



OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11) Número de publicación: 2 784 947

51 Int. Cl.:

A61K 8/35 (2006.01) A61K 8/42 (2006.01) A61Q 19/00 (2006.01) A61Q 5/00 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(86) Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: 23.06.2017 PCT/EP2017/065547

(87) Fecha y número de publicación internacional: 04.01.2018 WO18001898

niacinamida y composición cosmética que la contiene

Fecha de presentación y número de la solicitud europea: 23.06.2017 E 17735414 (9)
 Fecha y número de publicación de la concesión europea: 12.02.2020 EP 3478253

(54) Título: Mezcla líquida que contiene 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona, un compuesto de

(30) Prioridad:

30.06.2016 FR 1656175

Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente: **02.10.2020**

73) Titular/es:

L'ORÉAL (100.0%) 14, rue Royale 75008 Paris, FR

(72) Inventor/es:

OUATTARA, SOFIANE y CHEVALIER, VÉRONIQUE

(74) Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

DESCRIPCIÓN

Mezcla líquida que contiene 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona, un compuesto de niacinamida y composición cosmética que la contiene

El objeto de la presente invención es una mezcla líquida que contiene 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona y un compuesto de niacinamida y también una composición cosmética que contiene dicha mezcla.

La 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona (cetocompuesto) es una sustancia interesante como conservante para composiciones cosméticas para proteger a las composiciones de la contaminación microbiana, como se describe en la Solicitud de Patente Internacional WO 2011/039445.

Sin embargo, a temperatura ambiente (23 °C) este compuesto está en la forma de un sólido amorfo muy compacto 10 que no se absorbe fácilmente, haciendo difícil su manipulación, especialmente para fabricación industrial de productos, como composiciones (mezclas de ingredientes) que comprenden este compuesto. Además, este compuesto es muy poco soluble en agua o en glicerol o también incluso en 2-octildodecanol y se sabe a partir de los documentos de Patente Internacional WO2012/130953 y WO2012/130954 el uso de ciertos disolventes orgánicos para poder disolver este cetocompuesto y facilitar su uso en composiciones de mezclas de ingredientes. Para disolver el cetocompuesto. es necesario usar, por ejemplo, 1,3-propanodiol, uno de los mejores disolventes, en una cantidad grande en relación 15 con la cantidad de cetocompuesto, es decir, al menos el 40 % en peso de 1,3-propanodiol por el 60 % en peso de cetocompuesto, es decir, una relación en peso de cetocompuesto / 1,3-propanodiol = 1.5. Así, la disolución mediante un disolvente orgánico requiere el uso de grandes cantidades de disolvente en relación con la cantidad de cetocompuesto que se tiene que disolver. Esta gran cantidad de disolvente tiene un efecto restrictivo sobre la fabricación industrial de productos que contienen el cetocompuesto disuelto con los disolventes: restricciones en 20 términos de espacio (la mezcla de cetocompuesto y disolvente es voluminosa y requiere la fabricación de tanques de gran volumen) y en términos de coste asociado a esta gran cantidad de disolvente que se tiene que usar.

Parece, por lo tanto, necesario poder usar el cetocompuesto más fácilmente que por la ruta de disolución con un disolvente orgánico. Se busca especialmente poder proporcionar una mezcla líquida simple que comprenda el cetocompuesto, que sea fácilmente utilizable y teniendo también buena estabilidad, para permitir el fenómeno de la recristalización del cetocompuesto durante el almacenamiento de dicha mezcla líquida.

Los autores han descubierto, inesperadamente, que la combinación de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona con un compuesto de niacinamida en proporciones específicas hace posible obtener una mezcla en forma líquida, en la que no cristaliza el cetocompuesto, especialmente después de almacenamiento durante al menos 2 meses a temperatura ambiente (23 °C). Esta mezcla líquida es fácil de usar en composiciones y, así, permite la fabricación industrial más fácil de las composiciones que contienen el cetocompuesto.

Más específicamente, un objeto de la invención es una mezcla líquida que comprende 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona y un compuesto de niacinamida, o está constituida por los mismos (o consiste en los mismos), especialmente presente en una cantidad de manera que la relación en peso de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona / compuesto de niacinamida varía de 12 a 250.

Otro objeto de la invención es una composición, especialmente una composición cosmética, que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, dicha mezcla descrita anteriormente.

Un objeto más de la invención es un procedimiento para el tratamiento cosmético no terapéutico de materiales queratínicos, que comprende la aplicación a los materiales queratínicos de una composición como se describió anteriormente. El procedimiento puede ser un procedimiento cosmético para el cuidado de materiales queratínicos, o su maquillaje o su limpieza.

