aceptables, tales como dimetil éter. La composición también puede incluir agentes perlescentes tales como monoetanolamida estearica y/o mica, adecuadamente en una cantidad de desde 0.01 a 10 % en peso de la composición.

30 Los perfumes se pueden agregar adecuadamente en una cantidad de 0.01 a 2 % en peso de la composición, al igual que los pigmentos solubles en agua como la tartrazina, adecuadamente en una cantidad de una cantidad traza tal como 1×10^{-5} a 0.1 % en peso de la composición.

35 La composición también puede incluir agentes de ajuste del pH tales como hidróxido de sodio, aminometilpropanol, trietanolamina, adecuadamente en una cantidad de 0.01 a 10 % en peso de la composición. La composición puede estar regulada por medios bien conocidos en la técnica, por ejemplo, mediante el uso de sistemas reguladores que comprenden ácido succínico, ácido cítrico, ácido láctico y sales aceptables de los mismos, ácido fosfórico, fosfato mono o disódico y carbonato de sodio. Adecuadamente, la composición puede tener un pH entre 3 y 10, entre 4 y 8, o entre 4.5 y 6.5.

40 En una realización, la composición de la tecnología divulgada no contiene un derivado de ácido ascórbico elegidos entre ascorbil fosfato de sodio, glucósido ascorbilo, ácido L-ascórbico, palmitato de ascorbilo, ascorbato de retinilo, ascorbato de tetrahexildecilo o ascorbil fosfato de magnesio.

En una realización, la composición de la tecnología divulgada no incluye compuestos MMPi que comprenden un compuesto de hidroxiarilo o polihidroxiarilo, o compuestos cíclicos que tienen un grupo cíclico con base en un compuesto que comprende un pirano, una lactama o un componente de piperidina.

45 Medio cosméticamente aceptable

El medio cosméticamente aceptable comprende una fase acuosa. El medio también puede comprender alcohol y/o un aceite. En una realización, el medio cosméticamente aceptable puede incluir agua y/o un aceite.

La composición divulgada aquí puede estar en forma de un gel o una emulsión.

50 Como se usa aquí, la referencia al gel se usa en el sentido ordinario definido por IUPAC y pretende incluir una red coloidal no fluida o una red polimérica que se expande en todo su volumen por un fluido. El fluido puede ser, por ejemplo, agua o alcohol. En una realización, el fluido puede ser agua.

Cuando la composición divulgada aquí, está en forma de una emulsión, la emulsión divulgada aquí puede ser una composición de agua en aceite, aceite en agua o agua en silicona, por ejemplo una composición de aceite en agua, o composición de agua en silicona, a menudo aceite en agua.

La emulsión puede incluir una fase oleosa y tener un contenido de fase acuosa del 10 al 90 % en peso, o del 30 al 85 % en peso, o del 40 al 80 % en peso, o del 50 al 75 % en peso de la composición.

La emulsión puede incluir una fase oleosa que tiene 15 a 70 % en peso, o 10 a 60 % en peso, o 20 a 50 % en peso, o 25 a 50 % en peso, o 40 de la composición.

- 5 La emulsión puede ser una composición de aceite en agua que comprende del 15 al 70 % en peso de una fase oleosa; y del 30 al 85 % en peso de una fase acuosa, o que comprende del 25 al 50 % en peso de una fase oleosa; y 50 al 75 % en peso de una fase acuosa.

En una realización, cuando la composición está en forma de una emulsión de aceite en agua, la fase acuosa puede estar presente en 40 a 90 % en peso, y la fase oleosa puede estar presente en 10 a 60 % en peso de la composición.

- 10 La emulsión puede estar en forma de una emulsión de agua en silicona, y la fase acuosa puede estar presente en 30 a 85 % en peso de una fase acuosa; y silicona presente en 15 a 70 % en peso de una fase de silicona.

La emulsión puede estar en forma de una emulsión de agua en silicona, y la fase de agua puede estar presente en 60 a 75 % en peso de una fase acuosa; y silicona presente en 25 a 40 % en peso de una fase de silicona.

