



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 280 776**

51 Int. Cl.:

A61K 8/11 (2006.01)

A61K 8/81 (2006.01)

A61K 8/88 (2006.01)

A61K 8/73 (2006.01)

A61Q 1/02 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

B01J 13/14 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **03749122 .2**

86 Fecha de presentación : **26.08.2003**

87 Número de publicación de la solicitud: **1545433**

87 Fecha de publicación de la solicitud: **29.06.2005**

54

Título: **Partículas activadas ópticamente para su uso en composiciones cosméticas.**

30

Prioridad: **13.09.2002 US 243060**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.09.2007

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.09.2007

73

Titular/es: **LIPO CHEMICALS Inc.**
207 19th Avenue
Paterson, New Jersey 07504, US

72

Inventor/es: **Sojka, Milan, F. y**
Ortega, Lydia

74

Agente: **Espiell Volart, Eduardo María**

ES 2 280 776 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

Partículas activadas ópticamente para su uso en composiciones cosméticas.

5 Campo de la invención

La presente invención se refiere a partículas activadas ópticamente para su uso en composiciones cosméticas. Las partículas activadas ópticamente reducen la percepción visual de imperfecciones de la piel. Más particularmente, las partículas activadas ópticamente difunden la luz ambiental y emiten luz visible para reducir la percepción visual de imperfecciones, incluyendo, pero no limitadas a, celulitis, arrugas alrededor de los ojos y la boca, discromías en la piel por venas y arterias, sombras, poros, pequeñas señales, folículos y manchas de la piel. Las partículas activadas ópticamente pueden usarse en varias composiciones cosméticas, por ejemplo, lociones para la piel, cremas, champús para el cabello, enjuagues corporales, geles de baño, agentes limpiadores de la piel, acondicionadores para el cabello, composiciones colorantes de la piel, colorantes para el cabello, líquidos y polvos de base de maquillaje (compactos o sueltos), pastas de dientes, enjuagues orales, medicamentos tópicos y productos para el tratamiento de la piel.

Antecedentes de la invención

La piel de aspecto natural se ve afectada por varios factores fisiológicos y genéticos. Las definiciones estándar de una piel bonita incluyen una piel con una calidad transparente con matices de color uniforme (por ejemplo, mejillas rosadas). La base de este aspecto natural es la propia estructura de la piel. La capa exterior de la piel humana es una capa semitransparente denominada estrato córneo. La transparencia del estrato córneo permite la observación de las capas más profundas de la piel, en las que residen los vasos sanguíneos y los pigmentos. El tono rojizo de la hemoglobina de la sangre, y el tono marrón/negro de la melanina, el principal pigmento de la piel, se combinan para producir el color de la piel de un individuo. Además de que la piel tenga una apariencia transparente con una distribución uniforme del color subyacente, una piel ideal también debe ser suave y uniforme, sin ninguna irregularidad superficial aparente. Muy pocos individuos cumplen el patrón de la piel ideal, por consiguiente, la mayoría de los individuos requieren ayuda en forma de composiciones cosméticas. Por lo tanto, se ha desarrollado una amplia variedad de composiciones “de maquillaje” para mejorar el aspecto de la piel.

El maquillaje tradicional no está diseñado para imitar el aspecto natural de la piel bonita, sino que se aplica sobre la piel para disimular imperfecciones de la piel. Actualmente, la tendencia en las composiciones cosméticas es aportar un aspecto más natural a la piel. En particular, un objetivo muy deseado es el desarrollo de una composición cosmética que no dé al usuario una apariencia de “maquillado”. Sin embargo, ha sido difícil lograr el objetivo de superar las irregularidades de la piel y el tono no uniforme de la piel, mientras se mantiene la apariencia vibrante de una piel limpia y desnuda. Esta dificultad se atribuye principalmente a los componentes opacos incluidos típicamente en las composiciones cosméticas, tales como los pigmentos de titanio y óxido de hierro, que aportan el color deseado y la cobertura de la piel, pero oscurecen una vibrante transparencia de la piel. Recientemente han aparecido pigmentos transparentes, pero la cobertura necesaria para disimular irregularidades de la piel está frecuentemente ausente.

Las composiciones para el cuidado personal se han dirigido a una reducción en las imperfecciones de la piel y los signos visibles de envejecimiento, por ejemplo, líneas y arrugas finas, usando dos metodologías principales. La primera metodología usa diversos ingredientes anti-envejecimiento bioactivos. La segunda es una metodología física que usa materiales inorgánicos para disimular el aspecto de las líneas finas y otras imperfecciones de la piel. La segunda metodología usada se conoce como tecnología de “*soft focus*”, que se basa en el principio de la dispersión de la luz. Una reciente tercera metodología es combinar la dispersión de la luz con la emisión de luz fluorescente. La luz emitida ilumina las sombras de las imperfecciones de la piel y proporciona la ilusión de que las imperfecciones no existen.

El uso de compuestos abrillantadores fluorescentes en composiciones limpiadoras y cosméticas es conocido. La patente de EE.UU. n° 4.032.263 desvela una composición detergente blanqueante y abrillantadora que contiene un detergente aniónico y/o no iónico, un aditivo salino, un agente blanqueante de peroximonosulfato, un promotor blanqueante de bromuro y uno o más abrillantadores ópticos que son estables en presencia del blanqueante y del promotor.

La patente de EE.UU. n° 4.752.496 desvela un procedimiento para aplicar ingredientes cosméticos a un sustrato. Los ingredientes cosméticos se combinan con un portador líquido y un agente formador de película, y se depositan sobre un sustrato. El agente formador de película microencapsula los ingredientes cosméticos, y, después de secar, protege los ingredientes cosméticos. Los ingredientes cosméticos protegidos pueden aplicarse entonces a un sustrato y cubrirse con una lámina de cartón.