La 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona es un compuesto de fórmula:

5

25

30

35

40

45

El compuesto de niacinamida se elige de entre: niacinamida (también conocido como vitamina B3), N,N-dietilniacinamida, N-picolilniacinamida y N-alilniacinamida. Según una realización preferida, el compuesto de niacinamida es niacinamida. En la mezcla según la invención, la relación en peso de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona / compuesto de niacinamida preferiblemente varía de 19 a 220.

ES 2 784 947 T3

El compuesto 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que varía del 0.01 % al 5 %, en peso, respecto al peso total de la composición, preferiblemente que varía del 0.01 % al 3 %, en peso, y preferiblemente que varía del 0.01 % al 2.5 %, en peso.

- La mezcla es líquida y homogénea, es fácil de manipular y, por lo tanto, permite la incorporación fácil del cetocompuesto con otros ingredientes adicionales para preparar composiciones como composiciones cosméticas o dermatológicas.
 - «Mezcla líquida» significa una mezcla fluida que fluye por su propio peso en menos de 10 segundos a temperatura ambiente (23 °C).
- Otro objeto de la invención es un procedimiento para preparar una mezcla líquida que comprende una etapa de mezcla de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona y compuesto de niacinamida calentada a una temperatura de entre 70 °C y 80 °C, después una etapa de enfriamiento a una temperatura de entre 15 °C y 28 °C, en particular entre 20 °C y 25 °C (temperatura ambiente).
 - Otro objeto de la invención es una composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, la mezcla líquida descrita anteriormente.
- Medio fisiológicamente aceptable significa un medio que es compatible con materiales queratínicos humanos como la piel, el cuero cabelludo, el cabello y las uñas. Dicho medio puede comprender uno o más ingredientes adicionales diferentes del cetocompuesto y del compuesto de niacinamida.
- La composición puede comprender al menos un ingrediente adicional elegido de entre: agua, aceites, polioles que tienen de 1 a 10 átomos de carbono, agentes gelificantes, tensioactivos, polímeros formadores de película, colorantes, fragancias, cargas, agentes protectores UV frente a la radiación ultravioleta, extractos de plantas, principios activos cosméticos y dermatológicos y sales.
 - La composición según la invención puede comprender una fase acuosa.
 - La composición puede comprender agua, que puede estar presente en una cantidad que varíe del 5 % al 80 %, en peso, respecto al peso total de la composición y preferiblemente que varíe del 35 % al 75 %, en peso.
- La composición también puede comprender un poliol que sea miscible en agua a temperatura ambiente (25 °C), especialmente elegido de entre polioles especialmente que tengan de 2 a 10 átomos de carbono, preferiblemente que tengan de 2 a 6 átomos de carbono, como glicerol, propilenglicol, 1,3-propanodiol, butilenglicol, pentilenglicol, hexilenglicol, dipropilenglicol, dietilenglicol o diglicerol.
- Las composiciones según la invención pueden estar en forma de emulsiones de aceite en agua (O/W), emulsiones de agua en aceite (W/O) o emulsiones múltiples (triples: W/O/W u O/W/O), disoluciones oleosas, geles oleosos, disoluciones acuosas, geles acuosos, composiciones sólidas. Estas composiciones se preparan según los métodos habituales.
 - Las composiciones según la invención pueden ser más o menos fluidas y pueden tener el aspecto de crema blanca o coloreada, pomada, leche, loción, suero, pasta o espuma. Pueden aplicarse opcionalmente en la piel en forma de aerosol. También pueden estar en forma sólida, por ejemplo, en forma de barra o de polvo compacto.

La composición según la invención puede estar especialmente en la forma de:

- un producto de maquillaje, especialmente para el maquillaje de la piel del rostro, el cuerpo o los labios o las pestañas:
- un gel o una loción para después del afeitado;
- una crema depiladora;

35

45

- una composición para la higiene corporal como gel de ducha o champú;
- una composición cosmética;
- una composición sólida tal como jabón o pastilla de limpieza;
- una composición en aerosol que comprenda también un propelente presurizado;
- una loción fijadora, una crema o un gel para el peinado, una composición colorante, una loción reestructurante del cabello, una composición de permanente, una loción o un gel para combatir la pérdida del cabello o
 - una composición para el cuidado de la piel o para su limpieza.

Otro objeto de la invención es un procedimiento para preparar una composición, especialmente una composición cosmética o dermatológica, que comprende:

una etapa de mezcla de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona y compuesto de nicinamida definida anteriormente, calentada a una temperatura de entre 70 °C y 80 °C, después una etapa de enfriamiento a una temperatura de entre 15 °C y 28 °C, después

una etapa de adición de la mezcla obtenida previamente con uno o más ingredientes adicionales, especialmente ingredientes cosméticos o dermatológicos, como los descritos anteriormente.

La invención se ilustra con más detalle en el ejemplo que sigue. Las cantidades de los ingredientes se expresan como porcentajes en peso.

