

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 786 302**

51 Int. Cl.:

A61Q 17/04 (2006.01)

A61Q 19/08 (2006.01)

A61K 8/891 (2006.01)

A61K 8/894 (2006.01)

A61K 8/06 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **19.12.2014 PCT/US2014/071515**

87 Fecha y número de publicación internacional: **25.06.2015 WO15095711**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **19.12.2014 E 14833312 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **05.02.2020 EP 3082974**

54 Título: **Sistema de vehículo para principios activos solubles en agua**

30 Prioridad:

20.12.2013 US 201314136634

20.12.2013 US 201314136562

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

09.10.2020

73 Titular/es:

L'OREAL (100.0%)

14 rue Royale

75008 Paris, FR

72 Inventor/es:

CHIOU, CATHERINE;

PAN, ZHI;

GALDI, ANGELIKE;

MANNING, LAUREN y

GOLDBERG, ANDREW, B.

74 Agente/Representante:

PONS ARIÑO, Ángel

ES 2 786 302 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

Sistema de vehículo para principios activos solubles en agua

5 Campo de la invención

La presente invención se dirige a composiciones que contienen filtros de protección solar de UV solubles en agua. De manera más específica, la presente invención se dirige a una composición de protección solar en forma de una emulsión inversa de agua en silicona que contiene altos niveles de filtros de UV solubles en agua. La composición puede transportar grandes cantidades de ingredientes solubles en agua de una manera agradable a la textura, sin experimentar separación de la emulsión. La presente invención también proporciona un efecto de liberación de agua cuando se aplica sobre un sustrato queratinoso, tal como la piel, el cabello o las uñas. El efecto de liberación de agua permite que la composición, inicialmente en forma de una emulsión, se convierta en una pluralidad de gotículas tras la aplicación de cizalla, tal como, por ejemplo, frotamiento.

15

Antecedentes de la invención

La incorporación de principios activos solubles en agua a composiciones de tipo emulsión ha planteado diversos problemas de estabilidad. Esto ha sido especialmente cierto cuando el deseo era incorporar mayores cantidades de dichos ingredientes a las composiciones. Los ejemplos de la falta de estabilidad incluyen la decoloración de la fórmula y/o la separación por precipitación de los ingredientes de la composición.

20

Muchos consideran que la fotoprotección de los sustratos queratinosos, en especial, de la piel, resulta necesaria con el fin de facilitar protección contra los eritemas solares y el fotoenvejecimiento, así como disminuir las posibilidades de desarrollo de cáncer de piel. De manera típica, existen dos tipos de protectores solares de UV usados para lograr la fotoprotección, a saber, los filtros de UV inorgánicos y los filtros de UV orgánicos.

25

Los filtros de UV inorgánicos, tales como el dióxido de titanio y el óxido de zinc, se emplean, de manera típica, en grandes cantidades con el fin de garantizar una cobertura adecuada/protección máxima sobre la superficie sobre la que estos se aplican. Como resultado, estos tienen la tendencia a tener un tacto seco y confieren un color blanco no deseable sobre la superficie sometida a tratamiento.

30

Los filtros de UV orgánicos, de manera típica, se clasifican por ser solubles en agua o solubles en aceite, basándose en su solubilidad. Los filtros de UV solubles en aceite, tales como el homosalato, el octocrileno y la avobenzona, aunque son fáciles de incorporar a las emulsiones, a menudo confieren un tacto grasoso y pegajoso en la piel de un usuario que los consumidores consideran desagradable y, por tanto, no deseable.

35

Los filtros de UV solubles en agua no confieren este tacto desagradable, ya que los consumidores consideran que estos proporcionan un tacto de la piel mucho más ligero. Los filtros de UV solubles en agua a menudo se usan en forma de una sal de sodio (es decir, un electrolito) con el fin de mejorar su perfil de solubilidad. Sin embargo, el problema es que tales filtros, debido a sus propiedades electrolíticas, son difíciles de formular cuando se trata de la estabilidad a largo plazo. Esta falta de estabilidad a menudo se manifiesta en sí misma en forma de recristalización de los filtros en la composición, haciendo que estos se separen de la emulsión. De manera adicional, los filtros de UV solubles en agua tienden a tener un efecto perjudicial sobre cualquier ingrediente espesante hallado de manera convencional en los productos tópicos, ya que estos también tienen la tendencia a separarse de la emulsión debido a las propiedades electrolíticas de los filtros de UV. Como resultado, los filtros de UV solubles en agua presentan un problema en su incorporación a emulsiones destinadas a la aplicación tópica sobre un sustrato queratinoso, ya que la mayoría de las emulsiones tradicionales se espesan y/o estabilizan con polímeros naturales o sintéticos, tales como las gomas y los poliacrílatos, que son muy sensibles a los electrolitos.

45

El documento US 2007/0264210 A1 se refiere a un método de potenciación de la administración de productos activos para el cuidado de la piel solubles en agua en el tejido queratinoso, que comprende la etapa de aplicar al tejido queratinoso una emulsión de agua en aceite que comprende una fase acuosa y una fase no acuosa, en donde la fase acuosa comprende un producto activo para el cuidado de la piel soluble en agua y donde, tras la aplicación de esfuerzo de cizallamiento a la composición, la fase acuosa se separa de manera visible de la fase no acuosa. Las composiciones comprenden dimeticona y un elastómero de siloxano reticulado emulsionante.

55

El documento US 2007/0128137 A1 desvela composiciones de emulsión de agua en aceite que comprenden: de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 15 % de un elastómero de siloxano reticulado no emulsionante; de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 15 % de un elastómero de siloxano reticulado emulsionante; de aproximadamente el 1 % a aproximadamente el 40 % de un disolvente para los elastómeros de siloxano reticulados no emulsionantes y emulsionantes; opcionalmente, del 0 % a aproximadamente el 5 % de un emulsionante adicional; y de aproximadamente el 50 % a aproximadamente el 99 % de fase acuosa; en donde, cuando se aplica esfuerzo de cizallamiento a la composición durante la extensión sobre la piel, la fase acuosa se libera de la emulsión.

60

65

El documento WO 2013/192004 A2 es un documento publicado posteriormente y desvela una composición cosmética de liberación de agua en forma de una emulsión y un proceso para la preparación de la composición cosmética. La composición cosmética incluye una fase acuosa y una fase oleosa. La fase acuosa incluye un agente hidratante en una concentración, en peso, de aproximadamente el 10 % a aproximadamente el 50 %, basándose en el peso de la composición. La fase oleosa incluye dimeticona en una concentración, en peso, de aproximadamente el 1 % a aproximadamente el 25 %, basándose en el peso de la composición. La fase oleosa incluye un elastómero de siloxano reticulado emulsionante en una concentración, en peso, de aproximadamente el 0,5 % a aproximadamente el 7 %, basándose en el peso de la composición. La composición cosmética tiene una relación de fases de la fase acuosa respecto a la fase oleosa de aproximadamente 3,0 a aproximadamente 12,0. La composición cosmética se convierte de una emulsión en una pluralidad de gotículas con el frotamiento.

Otras composiciones cosméticas se muestran en los documentos DE 10 2009 045981A1, EP 2 016 932 A2, WO 00/24365A1 y EP 2 319 484 A2.

Por lo tanto, un objeto de la presente invención es proporcionar una composición que pueda transportar de manera estable filtros de protección solar de UV solubles en agua, que también resulte agradable al tacto para los consumidores tras la aplicación. Además, un objeto de la presente invención es proporcionar una composición de fotoprotección que contenga al menos un filtro de UV soluble en agua, en forma de sal o ácido, que tenga una estabilidad mejorada, pero sin tener un tacto grasoso y/o pegajoso.

Breve descripción de la invención

Se entiende que los números que expresan cantidades de ingredientes y/o condiciones de reacción están modificados en todos los casos por el término "aproximadamente", a menos que se indique lo contrario.