- 15 Si la composición divulgada aquí está en forma de una composición de agua en silicona, la fase oleosa puede proporcionarse mediante cualquier silicato adecuado, dimeticonoles, elastómero de silicona y mezclas de estos (por ejemplo, un elastómero de silicona).

Por ejemplo, la fase de aceite de silicona se puede formar a partir de un organopolisiloxano. El organopolisiloxano se puede elegir entre uno o más de un polialquilsiloxano, dimeticona sustituida con alquilo, ciclometicona, trimetilsiloxisilicato, dimeticonol, polialquilaril siloxano y mezclas de estos. El polialquilsiloxano puede ser, por ejemplo, una ciclometicona, o dimeticona, por ejemplo, una dimeticona.

- 20 Una composición de agua en silicona divulgada aquí puede incluir un elastómero de organopolisiloxano entrecruzado emulsionante, un elastómero de organopolisiloxano entrecruzado no emulsionante o una mezcla de estos. El término "no emulsionante", como se usa aquí, define elastómeros de organopolisiloxano entrecruzados de los que faltan unidades de polioxialquilenos. Los elastómeros pueden incluir dimetilpolisiloxanos entrecruzados por sitios Si-H en una resina MQ molecularmente esférica. Los elastómeros de organopolisiloxano entrecruzados emulsionantes incluyen los polímeros entrecruzados descritos en las patentes de Estados Unidos 5,412,004; 5,837,793; y 5,811,487. El elastómero emulsionante compuesto de polímero cruzado de dimeticona copoliol (y) dimeticona disponible comercialmente de Shin Etsu bajo el nombre comercial KSG-21.

- 30 Los elastómeros no emulsionantes pueden incluir polímeros cruzados de dimeticona. Tales polímeros cruzados de dimeticona son suministrados por una variedad de proveedores, incluido Dow Corning (EL9240). Se encuentran disponibles otros polímeros cruzados de dimeticonas de General Electric (SFE 839), Shin Etsu (KSG-15, 16, 18 [polímero cruzado de dimeticona/fenilvinil dimeticona]) e Industrias Grant (línea de elastómeros GRANSIL™). Los elastómeros de organopolisiloxano entrecruzados útiles en la composición divulgada aquí y los procedimientos para fabricarlos se describen adicionalmente en las patentes de los Estados Unidos 4,970,252; 5,760,116; y 5,654,362. Los elastómeros disponibles comercialmente, típicos para su uso aquí, son la mezcla de elastómero de silicona 9040 de Dow Corning, KSG-21 de Shin Etsu y sus mezclas.

Una emulsión de aceite en agua o agua en aceite puede incluir un aceite orgánico. El aceite orgánico puede ser volátil o no volátil. El aceite orgánico puede incluir un diluyente, un disolvente, un polímero de poliolefina o un aceite de éster.

- 40 El término "aceite de éster" significa un aceite que es líquido a temperatura ambiente (25 °C) que comprende al menos un grupo funcional de éster. El aceite de éster usado aquí se elige, por ejemplo, de monoésteres.

El aceite de éster puede, por ejemplo, elegirse entre los monoésteres de fórmula R^1COOR^2 en donde R^1 puede seleccionarse de cadenas a base de hidrocarburos lineales y ramificados que comprenden de 4 a 30, o de 6 a 24, o de 7 a 20 átomos de carbono y R^2 pueden elegirse de cadenas a base de hidrocarburos ramificados que comprenden de 3 a 40 átomos de carbono, tales como de 10 a 30 átomos de carbono y además tales de 16 a 26 átomos de carbono.

- 45 Los ejemplos de los aceites de éster que se pueden mencionar incluyen neopentanoato de isodecilo; octanoato de isocetilo; isononanoato de isononilo, isononanoato de isodecilo, isononanoato de tridecilo; laurato de hexilo, laurato de 2-hexildecilo; miristato de isopropilo, miristato de isocetilo, miristato de isotridecilo, miristato de 2-octildodecilo; palmitato de isopropilo, palmitato de 2-etilhexilo, palmitato de isoocitilo, palmitato de isocetilo, palmitato de isodecilo, isoestearato de isopropilo, estearato de 2-octildodecilo, isoestearato de isoestearilo y erucato de 2-octildodecilo.