10 Ejemplo 1: aspecto visual de varias mezclas

5

15

Se produjeron 11 mezclas de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona (cetocompuesto) y niacinamida en diferentes proporciones en peso descritas en la tabla a continuación mediante calentamiento de cada una de las mezclas a la temperatura de 75 °C ± 5 °C, permitiendo después enfriar a temperatura ambiente (23 °C).

El aspecto de la mezcla a T0 se observó después a simple vista, después se dejó la mezcla almacenada a temperatura ambiente (23 °C) durante 2 meses y se observó el aspecto de la mezcla de nuevo al final del almacenamiento. Se observó si la mezcla era líquida y homogénea, o también si no era homogénea, con el aspecto de cristales.

Se obtuvieron los siguientes resultados:

Mezcla	Composición de cetona (% en peso)	Niacinamida (% en peso)	Aspecto a T0	Aspecto a T = 2 meses a T ambiente
M1	99.5	0.5	líquido	líquido
M2	99	1	líquido	líquido
МЗ	98	2	líquido	líquido
M4	97	3	líquido	líquido
M5	96	4	líquido	líquido
M6	95	5	líquido	líquido
M7	94	6	líquido	cristales
M8	93	7	líquido	líquido
M9	92	8	líquido	cristales
M10	91	9	líquido	cristales
M11	90	10	líquido	cristales

Se observó, así, que las mezclas M1 a M8, que contenían del 0,5 % al 7 % de niacinamida, eran líquidas y homogéneas a T0 y después de 2 meses de almacenamiento temperatura ambiente, mientras que las mezclas M9 a M11, que contenían del 8 % al 10 % de niacinamida, no eran homogéneas (aspecto de cristales) después de 2 meses de almacenamiento a temperatura ambiente.

Así, las mezclas M1 a M8 eran aptas para uso en la fabricación industrial de composiciones, especialmente de composiciones cosméticas, por simple adición de la mezcla líquida con los otros constituyentes para obtener la composición final deseada.

Ejemplo 2:

20

25

Se preparó un gel para el cuidado facial teniendo la siguiente composición (contenidos como porcentaje en peso):

ES 2 784 947 T3

Polímero reticulado de acrilatos/acrilato de alquilo C ₁₀ -C ₃₀ (Carbopol® Ultrez 20 Polymer de Noveon)	0.9 %
PEG-8	6 %
Mezcla M6 que contiene el 95 % en peso de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona y el 5 % en peso de niacinamida	0.53 %
Hidróxido de sodio	0.35 %
Agua c. s.	
	100 %

La composición es estable y homogénea.

REIVINDICACIONES

- 1. Mezcla líquida constituida por 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona y de compuesto de niacinamida elegido de entre: niacinamida, N,N-dietilniacinamida, N-picolilniacinamida y N-alilniacinamida.
- Mezcla según la reivindicación precedente, caracterizada por que comprende 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona
 y niacinamida en cantidades tales que la relación en peso de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona / compuesto de niacinamida varía de 12 a 250 y preferiblemente varía de 19 a 220.
 - 3. Mezcla según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizada por que el compuesto de niacinamida es niacinamida.
- 4. Procedimiento para preparar una mezcla líquida que comprende una etapa de mezcla de 4-(3-etoxi-4-10 hidroxifenil)butan-2-ona y compuesto de niacinamida elegido de entre: niacinamida, N,N-dietilniacinamida, N-picolilniacinamida y N-alilniacinamida, calentada a una temperatura de entre 70 °C y 80 °C, después una etapa de enfriamiento a una temperatura de entre 15 °C y 28 °C.
 - 5. Composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, una mezcla líquida de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona y de compuesto de niacinamida según una de las reivindicaciones 1 a 3.
- 15 6. Composición según la reivindicación precedente, caracterizada por que comprende al menos un ingrediente adicional elegido de entre: agua, aceites, polioles que tienen de 1 a 10 átomos de carbono, agentes gelificantes, tensioactivos, polímeros formadores de película, colorantes, fragancias, cargas, agentes protectores UV frente a la radiación ultravioleta, extractos de plantas, principios activos cosméticos y dermatológicos y sales.
- 7. Composición según cualquiera de las reivindicaciones 4 y 5, caracterizada por que la 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)butan-2-ona está presente en una cantidad que varía del 0.01 % al 5 %, en peso, respecto al peso total de la composición, preferiblemente que varía del 0.01 % al 3 %, en peso, y preferiblemente que varía del 0.01 % al 2.5 %, en peso.
 - 8. Procedimiento de tratamiento cosmético no terapéutico para el cuidado de materiales queratínicos, y/o su maquillaje y/o su limpieza, que comprende la aplicación a dichos materiales queratínicos de una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 5 a 7.