La invención proporciona una composición de acuerdo con la reivindicación 1. En una realización de ejemplo, se proporciona una composición en forma de una emulsión estable y agradable al tacto que contiene cantidades significativas de al menos un principio activo soluble en agua. El al menos un principio activo soluble en agua es un filtro de protección solar de UV. La composición incluye una fase acuosa y una fase oleosa. La fase acuosa contiene el al menos un ingrediente soluble en agua en una concentración de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 20 % en peso, basándose en el peso total de la composición. La fase oleosa consiste en dimeticona en una concentración en peso de aproximadamente el 1 % a aproximadamente el 25 %, basándose en el peso total de la composición, un elastómero de siloxano reticulado emulsionante en una concentración en peso de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 20 %, basándose en el peso total de la composición, y, opcionalmente, un coemulsionante en una concentración, en peso, del 0,01 al 1 %, basándose en el peso de la composición. La composición para el cuidado de la piel tiene una relación de fases de la fase acuosa respecto a la fase oleosa de aproximadamente 5,0 a aproximadamente 9,0. La composición se convierte de una emulsión en una pluralidad de gotículas tras la aplicación de cizallamiento, tal como, por ejemplo, el frotamiento con los dedos o el uso de un dispositivo electromecánico que confiera fuerza, tal como, por ejemplo, un cepillo de limpieza electromecánico.

En general, la presente invención se dirige a una composición de fotoprotección de tipo emulsión inversa de agua en aceite (silicona) que contiene un elastómero de siloxano reticulado emulsionante y filtros de UV solubles en agua (WSUVF en inglés).

En otra realización de ejemplo, se proporciona un método de administración de principios activos para el cuidado de la piel sobre sustratos queratinosos. El método incluye aplicar la composición desvelada anteriormente sobre la superficie de un sustrato queratinoso, seguido de la aplicación de cizallamiento sobre la composición presente sobre el sustrato queratinoso.

De la composición se puede usar para la inhibición del contacto de los rayos UV con los sustratos queratinosos. El uso incluye aplicar la composición de fotoprotección desvelada anteriormente sobre la superficie de un sustrato queratinoso, seguido de la aplicación de fuerza sobre la composición presente sobre el sustrato queratinoso.

Los inventores han descubierto, de manera sorprendente, que los problemas de estabilidad encontrados por el uso de filtros de UV solubles en agua en emulsiones se pueden mitigar mediante el uso de una emulsión inversa de agua en aceite, donde los WSUVF se incorporan a la fase de agua dominante antes del emulsionamiento. Tal enfoque solubiliza por completo los WSUVF y sus sales y proporciona la estabilidad de la emulsión sin el uso de ningún espesante de fase de agua. Además, la fase externa oleosa (silicona) da a la composición un tacto agradable y sedoso tras la aplicación tónica.

Otras características y ventajas de la presente invención resultarán evidentes a partir de la siguiente descripción más detallada de la realización preferida que ilustra, a modo de ejemplo, los principios de la invención.

Descripción detallada de la invención

El término "sustrato queratinoso", tal como se usa en el presente documento, incluye, pero sin limitación, la piel, el cabello y las uñas.

5 El término "fuerza", tal como se usa en el presente documento, incluye el cizallamiento/la fricción producida por un movimiento de frotamiento de los dedos de un usuario final, un dispositivo de limpieza electromecánico que tiene un cepillo móvil con cerdas y/o un dispositivo electromecánico que produce un movimiento de percusión, similar al de los dedos que percuten sobre la superficie de la piel.

10 El término "homogéneo" significa sustancialmente uniforme en su conjunto, es decir, una mezcla de fase individual.

En la presente solicitud, el término "temperatura ambiente" significa una temperatura de aproximadamente 25 °C.

15 En la presente solicitud, el término "estable" significa que la emulsión permanece intacta sin separación de fases, el color y/o el olor cambian durante el período de control de la estabilidad y los principios activos solubles en agua permanecen solubilizados en la fase de agua sin cristalización o separación por precipitación de la emulsión.

20 En la presente solicitud, la expresión "liberación de agua" tal como se usa en el presente documento, describe el fenómeno en donde, después de la aplicación de una composición sobre un sustrato diana, se aplica además una fuerza sobre la composición que hace que la emulsión de tipo agua en aceite se rompa, lo que, a su vez, hace que la fase acuosa interna que contiene el/los principio/s activo/s soluble/s en agua emerja en forma de gotículas.

25 La composición de antienvjecimiento, la composición de fotoprotección y el método de la presente invención pueden comprender, consistir en o consistir esencialmente en los elementos esenciales y las limitaciones de la invención que se describen en el presente documento, así como cualquier ingrediente, componente o limitación adicional u opcional que se describa en el presente documento o sea útil de otro modo en las composiciones destinadas a la aplicación tópica sobre sustratos queratinosos.

30 Los inventores han descubierto, de manera sorprendente, que las altas concentraciones de los principios activos solubles en agua, tales como, por ejemplo, los ácidos fenólicos o polifenólicos, se pueden formular en una emulsión estable de tipo agua en aceite que, aunque inicialmente esté en forma de una crema, posee un efecto transformador de liberación de agua tras la aplicación de fuerza, tal como, por ejemplo, cizallamiento. El efecto transformador de liberación de agua es que la crema se transforma en gotículas que contienen la fase acuosa con el ingrediente soluble en agua, lo que, cuando se expone a la fuerza, tal como el efecto de cizallamiento causado por el frotamiento/masaje de la emulsión presente sobre la superficie del sustrato queratinoso, fuerza de ese modo que las gotículas que contienen ingredientes solubles en agua entren en el sustrato queratinoso.

40 Una ventaja de una realización de la presente divulgación incluye la provisión de una composición estable o una composición de fotoprotección estable que puede transportar niveles relativamente altos de ingredientes electrolíticos solubles en agua sin experimentar separación de fases, es decir, recristalización y/o rotura de la emulsión. Otra ventaja más de una realización de la presente divulgación es la provisión de una composición cosmética o composición de fotoprotección para el cuidado de la piel que puede producir un efecto de liberación de agua sobre un sustrato queratinoso, tal como la piel. El efecto de liberación de agua permite que la composición, inicialmente en forma de una emulsión, se convierta en una pluralidad de gotículas que transporten altos niveles de ingredientes solubles en agua tras la aplicación de fuerza, tal como, por ejemplo, el cizallamiento causado por el frotamiento de la composición por parte de un usuario final sobre la superficie de un sustrato queratinoso diana. Las gotículas, a su vez, permiten que los ingredientes solubles en agua presentes en dichas gotículas penetren de manera eficaz en un sustrato queratinoso diana.

50 El sistema de emulsión de agua en aceite de la presente invención tiene, de manera típica, un aspecto de crema de color blanco y brillante. Sin embargo, este se puede modificar para que tenga un aspecto transparente de tipo gel o mate mediante el ajuste de su índice de refracción. Cuando la composición se deposita sobre un sustrato queratinoso diana, seguido de la aplicación de fuerza, la composición libera rápidamente la fase acuosa que contiene los ingredientes solubles en agua en forma de gotículas de tipo perlas, permitiendo de ese modo que los ingredientes solubles en agua presentes en la fase acuosa se fueren a entrar en la superficie del sustrato queratinoso diana. Asimismo, cuando la composición de fotoprotección se deposita sobre un sustrato queratinoso diana, seguido de la aplicación de fuerza, la composición libera rápidamente la fase acuosa que contiene los filtros de UV solubles en agua en forma de gotículas de tipo perlas, permitiendo de ese modo que los filtros de UV solubles en agua presentes en la fase acuosa se extiendan sobre la superficie del sustrato queratinoso diana.

60 Fase acuosa

65 En una realización, la fase acuosa presente en la composición de acuerdo con la divulgación incluye al menos un filtro de protección solar de UV soluble en agua, agua y otros ingredientes en fase acuosa. La fase acuosa de la composición está en una concentración, en peso, de aproximadamente el 60 % a aproximadamente el 92 % o, como alternativa, de aproximadamente el 70 % a aproximadamente el 90 % o, como alternativa, de aproximadamente el 80 % a aproximadamente el 90 %, basándose en el peso de la composición.