El aceite de éster puede estar presente en la emulsión divulgada aquí en una cantidad que varía, por ejemplo, del 0 al 20 % en peso, o del 0.1 al 15 % en peso, o del 1 al 10 % en peso de la composición.

Ejemplos

Se preparan una serie de composiciones usando el siguiente procedimiento general. Se agrega un porcentaje de agua a un recipiente y se agrega un porcentaje de ácido salicílico para formar una mezcla. La mezcla se agita luego durante aproximadamente 30 minutos. Un porcentaje de vitamina C, o un derivado de este, se agrega al recipiente y se agita hasta que se disuelve. El pH se ajusta a 4.5 ± 0.1 usando una solución de 50 p/p de hidróxido de potasio o polvo de ácido cítrico. Las composiciones preparadas son:

5 Ejemplo comparativo 1 (CE1): una composición que contiene 0.2 % en peso de ascorbil fosfato de sodio y 2 % en peso de ácido salicílico.

Ejemplo comparativo 2 (CE2): una composición que contiene 0.2 % en peso de glucósido de ascorbilo y 2 % en peso de ácido salicílico.

10 Ejemplo inventivo 1 (IE1): una composición que contiene 0.2 % en peso de ácido 3-O-etilo ascórbico y 2 % en peso de ácido salicílico.

Pruebas

15 La estabilidad de los ejemplos se evalúa mediante el análisis de los cambios de color a lo largo del tiempo utilizando un espectrofotómetro de mesa X-Rite Color™ i7 con kit de transmisión para mediciones de líquidos. El procedimiento de prueba implica las siguientes etapas para cada nueva muestra: (1) Calibrar el espectrofotómetro para la medición de la transmisión, (2) Llenar la cubeta con la solución de prueba, (3) Insertar la cubeta en el instrumento, (4) Medir los valores iniciales (estándar) $L^* a^* b^*$ para cada ejemplo, y (5) limpiar y secar la solución para la próxima medición.

20 Después de la medición inicial, cada ejemplo se coloca en un gabinete de humedad a 40°C . Los cambios en el color se miden para cada ejemplo después de 1, 7 y 14 días después de que cada muestra se almacena en un gabinete a 40°C . Antes de las mediciones de cambio de color, cada muestra se deja enfriar hasta 23°C . Cada ejemplo es evaluado siguiendo las anteriores etapas 1-5.

25 La calificación DE2000 después de la medición inicial en el espectrofotómetro se normaliza a 0. Los resultados obtenidos después de 1, 2, 3, 4 y 8 semanas para cada ejemplo se muestran en las siguientes tablas para mediciones realizadas a 3°C , 23°C y 40°C . Por lo general, se obtienen mejores resultados para ejemplos que tienen una clasificación DE2000 más baja (DE2000 es una medida de cambio de color sin unidades). Un aumento en DE2000 indica que un ejemplo se está volviendo menos estable con el tiempo.

	Medición de DE2000 a 3°C		
Tiempo/semanas	IE1	CE1	CE2
0	0	0	0
1	0.09	0.11	0.11
2	0.09	0.09	0.1
3	0.05	0.08	0.09
4	0.08	0.11	0.13
8	0.09	0.08	0.18

	Medición de DE2000 a 23°C		
Tiempo/semanas	IE1	CE1	CE2
0	0	0	0
1	0.08	0.14	0.11
2	0.1	0.25	0.1
3	0.08	0.43	0.09
4	0.1	0.63	0.13
8	0.1	1.12	0.18

ES 2 765 871 T3

Tiempo/semanas	Medición de DE2000 a 40 ° C		
	IE1	CE1	CE2
0	0	0	0
1	0.09	1.76	0.1
2	0.08	2.38	0.06
3	0.09	3.5	0.11
4	0.11	3.97	0.13
8	0.21	5.89	0.27

Los resultados obtenidos indican que la composición de la tecnología divulgada ha mejorado la estabilidad a 3 ° C, 23 ° C y 40 ° C en comparación con los ejemplos comparativos que contienen vitamina C, o derivados de la misma (como el ascorbil fosfato de sodio y el glucósido de ascorbilo).