La patente de EE.UU. n° 6.117.435 desvela composiciones cosméticas “de apariencia natural”. Estas composiciones tópicas para su aplicación sobre la piel contienen perlas de sílice con un núcleo interno de sílice, una capa intermedia de un óxido metálico y una capa externa de sílice, al menos un pigmento interferente y, opcionalmente, al menos un pigmento no interferente, en una fórmula cosmética o farmacéuticamente aceptable. Las composiciones cosméticas imparten un aspecto natural a la piel a la vez que reducen el aspecto de las irregularidades o defectos de la piel sin un aspecto opaco o maquillado.

La patente de EE.UU. nº 6.194.375 desvela un perfume absorbido en partículas poliméricas que, adicionalmente, tiene un recubrimiento polimérico en la superficie de la partícula. El polímero de la superficie de la partícula puede ser parte de una cubierta de encapsulación, y puede ser alcohol polivinílico altamente hidrolizado (APV). La patente de EE.UU. nº 6.204.033 desvela partículas poliméricas esféricas de APV que encapsulan un coloide magnético para su uso en la unión de biomoléculas. El documento WO94/28223 desvela artículos no tejidos que comprenden una red no tejida de fibras orgánicas y un ligante que comprende al menos parcialmente reticulado con una resina que tiene una pluralidad de grupos hidroxilo.

Las partículas activadas ópticamente que contienen un abrillantador fluorescente fijado a un núcleo microporoso de polvo de nailon-12, y están encapsuladas en una cubierta de polioximetileno urea (PMU), están disponibles comercialmente como LipoLight™ OAP/C de Lipo Chemicals, Inc., Paterson, NJ. Las intensidades fluorescentes de las partículas de PMU encapsuladas son aproximadamente el doble que las de las partículas idénticas pero no encapsuladas. Las partículas encapsuladas se usan para reducir la percepción de las imperfecciones de la piel. Sin embargo, la cubierta de PMU presenta problemas medioambientales y de toxicidad debido a la presencia de formaldehído libre. Consecuentemente, los investigadores han investigado partículas que eliminan el uso de PMU, mientras conservan la eficacia requerida para reducir el aspecto de las imperfecciones de la piel.

Consecuentemente, en la técnica permanece una necesidad de composiciones cosméticas capaces de impartir una percepción de que la piel humana tiene menos arrugas y otras imperfecciones, por ejemplo, la celulitis, produce un tono uniforme en la piel, oscurece discromías de la piel y/o reduce las manchas de la piel. Las partículas activadas ópticamente de la presente invención cumplen este requisito emitiendo y reflejando luz visible, y aumentando la difusión de la luz. También hay una necesidad de proporcionar partículas activadas ópticamente mejoradas que superen el inconveniente asociado con las partículas activadas ópticamente anteriores.

Resumen de la invención

La presente invención está dirigida a partículas activadas ópticamente útiles en composiciones aplicadas por vía tópica, tales como composiciones cosméticas y composiciones farmacéuticas. Las partículas activadas ópticamente reducen la percepción visual de las imperfecciones de la piel. Más particularmente, la presente invención está dirigida a partículas activadas ópticamente que comprenden un sustrato sólido con un compuesto fluorescente fijado al mismo, y dicho sustrato tratado con compuesto fluorescente está encapsulado en, o recubierto por, un alcohol polivinílico (APV) reticulado.

La presente invención proporciona partículas activadas ópticamente (AO) para su uso en composiciones aplicadas por vía tópica para reducir la percepción visual de imperfecciones de la piel mediante la emisión de luz visible y mediante la dispersión de la luz. Una partícula activada ópticamente comprende (a) un sustrato sólido, por ejemplo, un sustrato polimérico sintético, un sustrato polimérico natural, una sal insoluble, un mineral u otro sólido insoluble, y (b) un compuesto fluorescente fijado permanente o semipermanentemente al sustrato sólido para formar partículas tratadas con compuesto fluorescente que están (c) encapsuladas en una cubierta reticulada transparente de APV.

Las partículas AO difunden y emiten luz visible para reducir la percepción visual de la celulitis, las sombras, las discromías de la piel, las arrugas y las imperfecciones similares de la piel. En particular, después de que las partículas activadas ópticamente sean aplicadas por vía tópica sobre la superficie de la piel, las partículas AO encapsuladas absorben una porción de la radiación ultravioleta y emiten luz visible para reducir la percepción visual de las imperfecciones de la piel.

Las partículas AO encapsuladas se usan en la preparación de composiciones aplicadas por vía tópica, tales como lociones para la piel, cremas, champús para el cabello, enjuagues corporales, geles del baño, agentes limpiadores de la piel, acondicionadores para el cabello, composiciones colorantes de la piel, colorantes para el cabello, líquidos y polvos de base de maquillaje (compactos o sueltos), pastas de dientes, enjuagues orales, medicamentos tópicos y productos para el tratamiento de la piel.

Consecuentemente, un aspecto de la presente invención es proporcionar partículas AO encapsuladas para su uso en composiciones aplicadas por vía tópica, en el que las partículas AO dispersan la luz en todas las longitudes de onda, y absorben luz ultravioleta de unas longitudes de onda en particular y emiten luz visible en unas longitudes de onda más largas (es decir, liberan energía en forma de luz), con objeto de reducir el aspecto y la percepción visual de las imperfecciones de la piel.