En una realización, la fase acuosa presente en la composición de fotoprotección de acuerdo con la divulgación incluye al menos un filtro de UV soluble en agua, agua y otros ingredientes en fase acuosa. La fase acuosa de la composición de fotoprotección está en una concentración en peso de aproximadamente el 60 % a aproximadamente el 92 % o, como alternativa, de aproximadamente el 70 % a aproximadamente el 90 % o, como alternativa, de aproximadamente el 80 % a aproximadamente el 90 %, basándose en el peso de la composición de fotoprotección.

Principio activo soluble en agua

En una realización, la fase acuosa presente en la composición de acuerdo con la divulgación incluye al menos un filtro de protección solar de UV soluble en agua en una concentración, en peso, de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 20 % o, como alternativa, de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 15 % o, como alternativa, de aproximadamente el 0,5 % a aproximadamente el 10 %, basándose en el peso de la composición.

En una realización, la fase acuosa presente en la composición de fotoprotección de acuerdo con la divulgación incluye al menos un filtro de UV soluble en agua en una concentración en peso de aproximadamente el 2 % a aproximadamente el 25 % en peso, tal como de aproximadamente el 3 % a aproximadamente el 20 % en peso, tal como de aproximadamente el 4 % a aproximadamente el 18 % en peso, tal como de aproximadamente el 4 % a aproximadamente el 15 % en peso, tal como de aproximadamente el 5 % a aproximadamente el 10 % en peso, basándose todos los pesos en el peso de la composición.

En una realización, donde la composición incluye ácido elálgico, la concentración preferida de ácido elálgico, en peso, es de aproximadamente el 0,001 % a aproximadamente el 0,01 %, debido a la solubilidad inherentemente baja en agua del ácido elálgico.

Los ejemplos adecuados de filtros de UV solubles en agua que se pueden usar incluyen, pero sin limitación, ácido tereftalilideno dialcanfor sulfónico (Ecamsul), ácido fenilbencimidazol sulfónico (Ensulizol), benzofenona-4, ácido aminobenzoico (PABA), éster de polietoxietilo de ácido 4-bis(polietoxi)-para-aminobenzoico (PEG-25 PABA), metosulfato de alcanfor benzalconio, tetrametilbutilfenol de metilen bis-benzotriazolilo (Bisoctrizol), tetrasulfonato de fenil dibencimidazol disódico (Bisdisulizol disódico) y tris-bifenil triazina; sus derivados y sales correspondientes; derivados de naftalen bisimida, tales como aquellos descritos en la solicitud de patente europea EP1990372 A2, cuyo contenido al completo se incorpora en el presente documento a modo de referencia; y sales cuaternarias catiónicas de cinamidoamina y derivados, tales como aquellos descritos en la patente estadounidense 5.601.811, cuyo contenido al completo se incorpora en el presente documento a modo de referencia, y mezclas de los mismos.

Otros principios activos solubles en agua pueden estar presentes en sus formas de compuestos químicos sintéticos o, como alternativa, como parte integral de extractos botánicos. Los ejemplos adecuados de ingredientes solubles en agua incluyen, pero sin limitación, (1) compuestos fenólicos y polifenólicos y (2) otros compuestos no fenólicos.

Las sales de los compuestos que se pueden usar de acuerdo con la invención se eligen, en particular, de sales de metales alcalinos, por ejemplo, sodio o potasio; sales de metales alcalinotérreos, por ejemplo, calcio, magnesio o estroncio; sales de metales, por ejemplo, zinc, aluminio, manganeso o cobre; sales de amonio de Fórmula NH_4^+ ; sales de amonio cuaternario; sales de aminas orgánicas, por ejemplo, sales de metilamina, dimetilamina, trimetilamina, trietilamina, etilamina, 2-hidroxi-etilamina, bis(2-hidroxi-etil)amina o tris(2-hidroxi-etil)amina; sales de lisina o arginina. Preferentemente, se usan las sales elegidas de sodio, potasio, magnesio, estroncio, cobre, manganeso o zinc. Preferentemente, se usa la sal de sodio.

Los compuestos fenólicos y polifenólicos incluyen, pero sin limitación, flavonas, chalconas, taninos, ácidos fenólicos, catequinas, antocianidinas, estilbenoides, curcuminoides, fenilpropanoides. Muchos de los compuestos fenólicos y polifenólicos son antioxidantes y/o compuestos bien conocidos que pueden proporcionar beneficios cosméticos y para el cuidado de la piel. Algunos ejemplos populares son baicalina, resveratrol, ácido ferúlico, ácido elálgico, ácido salicílico y extractos botánicos.

En general, cualquier WSUVF que pueda absorber luz UV en el intervalo de aproximadamente 280 a aproximadamente 400 nm se puede emplear en la presente invención.

Otros compuestos solubles en agua no fenólicos incluyen, pero sin limitación, vitaminas, xantinas, ceramidas, colesterolos, esfingosinas, C-glucósidos, tampones de ácido amino sulfónico N-sustituido de ion híbrido, azúcares, ácidos nucleicos, α -hidroxiácidos y β -hidroxiácidos, extractos botánicos, trietoxisilano de aminopropilo (APTES), dihidroxiacetona (DHA), aminoácidos y péptidos y sus derivados y mezclas de los mismos.

Hidrótropos opcionales

La composición de la presente descripción puede incluir, opcionalmente, hidrótropos. Los ejemplos de hidrótropos adecuados incluyen, por ejemplo, pero sin limitación, nicotinamida, cafeína, PCA de sodio, salicilato de sodio, urea o hidroxietil urea. Se puede usar al menos uno o una combinación de dos o más hidrótropos para mejorar la

solubilidad de los compuestos fenólicos y polifenólicos en la fase de agua.

- Los hidrótrofos pueden estar presentes en las composiciones en cantidades que varíen, en general, de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 20 % en peso, preferentemente de aproximadamente el 0,5 % a aproximadamente el 10 % en peso y lo más preferentemente de aproximadamente el 1 % a aproximadamente el 5 % en peso, basándose en el peso total de la composición.

Agua

- La fase acuosa presente en la composición o composición de fotoprotección de acuerdo con la divulgación incluye agua en una concentración en peso de aproximadamente el 60 % a aproximadamente el 92 % o, como alternativa, de aproximadamente el 70 % a aproximadamente el 90 % o, como alternativa, de aproximadamente el 80 % a aproximadamente el 90 %, basándose en el peso total de la composición. El agua usada puede ser agua desmineralizada estéril y/o agua floral, tal como agua de rosas, agua de cabezuela, agua de manzanilla o agua de cal, y/o agua termal o mineral natural, tal como, por ejemplo: agua de Vittel, agua de la cuenca Vichy, agua de Uriage, agua de La Roche Posay, agua de La Bourboule, agua de Enghien-les-Bains, agua de Saint Gervais-les-Bains, agua de Neris-les-Bains, agua de Allevar-les-Bains, agua de Digne, agua de Maizieres, agua de Neyrac-les-Bains, agua de Lons-le-Saunier, agua de Eaux Bonnes, agua de Rochefort, agua de San Christau, agua de Les Fumades, agua de Tercis-les-Bains o agua de Avene. La fase de agua también puede comprender agua termal reconstituida, es decir, un agua que comprenda oligoelementos, tales como zinc, cobre, magnesio, etc., que reconstituyan las características de un agua termal.

Fase oleosa

- La fase oleosa presente en la composición o composición de fotoprotección de acuerdo con la divulgación consiste en dimeticona, un elastómero de siloxano reticulado emulsionante y, opcionalmente, un coemulsionante. La fase oleosa de la composición de liberación de agua está en una concentración en peso de aproximadamente el 8 % a aproximadamente el 25 % o, como alternativa, de aproximadamente el 10 % a aproximadamente el 20 % o, como alternativa, de aproximadamente el 10 % a aproximadamente el 15 %, basándose en el peso total de la composición.