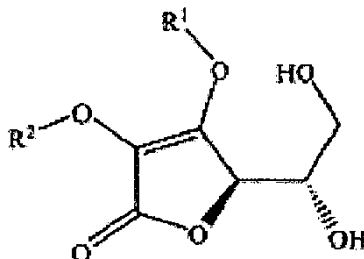
5

REIVINDICACIONES

1. Una composición que tiene un pH que varía de 3 a 7 y que comprende:

0.1 a 3 % en peso (o 0.5 a 2.5 % en peso) de un beta-hidroxiácido aromático;

0.05 a 3 % en peso (o 0.09 a 2.5 % en peso) de un ácido ascórbico con sustitución en O representado por la fórmula:



5

en donde los grupos R^1 y R^2 son independientemente H, alquilo C1-20, cicloalquilo C3-20, alcoxi C1-20, acilo C2-20, arilo C6-20, heterocíclico aromático C1-20, heterocíclico no aromático C1-20 o cicloalqueno C3-20 con la condición de que tanto R^1 como R^2 no puedan ser H; y

un medio cosméticamente aceptable que comprende una fase acuosa,

10 en donde el beta-hidroxiácido aromático está presente en una concentración más alta que el ácido ascórbico sustituido con O.

2. La composición de la reivindicación 1, en donde el ácido ascórbico con sustitución en O es ácido 3-alquilo ascórbico.

3. La composición de la reivindicación 2, en donde el ácido ascórbico con sustitución en O es ácido 3-O-etilo ascórbico.

4. La composición de cualquier reivindicación precedente, en donde el beta-hidroxiácido aromático es ácido salicílico.

15 5. La composición de cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde la composición comprende del 1 al 2.5 % en peso del beta-hidroxiácido aromático y del 0.09 al 2.5 % en peso del ácido ascórbico con sustitución en O.

6. La composición de cualquier reivindicación precedente, en donde la composición tiene una proporción en peso del beta-hidroxiácido aromático al ácido ascórbico sustituido en O de (i) 1:1 a 1:0.01, o (ii) 1:0.7 a 1:0.5 o (iii) 1:0.5 a 1:0.1.

20 7. La composición de cualquier reivindicación precedente, en donde la composición es una emulsión de aceite en agua y la emulsión de aceite en agua tiene una fase acuosa presente en 40 a 90 % en peso de la composición, y opcionalmente en donde la fase oleosa está presente en 10 a 60 % en peso de la composición.

8. La composición de cualquier reivindicación precedente, en donde la composición no incluye gluconolactona.

9. La composición de cualquier reivindicación precedente, en donde la composición tiene un pH que varía de 4.0 a 5.5.

25 10. El uso cosmético de una composición de cualquier reivindicación precedente.

11. El uso cosmético de la reivindicación 10, en donde la composición es una composición para el cuidado de la piel.

12. Un método para mejorar el cuidado de la piel que comprende administrar a la piel una composición de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en donde mejorar el cuidado de la piel incluye (i) mejorar la exfoliación o humidificación de la piel, o (ii) disminuir o prevenir al menos una de las siguientes: formación de arrugas o líneas finas, flacidez de la piel o hiperpigmentación, o (iii) aumentar la firmeza de la piel o laxitud de la piel.

30 13. El uso de la composición de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 para mejorar el estado de la piel en donde mejorar el estado de la piel incluye (i) mejorar la exfoliación o humidificación de la piel, o (ii) disminuir o prevenir al menos uno de los siguientes: formación de arrugas o líneas finas, flacidez de la piel o hiperpigmentación, o (iii) aumentar la firmeza de la piel o laxitud de la piel.