(19) OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 366 886**

(51) Int. Cl.:
A61K 8/11 (2006.01)

(12) TRADUCCIÓN DE REIVINDICACIONES DE SOLICITUD DE PATENTE EUROPEA T1

(96) Número de solicitud europea: **10182378 .9**
(96) Fecha de presentación de la solicitud: **20.04.2001**
(97) Número de publicación de la solicitud: **2324812**
(97) Fecha de publicación de la solicitud: **25.05.2011**

(30) Prioridad: **21.04.2000 US 198749 P**

(43) Fecha de publicación de la mención BOPI:
26.10.2011

(46) Fecha de publicación de la traducción de las reivindicaciones: **26.10.2011**

(71) Solicitante/s: **SOL-GEL TECHNOLOGIES Ltd.**
Industrial Zone West
P.O. Box 367
Beit Shemesh 99100, IL

(72) Inventor/es: **Lapidot, Noa;**
Magdassi, Shlomo;
Avnir, David;
Rottman, Claudio;
Ben Zazon, Orit y
Seri-Levy, Alon

(74) Agente: **Carpintero López, Mario**

(54) Título: **Composición que presenta estabilidad de formulación potenciada y administración de ingredientes activos tópicos potenciado.**

ES 2 366 886 T1

REIVINDICACIONES

1. Un procedimiento para la preparación de microcápsulas que tienen una estructura de núcleo-cáscara, en el que dichas microcápsulas tienen un diámetro de aproximadamente 0,1 a 100 micrómetros, en las que cada núcleo incluye al menos un ingrediente activo, dicho núcleo está encapsulado dentro de una cáscara microcapsular y en las que dicha cáscara está comprendida por al menos un polímero inorgánico obtenido por un procedimiento de sol-gel y dicha cáscara microcapsular protege el ingrediente activo antes de la aplicación tópica y libera dicho ingrediente activo después de la aplicación tópica, dicho procedimiento comprende las etapas de: (a) preparar una solución hidrófoba o una dispersión hidrófoba que comprende precursores sol-gel y un ingrediente a encapsular; (b) emulsionar la solución o dispersión hidrófoba de la etapa (a) en una solución acuosa sometida a fuerzas de alto cizallamiento para obtener una emulsión; (c) mezclar y agitar la emulsión obtenida, con una segunda solución acuosa, a un pH seleccionado para obtener las microcápsulas sol-gel.

2. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que dicha solución o dispersión hidrófoba comprende adicionalmente un tensioactivo, un polímero, un tensioactivo polimérico, un agente de suspensión o mezclas de los mismos.

3. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que dichos precursores sol-gel se seleccionan a partir del grupo que consiste en un monómero de alcóxido metálico, un monómero de alcóxido semimetálico, un monómero de éster metálico, un monómero de éster semimetálico, un monómero de silazano, un monómero de la fórmula $M(R)_n(P)_m$, en la que M es un elemento metálico o un elemento semimetálico, R es un sustituyente hidrolizable, n es un número entero desde 2 hasta 6, P es un sustituyente no polimerizable y m es un número entero desde 0 hasta 6, un polímero parcialmente hidrolizado y parcialmente condensado de los mismos, o cualquier mezcla de los mismos.

4. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que dicha dispersión hidrófoba se prepara por un procedimiento que comprende las siguientes etapas: (a) humedecer y mezclar un ingrediente sólido a encapsular con al menos un aditivo seleccionado del grupo que consiste en un líquido, un agente humectante, o una combinación de los mismos; (b) micronizar el sólido por trituración o molienda para obtener una dispersión del sólido en dicho aditivo.

5. El procedimiento de la reivindicación 4, que comprende adicionalmente añadir al menos un aceite en la etapa (a) o en la etapa (b) o en ambas etapas (a) y (b) para obtener una dispersión del sólido en el aceite.

6. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que dicha dispersión hidrófoba se prepara por un procedimiento que comprende las siguientes etapas: (a) micronizar un ingrediente sólido para encapsular por trituración o molienda; (b) humedecer y mezclar un ingrediente sólido a encapsular con al menos un aditivo seleccionado del grupo que consiste en un líquido, un agente humectante, o una combinación de los mismos.

7. El procedimiento de la reclamación 6, comprendiendo adicionalmente la etapa de añadir al menos una fase de dispersión seleccionada del grupo que consiste en un aceite, un precursor sol-gel o una combinación de los mismos y su mezcla para obtener una dispersión.

8. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 0-4, en el que la concentración del sólido es aproximadamente 0,001 por ciento al 95 por ciento (peso/peso) en base al peso total del sólido y el aceite.

9. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 4, en el que el tamaño de la partícula del sólido disperso está entre aproximadamente 0,1 aproximadamente 20 micrómetros.

10. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 4, en el que un aceite está presente en la dispersión final a una concentración de entre aproximadamente 5 aproximadamente 99 por ciento (peso/peso).

11. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 4 en el que el líquido está seleccionado del grupo que consiste en un líquido hidrófobo, un líquido hidrófilo, un líquido acuoso, o mezclas de los mismos.

12. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 4 en el que la concentración de los precursores sol-gel en la dispersión final está entre aproximadamente 5 aproximadamente 99 por ciento (peso/peso).

13. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 4 en el que el agente humectante está seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un tensioactivo polimérico, o mezclas de los mismos.

14. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 13 en el que el tensioactivo está seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo aniónico, un tensioactivo catiónico, un tensioactivo anfótero, un tensioactivo no iónico, o mezclas de los mismos.

15. El procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que el aceite está seleccionado a partir de un grupo que consiste en aceite mineral, dimeticona, ciclometicona, alquilsiloxanos, éteres de alquilsiloxanos, copolioles de dimeticona, benzoato de alquilo C12-15, benzoato de isoestearilo, benzoato de éter estearílico PPG-15, benzoato de octildodecilo, benzoato de estearilo, benzoato de metilo Gluceth-20, dibenzoato de Poloxámero 1 82, benzoato de Poloxámero 1 05, Transcutol, éster de Bernel, maleato de dietilhexilo, sebacato de dietilhexilo, adipato d e dietilhexilo, adipato de diisopropilo, sebacato de diisopropilo, maleato de diisopropilo, salicilato de etilhexilo, salicilato de tridecilo, salicilato de butiloctilo, miristato de isopropilo, o mezclas de los mismos.