Dimeticona

- La fase oleosa presente en la composición o composición de fotoprotección de acuerdo con la divulgación incluye dimeticona en una concentración, en peso, de aproximadamente el 1 % a aproximadamente el 25 % o, como alternativa, de aproximadamente el 2 % a aproximadamente el 20 % o, como alternativa, de aproximadamente el 4 % a aproximadamente el 15 %, basándose en el peso de la composición.

Elastómero de siloxano reticulado emulsionante

- La fase oleosa presente en la composición o composición de fotoprotección de acuerdo con la divulgación incluye un elastómero de siloxano reticulado emulsionante en una concentración, en peso, de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 20 % o, como alternativa, de aproximadamente el 0,3 % a aproximadamente el 10 % o, como alternativa, de aproximadamente el 0,5 % a aproximadamente el 7 %, basándose en el peso de la composición.

- Los ejemplos de elastómeros de siloxano reticulados emulsionantes adecuados incluyen, pero sin limitación, polímero cruzado de dimeticona/copolíol sustituido o no sustituido, polímeros cruzados de dimeticona y dimeticona/PEG-10/15, polímero cruzado de dimeticona/poliglicerilo sustituido o no sustituido, polímero cruzado de dimeticona y dimeticona/poliglicerina-3. Tales elastómeros de siloxano reticulados emulsionantes adecuados se comercializan o preparan, por ejemplo, con los nombres de "KSG-210", un polímero cruzado modificado con poliéter con una denominación INCI de polímero cruzado de dimeticona (y) dimeticona/PEG-10/15, y "KSG-710", un polímero cruzado modificado con poliglicerina con una denominación INCI de polímero cruzado de dimeticona (y) dimeticona/poliglicerina-3, ambos disponibles a través de Shin-Etsu Silicones of America, Inc. (Akron, OH).

- Coemulsionante

- En una realización, la fase oleosa presente en la composición de acuerdo con la divulgación puede incluir, opcionalmente, un coemulsionante en una concentración en peso de aproximadamente el 0,01 % a aproximadamente el 1 % o, como alternativa, de aproximadamente el 0,05 % a aproximadamente el 0,9 % o, como alternativa, de aproximadamente el 0,07 % a aproximadamente el 0,8 %, basándose en el peso total de la composición. Si la concentración del coemulsionante supera el 1 % en peso de la composición de antienvjecimiento, entonces la composición puede seguir formando una emulsión, pero no se logra el efecto transformador deseable del cambio de la crema en gotículas tras la aplicación de cizallamiento.

- Los ejemplos adecuados de coemulsionantes incluyen copolímeros de polisiloxano lineales o ramificados sustituidos con poliéter. Un coemulsionante preferido es el PEG-10 dimeticona disponible con el nombre comercial de ES-5612

a través de Dow Corning Corporation (Midland, Michigan) o KF-6017 a través de Shin-Etsu (Akron, Ohio). Otro coemulsionante preferido es la dimeticona (y) PEG/PPG-18/18 dimeticona disponible con el nombre comercial de ES-5226 DM a través de Dow Corning Corporation (Midland, Michigan). Otros coemulsionantes adecuados incluyen PEG-9 polidimetilsiloxietil dimeticona disponible con el nombre comercial KF-6028 y PEG-9, lauril PEG-9 polidimetilsiloxietil dimeticona disponible con el nombre comercial KF-6038, ambos disponibles a través de Shin-Etsu (Akron, Ohio). Otro ejemplo adecuado de un coemulsionante son los copolímeros de polioxialquileno también conocidos como poliéteres de silicona. Los copolímeros de polioxialquileno se describen con detalle en la patente estadounidense 4.268.499, que se incorpora en el presente documento a modo de referencia en su totalidad. Un copolímero de polioxialquileno particularmente preferido es conocido por su denominación CTFA como copoliol dimeticona. Dow Corning suministra una forma particularmente preferida de copoliol dimeticona como DC5225C.

Polvos opcionales

La composición o composición de fotoprotección de la presente divulgación puede incluir, opcionalmente, polvos. Los polvos opcionales proporcionan fórmulas que son más suaves y lisas para la piel. Los polvos representativos incluyen, pero sin limitación, talco, mica, carbonato de magnesio, carbonato de calcio, silicato de magnesio, silicato de aluminio y magnesio, sílice, dióxido de titanio, óxido de zinc, óxido de hierro rojo, óxido de hierro amarillo, óxido de hierro negro, polvo de polietileno, polvo de metacrilato, polvo de poliestireno, polvo de seda, celulosa cristalina, almidón, mica titanizada, mica titanizada con óxido de hierro, oxiclورو de bismuto y similares. Los polvos adicionales incluyen, pero sin limitación, polvos inorgánicos, tales como gomas, creta, tierra de batán, caolín, sericita, muscovita, flogopita, mica sintética, lepidolita, biotita, mica de litio, vermiculita, silicato de aluminio, almidón, arcillas de esmectita, esmectitas de alquil y/o trialkil aril amonio, silicato de aluminio y magnesio modificado químicamente, arcilla de tipo montmorillonita modificada orgánicamente, silicato de aluminio hidratado, octenil succinato de almidón de aluminio pirógeno, silicato de bario, silicato de calcio, silicato de magnesio, silicato de estroncio, tungstato de metal, magnesio, sílice alúmina, zeolita, sulfato de bario, sulfato de calcio calcinado (yeso calcinado), fosfato de calcio, apatita de flúor, hidroxiapatita, polvo cerámico, jabón metálico (estearato de zinc, estearato de magnesio, miristato de zinc, palmitato de calcio y estearato de aluminio), dióxido de silicona coloidal y nitruro de boro; polvos orgánicos, tales como polvo de resina de poliamida (polvo de nailon), ciclodextrina, polvo de polimetacrilato de metilo, polvo de copolímero de estireno y ácido acrílico, polvo de resina de benzoguanamina, polvo de poli(tetrafluoruro de etileno) y polímero de carboxivinilo, polvo de celulosa, tal como hidroxietil celulosa y carboximetil celulosa sódica, monoestearato de etilen glicol; pigmentos blancos inorgánicos, tales como óxido de magnesio. Un polvo representativo incluye, por ejemplo, polimetilsilsesquioxano. Los polvos pueden estar presentes en las composiciones en cantidades que varíen, en general, de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 5 % en peso o de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 10 % en peso, basándose en el peso total de la composición.

Relación de fases

La relación de fases se calcula mediante la división del peso total de la fase acuosa por el peso total de la fase oleosa. La composición de antienvjecimiento o composición de fotoprotección de la presente divulgación como emulsión de agua en aceite tiene una relación en peso de la fase acuosa respecto a la fase oleosa de aproximadamente 5 a aproximadamente 9. La relación de fases excluye cualquier polvo opcional adicional que se pueda añadir a la composición. Sin pretender imponer ninguna teoría, se cree que esta relación de fases es crítica para: (1) la estabilidad de la emulsión en vista de la alta concentración del/de los ingrediente/s soluble/s en agua contenido/s en la misma y (2) la formación de gotículas tras la aplicación de fuerza sobre la emulsión.

Efecto de liberación de agua

Con respecto a la presente invención, un buen efecto de liberación de agua de la emulsión de agua en aceite significa que el efecto de liberación de agua tiene un resultado de evaluación de más de o igual a una puntuación de 3 en el sistema de evaluación descrito a continuación. El método de ensayo y la puntuación de evaluación del sistema de ensayo se describen a continuación.