Otro aspecto de la presente invención es proporcionar partículas AO en el que el sustrato sólido se trata previamente, por ejemplo, con un agente humectante o dilatante, para conseguir un sustrato sólido humectable, y disponible electrostática o iónicamente para fijar un compuesto fluorescente al mismo. En las formas de realización preferidas se usa un agente dilatante para dilatar un sustrato polimérico para fijar un compuesto fluorescente al sustrato.

Otro aspecto de la presente invención es proporcionar partículas AO encapsuladas con un compuesto fluorescente adherido o fijado a un sustrato sólido mediante una o más fuerzas de Van Der Waals, enlace iónico, enlace covalente, puentes de hidrógeno u otra asociación física o química fuerte o débil, tal que el compuesto fluorescente esté permanentemente, o al menos semipermanentemente, fijado al sustrato sólido.

Otro aspecto de la presente invención es proporcionar partículas AO que están encapsuladas con una cubierta transparente y/o translúcida de APV reticulado. Las partículas AO encapsuladas superan los inconvenientes asociados con las partículas AO encapsuladas en PMU, y sorprendentemente, mejoran la eficacia de las partículas AO usadas en composiciones aplicadas por vía tópica.

Otro aspecto de la presente invención es proporcionar partículas AO encapsuladas con un tamaño medio de partícula menor de aproximadamente $50\ \mu$ (micrómetros), preferiblemente desde aproximadamente $0,1\ \mu$ hasta aproximadamente $50\ \mu$, más preferiblemente desde aproximadamente $1\ \mu$ hasta aproximadamente $30\ \mu$, y muy preferiblemente desde aproximadamente $2\ \mu$ hasta aproximadamente $15\ \mu$, de diámetro. En las formas de realización preferidas, una partícula AO encapsulada de la presente invención es incolora, transparente o translúcida, y presenta un tamaño de partícula lo suficientemente pequeño como para evitar su detección a simple vista.

Otro aspecto de la presente invención es proporcionar partículas AO encapsuladas que comprenden un sustrato polimérico sintético elegido del grupo constituido por un nailon, un acrilato, un poliéster, un polietileno, un polipropileno, un cloruro de polivinilo o un polímero plástico similar, y mezclas de los mismos.

Aún otro aspecto más de la presente invención es proporcionar partículas AO encapsuladas, en el que el sustrato sólido está en forma de, pero no limitada a, una esfera, un cubo, un cilindro, un tetraedro (de forma piramidal), un romboide, una placa u otra configuración de forma poligonal; u otras partículas con forma regular o irregular. El sustrato sólido puede tener una estructura sólida o hueca.

Estos y otros nuevos aspectos y características de la presente invención serán apreciables a partir de la siguiente descripción detallada de las formas de realización preferidas, tomada en conjunto con los dibujos anexos.

Breve descripción de los dibujos

La fig. 1 es una representación esquemática de la preparación de una partícula AO encapsulada de la presente invención;

la fig. 2 es una vista esquemática ampliada de una partícula activada ópticamente encapsulada existente en un pliegue de una capa exterior de la piel, en la que la partícula activada ópticamente encapsulada está difundiendo y emitiendo luz para disminuir el efecto de sombra de las imperfecciones de la piel; y

la fig. 3 contiene representaciones de la intensidad frente a la longitud de onda (λ) que compara las partículas AO de la presente invención con partículas AO recubiertas con PMU.

Descripción detallada de la forma de realización preferida

Las partículas activadas ópticamente de la presente invención emiten y difunden luz visible para reducir drásticamente el aspecto de las imperfecciones de la piel. Las partículas micrométricas invisibles comprenden un núcleo de un compuesto fluorescente fijado a un sustrato sólido encapsulado por un alcohol polivinílico reticulado. Las partículas AO pueden formularse en composiciones aplicadas por vía tópica, tales como cremas antiarrugas, polvos comprimidos y sueltos, bases de maquillaje y geles para ojos, para reducir el aspecto de las arrugas, los poros y otras imperfecciones de la piel.

Las partículas combinan los efectos de la emisión de luz, que iluminan las sombras de las imperfecciones de la piel, y la dispersión de la luz, que da un efecto de *soft-focus*. El efecto óptico se atribuye a una combinación de la emisión de luz difusa (es decir, fluorescente) y la dispersión de la luz visible. En particular, el compuesto fluorescente fijado sobre el sustrato sólido absorbe una porción de la luz UV invisible y reemite esa luz como luz difusa visible. La luz visible emitida ilumina las áreas sombreadas de las arrugas, los poros dilatados y otras imperfecciones de la piel, reduciendo así significativamente su aspecto. La difusión de la luz visible incidente reflejada causa un efecto de *soft-focus* que contribuye al resultado global de beneficio óptico. Esta combinación de efectos permite que las partículas AO reduzcan drásticamente el aspecto de las imperfecciones de la piel.

En particular, las partículas activadas ópticamente se usan en composiciones cosméticas para reducir la percepción visual de la celulitis, las sombras, las arrugas, las leves discromías de la piel, las pequeñas señales, las venas varicosas y las manchas de la piel, particularmente, pero no limitada a, el área de la cara. Las partículas son preferiblemente incoloras, transparentes o translúcidas, y tienen un tamaño de partícula lo suficientemente pequeño como para ser invisibles a simple vista. El ojo humano percibe una combinación de luz dispersada y emitida proporcionada por las partículas activadas ópticamente. Las partículas AO pueden incorporarse en geles, dispersiones, emulsiones y polvos, y las composiciones que contienen las partículas AO pueden usarse solas o sobre composiciones de maquillaje.