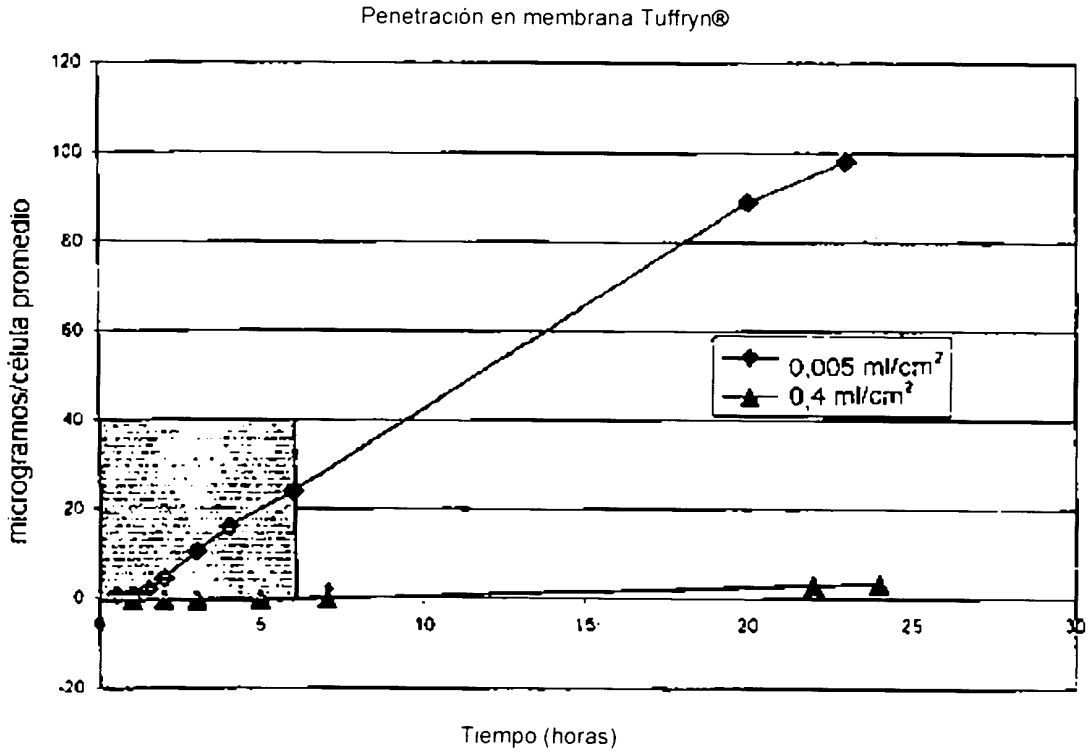

Penetración en membrana Tuffryn®
microgramos/célula promedio
120
100
80
60
40
20
0
-20
5
10
15
20
25
30
0,005 ml/cm²
0,4 ml/cm²
Tiempo (horas)

Figura 1

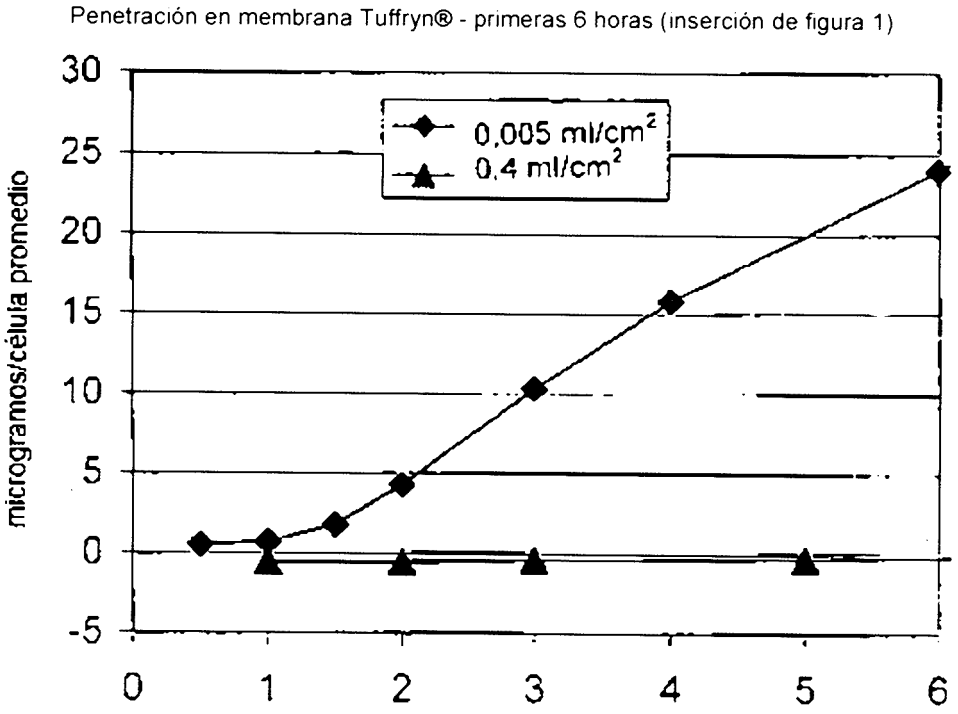

Penetración en membrana Tuffryn® - primeras 6 horas (inserción de figura 1)
0,005 ml/cm²
0,4 ml/cm²
microgramos/célula promedio
30
25
20
15
10
5
0
-5
0
1
2
3
4
5
6
Tiempo (horas)

Figura 2