Se toman aproximadamente 0,2 g de una muestra de emulsión de agua en aceite de la composición y se colocan sobre el dorso de una mano, a continuación, estos se aplican sobre la misma haciendo círculos suavemente con el dedo corazón y el dedo anular de la otra mano y, a continuación, se observa el fenómeno del efecto de liberación de agua cuando la aplicación de círculos alcanza 20 ciclos y se evalúa mediante un sistema de puntuación de 5 niveles. Una puntuación de 5 representa que aparecen más de 10 gotículas de agua de tipo perlas que tienen un diámetro promedio de más de o igual a 3 mm o que aparecen más de 20 gotículas de agua de tipo perlas que tienen un diámetro promedio de más de o igual a 1 mm. Una puntuación de 4 representa que aparecen 2-10 gotículas de agua de tipo perlas que tienen un diámetro promedio de más de o igual a 3 mm o que aparecen 10-20 gotículas de agua de tipo perlas que tienen un diámetro promedio de más de o igual a 1 mm y las gotículas de agua de tipo perlas que tienen un promedio de más de o igual a 3 mm no son más de 10. Una puntuación de 3 representa que aparecen 2-9 gotículas de agua de tipo perlas que tienen un diámetro promedio de más de o igual a 3 mm y que existe, como máximo, 1 gota de agua de tipo perla que tiene un diámetro promedio de más de o igual a 3 mm o que aparecen 10-20 gotículas de agua de tipo perlas que tienen un diámetro promedio de 1 mm. Una puntuación de 2 representa que

aparecen 2-9 gotículas de agua de tipo perlas que tiene un diámetro promedio de 1 mm. Una puntuación de 1 representa que no aparece ninguna gotícula de agua. Cada nivel entre las puntuaciones 5 a 4, 4 a 3, 3 a 2 y 2 a 1 muestra que el efecto de liberación de agua se encuentra entre los dos valores finales descritos anteriormente y cuanto menor sea la puntuación, más deficiente es el efecto de liberación de agua.

5 En una realización, el efecto de liberación de agua de la composición cosmética de la presente divulgación es de aproximadamente 3 a 5.

Ejemplos

10 El método de preparación de cada uno de los ejemplos proporcionados en las Tablas 1 y 2 es, en general, el mismo. Los ejemplos en las Tablas 1 y 2 incluyen Ejemplos comparativos de emulsiones con la incorporación de altas concentraciones de principios activos solubles en agua distintos de los filtros de protección solar de UV que tienen un efecto de liberación de agua. Los ejemplos en las Tablas 3 y 4 son Ejemplos comparativos que ilustran la falta de estabilidad de la emulsión y/o estabilización de los principios activos en una emulsión típica de agua en aceite.

15 En cada ejemplo (de invención y comparativo), la viscosidad de la emulsión se mide usando un viscosímetro Brookfield, que usa el huso Heliopath T-D, y la velocidad se ajusta a 10 rpm. Se dejó que el huso oscilara en la muestra de ensayo y las mediciones se tomaron después de un minuto.

20 El efecto de liberación de agua de cada ejemplo se mide mediante la colocación de aproximadamente 0,2 g de la composición cosmética sobre el dorso de una mano y, a continuación, su aplicación sobre la misma haciendo círculos suavemente con el dedo corazón y el dedo anular de la otra mano. El fenómeno del efecto de liberación de agua se observa cuando la aplicación de círculos alcanza 20 ciclos.

25 Se capturaron imágenes microscópicas de la emulsión para controlar la estabilización de los ingredientes solubles en agua en la emulsión. El microscopio se ajusta con un aumento de 10 veces, usando un microscopio Leica DM2500, y se analiza con el soporte lógico Leica Application Suite.

30 Todos los ejemplos se controlaron para determinar la estabilidad de la emulsión y la estabilización de los principios activos durante un período de 8 semanas a 5 °C, 25 °C, 37 °C y 45 °C y después de 10 ciclos de congelación/descongelación (que variaron de -20 °C a 25 °C). Se tomaron imágenes de la viscosidad y microscópicas en las semanas 4 y 8 mediante la medición a 25 °C.

35 Tabla 1. Ejemplos comparativos

Fase	Denominación INCI	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3	Ej. 4	Ej. 5
A	POLÍMERO CRUZADO DE DIMETICONA/PEG-10/15	1,25	1,25	1,25	1,25	0,75
A	POLÍMERO CRUZADO DE DIMETICONA/POLIGLICERINA-3					0,5
A	PEG-10 DIMETICONA	0,1	0,1	0,1	0,1	0,1
A	DIMETICONA (y) DIMETICONOL (88/12)	1	1	1	1	1
A	DIMETICONA	13,7	13,7	13,7	13,7	13,7
B	AGUA, CONSERVANTES	CS 100				
B	NIACINAMIDA	5		5		
B	CAFÉINA	5		5		
B	EXTRACTO DE HOJA DE <i>ENGELHARDTIA CHRYSOLEPIS</i>	0,5				
B	ÁCIDO FERÚLICO	0,5				
B	ÁCIDO ASCÓRBICO DE 3-O-ETILO		1	5		
B	ÁCIDO HIDROXIFENOXI PROPIÓNICO			1		
B	ÁCIDO ELÁGICO			0,01		
B	CETEARETH-25 (y) GLICERINA (y) ALCOHOL CETÍLICO (y) CERAMIDA NP (y) ACIDO BEHÉNICO (y) COLESTEROL (y) CERAMIDA NS (y) CERAMIDA EOP (y) CERAMIDA EOS (y) CERAMIDA AP (y) CAPROOIL FITOESFINGOSINA (y) CAPROOIL ESFINGOSINA				0,14	
B	ÁCIDO HIDROXIETILPIPERAZIN ETANO SULFÓNICO				1	

ES 2 786 302 T3

(continuación)

Fase	Denominación INCI	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3	Ej. 4	Ej. 5
B	TETRAHIDROPIRANTRIOL DE HIDROXIPROPILO				3,3	
B	MANOSA					10
B	ÁCIDO SALICÍLICO					2
B	ALCOHOL DESNATURALIZADO					5
B	GLICERINA	3	3	3	3	3
B	CITRATO DE SODIO	0,2	0,2	0,2	0,2	0,2
B	CLORURO DE SODIO	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
B	ÁCIDO CÍTRICO		0,2	0,2		0,2
C	POLIMETILSILSESQUIOXANO	1	1	1	1	1
	Total (%)	100	100	100	100	100
	Viscosidad Brookfield (Pa·s (cP))	38,4 (38.400)	65,0 (65.000)	55,0 (55.500)	28,0 (28.000)	45,6 (45.600)
	Fase oleosa total (%)	12,27	12,07	12,07	12,07	12,07
	Fase de agua total (%)	86,43	86,93	86,93	86,93	86,93
	Relación (fase de agua/fase oleosa)	7,04	7,20	7,20	7,20	7,20
	Efecto de liberación de agua	5	4 a 5	4 a 5	4 a 5	5
	Textura/aspecto	Crema de tipo gel translúcida a opaca. Se liberaron gotículas de agua con el frotamiento				
	Resultados de estabilidad	La emulsión se mantuvo estable después de 8 semanas. No se formaron cristales.				

Tabla 2. Ejemplos comparativos

Fase	Denominación INCI	Ej. 6	Ej. 7	Ej. 8	Ej. 9	Ej. 10
A	POLÍMERO CRUZADO DE DIMETICONA/PEG-10/15	1,25	1,25	1,25	1,25	1,25
A	PEG-10 DIMETICONA	0,1		0,1		0,07
A	LAURIL PEG-9 POLIDIMETILSILOXIETIL DIMETICONA		0,1		0,1	
A	DIMETICONA	10,7	10,7	10,7	10,7	10,7
A	TOCOFEROL	0,2				
B	AGUA, CONSERVANTES	CS 100				
B	ADENOSINA	0,6				
B	EXTRACTO DE RAÍZ DE SCUTELLARIA BAICALENSIS		0,1	0,5	0,5	
B	CAFÉINA	1	1	5		
B	NIACINAMIDA	1	1	5		
B	ÁCIDO CAPRILOIL SALICÍLICO	0,1	0,1	0,1	0,1	
B	RESVERATROL				0,5	
B	GLICERINA	15	15	15	15	3
B	DIHIDROXI ACETONA					5
B	PROPANODIOL	5	5		5	
B	PROPILEN GLICOL			5		
B	EDTA DISÓDICO	0,1	0,1	0,1	0,1	0,1
B	CITRATO DE SODIO	0,2	0,2	0,2	0,2	0,2
B	CLORURO DE SODIO	0,8	0,8	0,8	0,8	0,5
B	ALCOHOL DESNATURALIZADO	3	3	3	3	
B	ÁCIDO CÍTRICO					0,2
B	CARAMELO					0,03

(continuación)

Fase	Denominación INCI	Ej. 6	Ej. 7	Ej. 8	Ej. 9	Ej. 10
B	RED 4					0,0002
C	SILILATO DE SÍLICE	0,7	0,5	0,5	0,5	
	Total (%)	100	100	100	100	100
	Viscosidad Brookfield (Pa·s (cP))	38,5 (38.500)	37,0 (37.000)	35,0 (35.000)	36,0 (36.000)	53,6 (53.600)
	Fase oleosa total (%)	16,8	16,6	16,6	16,6	12,07
	Fase de agua total (%)	83,2	83,4	8,4	83,4	87,93
	Relación (fase de agua/fase oleosa)	4,50	5,02	5,02	5,02	7,29
	Efecto de liberación de agua	4	3 a 4	4	3 a 4	4 a 5
	Textura/aspecto	Crema de tipo gel translúcida a opaca. Se liberaron gotículas de agua con el frotamiento.				
	Resultados de estabilidad	La emulsión se mantuvo estable después de 8 semanas. No se formaron cristales.				

En la preparación de cada uno de los Ejemplos de la invención en la Tabla 1 y 2, se usa el siguiente procedimiento. Los ingredientes de la Fase A (fase oleosa) se colocaron en un vaso de precipitados principal y se mezclaron bien con un mezclador de hélices a aproximadamente 600-700 RPM y se reservaron. Los ingredientes de la Fase B (acuosa) se mezclaron entre sí en un vaso de precipitados secundario con un mezclador de hélices a aproximadamente 600-700 RPM hasta que se disolvieron todos los sólidos, dando una solución transparente. Si resultaba necesario, la Fase B (acuosa) se calentaba suavemente a aproximadamente 40-45 °C hasta que se disolvían todos los sólidos. La mezcla de ingredientes de la fase acuosa (Fase B) se añadió lentamente a los ingredientes mezclados de la Fase A (fase oleosa) usando un mezclador de hélices durante un período de 10-15 minutos en un lote de aproximadamente 1 kg. A medida que aumentaba la viscosidad de la mezcla, aumentaba la velocidad de agitación de 700 rpm a aproximadamente 1.200 rpm. A medida que la fase acuosa se mezclaba con la fase oleosa, se formaba una emulsión de agua en aceite. Los polvos de la Fase C se añadieron al lote y se mezclaron en la emulsión de agua en aceite.

Tabla 3. Ejemplo comparativo

Fase	Denominación INCI	Ej. 11
A	PEG/PPG-18/18 DIMETICONA	1,75
A	DIMETICONA	20,75
B	AGUA, CONSERVANTES	CS 100
B	EXTRACTO DE RAÍZ DE SCUTELLARIA BAICALENSIS	0,4
B	CAFEÍNA	5
B	NIACINAMIDA	5
B	GLICERINA	10
B	PROPILEN GLICOL	10
B	DIPROPILEN GLICOL	10
B	EDTA DISÓDICO	0,1
B	CLORURO DE SODIO	2
C	ALCOHOL DESNATURALIZADO	5
Total	Total (%)	100
	Viscosidad Brookfield (Pa·s (cP))	66,0 (66.000)
	Fase oleosa total (%)	22,5
	Fase de agua total (%)	77,5
	Relación (fase de agua/fase oleosa)	3,44
	Efecto de liberación de agua	1
	Textura/aspecto	Gel cremoso translúcido de color amarillo claro. No se liberaron gotículas de agua con el frotamiento.
	Resultados de estabilidad	La emulsión se mantuvo estable después de 8 semanas, pero se formaron cristales en forma de aguja sobre la superficie de la emulsión.

En la preparación del Ejemplo 11 en la Tabla 3, se usa el siguiente procedimiento. Los ingredientes de la Fase A (fase oleosa) se colocaron en un vaso de precipitados principal y se mezclaron bien con un mezclador de hélices a aproximadamente 600-700 RPM y se reservaron. Los ingredientes de la Fase B (acuosa) se mezclaron entre sí en un vaso de precipitados secundario con un mezclador de hélices a aproximadamente 600-700 RPM hasta que se disolvieron todos los sólidos, dando una solución transparente. Si resultaba necesario, la Fase B (acuosa) se calentaba suavemente a aproximadamente 40-45 °C hasta que se disolvían todos los sólidos. La mezcla de ingredientes de la fase acuosa (Fase B) se añadió lentamente a los ingredientes mezclados de la Fase A (fase oleosa) usando un mezclador de hélices durante un período de 10-15 minutos en un lote de aproximadamente 1 kg. A medida que aumentaba la viscosidad de la mezcla, aumentaba la velocidad de agitación de 700 rpm a aproximadamente 1.200 rpm. A medida que la fase acuosa se mezclaba con la fase oleosa, se formaba una emulsión de agua en aceite. Por último, se añadió alcohol (Fase C) a la emulsión.

Tabla 4. Ejemplo comparativo

Fase	Denominación INCI	Ej. 12
A	POLÍMERO CRUZADO DE DIMETICONA/PEG-10/15	1
A	DIMETICONA (y) DIMETICONOL (88/12)	1
A	DIMETICONA	9
A	TRISILOXANO	16
B	AGUA	CS 100
B	FENOXIETANOL	0,6
B	CAPRILIL GLICOL	0,2
B	HEXILEN GLICOL	0,1
B	CARBAMATO DE YODOPROPILO	0,01
B	POLIAMINO PROPIL BIGUANIDA	0,04
B	BUTILEN GLICOL	2
B	GLICERINA	10
B	CITRATO DE SODIO	0,5
	Total (%)	100
	Viscosidad Brookfield (Pa·s (cP))	5,0 (5.000)
	Fase oleosa total (%)	27
	Fase de agua total (%)	73
	Relación (fase de agua/fase oleosa)	2,70
	Efecto de liberación de agua	1
	Textura/aspecto	Suero translúcido y lechoso. Acuoso sobre la piel tras la aplicación. No se liberaron gotículas de agua con el frotamiento.
	Resultados de estabilidad	La emulsión se separó después de 3 días de ciclos de congelación-descongelación

En la preparación del Ejemplo 12 en la Tabla 4, se usa el siguiente procedimiento. Los ingredientes de la Fase A (fase oleosa) se colocaron en un vaso de precipitados principal y se mezclaron bien con un mezclador de hélices a aproximadamente 600-700 RPM y se reservaron. Los ingredientes de la Fase B (acuosa) se mezclaron entre sí en un vaso de precipitados secundario con una barra de agitación magnética hasta que se disolvieron todos los sólidos, dando una solución turbia. La mezcla de ingredientes de la fase acuosa (Fase B) se añadió lentamente a los ingredientes mezclados de la Fase A (fase oleosa) usando un mezclador de hélices durante un período de 10-15 minutos en un lote de aproximadamente 1 kg. A medida que aumentaba la viscosidad de la mezcla, aumentaba la velocidad de agitación de 700 rpm a aproximadamente 1.000 rpm. A medida que la fase acuosa se mezclaba con la fase oleosa, se formaba una emulsión de agua en aceite.

El Ejemplo comparativo 12, en contraste con la presente divulgación, tenía un porcentaje en peso total de la fase acuosa o fase de agua de aproximadamente el 73 % y un porcentaje en peso total de aceite de aproximadamente el 27 %, lo que hace que la relación de la fase acuosa respecto a la fase oleosa sea de aproximadamente 2,7. El Ejemplo comparativo 12 formó un suero translúcido y lechoso que es acuoso sobre la piel tras la aplicación. El Ejemplo comparativo 12 no tiene ningún efecto de liberación de agua.

El Ejemplo comparativo 12 es, en general, inestable. La imagen microscópica mostró que el límite de la emulsión de agua en aceite tenía un contorno con filtraciones, lo que indicaba la posible inestabilidad de la emulsión. Aunque el

suero del Ejemplo comparativo 12 se formó inicialmente como una emulsión, después de 3 días de ciclos de congelación-descongelación, el suero se separó por completo.

Tabla 5. Ejemplos de la invención 13-17

Fase	Denominación INCI	Ej. 13	Ej. 14	Ej.15	Ej. 16	Ej. 17
A	DIMETICONA	7	7	7	6	6
A	POLÍMERO CRUZADO DE DIMETICONA (y) DIMETICONA/PEG-10/15 (KSG-210)	5	5		6	6
A	POLÍMERO CRUZADO DE DIMETICONA (y) DIMETICONA/POLIGLICERINA-3 (KSG-710)			5		
B1	AGUA, CONSERVANTES	53,21	56,87	56,87	46,41	37,15
B1	GLICERINA	15	15	15	15	15
B1	PROPANODIOL	3	3	3	3	3
B1	CLORURO DE SODIO	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
B1	CITRATO DE SODIO	0,2	0,2	0,2	0,2	0,2
B1	EDTA DISÓDICO	0,1	0,1	0,1	0,1	0,1
B1	HIDRÓXIDO DE SODIO	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05
B2	ÁCIDO TEREFTALILIDENO DIALCANFOR SULFÓNICO (ECAMSUL)	3			3	
B2	BENZOFENONA-4					5
B2	ÁCIDO FENILBENCIMIDAZOL SULFÓNICO (ENSULIZOL)	3	4	4	5	4
B2	AGUA	7,2	7,2	7,2	12	20
B2	TRITANOLAMINA	1,8	0	0	1,8	2,5
B2	HIDRÓXIDO DE SODIO	0,44	0,58	0,58	0,44	
C	POLIMETILSILSESQUIOXANO	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
	Total (%)	100	100	100	100	100
	Viscosidad Brookfield (Pa·s (cP))	46,0 (46.000)	33,0 (33.000)	61,0 (61.000)	58,0 (58.000)	41,0 (41.000)
	Fase oleosa total (%)	12	12	12	12	12
	Fase de agua total (%)	88	88	88	88	88
	Relación (fase de agua/fase oleosa)	7,33	7,33	7,33	7,33	7,33
	Efecto de liberación de agua	3 a 4	4	4	4 a 5	4
	Textura/aspecto:	Crema de tipo gel translúcida a opaca, de color amarillo claro a blanco				
	Resultados de estabilidad:	Las emulsiones permanecieron estables después de 12 semanas. No se formaron cristales.				

5

En la preparación de cada uno de los ejemplos en la Tabla 5, se usa el siguiente procedimiento.

Los ingredientes de la Fase B (acuosa) se mezclan entre sí en un vaso de precipitados secundario con un mezclador de rotor/estator hasta que se disuelven todos los sólidos, dando una solución transparente. Si resulta necesario, la Fase B (acuosa) se puede calentar suavemente a aproximadamente 40-45 °C hasta que se disuelvan todos los sólidos. Los ingredientes de la Fase A (fase oleosa) se colocan en un vaso de precipitados principal y se mezclan bien con un mezclador de hélices a aproximadamente 600-700 RPM y se reservan. La mezcla de ingredientes de la fase acuosa (Fase B) se añade lentamente a los ingredientes mezclados de la Fase A (fase oleosa) usando un mezclador de hélices durante un período de 10-15 minutos en un lote de aproximadamente 1 kg. A medida que aumenta la viscosidad de la mezcla, aumenta la velocidad de agitación de 700 rpm a aproximadamente 1.200 rpm. A medida que la fase acuosa se mezcla con la fase oleosa, se forma una emulsión de agua en aceite. Opcionalmente, los polvos se añaden al lote y se mezclan en la emulsión de agua en aceite.

10

15

Tabla 6. Ejemplo 18 (comparativo)

Fase	Denominación INCI estadounidense	Ej. 18
A	OCTORILENO	7
A	SALICILATO DE ETILHEXILO (OCTISALATO)	5

20

(continuación)

Fase	Denominación INCI estadounidense	Ej. 18
A	BUTIL METOXIDIBENZOILMETANO (AVOBENZONA)	3
A	POLÍMERO CRUZADO DE DIMETICONA (y) DIMETICONA/PEG-10/15 (KSG-210)	5
A	CETIL PEG/PPG-10/1 DIMETICONA (ABIL EM 90)	1
B	AGUA, CONSERVANTES	59,65
B	GLICERINA	15
B	PROPANODIOL	3
B	CLORURO DE SODIO	0,5
B	CITRATO DE SODIO	0,2
B	EDTA DISÓDICO	0,1
B	HIDRÓXIDO DE SODIO	0,05
C	POLIMETILSILSESQUIOXANO (TOSPEARL 145 A)	0,5
	Total (%)	100
	Viscosidad Brookfield (Pa·s (cP))	ND
	Fase oleosa total (%)	21
	Fase de agua total (%)	79
	Relación (fase de agua/fase oleosa)*:	3,76
	Efecto de liberación de agua:	ND
	Textura/aspecto:	Crema espesa y de color blanco
	Resultados de estabilidad:	No es estable. Con separación de fases

*Excluye los polvos (Fase C).

El Ejemplo comparativo 18 se preparó mediante el calentamiento de la fase de agua y la fase oleosa por separado hasta 80 °C. La fase de agua se añadió a la fase oleosa, al tiempo que se mezclaba hasta que era homogénea. La emulsión resultante se enfrió a aproximadamente temperatura ambiente. Opcionalmente, se añadieron polvos y se mezclaron bien.

De manera similar a los Ejemplos de la invención 13-17, la emulsión de agua en aceite del Ejemplo 18 usó un elastómero de siloxano emulsionante (KSG-210) como emulsionante primario y un copolímero de dimeticona de poliéter sustituida con alquilo (Abil EM90) como coemulsionante. Se añadieron filtros de UV orgánicos a la fase oleosa para preparar una emulsión de protección solar. El Ejemplo 18 incluye aproximadamente el 7 % en peso de octilcristileno, aproximadamente el 5 % de octisalato y aproximadamente el 3 % de avobenzona. La emulsión en el Ejemplo 18 se formó inicialmente como una crema espesa y de color blanco, pero sus fases se separaron al día siguiente. Por tanto, no resultó posible medir su efecto de "liberación de agua", ni su viscosidad.

Tabla 7. Ejemplo 19 (comparativo)

Fase	Denominación INCI	Ej. 19
A	Polímero cruzado de dimeticona (y) dimeticona/PEG-10/15 (KSG-210)	4
A	Dimeticona (y) dimeticonol (88/12)	1
A	Dimeticona	6
A	Trisiloxano	16
B	Agua	59,3
B	Fenoxietanol	0,6
B	Caprilil glicol	0,2
B	Hexilen glicol	0,1
B	Butilcarbamato de yodopropinilo (10 %)	0,1
B	Poliaminopropil biguanida (20 % en agua)	0,2
B	Butilen glicol	2
B	Glicerina	10

(continuación)

Fase	Denominación INCI	Ej. 19
B	Citrato de sodio	0,5
	Total (%)	100
	Viscosidad Brookfield (Pa·s (cP))	5,0 (5.000)
	Fase oleosa total (%)	27
	Fase de agua total (%)	73
	Relación (fase de agua/fase oleosa)	2,7
	Efecto de liberación de agua	1
	Textura: Suero translúcido y lechoso; acuoso sobre la piel tras la aplicación. Ningún efecto de "formación de perlas/liberación de agua".	
	Microscopio: inestable. W/Si con contorno de filtraciones, lo que indica la posible inestabilidad de la emulsión.	

5 En la preparación del Ejemplo comparativo 19, se usó el siguiente procedimiento. Los ingredientes de la Fase B (acuosa) se mezclan entre sí en un vaso de precipitados secundario usando una barra de agitación para mezclar bien y disolver todos los sólidos. Los ingredientes de la Fase A (fase oleosa) se colocan en un vaso de precipitados principal y se mezclan bien con un mezclador de hélices a aproximadamente 600-700 RPM y se reservan. La mezcla de ingredientes de la fase acuosa (Fase B) se añade lentamente a los ingredientes mezclados de la Fase A usando un mezclador de hélices durante un período de 10-15 minutos en un lote de 1 kg. A medida que la viscosidad aumenta lentamente, aumenta la velocidad de agitación de 700 RPM a 1.000 RPM para formar un suero.

10 El Ejemplo comparativo 19, en contraste con la presente divulgación, tiene un porcentaje en peso total de la fase acuosa o fase de agua de aproximadamente el 73 % y un porcentaje en peso total de aceite de aproximadamente el 27 %, lo que hace que la relación de la fase acuosa respecto a la fase oleosa sea de aproximadamente 2,7. El Ejemplo comparativo 19 forma un suero translúcido y lechoso que es acuoso sobre la piel tras la aplicación. La viscosidad del Ejemplo comparativo 19 se mide usando un viscosímetro Brookfield, usando un huso T-D, y la velocidad se ajusta a 10 rpm durante 1 minuto. La viscosidad del Ejemplo comparativo 19 es de aproximadamente 5.000 mPa·s (cP). El efecto de liberación de agua del Ejemplo comparativo 19 se mide mediante la colocación de aproximadamente 0,2 g de la composición cosmética sobre el dorso de una mano y, a continuación, su aplicación sobre la misma haciendo círculos suavemente con el dedo corazón y el dedo anular de la otra mano. No aparecieron gotículas de tipo perlas que tuvieran un diámetro promedio de más de o igual a 1 mm. El efecto de liberación de agua del suero del Ejemplo comparativo 19 es de aproximadamente 1; por lo tanto, el Ejemplo comparativo 19 no tiene ningún efecto de liberación de agua.

25 El Ejemplo comparativo 19 es, en general, inestable. El microscopio muestra que el límite de W/Si tiene un contorno con filtraciones, lo que indica la posible inestabilidad de la emulsión. Aunque el suero del Ejemplo comparativo 19 se forma inicialmente como una emulsión, después de 3 días de ciclos de congelación-descongelación, el suero se separa por completo.

30 Aunque la invención se ha descrito con referencia a una realización preferida, aquellos expertos en la materia entenderán que se pueden realizar diversos cambios y que se pueden sustituir los equivalentes por elementos de los mismos sin apartarse del alcance de la invención. Además, se pueden realizar muchas modificaciones para adaptar una situación o un material particular a las enseñanzas de la invención sin apartarse del alcance esencial de la misma. Por lo tanto, se pretende que la invención no se limite a la realización particular desvelada como el mejor modo contemplado para llevar a cabo la presente invención, sino que la invención incluya todas las realizaciones que se encuentren dentro del alcance de las reivindicaciones adjuntas.

REIVINDICACIONES

1. Una composición que comprende:

5 una fase acuosa que incluye al menos un filtro de protección solar de UV soluble en agua en una concentración en peso del 2 % al 25 %, basándose en el peso de la composición; y una fase oleosa que consiste en:

10 dimeticona, en una concentración en peso del 1 % al 25 %, basándose en el peso de la composición;
un elastómero de siloxano reticulado emulsionante en una concentración, en peso, del 0,1 % al 20 %, basándose en el peso de la composición; y
opcionalmente, un coemulsionante en una concentración, en peso, del 0,01 % al 1 %, basándose en el peso de la composición;
15 en donde la relación, en peso, de la fase acuosa respecto a la fase oleosa es de 5,0 a 9,0; y en donde la composición se convierte de una emulsión en una pluralidad de gotículas tras la aplicación de cizallamiento.

2. La composición de la reivindicación 1, en donde el filtro de protección solar de UV se elige de ácido tereftalilideno dialcanfor sulfónico (Ecamsul), ácido fenilbencimidazol sulfónico (Ensulizol), benzofenona-4, ácido aminobenzoico (PABA), metosulfato de alcanfor benzalconio, tetrametilbutilfenol de metilen bis-benzotriazolilo (Bisoctrizol), tetrasulfonato de fenil dibencimidazol disódico (Bisdisulizol disódico), tris-bifenil triazina; sus derivados y sales correspondientes; derivados de naftalin bisimida y sales cuaternarias catiónicas de cinamidoamina y derivados y mezclas de los mismos.

25 3. La composición de la reivindicación 1, en donde la fase acuosa incluye, además, otro principio activo soluble en agua elegido de flavonas, estilbenoides, taninos, ácidos fenólicos, polifenólicos, vitaminas, xantinas, ceramidas, colesterolos, esfingosinas, C-glucósidos, tampones de ácido amino sulfónico N-sustituido de ion híbrido, azúcares, ácidos nucleicos, α -hidroxiácidos y β -hidroxiácidos, trietosixilano de aminopropilo, dihidroxiacetona, extractos botánicos, aminoácidos y péptidos, sus derivados y combinaciones de los mismos.

30 4. La composición de la reivindicación 1, en donde la composición incluye, además, al menos un hidrótopo seleccionado de nicotinamida, cafeína, PCA de sodio, salicilato de sodio, urea o hidroxietil urea.

35 5. La composición de la reivindicación 1, en donde el coemulsionante es un copolímero de polioxialquileno.

6. La composición de la reivindicación 5, en donde el coemulsionante se elige de PEG-10 dimeticona, PEG-9 polidimetilsiloxietil dimeticona y PEG-9, lauril PEG-9 polidimetilsiloxietil dimeticona, dimeticona y dimeticona PEG/PPG-18/18 y combinaciones de los mismos.

40 7. La composición de la reivindicación 1, que incluye, además, un polvo en una concentración en peso del 0,1 % al 5 %, basándose en el peso de la composición.

8. La composición de la reivindicación 1, en donde:

45 (a) la fase acuosa incluye al menos un filtro de protección solar de UV soluble en agua elegido de ácido tereftalilideno dialcanfor sulfónico (Ecamsul), ácido fenilbencimidazol sulfónico (Ensulizol) y benzofenona-4, en una concentración en peso del 4 % al 10 %, basándose en el peso de la composición, en donde la fase acuosa está en una concentración en peso del 80 % al 90 %, basándose en el peso de la composición;
50 (b) la dimeticona está presente en una concentración en peso de aproximadamente el 4 % a aproximadamente el 20 %, basándose en el peso de la composición; y
(c) el elastómero de siloxano reticulado emulsionante está presente en una concentración en peso del 1 % al 5 %, basándose en el peso de la composición.

55 9. La composición de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en donde el elastómero de siloxano reticulado emulsionante se selecciona del grupo que consiste en polímero cruzado de dimeticona/copoliol, polímeros cruzados de dimeticona y dimeticona/PEG-10/15, polímero cruzado de dimeticona/poliglicerilo, polímero cruzado de dimeticona y dimeticona/poliglicerina-3.

60 10. Un proceso para la reducción de los signos de envejecimiento sobre un sustrato queratinoso que comprende las etapas de:

65 aplicar la composición de la reivindicación 1 sobre el sustrato queratinoso; y aplicar cizallamiento sobre la composición, transformando de ese modo la composición en una pluralidad de gotículas que contienen al menos un ingrediente soluble en agua que se fuerza a entrar en el sustrato queratinoso.

11. La composición de la reivindicación 1 para su uso en el tratamiento de eritemas solares o el desarrollo de cáncer de piel mediante la inhibición del contacto de los rayos UV con un sustrato queratinoso, comprendiendo el uso las etapas de:

- 5 aplicar la composición sobre una superficie del sustrato queratinoso; y
aplicar cizallamiento sobre la composición, transformando de ese modo la composición en una pluralidad de gotículas que contienen el filtro de protección solar de UV.