El sustrato de las partículas AO puede ser cualquier material sólido que sea insoluble en el vehículo o portador de la composición aplicada por vía tópica, y que sea capaz de tener un compuesto fluorescente fijado permanente o semipermanentemente al mismo. El compuesto fluorescente puede fijarse al sustrato sólido mediante uno o más procedimientos, tales como fuerzas de Van Der Waals, enlace iónico, enlace covalente, puentes de hidrógeno u otra asociación física y química.

ES 2 280 776 T3

El sustrato es normalmente un sustrato polimérico sintético, por ejemplo, una poliamida, un poliacetato, un poliéster, un poliacrílico, un polietileno, un polipropileno, un cloruro de polivinilo, rayón u otros polímeros sintéticos similares. El sustrato también puede ser otro material sólido, incluyendo, pero no limitándose a, un material polimérico natural, por ejemplo, celulosa de algodón, celulosa regenerada, celulosa microcristalina, almidón y fibras naturales similares; una sal insoluble; un mineral; o cualquier otro material sólido insoluble capaz de actuar tanto como un sustrato para el compuesto fluorescente como de un centro de dispersión. El término "insoluble" según se usa en este documento se define como un sustrato que es insoluble en el vehículo o portador de una composición aplicada por vía tópica que incorpora las presentes partículas AO.

El sustrato sólido tiene normalmente un tamaño de partícula medio de menos de aproximadamente 50μ (micrómetros) de diámetro, y preferiblemente desde aproximadamente 0,1 hasta aproximadamente 50μ de diámetro. Más preferiblemente, el sustrato tiene un diámetro medio de tamaño de partícula desde aproximadamente 1 hasta aproximadamente 30μ , y muy preferiblemente, desde aproximadamente 2 hasta aproximadamente 15μ . El sustrato sólido tiene un intervalo de tamaño de partícula desde aproximadamente 0,001 hasta aproximadamente 150μ . Preferiblemente, el sustrato es incoloro, transparente o translúcido, y tiene un diámetro lo suficientemente pequeño como para ser invisible a simple vista.

La forma o la figura del sustrato sólido no están limitadas. Por ejemplo, el sustrato sólido puede ser una esfera, un cubo, un cilindro, un tetraedro (de forma piramidal), un romboide, una placa u otra configuración de forma poligonal. Las partículas del sustrato sólido también pueden tener una forma irregular, y, adicionalmente, pueden tener una estructura sólida o hueca.

Un sustrato sólido preferido es esferas de nailon-12 o nailon-6 con un diámetro medio de tamaño de partícula desde aproximadamente 5 hasta aproximadamente $10 \mu\text{m}$. Otro sustrato sólido preferido es esferas de celulosa microcristalina.

Un compuesto fluorescente se fija al sustrato sólido en una cantidad desde aproximadamente el 0,01% hasta aproximadamente el 1%, y preferiblemente desde aproximadamente el 0,02% hasta aproximadamente el 0,7%, en peso del sustrato sólido. Para lograr el beneficio completo de la presente invención, se fija al sustrato desde aproximadamente el 0,05% hasta aproximadamente el 0,5%, en peso, de un compuesto fluorescente.

Según se estableció previamente, el compuesto fluorescente se fija al sustrato mediante uno o más procedimientos físicos o químicos. El compuesto fluorescente se fija al sustrato bien permanentemente (por ejemplo, un enlace covalente) o bien semipermanentemente (por ejemplo, un puente de hidrógeno). Un compuesto fluorescente fijado semipermanentemente permanece fijado al sustrato a lo largo de la elaboración, almacenamiento y uso de la composición aplicada por vía tópica que contiene las presentes partículas AO.

El compuesto fluorescente puede fijarse directamente al sustrato. En otra forma de realización, el sustrato puede ser dilatado por un disolvente adecuado que ayude a fijar el compuesto fluorescente sobre el sustrato. El disolvente de dilatación es normalmente un alcohol, un diol o un polioliol, por ejemplo, un alcohol C_{1-4} , tal como alcohol isopropílico, un propilenglicol, etilenglicol, un polietilenglicol, un butilenglicol, un glicerol y disolventes hídricos similares.

La identidad del compuesto fluorescente no está limitada, y puede ser cualquier compuesto capaz de absorber una porción de UV invisible del espectro visible y convertir esta energía en la porción de longitud de onda más larga visible del espectro. El compuesto fluorescente es incoloro en el sustrato, y no absorbe energía en la parte visible del espectro. El compuesto fluorescente es típicamente un derivado de estilbena o 4,4'-diaminoestilbena, bifenilo, un heterociclo de 5 miembros, por ejemplo, triazol, oxazol o imidazol, o un heterociclo de 6 miembros, por ejemplo, una cumarina, una naftalamida o una s-triacina.

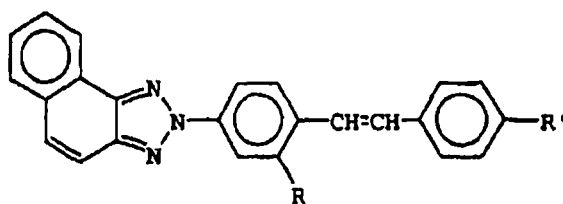
Una clase de compuesto fluorescente son los derivados bistriacínico del ácido 4,4'-diaminoestilbena-2,2'-disulfónico, ejemplificados en la Tabla 1.

TABLA 1

R	R'
-NHC ₆ H ₅	-OCH ₃
-NHC ₆ H ₅	-NHCH ₃
-NHC ₆ H ₅	
-NHC ₆ H ₅	-N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂
-NHC ₆ H ₅	
-NHC ₆ H ₅	-NHC ₆ H ₅
	-N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂

R	R'
	-N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂
	-N(CH ₂ CH ₃) ₂

Algunas clases adicionales de compuestos fluorescentes son los 2-(estilben-4-il)naftotriazoles

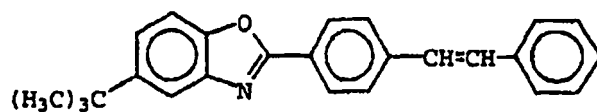


ES 2 280 776 T3

en los que R = SO₃H, R' = H, y R = CN y R' = Cl;

los 2-(4-fenilestilben-4-il)benzoxazoles

5

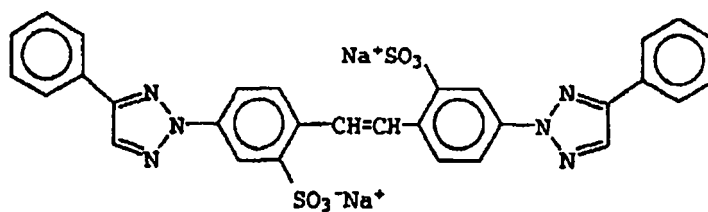


10

;

los bis(azol-2-il)estilbenos

15



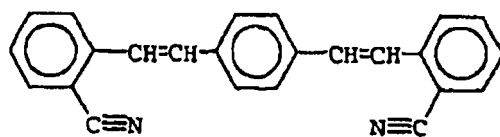
20

25

;

los 1,4-bis(estiril)bencenos

30

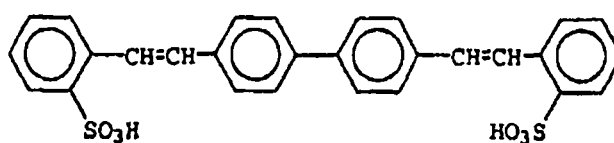


35

;

los 4,4'-bis(estiril)bifenilos

40



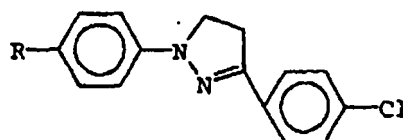
45

50

;

los derivados de 1,3-difenil-2-pirazolina

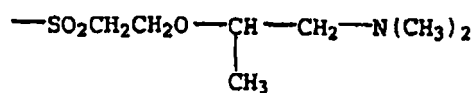
55



60

en los que R es -SO₃H, -SO₂NH₂, -SO₂NHCH₂CH₂CH₂N⁺(CH₃)₃⁻SO₃OCH₃, -SO₂CH₂CH₂SO₃H, sal sódica, o

65



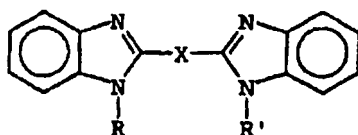
;

los derivados de bis(benzoxazol-2-ilo)

5		
10	R	R'
	-CH=CH-	Alquilo, 5 CH ₃
15		H, alquilo
20		H, alquilo
25		
30		COO-alquilo, SO ₂ -alquilo, H, alquilo

los derivados de bis(bencimidazol-2-ilo)

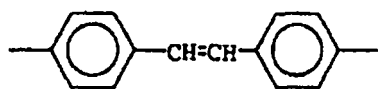
35



40

en los que X = -CH=CH- o

45



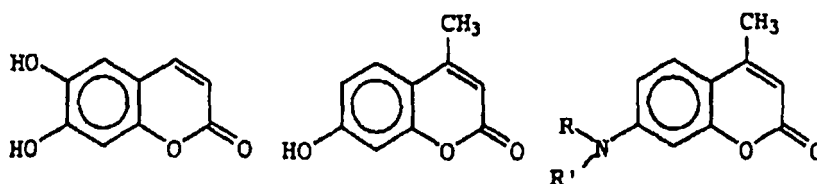
50

;

los 2-(benzofuran-2-il)bencimidazoles;

las cumarinas, incluyendo 3-fenil-7-aminocumarina, 3-fenil-7-(azol-2-il) cumarinas, 3,7-bis(azolil)-cumarinas,

55

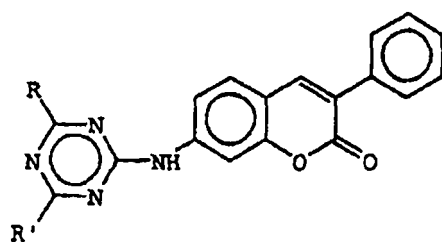


60

R=R' =H
R=R' =CH₃

65

5

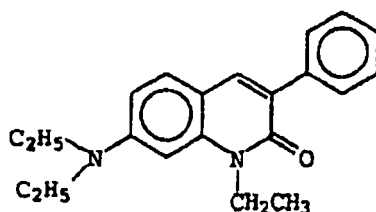


10

i

los carboestirilos

15



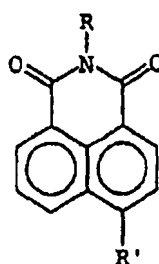
20

i

25

las naftalimididas

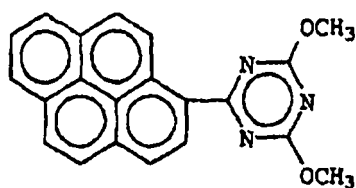
30



35

compuestos y clases variadas tales como piridotriazoles cuaternizados, un compuesto de pireno

40



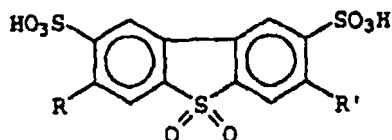
45

i

50

y el derivado acilamino (R,R') de 3,7-diamino-dibenzotiofeno-2,8-ácido disulfónico-5,5-dióxido, en el que los grupos acilo preferidos son alcoxibenzoilos,

55



60

Los compuestos fluorescentes están disponibles bajo una variedad de marcas comerciales, tales como TINOPAL, LEUCOPHÖR y CALCOFLUOR. Algunos compuestos fluorescentes específicos incluyen, pero no se limitan a, TINOPAL 5BM, CALCOFLUOR CG y LEUCOPHÖR BSB.

65

ES 2 280 776 T3

Después de fijar el compuesto fluorescente al sustrato sólido, el sustrato tratado con compuesto fluorescente resultante es recubierto por, o encapsulado en, un APV reticulado. El recubrimiento de APV reticulado actúa como una interfase de difusión adicional para la luz emitida, aumentando así la difusión de la luz emitida y reflejada, lo que consecuentemente reduce la percepción visual de las imperfecciones de la piel. El recubrimiento de APV reticulado supera los inconvenientes asociados con los anteriores recubrimientos de polioximetilen urea sobre partículas tratadas, y aumenta la eficacia de las partículas AO.

El alcohol polivinílico reticulado está presente en una partícula AO de la presente invención en una cantidad desde aproximadamente el 0,01% hasta aproximadamente el 25%, y preferiblemente desde aproximadamente el 0,05% hasta aproximadamente el 10%, en peso de la partícula AO. Para lograr el beneficio completo de la presente invención, el APV reticulado está presente en una cantidad desde aproximadamente el 0,1% hasta aproximadamente el 5%, en peso de las partículas AO.

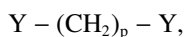
El alcohol polivinílico no puede ser preparado directamente mediante polimerización, y se obtiene mediante la hidrólisis del acetato de polivinilo. La hidrólisis generalmente se detiene antes de su finalización, y los polímeros con cantidades variables de hidrólisis están disponibles comercialmente. Un alcohol polivinílico preferido usado en las presentes partículas AO tiene un nivel sustancial de hidrólisis.

En particular, se prefiere un alcohol polivinílico que está hidrolizado aproximadamente del 70% al 100%, es decir, en el que se han eliminado aproximadamente del 70% al 100% de los residuos de acetato mediante hidrólisis. Más preferiblemente, el alcohol polivinílico está hidrolizado al menos aproximadamente en el 85%, preferiblemente al menos aproximadamente en el 90%, y más preferiblemente al menos aproximadamente en el 96%, por ejemplo, hidrolizado en aproximadamente del 96% al 100%.

Además, puede usarse un copolímero de alcohol polivinílico, disponible mediante la hidrólisis del correspondiente copolímero de acetato de vinilo, para encapsular las partículas tratadas. Por ejemplo, puede hidrolizarse un copolímero de acetato de vinilo y vinilformamida, con una elevada proporción de acetato de vinilo, a un copolímero de alcohol vinílico y vinilformamida.

El alcohol polivinílico es un polímero soluble o dispersable en agua. Por lo tanto, según una importante característica de la presente invención, el APV se reticula para proporcionar un recubrimiento insoluble. El APV se reticula usando procedimientos bien conocidos en la materia, por ejemplo, usando un agente de reticulación di o polifuncional, radiación y o ciclos de congelación-descongelación. En particular, el agente de reticulación del APV puede ser, pero no se limita a:

(a) ésteres de disulfonato, por ejemplo, compuestos de fórmula



en la que p es un número entre 2 y 12, e Y, es, independientemente, tosilato, mesilato, u otros ésteres de sulfonato de alquilo o arilo;

(b) aziridinas multifuncionales;

(c) aldehídos multifuncionales, por ejemplo, glutaraldehído, trioxano, paraformaldehído, tereftaldehído, malonaldehído y glioxal, y acetales y bisulfitos de los mismos;

(d) halohidrinás, tales como epíclorhidrina;

(e) compuestos epoxi multifuncionales, por ejemplo, etilenglicol diglicidil éter, bisfenol A diglicidil éter y bisfenol F diglicidil éter;

(f) ácidos carboxílicos y ésteres multifuncionales, cloruros de ácido y anhídridos derivados de los mismos, por ejemplo, ácidos di y policarboxílicos que contienen de 2 a 12 átomos de carbono, y los ésteres de metilo y etilo, cloruros de ácido y anhídridos derivados de los mismos, tales como ácido oxálico, ácido adípico, ácido succínico, ácido dodecanoico, ácido malónico, ácido glutárico y ésteres, anhídridos, y cloruros de ácido derivados de los mismos;

(g) titanatos orgánicos, tales como TYZOR AA, disponible en E.I. DuPont de Nemours, Wilmington, DE;

(h) resinas de melamina, tales como las resinas CYMEL disponibles en Cytec Industries, Wayne, NJ;

(i) hidroximetil ureas, tales como N,N-dihidroximetil-4,5-dihidroxietilen urea;

(j) isocianatos multifuncionales, tales como diisocianato de tolueno, diisocianato de isoforona, diisocianato de metileno, diisocianato de xileno y diisocianato de hexametileno; y

ES 2 280 776 T3

(k) otros agentes de reticulación para polímeros que contienen hidroxilo conocidos por las personas expertas en la materia.

Un agente de reticulación de APV preferido es un aldehído multifuncional, en particular, glicoxal.

5

Las partículas AO también pueden contener ingredientes opcionales, bien por debajo de la cubierta de APV reticulado, o bien aplicado a la cubierta de APV reticulado. Los ingredientes opcionales pueden ser un ingrediente cosmético, por ejemplo, un colorante de la piel, un acondicionador de la piel, retinol, una proteína, una vitamina y similares, o puede ser un medicamento tópico, por ejemplo, un medicamento antiacneico, un agente antibacteriano, un agente de protección solar, una medicación para una erupción de la piel o una enfermedad de la piel, un compuesto antipruriginoso, un compuesto antifúngico, y similares.

10

Las presentes partículas AO para su uso en composiciones aplicadas por vía tópica están representadas detalladamente en las Figs. 1 a 3. Las partículas AO emiten y difunden la luz para reducir la percepción visual de la celulitis, arrugas, sombras, poros, folículos, discromías de la piel por venas y arterias, y para oscurecer imperfecciones visuales de la superficie de la piel. Adicionalmente, las partículas AO reducen la percepción de pequeñas señales o abrasiones, y las manchas de la piel, por ejemplo, en el área de la cara.

15

Una partícula activada ópticamente 12 de la presente invención se ilustra y se prepara según se representa en la Fig. 1. En la preparación de las partículas AO, se fija un compuesto fluorescente 22 sobre un sustrato sólido 24, u opcionalmente un sustrato sólido dilatado 24S. El compuesto fluorescente 22 se fija al sustrato 24 (por ejemplo, una esfera de nailon) mediante un enlace covalente, un enlace iónico, fuerzas de Van Der Waals, un puente de hidrógeno u otra asociación fuerte o débil química o física, tal que el compuesto fluorescente 22 se fija, permanente o semipermanentemente, al sustrato 24 o 24S y pasa a ser parte de una partícula tratada con compuesto fluorescente 10.

25

Cuando se usa una esfera como el sustrato 24 o 24S, la partícula activada ópticamente 12 difunde la luz 40 con un patrón extendido radialmente, según muestra la Fig. 2. Una partícula tratada con un compuesto fluorescente 10 es encapsulada en una cubierta transparente o translúcida 30 de alcohol polivinílico reticulado. Por lo tanto, las partículas activadas ópticamente 12 reducen la percepción visual de la celulitis, arrugas, discromías o sombras 16 cuando se aplican a una superficie de la piel 14, según se esquematiza en la Fig. 2.

30

Las partículas activadas ópticamente de la presente invención pueden prepararse como sigue:

Ejemplos

35

Se añadieron propilenglicol (875 g) y PEG 200 (125 g) a un matraz de 3 L de fondo redondo equipado con un agitador, un condensador y una funda calefactora. Se añadió polvo de nailon-12 (7μ de diámetro) a la mezcla de reacción lentamente durante 15 minutos. La mezcla se agitó durante 15 minutos adicionales para dilatar las partículas de nailon, entonces se añadió la disolución de LEUCOPHOR BSB (disponible comercialmente en Clariant, 50 g), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos. Entonces se añadió agua destilada (950 g), y la mezcla resultante se calentó lentamente hasta 90°C con una tasa de ascenso de $1\text{-}2^{\circ}\text{C}/\text{min}$. La temperatura se mantuvo a 90°C durante 30 minutos, después se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente. La mezcla se filtró, y el polvo blanco recogido se lavó con cuatro porciones de 1200 ml de agua destilada, después se secó al aire para dar un polvo húmedo. El polvo húmedo se secó en un horno a 75°C durante 15 horas para obtener un polvo blanco seco fluorescente. El análisis espectrofotométrico de las disoluciones de lavado indicó que las partículas de nailon contenían un 0,3% de compuesto fluorescente.

45

Ejemplo 2

Se repitió el procedimiento del Ejemplo 1 excepto porque la temperatura de reacción se aumentó hasta 100°C . El análisis indicó que las partículas de nailon contenían un 0,4%, en peso, de compuesto fluorescente.

50

Ejemplo 3

Se repitió el procedimiento del Ejemplo 2 excepto porque se usó polvo de nailon-6 en lugar de polvo de nailon-12. El análisis indicó que las partículas de nailon contenían un 0,5%, en peso, de compuesto fluorescente.

55

Ejemplo 4

Se repitió el procedimiento del Ejemplo 2 excepto porque se sustituyó el etilenglicol (1000 g) por una mezcla de propilenglicol y PEG 200 y no se añadió agua. El análisis indicó que las partículas de nailon contenían un 0,4%, en peso, de compuesto fluorescente.

60

Ejemplo 5

Se repitió el procedimiento del Ejemplo 2 excepto porque se sustituyó el butilenglicol (1000 g) por una mezcla de propilenglicol y PEG 200 y no se añadió agua. El análisis indicó que las partículas de nailon contenían un 0,4%, en peso, de compuesto fluorescente.

65

ES 2 280 776 T3

Ejemplo 6

Se repitió el procedimiento del Ejemplo 2 excepto porque se usó polvo de celulosa microcristalina en lugar de polvo de nailon-12. El análisis indicó que el polvo de celulosa microcristalina contenía un 0,3%, en peso, de compuesto fluorescente.

Ejemplo 7

Se añadió alcohol isopropílico (150 g) a un matraz de 1 L de fondo redondo equipado con un agitador, un condensador y una funda calefactora. Se añadió polvo de nailon-12 ($7\ \mu$ de diámetro) a la mezcla de reacción lentamente durante 15 minutos, y la mezcla se agitó durante 15 minutos adicionales para dilatar las partículas de nailon. La mezcla se filtró, y la torta del filtro, que contenía aproximadamente 80 g de alcohol isopropílico y polvo de nailon fue devuelta al matraz de reacción. Se añadieron agua destilada (312 g) y una disolución de LEUCOPHOR BSB (disponible comercialmente en Clariant, 8 g), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos. La mezcla resultante se calentó a 88°C durante 30 minutos, después se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente. La mezcla se filtró, y el polvo blanco recogido se lavó con cuatro porciones de 200 ml de agua destilada, se secó al aire para dar un polvo húmedo. El polvo húmedo se secó en un horno a 75°C durante 15 horas para obtener un polvo blanco seco fluorescente. El análisis espectrofotométrico de las disoluciones de lavado indicó que las partículas de nailon contenían un 0,3% de compuesto fluorescente.

Ejemplo 8

Se dispersó alcohol polivinílico (APV) (CELVOL 165, 10 g grado de hidrólisis: 99,3+%) en 90 g de agua fría a una temperatura de 20-25°C. Entonces la suspensión resultante se calentó a 95°C tan rápidamente como fue posible con agitación continua. A 95°C, el APV se disolvió completamente, sin partículas residuales, en un máximo de 45 minutos. La mezcla se enfrió hasta la temperatura ambiente y se añadió un biocida para evitar el crecimiento microbiano durante su almacenamiento.

Una porción de la disolución de APV se añadió a agua fría para conseguir una concentración total de APV del 0,2% en peso, en un matraz de 2000 ml de tres cuellos equipado con un agitador, un termómetro y un condensador.

Se añadió una dispersión de partículas del 35% en peso del Ejemplo 7 en un 10,5% en peso de agua lentamente a la disolución acuosa agitada al 0,2% en peso de APV. Después de que la mezcla del recipiente de reacción fuera homogénea, se añadió un 1,25% en peso de glioxal, y se inició el calentamiento. La mezcla de reacción se calentó a 55°C, y la temperatura se mantuvo durante una hora para completar la reticulación del APV y proporcionar una membrana de APV reticulado en cada partícula. Las partículas AO resultantes se filtraron y se secaron. La Microscopía Electrónica de Barrido (*Scanning Electron Microscopy*, SEM) y la Espectroscopía Electrónica para Análisis Químicos (*Electron Spectroscopy for Chemical Analysis*, ESCA) indicaron una encapsulación total de las partículas de sustrato tratadas con fluorescente.

Las partículas AO de la presente invención están incorporadas en composiciones líquidas y sólidas aplicadas por vía tópica. Las partículas AO están incorporadas en composiciones líquidas aplicadas por vía tópica en una cantidad desde aproximadamente el 0,5% hasta aproximadamente el 20%, y preferiblemente desde aproximadamente el 1% hasta aproximadamente el 15%, en peso, de la composición. Para lograr el beneficio completo de la presente invención, las partículas AO están incorporadas en una cantidad desde aproximadamente el 2% hasta aproximadamente el 12%, en peso, de la composición.

Las partículas AO están incorporadas en composiciones sólidas aplicadas por vía tópica en una cantidad desde aproximadamente el 0,5% hasta aproximadamente 50%, y preferiblemente desde aproximadamente el 1% hasta aproximadamente el 30%, en peso, de la composición. Para lograr el beneficio completo de la presente invención, las partículas AO están incorporadas en una cantidad desde aproximadamente el 2% hasta aproximadamente el 20%, en peso, de la composición.

Ejemplo 9

Se preparó una crema para la piel que contiene las partículas activadas ópticamente fijadas del Ejemplo 8 según el siguiente procedimiento:

ES 2 280 776 T3

SEC	Porcentaje en peso	Ingrediente	Nombre INCI
1	77,15	Agua desionizada	Agua
1	1,00	UNIPHEN ¹⁾ P-23	Fenoxietanol(y) Metilparabeno (y) Etilparabeno (y) Propilparabeno (y) Butilparabeno
1	0,35	KELTROL ²⁾ CG	Goma xantana
2	4,00	LIPOVOL ³⁾ SES	Aceite de sésamo (<i>Sesamum indicum</i>)
2	0,50	LIPOPEG ³⁾ 6000DS	Diestearato de PEG-150
2	1,25	LIPOCOL ³⁾ C	Alcohol cetílico
2	2,50	LIPONATE ³⁾ CG	Triglicérido caprílico/cáprico
2	0,75	LIPOWAX ³⁾ P	Alcohol cetearílico (y) polisorbato 60
2	2,50	LIPO ³⁾ GMS 450	Estearato de glicerilo
3	10,00	Partículas activadas ópticamente del Ejemplo 8	
<p>1) Disponible en Induchem AG, Suiza; 2) Disponible en Kelco Co., San Diego, CA; 3) Disponible en Lipo Chemicals, Inc., Paterson, NJ.</p>			

Procedimiento

1. En un vaso de precipitados se calentaron los ingredientes de la secuencia n° 1 a 78-80°C con una mezcla con hélice de elevado impulso a una velocidad media/alta.
2. En un vaso de precipitados distinto se mezclaron los ingredientes de la secuencia n° 2 y se calentaron a 80°C.
3. Las mezclas de las etapas 1 y 2 se combinaron usando una velocidad media/alta de mezcla con hélice de elevado impulso. La mezcla continuó durante cinco minutos o hasta que se completó la emulsificación.
4. Enfriar hasta 25°C.
5. Añadir el ingrediente de la secuencia n° 3, y mezclar hasta homogeneidad.

Se probó la intensidad de fluorescencia de la crema cosmética resultante y se comparó con la crema estándar, que contenía partículas AO recubiertas con polioximetilen urea. Sorprendentemente, las partículas encapsuladas con APV funcionaron mejor que las partículas encapsuladas con PMU, según se ilustra en la Fig. 3. