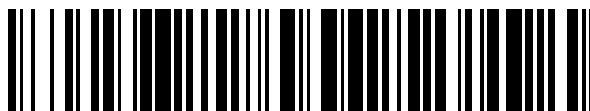


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 793 934**

51 Int. Cl.:

A61Q 19/02	(2006.01)
A61K 8/19	(2006.01)
A61K 8/25	(2006.01)
A61K 8/891	(2006.01)
A61K 8/81	(2006.01)
A61K 8/58	(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **18.06.2014 PCT/US2014/043002**

87 Fecha y número de publicación internacional: **24.12.2014 WO14205113**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.06.2014 E 14813312 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **29.04.2020 EP 3010481**

54 Título: **Métodos, composiciones y kit para blanquear las manchas hiperpigmentadas en la piel**

30 Prioridad:

19.06.2013 US 201361836701 P

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

17.11.2020

73 Titular/es:

**ELC MANAGEMENT LLC (100.0%)
155 Pinelawn Road, Suite 345 South
Melville, NY 11747, US**

72 Inventor/es:

**MU, WEILIN y
CASTRO, JOHN R.**

74 Agente/Representante:

ISERN JARA, Jorge

Observaciones:

**Véase nota informativa (Remarks, Remarques o
Bemerkungen) en el folleto original publicado por
la Oficina Europea de Patentes**

ES 2 793 934 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

Métodos, composiciones y kit para blanquear las manchas hiperpigmentadas en la piel

5 Campo tecnológico

La invención pertenece al campo de los métodos y composiciones para usar en el blanqueamiento de manchas hiperpigmentadas en la piel.

10 Sumario de la invención

A medida que las personas envejecen, la piel sufre muchos tipos de cambios. Un cambio común es el desarrollo de manchas hiperpigmentadas en la superficie de la piel, como la cara o las manos. Esto puede suceder debido al envejecimiento, la exposición al sol o la postinflamación, la última se conoce como PIH o hiperpigmentación postinflamatoria.

15 Existen varios productos para tratar la piel hiperpigmentada, más comúnmente en forma de crema o loción para la piel. Existen varias dificultades para tratar las manchas hiperpigmentadas en las manos, que es un área donde ocurren con mayor frecuencia. Un problema es que es más difícil aplicar la crema de tratamiento a la mancha hiperpigmentada solamente. Cuando la crema se aplica a las manos en general, toda la superficie a la que se aplica la crema se blanqueará, no solo la mancha hiperpigmentada. El segundo problema es que la crema aplicada a las manos se quita con bastante rapidez debido al lavado de manos, exposición al medio ambiente, etc. Por lo tanto, existe la necesidad de formas más efectivas de aplicar un blanqueador de la piel activo directamente a la mancha hiperpigmentada a tratar, que permanezca en el lugar durante un período de tiempo efectivo e, idealmente, que el producto de tratamiento enmascare la mancha hiperpigmentada mientras el tratamiento está en curso.

El documento US2007/0009446 A divulga una composición cosmética de emulsión inestable de agua en silicona de baja viscosidad.

30 El documento US2007/0140994 A divulga composiciones de filtro solar que comprenden un organopolisiloxano con funcionalidad hidrocarbilo.

El documento US2006/0110346 A divulga composiciones cosméticas resistentes a la transferencia que contienen al menos una resina de silicona y al menos un adhesivo de silicona sensible a la presión y métodos de uso de estas.

35 El documento US2008/0279797 A divulga composiciones cosméticas que comprenden un oligosilsequioxano poliédrico injertable que forma películas cuando se cura in situ.

40 La invención está dirigida a una composición y un kit para su aplicación en manchas de piel hiperpigmentadas como se define en las reivindicaciones 1 y 6 que pueden permanecer en el lugar durante un período prolongado de tiempo incluso después de lavarse las manos o exponerse a condiciones ambientales tales como lluvia, viento, etc., y opcionalmente, que se funde con la piel mientras se lleva a cabo el tratamiento.

45 La invención está dirigida a una composición para blanquear la piel que comprende un material de recubrimiento polimérico líquido que se endurece en una película sólida resistente al agua, permeable al vapor de agua, adherente y conformable cuando se aplica a la piel, y al menos un activo para blanquear la piel.

El material de recubrimiento polimérico comprende sililato de dimeticona en una cantidad de 1 a 35 % en peso de la composición. La composición para blanquear la piel además comprende:

50 un aceite de silicona no volátil que tiene una viscosidad que varía de 20 a 200,000 cst a 25 °C, en donde la cantidad total de aceites volátiles y no volátiles en la composición es de 1 a 50 % en peso;

55 de 0.5 a 15 % en peso de un mineral de montmorillonita o derivado cuaternizado del mismo; y

una mezcla de pigmentos en partículas y polvos en una cantidad suficiente para hacer que la composición coincida con la piel circundante cuando se aplica a las manchas hiperpigmentadas.

60 La invención también se dirige a un método para blanquear manchas hiperpigmentadas en un área de tratamiento de la piel que comprende aplicar a la mancha hiperpigmentada una composición para blanquear la piel como se define en la reivindicación 5.

Un kit para blanquear manchas hiperpigmentadas en la piel que comprende:

65 • un receptáculo con cierre y un aplicador,

- y se almacena dentro del receptáculo una composición para blanquear la piel de la invención.

Descripción de las figuras

- 5 La figura 1 representa un tipo de recipiente adecuado para almacenar y dispensar una composición de acuerdo con la presente invención.
- La figura 2 representa un aplicador puntiforme.
- 10 La figura 3 muestra el receptáculo del recipiente con más detalle.
- La figura 4 representa la punta del aplicador del aplicador puntiforme.

Descripción detallada

- 15 Todos los porcentajes mencionados aquí son porcentajes en peso a menos que se indique lo contrario. El término "líquido" cuando se usa para describir el material polimérico significa que la composición del material de recubrimiento polimérico es un líquido vertible a temperatura ambiente (25 ° C).

20 A. La composición

La composición de la invención comprende un material de recubrimiento polimérico líquido que se endurece en una película sólida resistente al agua, permeable al vapor de agua, adherente y conformable cuando se aplica a la piel, y al menos un activo blanqueador de la piel.

25 1. Material de recubrimiento polimérico

- El polímero usado en la composición de la invención es inicialmente líquido a temperatura ambiente, pero se puede curar o secar tras la exposición al aire ambiental para formar una película sólida, resistente al agua y adherente que también es conformable a la piel. El tipo de película formada sobre la piel después del curado al aire se parece más al llamado "vendaje líquido", que es una película líquida que se seca en una película adherente sólida cuando se aplica a la piel. La película se conforma a la piel y, por lo general, permanece adherida a la piel durante un período prolongado de tiempo durante la ducha, natación y actividades normales al aire libre. Al mismo tiempo, la película de polímero puede no adherirse a sustratos que no sean la piel. Por lo tanto, el recubrimiento puede permanecer adherente y conformable a la superficie de la piel, pero no exhibirá suficiente pegajosidad o adhesividad para recolectar polvo, ni adherirse a la ropa u otros objetos que puedan entrar en contacto con la película.

- El material de recubrimiento polimérico puede estar presente en la composición en cantidades que varían de 1 a 99.9 %, preferiblemente de aproximadamente 1 a 95 %, más preferiblemente de aproximadamente 1 a 75 %. En una realización preferida, el material de recubrimiento polimérico cuando se aplica a la piel en un espesor de 0.0005 a 0.010 pulgadas [0.01 a 0.25 mm] tendrá una tasa de transmisión de vapor de humedad de 100 a 1,000 gm/m²/día. Las composiciones ahora reivindicadas comprenden silicato de dimeticona en una cantidad de 1 a 35 % en peso de la composición. Otros polímeros adecuados para usar en la composición incluyen, pero no se limitan a, los siguientes:

45 (a). Materiales compuestos poliméricos de siloxano

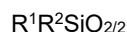
- Los materiales compuestos poliméricos de siloxano adecuados incluyen aquellos que son el producto de reacción de un polidimetilsiloxano bloqueado en su extremo con silanol y una resina de silicato. El polímero es el producto de reacción de una resina de siloxano que comprende al menos unidades T o Q o ambas y opcionalmente unidades M o D, y un diorganosiloxano. Dichos polímeros se pueden sintetizar de acuerdo con los métodos establecidos en la Patente de Estados Unidos No. 4,584,355.

El término unidad "M" significa una unidad siloxi monofuncional que tiene la fórmula general:



en donde R¹, R² y R³ son cada uno independientemente C1-30, preferiblemente C1-12, más preferiblemente alquilo o alcoxi de cadena lineal o ramificada C1-4, que pueden estar sustituidos con ácidos carboxílicos grupos fenilo o hidroxilo.

- 60 El término unidad "D" significa una unidad siloxi difuncional que tiene la fórmula general:



- 65 en donde R¹ y R² son como se establece anteriormente con respecto a la definición de unidad "M".

El término unidad "T" significa que la unidad siloxi trifuncional tiene la siguiente fórmula:



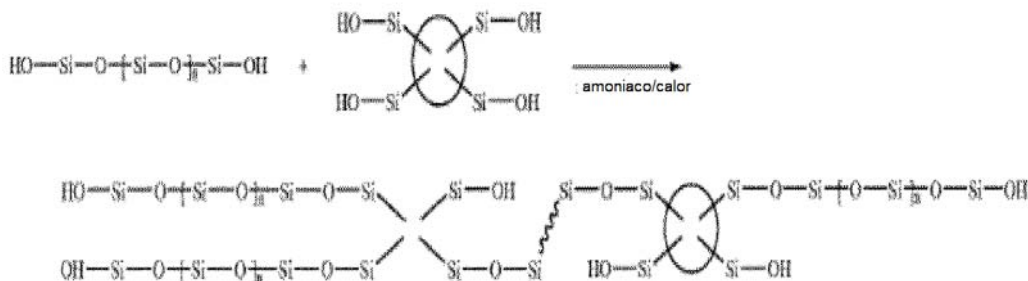
5 en donde R¹ es como se establece anteriormente.

El término unidad "Q" significa una unidad siloxi cuadrifuncional que tiene la siguiente fórmula:



10 El polímero de siloxano puede prepararse por hidrólisis de monómeros de silano, preferiblemente clorosilanos. Los clorosilanos se hidrolizan a silanoles y luego se condensan para formar siloxanos. Por ejemplo, las unidades Q a menudo se hacen hidrolizando tetraclorosilanos en medios acuosos o acuosos/alcohólicos para formar unidades de Si(OH)₄. Este silano sustituido con hidroxilo se polimeriza luego con unidades sustituidas con silanol tales como diorganosiloxanos.

En la realización preferida de la invención, el polímero se prepara de acuerdo con la siguiente reacción:



20 Los más preferidos son los polímeros vendidos por Dow Corning Corporation con los nombres comerciales 7-4405, que tienen el nombre CTFA de sililato de dimeticona. La composición para blanquear la piel de la invención comprende sililato de dimeticona en una cantidad de 1 a 35 % en peso de la composición. El polímero puede suministrarse a la composición en forma de una solución o dispersión en disolventes volátiles tales como siliconas lineales o hidrocarburos parafínicos. Lo más preferido es donde el polímero comprende Dow Corning 7-4405 Cosmetic Fluid, que es una mezcla de 40 partes de sililato de dimeticona y 60 partes de isododecano. En este caso, la composición comprende de 1-35 %, preferiblemente de 1-30 %, más preferiblemente de aproximadamente 3-20 % en peso de la composición total del material polimérico.

30 (b). Copolímeros de siloxanos y monómeros etilénicamente insaturados

También son adecuados los copolímeros de siloxano y uno o más monómeros etilénicamente insaturados. Los ejemplos incluyen los copolímeros establecidos en la Patente de los Estados Unidos No. 5,103,812 que se polimerizan a partir de monómeros de alquilsiloxano de vinilo y ácido acrílico, ácido metacrílico o sus ésteres alquílicos de cadena lineal o ramificada C1-10 simples. Otros ejemplos de monómeros etilénicamente insaturados incluyen metacrilato de metilo, arilato de metilo, metacrilato de tetrahidrofurfurilo, acrilato de ciclohexilo, acrilato de tetrahidrofurfurilo, acrilato de n-laurilo, metacrilato de n-laurilo, acrilato de 2-fenoxietanol, metacrilato de 2-fenoxietanol, acrilato de isodecilo, metacrilato de isodecilo, acrilato de isooctilo, metacrilato de isooctilo, acrilato de isobornilo, metacrilato de isobornilo, acrilato de 2-butoxietilo, acrilato de n-butilo, metacrilato de n-butilo, acrilato de etilo, metacrilato de etilo, itaconato de dimetilo, itaconato de di-n butilo, acrilato de 2-etilhexilo, metacrilato de 2-etilhexilo, metacrilato de furfurilo, acrilato de metilo, alfa metilestireno, estireno, pt-butil estireno, 4-metoxiestireno, acrilato de n-octadecilo, metacrilato de n-octadecilo, metacrilato de 2-feniletilo, metacrilato de n-tridecilo, benzoato de vinilo. Cualquiera de tales monómeros puede estar sustituido con halógenos tales como cloro, flúor y similares.

45 Los monómeros mencionados anteriormente pueden hacerse reaccionar con vinil alquilalcoxilanos que tienen la fórmula:



50 en donde R¹ es H, CH₃, o CH₂-COOR'; R² es un alquilo C1-10 o CH₂CH(OH)CH; R³, R⁴, y R⁵ son O-Si(Y)₃, o alquilo C1-10; en donde al menos uno de R³, R⁴, o R⁵ es O-Si(Y)₃; y en donde Y es alquilo C1-10, OSi(Z)₃ o R²OOC(R')C=CH₂, en donde Z es alquilo C1-6, arilo, y R' es R²SiR³R⁴R⁵.

Es particularmente preferido donde los vinilalquilalcoxilanos son:

3-metacrilolioxipropiltris(trimetilsiloxi)silano;

5 3-metacrioliolioxipropilpentametildisiloxano;

3-metadriloilosipropilbis(trimetilsiloxi)metilsilano;

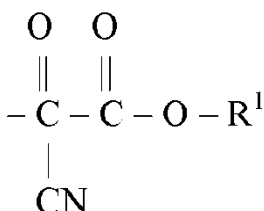
3-acrilolioxipropilmetilbis(trimetilsiloxi)silano;

10 3-acriloxipropiltris(trimetilsiloxi)silano

Y los monómeros etilénicamente insaturados son uno o más de los acrilatos, metacrilatos, isooctilacrilato y combinaciones de estos.

15 (c). Homo o copolímeros de cianoacrilato

También adecuados como el material polimérico son los homo o copolímeros de cianoacrilato. Los ejemplos incluyen polímeros divulgados en las Patentes de Estados Unidos No. 6,183,593; 8,217,110. Los cianoacrilatos pueden estar sustituidos con grupos alquilo de cadena lineal o ramificada C2-30, por ejemplo, cianoacrilato de butilo, octilcianoacrilato y similares. Un ejemplo de una unidad de repetición de monómero de cianoacrilato que puede ser adecuada es:



25 en donde R¹ es un alquilo de cadena lineal o ramificada C1-10, preferiblemente C8, que puede estar sustituido con halógenos (Cl, F, Br, I, etc.)

El monómero de cianoacrilato puede polimerizarse con uno o más monómeros tales como vinilpirrolidona; ácido acrílico, ácido metacrílico o sus ésteres simples; siloxanos; vinilsiloxanos, y similares.

30 2. Activo blanqueador de la piel

La composición también contiene al menos un ingrediente activo para blanquear la piel. Específicamente, el ingrediente para blanquear la piel está presente preferiblemente en cantidades que varían del 0.01 al 35 %, más preferiblemente del 0.1 al 15 %, más preferiblemente del 0.1 al 2.0 % en peso de la composición total. Los activos adecuados para el blanqueamiento de la piel incluyen, pero no se limitan a, los identificados como agentes blanqueadores de la piel en el CTFA Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook, 2006. Los ingredientes incluyen, pero no se limitan a, palmitato de dimetilmetoxi cromano, Tricholoma matsutak, extracto de Cornus controversa, extracto de Curcuma longa, Extracto de Glycyrrhiza glabra, 3,3',4',7-tetrahidroxiflavona, extracto de Artocarpus lakucha, extracto de hoja de Ilex paraguariensis, extracto de hoja de Cynara scolymus, ascorbato de creatina, 4,6,4'-trihidroxiarona, extracto de Cordyceps sinensis, micelios, Poria cocos, esclerotium, raíz de ginseng Panax, extracto de Ginkgo biloba, Perilla frutescens, Citrus reticulate, Polygonum cuspidatum, rizoma, I-cobre/zinc/glicina, propionato de 4-hidroxibenzoato, acetato de 4-hidroxibenzoato, aceite de cártamo, extracto de albaricoque, extracto de Zingiber jujube, extracto de Palmaria palmata, hexilresorcinol, fenetil resorcinol, ácido kójico, hinoquitiol, extracto de lactobacillus, extracto de raíz de Morus alba, niacinamida, resveratrol, trifosfato de resveratrol, extracto de germen de trigo, sulforafano, glabridina, amentoflavona, arbutina, extracto de Hibiscus rose, hidroxiresveratrol, extracto de Prunus mume, extracto de girasol, curcumina, Lycium chinense, extracto de Cornus officinalis, Shizandra chinense, corteza de Morus alba, Rubeas coreanus, Pinus korajensis, Prunus tomentosa, extracto de semilla de Juglans regia (nuez), extracto de Pyrus malus, extracto de Camellia sinensis, extracto de Cucumis sativas, extracto de Scutellaria baicalensis, etc. También son útiles las mezclas de extractos botánicos vendidos bajo los nombres comerciales Phyto white (mezcla de agua, butilenglicol, extracto de Cornus officinalis, Shizandra chinense, corteza de Morus alba, Rubeas coreanus, Pinus korajensis, Prunus tomentosa y extracto de semilla de Juglans regia (nuez)) y Phytolight (una mezcla de agua, propilenglicol, butilenglicol, extracto de Pyrus malus, extracto de Camellia sinensis, extracto de Cucumis sativas y extracto de Scutellaria baicalensis).

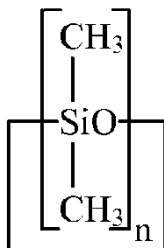
55 3. Otros ingredientes

La composición de la invención puede contener otros ingredientes incluyendo, pero no limitándose a los establecidos aquí.

(a). Aceites

5 La composición de la invención comprende un aceite de silicona no volátil que tiene una viscosidad de 20 a 200,000 cst a 25 °C. Otros aceites adecuados pueden ser volátiles o no volátiles. La cantidad total de tales aceites es de aproximadamente 1 a 50 % en peso de la composición total.

Los aceites volátiles incluyen siliconas cíclicas que tienen la fórmula general:



10

donde n = 3-6, preferiblemente 4, 5 o 6.

También son adecuadas las siliconas lineales volátiles, por ejemplo, las que tienen la fórmula general:

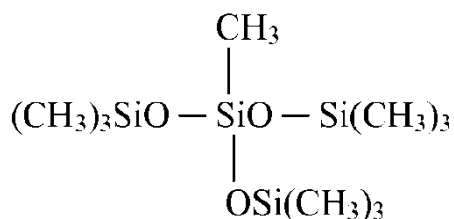
15



donde n = 0, 1, 2, 3, 4 o 5, preferiblemente 0, 1, 2, 3 o 4.

20 Las siliconas volátiles cíclicas y lineales incluyen hexametildisiloxano (viscosidad 0.65 centistokes (cst abreviado)), octametiltrisiloxano (1.0 cst), decametiltetrasiloxano (1.5 cst), dodecametilpentasiloxano (2 cst) y mezclas de estos, con todas las mediciones de viscosidad a 25 °C.

25 Las siliconas volátiles ramificadas adecuadas incluyen alquil trimeticonas tales como metil trimeticona, una silicona volátil ramificada que tiene la fórmula general:



30 La metil trimeticona se puede comprar de Shin-Etsu Silicones bajo el nombre comercial TMF-1.5, que tiene una viscosidad de 1.5 centistokes a 25 °C.

35 También son adecuados como los aceites volátiles diversos hidrocarburos parafínicos de cadena lineal o ramificada que tienen 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19 o 20 átomos de carbono, más preferiblemente de 8 a 16 átomos de carbono. Los hidrocarburos adecuados incluyen pentano, hexano, heptano, decano, dodecano, tetradecano, tridecano e isoparafinas C₈₋₂₀ como se divulga en la patente de Estados Unidos Nos. 3,439,088 y 3,818,105. Los hidrocarburos parafínicos volátiles preferidos tienen un peso molecular de 70-225, preferiblemente de 160 a 190 y un intervalo de punto de ebullición de 30 a 320, preferiblemente de 60 a 260 °C, y una viscosidad de menos de aproximadamente 10 cst. a 25 °C. Tales hidrocarburos parafínicos están disponibles de EXXON bajo la marca registrada ISOPARS, y de la Permethyl Corporation. Las isoparafinas C₁₂ adecuadas son fabricadas por Permethyl Corporation bajo el nombre comercial Permethyl 99A. También son adecuadas diversas isoparafinas C₁₆ disponibles comercialmente, tales como isohexadecano (que tiene el nombre comercial Permethyl R).

45 Una variedad de aceites no volátiles también es adecuada para usar en las composiciones de la invención. Los aceites no volátiles generalmente tienen una viscosidad mayor de aproximadamente 5 a 10 centistokes a 25 °C, y pueden variar en viscosidad hasta aproximadamente 1,000,000 de centipoises a 25 °C. Los ejemplos de aceites no volátiles incluyen, pero no se limitan a los establecidos aquí.

50 Los ésteres adecuados son mono, di y triésteres. La composición puede comprender uno o más ésteres seleccionados del grupo, o mezclas de estos.

Los monoésteres se definen como ésteres formados por la reacción de un ácido monocarboxílico que tiene la fórmula R-COOH, en donde R es un alquilo saturado o insaturado de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 45 átomos de carbono, o fenilo; y un alcohol que tiene la fórmula R-OH en donde R es un alquilo saturado o insaturado de cadena lineal o ramificada que tiene 2-30 átomos de carbono, o fenilo. Tanto el alcohol como el ácido pueden estar sustituidos con uno o más grupos hidroxilo. Uno o ambos del ácido o alcohol puede ser un ácido "graso" o alcohol, y puede tener de aproximadamente 6 a 30 átomos de carbono, más preferiblemente 12, 14, 16, 18 o 22 átomos de carbono en forma de cadena lineal o ramificada, saturada o insaturada. Los ejemplos de aceites monoéster que se pueden usar en las composiciones de la invención incluyen laurato de hexilo, isoestearato de butilo, isoestearato de hexadecilo, palmitato de cetilo, neopentanoato de isoestearilo, heptanoato de estearilo, isononanoato de isoestearilo, lactato de esterarilo, octanoato de estearilo, estearato de estearilo, isononanoato de isononilo, etc.

Los diésteres adecuados son el producto de reacción de un ácido dicarboxílico y un alcohol alifático o aromático o un alcohol alifático o aromático que tiene al menos dos grupos hidroxilo sustituidos y un ácido monocarboxílico. El ácido dicarboxílico puede contener de 2 a 30 átomos de carbono, y puede estar en forma de cadena lineal o ramificada, saturada o insaturada. El ácido dicarboxílico puede estar sustituido con uno o más grupos hidroxilo. El alcohol alifático o aromático también puede contener de 2 a 30 átomos de carbono, y puede estar en forma de cadena lineal o ramificada, saturada o insaturada. Preferiblemente, uno o más del ácido o alcohol es un ácido graso o alcohol, es decir, contiene 12-22 átomos de carbono. El ácido dicarboxílico también puede ser un ácido alfa hidróxido. El éster puede estar en forma de dímero o trímero. Los ejemplos de aceites de diésteres que se pueden usar en las composiciones de la invención incluyen malato de diisotearilo, dioctanoato de neopentilglicol, sebacato de dibutilo, dilinoleato dímero de dicetearilo, adipato de dicetilo, adipato de diisocetilo, adipato de diisononilo, dilinoleato dímero de diisoestearilo, fumarato de diisoestearilo, malato de diisoestearilo, malato de dioctilo, etc.

Triésteres adecuados comprenden el producto de reacción de un ácido tricarboxílico y un alcohol alifático o aromático o, alternativamente, el producto de reacción de un alcohol alifático o aromático que tiene tres o más grupos hidroxilo sustituidos con un ácido monocarboxílico. Al igual que con los mono y diésteres mencionados anteriormente, el ácido y alcohol contienen 2 a 30 átomos de carbono, y pueden ser saturados o insaturados, de cadena lineal o ramificada, y pueden estar sustituidos con uno o más grupos hidroxilo. Preferiblemente, uno o más del ácido o alcohol es un ácido graso o alcohol que contiene 12 a 22 átomos de carbono. Los ejemplos de triésteres incluyen ésteres de ácidos araquidónico, cítrico o behénico, tales como triaraquidina, citrato de tributilo, citrato de triisoestearilo, citrato de alquilo tri C₁₂₋₁₃, tricaprilina, citrato de tricaprililo, behenato de tridecilo, citrato de trioctildodecilo, behenato de tridecilo; o cocoato de tridecilo, isononanoato de tridecilo, etc.

Los ésteres adecuados para usar en la composición se describen adicionalmente en el C.T.F.A. Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook, undécima edición, 2006, bajo la clasificación de "ésteres".

Puede ser deseable incorporar uno o más aceites de hidrocarburos no volátiles en la composición. Los aceites de hidrocarburos no volátiles adecuados incluyen hidrocarburos parafínicos y olefinas, preferiblemente aquellos que tienen más de aproximadamente 20 átomos de carbono. Ejemplos de tales aceites de hidrocarburos incluyen olefinas C₂₄₋₂₈, olefinas C₃₀₋₄₅, isoparafinas C₂₀₋₄₀, poliisobuteno hidrogenado, poliisobuteno, polideceno, polideceno hidrogenado, aceite mineral, pentahidroescualeno, escualeno, escualano y mezclas de estos. En una realización preferida, tales hidrocarburos tienen un peso molecular que varía de aproximadamente 300 a 1000 Daltons.

Los ésteres de glicerilo sintéticos o de origen natural de ácidos grasos, o triglicéridos, también son adecuados para usar en las composiciones. Se pueden utilizar tanto fuentes vegetales como animales. Ejemplos de tales aceites incluyen aceite de ricino, aceite de lanolina, triglicéridos C₁₀₋₁₈, caprílico/cáprico/triglicéridos, aceite de almendra dulce, aceite de hueso de albaricoque, aceite de sésamo, aceite de camelina sativa, aceite de semilla de tamanu, aceite de coco, aceite de maíz, aceite de semilla de algodón, aceite de linaza, aceite para tinta, aceite de oliva, aceite de palma, mantequilla de illipe, aceite de colza, aceite de soja, aceite de semilla de uva, aceite de semilla de girasol, aceite de nuez y similares.

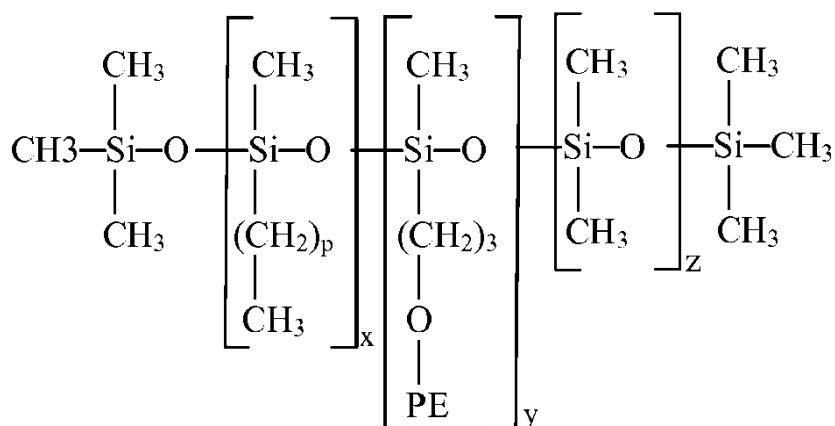
También son adecuados los ésteres de glicerilo sintéticos o semisintéticos, tales como mono, di y triglicéridos de ácidos grasos que son grasas o aceites naturales que se han modificado, por ejemplo, mono, di o triésteres de polioles tales como glicerina. En un ejemplo, un ácido carboxílico graso (C₁₂₋₂₂) se hace reaccionar con uno o más grupos de glicerilo repetitivos. Estearato de glicerilo, diisoestearato de diglicerilo, isoestearato de poliglicerilo-3, isoestearato de poliglicerilo-4, ricinoleato de poliglicerilo-6, dioleato de glicerilo, diisotearato de glicerilo, tetraisoestearato de glicerilo, trioctanoato de glicerilo, diestearato de diglicerilo, linoleato de glicerilo, miristato de glicerilo, isoestearato de glicerilo, aceites de ricino-PEG, oleatos de glicerilo-PEG, estearatos de glicerilo-PEG, ésteres de ácido graso de glicerilo-PEG, etc.

La composición de la invención comprende un aceite de silicona no volátil que tiene una viscosidad de 20 a 200,000 cst a 25 °C. Tanto los aceites de silicona no volátiles solubles en agua como los insolubles en agua son adecuados para usar en la composición. Las siliconas insolubles en agua adecuadas incluyen siliconas con funcionalidad amina tales como amodimeticona.

Por ejemplo, tales siliconas no volátiles pueden tener la siguiente fórmula general:

Un tipo de tensioactivo de silicona que se puede usar generalmente se denomina copoliol de dimeticona o alquilo de copoliol de dimeticona. Este tensioactivo es un tensioactivo de agua en aceite o de aceite en agua que tiene un equilibrio hidrófilo/lipófilo (HLB) que varía de aproximadamente 2 a 18. Preferiblemente, el tensioactivo de silicona es un tensioactivo no iónico que tiene un HLB que varía de aproximadamente 2 a 12, preferiblemente de aproximadamente 2 a 10, lo más preferiblemente de aproximadamente 4 a 6. El término "radical hidrófilo" significa un radical que, cuando está sustituido en el esqueleto principal del polímero de organosiloxano, confiere propiedades hidrófilas a la porción sustituida del polímero. Ejemplos de radicales que conferirán hidrofiliidad son hidroxipolietileno, hidroxilo, carboxilatos y mezclas de estos. El término "radical lipofílico" significa un radical orgánico que, cuando se sustituye sobre el esqueleto principal del polímero organosiloxano, confiere propiedades lipofílicas a la porción sustituida del polímero. Ejemplos de radicales orgánicos que conferirán lipofiliidad son alquilo, fluoro, arilo, ariloxi, de cadena lineal o ramificada C₁₋₄₀, acilo de hidrocarbilo C₁₋₄₀, hidroxipolipropileno o mezclas de estos.

Un tipo de tensioactivo de silicona adecuado tiene la fórmula general:



en donde p es 0-40 (el intervalo incluye todos los números adentro del intervalo y subintervalos tales como 2, 3, 4, 13, 14, 15, 16, 17, 18, etc.), y PE es (-C₂H₄O)_a-(-C₃H₆O)_b-H en donde a es 0 a 25, b es 0-25 con la condición de que tanto a como b no pueden ser 0 simultáneamente, x e y cada uno independientemente van de 0 a 1 millón con la condición de que ambos no pueden ser 0 simultáneamente. En una realización preferida, x, y, z, a y b son tales que el peso molecular del polímero varía de aproximadamente 5,000 a aproximadamente 500,000, más preferiblemente de aproximadamente 10,000 a 100,000, y lo más preferiblemente es aproximadamente 50,000 y el polímero se denomina genéricamente copoliol de dimeticona.

Un tipo de tensioactivo de silicona es donde p es tal que el alquilo de cadena larga es cetilo o laurilo, y el tensioactivo se denomina, genéricamente, cetil de copoliol de dimeticona o lauril de copoliol de dimeticona respectivamente.

En algunos casos, también se especifica el número de unidades repetidas de óxido de etileno u óxido de propileno en el polímero, como un copoliol de dimeticona que también se denomina dimeticona PEG-15/PPG-10, que se refiere a una dimeticona que tiene sustituyentes que contiene 15 unidades de etilenglicol y 10 unidades de propilenglicol en el esqueleto principal de siloxano. También es posible que uno o más de los grupos metilo en la estructura general anterior se sustituyan con un alquilo de cadena más larga (por ejemplo, etilo, propilo, butilo, etc.) o un éter tal como éter metílico, éter etílico, éter propílico, éter butílico y similares.

Ejemplos de tensioactivos de silicona son los vendidos por Dow Corning bajo el nombre comercial Dow Corning 3225C Formulation Aid que tiene el nombre CTFA ciclotetrasiloxano (y) ciclopentasiloxano (y) dimeticona PEG/PPG-18; o 5225C Formulation Aid, que tiene el nombre CTFA ciclopentasiloxano (y) dimeticona PEG/PPG-18/18; o tensioactivo Dow Corning 190 que tiene el nombre CTFA dimeticona PEG/PPG-18/18; o Dow Corning 193 Fluid, Dow Corning 5200 que tiene el nombre CTFA meticona lauril PEG/PPG-18/18; o Abil EM 90 que tiene el nombre CTFA dimeticona cetil PEG/PPG-14/14 vendido por Goldschmidt; o Abil EM 97 que tiene el nombre CTFA dimeticona bis-cetil PEG/PPG-14/14 vendido por Goldschmidt; o Abil WE 09 que tiene el nombre CTFA dimeticona cetil PEG/PPG-10/1 en una mezcla que también contiene isoestearato de poliglicerilo-4 y laurato de hexilo; o KF-6011 vendido por Shin-Etsu Silicones que tiene el nombre CTFA dimeticona PEG-11 metil éter; KF-6012 vendido por Shin-Etsu Silicones que tiene el nombre CTFA dimeticona PEG/PPG-20/22 butil éter; o KF-6013 vendido por Shin-Etsu Silicones que tiene el nombre CTFA dimeticona PEG-9; o KF-6015 vendido por Shin-Etsu Silicones que tiene el nombre CTFA dimeticona PEG-3; o KF-6016 vendido por Shin-Etsu Silicones que tiene el nombre CTFA dimeticona PEG-9 metil éter; o KF-6017 vendido por Shin-Etsu Silicones que tiene el nombre CTFA dimeticona PEG-10; o KF-6038 vendido por Shin-Etsu Silicones que tiene el nombre CTFA dimeticona lauril PEG-9 poldimetilsiloxietilo.

También son adecuados diversos tipos de tensioactivos de silicona entrecruzados que a menudo se denominan elastómeros emulsionantes. Normalmente se preparan como se establece anteriormente con respecto a la sección "elastómeros de silicona", excepto que los elastómeros de silicona contendrán al menos una unidad estructural hidrófila tal como grupos polioxialquilenados. Típicamente, estos elastómeros de silicona polioxialquilenados son organopolisiloxanos entrecruzados que pueden obtenerse mediante una reacción de adición de entrecruzamiento de diorganopolisiloxano que comprende al menos un hidrógeno enlazado al silicio y de un polioxialquileno que comprende al menos dos grupos etilénicamente insaturados. En al menos una realización, los organopolisiloxanos entrecruzados polioxialquilenados se obtienen mediante una reacción de adición de entrecruzamiento de un diorganopolisiloxano que comprende al menos dos hidrógenos enlazados cada uno a un silicio, y un polioxialquileno que comprende al menos dos grupos etilénicamente insaturados, opcionalmente en presencia de un catalizador de platino, como se describe, por ejemplo, en la patente de Estados Unidos No. 5,236,986 y la patente de Estados Unidos No. 5,412,004, patente de Estados Unidos No. 5,837,793 y la patente de Estados Unidos No. 5,811,487.

Los elastómeros de silicona polioxialquilenados que se pueden usar en al menos una realización de la invención incluyen los vendidos por Shin-Etsu Silicones bajo los nombres KSG-21, KSG-20, KSG-30, KSG-31, KSG-32, KSG-33; KSG-210, que es un polímero cruzado de dimeticona/PEG-10/15 dispersado en dimeticona; KSG-310, que es un polímero cruzado de lauril dimeticona PEG-15; KSG-320, que es un polímero cruzado de lauril dimeticona PEG-15 dispersado en isododecano; KSG-330 (el primero disperso en trietilhexanoína), KSG-340, que es una mezcla de polímero cruzado de lauril dimeticona PEG-10 y polímero cruzado de lauril dimeticona PEG-15.

También son adecuados los elastómeros de silicona poliglicerolados como los divulgados en el documento PCT/WO 2004/024798. Dichos elastómeros incluyen la serie KSG de Shin-Etsu, como KSG-710, que es un polímero cruzado de dimeticona/poliglicerina-3 dispersado en dimeticona; o polímero cruzado de lauril dimeticona/poliglicerina-3 disperso en una variedad de disolventes tales como isododecano, dimeticona, trietilhexanoína, vendidos bajo los nombres comerciales de Shin-Etsu KSG-810, KSG-820, KSG-830 o KSG-840. También son adecuadas las siliconas vendidas por Dow Corning bajo los nombres comerciales 9010 y DC9011.

Un emulsionante elastómero de silicona entrecruzado preferido es el polímero cruzado de dimeticona/PEG-10/15, que proporciona una excelente estética debido a su esqueleto principal elastomérico, pero también propiedades de tensioactivo.

La composición puede comprender uno o más tensioactivos orgánicos no iónicos. Los tensioactivos no iónicos adecuados incluyen alcoholes alcoxilados, o éteres, formados por la reacción de un alcohol con un óxido de alquileno, usualmente óxido de etileno o propileno. Preferiblemente, el alcohol es un alcohol graso que tiene de 6 a 30 átomos de carbono. Ejemplos de tales ingredientes incluyen Estearat 2-100, que se forma por la reacción de alcohol estearílico y óxido de etileno y el número de unidades de óxido de etileno varía de 2 a 100; Behenet 5-30 que se forma por la reacción de alcohol behenílico y óxido de etileno donde el número de unidades repetidas de óxido de etileno es de 5 a 30; Cetearat 2-100, formado por la reacción de una mezcla de alcohol cetílico y estearílico con óxido de etileno, donde el número de unidades repetidas de óxido de etileno en la molécula es de 2 a 100; Cetet 1-45 que se forma por la reacción de alcohol cetílico y óxido de etileno, y el número de unidades de óxido de etileno que se repiten es de 1 a 45, y así sucesivamente.

Se forman otros alcoholes alcoxilados por la reacción de ácidos grasos y alcoholes mono, di o polihídricos con un óxido de alquileno. Por ejemplo, los productos de reacción de ácidos carboxílicos grasos C₆₋₃₀ y alcoholes polihídricos que son monosacáridos tales como glucosa, galactosa, metilglucosa y similares, con un alcohol alcoxilado. Los ejemplos incluyen alquilenglicoles poliméricos que reaccionan con ésteres de ácidos grasos de glicerilo tales como oleatos de glicerilo-PEG, estearato de glicerilo-PEG; o polihidroxicanotas-PEG tales como dipolihidroxiestearato-PEG en donde el número de unidades de etilenglicol que se repiten varía de 3 a 1000.

Otros tensioactivos no iónicos adecuados incluyen sorbitán alcoxilado y derivados de sorbitán alcoxilado. Por ejemplo, la alcoxilación, en particular la etoxilación de sorbitán proporciona derivados de sorbitán polialcoxilados. La esterificación de sorbitán polialcoxilado proporciona ésteres de sorbitán tales como los polisorbatos. Por ejemplo, el sorbitán polialquioxilado se puede esterificar con ácidos grasos C₆₋₃₀, preferiblemente C₁₂₋₂₂. Los ejemplos de tales ingredientes incluyen polisorbatos 20-85, oleato de sorbitán, sesquioleato de sorbitán, palmitato de sorbitán, sesquioestearato de sorbitán, estearato de sorbitán, etc.

(d). Minerales de montmorillonita

La composición de la invención comprende de 0.5 a 15 % en peso de un mineral de montmorillonita o derivado cuaternizado del mismo.

La composición contiene uno o más agentes estructurantes tales como minerales de montmorillonita naturales o sintéticos tales como hectorita, bentonita y derivados cuaternizados de los mismos, que se obtienen haciendo reaccionar los minerales con un compuesto de amonio cuaternario, tal como bentonita de estearalconio, hectoritas, hectoritas cuaternizadas como hectorita Quaternium-18, atapulgita, carbonatos como carbonato de propileno, bentonas y similares.

La composición puede contener otros ingredientes tales como conservantes, antioxidantes, vitaminas y similares.

B. El método

5 En el método de la invención, la composición se puede aplicar a las manchas hiperpigmentadas en la piel al menos una vez al día, o más a menudo si es necesario. La composición se puede aplicar a cualquier superficie de la piel donde haya manchas hiperpigmentadas, incluyendo cara, manos, espalda, brazos, etc. Debido a la naturaleza adherente de la composición, permanecerá en las manchas a las que se aplica durante un período de tiempo de 12 a hasta 72 horas. La colocación de la composición que contiene el agente blanqueador de la piel en la mancha misma y su adherencia a la piel durante un período prolongado blanqueará la mancha de manera muy efectiva. La composición permanece en la mancha de manera más efectiva que la aplicación de una composición para blanquear la piel de vez en cuando. Cuando la composición se aplica durante un período prolongado de tiempo, el tratamiento es mucho más efectivo.

C. El kit

La invención también comprende un kit para usar en el blanqueamiento de manchas hiperpigmentadas en la piel que comprende:

- Un receptáculo con cierre y un aplicador,
- y se almacena dentro del receptáculo una composición de la invención para blanquear la piel.

Una realización del kit de acuerdo con la invención se expone en las Figuras 1-4.

La figura 1 representa un tipo de recipiente 1 adecuado para almacenar y dispensar la composición 2. El recipiente 1 tiene una tapa 3 y un receptáculo 4. La tapa 3 se fija preferiblemente al receptáculo 4 con roscas 5 que se acoplan con roscas 6 en el cuello 7 del receptáculo 4. Una varilla 8 se extiende desde la tapa 3 y tiene un aplicador 9 en el extremo distal del mismo. Preferiblemente, el aplicador 9 es lo que se denomina un aplicador 10 puntiforme como se representa en la Figura 4. Esto permite la aplicación de la composición específicamente a las manchas hiperpigmentadas, que a menudo son pequeñas y discretas en la superficie de tratamiento. El aplicador puntiforme tiene preferiblemente una superficie de aplicación que varía de 5 a 50 mm en área de superficie, más preferiblemente de 5 a 25 mm. El aplicador puntiforme puede estar hecho de silicona o material termoplástico como poliuretano, polietileno, polipropileno, etc., y puede o no ser deformable. El aplicador puntiforme también puede ser afelpado.

La invención se describe adicionalmente en relación con los siguientes ejemplos que se exponen solo con fines ilustrativos.

Ejemplo 1

Se preparó una composición para tratar manchas hiperpigmentadas en la piel de la siguiente manera:

Ingrediente	% en peso
Dióxido de titanio	41.67
Isododecano	14.80
Dimeticona	12.76
Sililato de dimeticona	9.76
Óxidos de hierro (CI77492)	5.93
Polimetilmetacrilato	3.73
Ascorbato de tetrahexadecilo	3.00

(continuación)

Ingrediente	% en peso
Fenilo de trimeticona	2.00
Óxidos de hierro (CI77491)	1.18
dimeticona cetil PEG/PPG-1	1.00
Trietoxicaprilil silano	0.92
Diesteardimonio hectorita	0.90
Dimeticona PEG-10	0.70
Lecitina	0.50
Sesquioleato de sorbitán	0.50
Caprililglicol	0.30
Ingrediente para blanquear la piel	2.00
Bisabolol	0.10
Carbonato de propileno	0.07
Óxidos de hierro (CI77499)	0.02

5 La composición se preparó combinando los ingredientes y mezclándolos bien para formar un líquido viscoso que se almacenó en un recipiente con tapa hermética y un aplicador de varilla con brocha. La composición se aplicó al antebrazo volar de los sujetos de prueba, 0.10 gramos. Al secar se formó un "apósito líquido". Se tomaron fotografías. Luego se instruyó a los sujetos para que se sometieran a su rutina diaria normal con al menos una ducha y regresaran para tomar fotografías a las 24 y 48 horas. Todos los sujetos de prueba estuvieron de acuerdo en que la composición prácticamente no había cambiado ni en la adhesión ni en la retención del color después de 48 horas.

10 Ejemplo 2

Se preparó una fórmula para tratar manchas hiperpigmentadas en la piel de la siguiente manera:

Ingrediente	% en peso
Dióxido de titanio (CI77891)	QS100
Dimeticona	19.57
Isododecano	14.80
Sililato de dimeticona	9.20
Óxidos de hierro	4.95
Fenilo de trimeticona	2.00
Trietoxicaprilil silano	1.00
Dimeticona cetil PEG/PPG-1	1.00
Dimeticona PEG-10	0.70
Diesteardimonio hectorita	0.63
Sesquioleato de sorbitán	0.50
Lecitina	0.50
Caprililglicol	0.30
Linoleato/oleato de tocoferilo	0.20

(continuación)

Ingrediente	% en peso
Ácido linoleico	0.20
Bisabolol	0.10
Ascorbato de tetrahexildecilo	0.10
Carbonato de propileno	0.04
Extracto de Glycyrrhiza glabra	0.10

La composición se preparó combinando los ingredientes y mezclándolos bien para formar un líquido viscoso.

- 5 Aunque la invención se ha descrito en relación con la realización preferida, no se pretende limitar el alcance de la invención a la forma particular establecida, sino que, por el contrario, se pretende cubrir tales alternativas y modificaciones que son incluidas dentro del alcance de la invención como se define por las reivindicaciones.

REIVINDICACIONES

- 5 1. Una composición para blanquear la piel para blanquear manchas hiperpigmentadas en la piel, comprendiendo la composición un material de recubrimiento polimérico líquido que, tras la exposición al aire ambiental y a la humedad en la piel, se endurece a una película sólida resistente al agua, permeable al vapor de agua, adherente y conformable cuando se aplica a la piel, y al menos un activo blanqueador de la piel;
- 10 en donde el material de recubrimiento polimérico comprende sililato de dimeticona en una cantidad de 1 a 35 % en peso de la composición; y la composición comprende además:
- 15 un aceite de silicona no volátil que tiene una viscosidad que varía de 20 a 200,000 cst a 25 °C, en donde la cantidad total de aceites volátiles y no volátiles en la composición es de 1 a 50 % en peso;
- de 0.5 a 15 % en peso de un mineral de montmorillonita o derivado cuaternizado del mismo; y
- 20 una mezcla de pigmentos en partículas y polvos en una cantidad suficiente para hacer que la composición coincida con la piel circundante cuando se aplica a las manchas hiperpigmentadas.
2. La composición para blanquear la piel de la reivindicación 1, en donde el al menos un activo para blanquear la piel está presente en una cantidad de 0.01 a 35 % en peso de la composición.
3. La composición para blanquear la piel de la reivindicación 1, en donde el al menos un activo para blanquear la piel está presente en una cantidad de 0.1 a 15 % en peso de la composición.
- 25 4. La composición para blanquear la piel de la reivindicación 1, en donde el al menos un activo para blanquear la piel está presente en una cantidad de 0.1 a 2 % en peso de la composición.
- 30 5. Un método para blanquear manchas hiperpigmentadas en la piel que comprende aplicar a las manchas que necesitan blanqueamiento, una composición para blanquear la piel que comprende un material de recubrimiento polimérico líquido que, tras la exposición al aire ambiental y a la humedad en la piel, se endurece a una película sólida resistente al agua, permeable al vapor de agua, adherente y conformable, cuando se aplica a la mancha, y al menos un activo para blanquear la piel presente en una cantidad suficiente en el material polimérico para hacer que la mancha tratada se blanquee con el tiempo cuando la película polimérica endurecida se adhiere a la misma;
- 35 en donde el material de recubrimiento polimérico comprende sililato de dimeticona en una cantidad de 1 a 35 % en peso de la composición; y la composición comprende además:
- 40 un aceite de silicona no volátil que tiene una viscosidad que varía de 20 a 200,000 cst a 25 °C, en donde la cantidad total de aceites volátiles y no volátiles en la composición es de 1 a 50 % en peso;
- de 0.5 a 15 % en peso de un mineral de montmorillonita o derivado cuaternizado del mismo; y
- 45 una mezcla de pigmentos en partículas y polvos en una cantidad suficiente para hacer que la composición coincida con la piel circundante cuando se aplica a las manchas hiperpigmentadas;
- 50 en donde el material de recubrimiento polimérico es adherente a la mancha a la que se aplicó durante un período de 12 a 48 horas; y
- en donde el punto se blanquea tratando durante un período de 4 a 60 días con la aplicación del material de recubrimiento polimérico líquido la mancha cada 12 a 72 horas.
- 55 6. Un kit para blanquear manchas hiperpigmentadas en la piel que comprende:
- un receptáculo que tiene un cierre y un aplicador; y
- almacenado dentro del receptáculo la composición para blanquear la piel de la reivindicación 1.
7. El kit de la reivindicación 6, en donde el receptáculo está hecho de vidrio.
- 60 8. El kit de la reivindicación 6 en donde el aplicador es un pincel o un aplicador puntiforme.

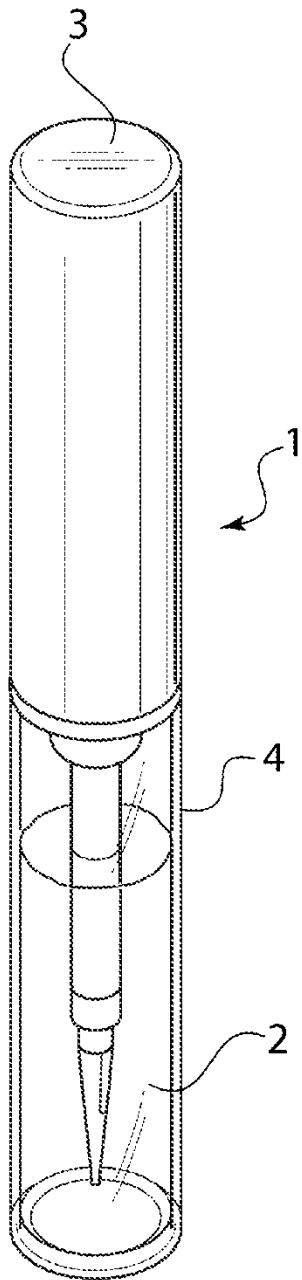


FIG. 1

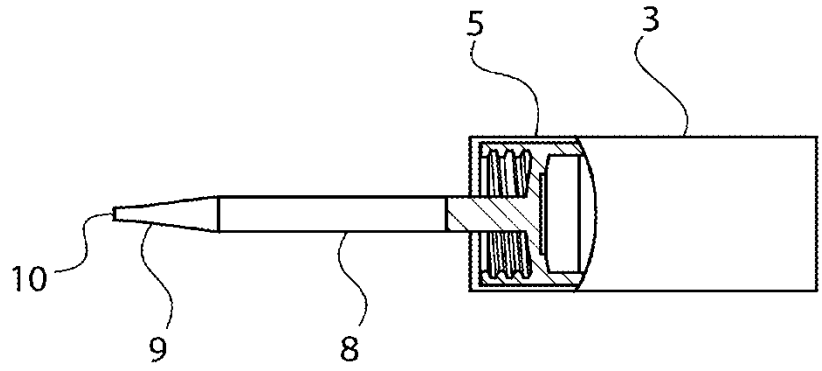


FIG. 2

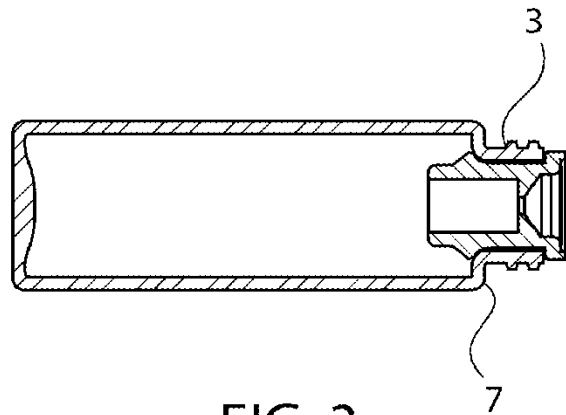


FIG. 3

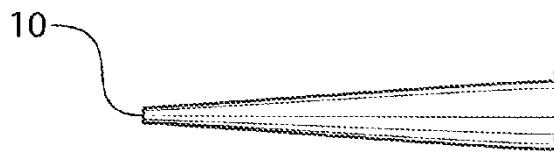


FIG. 4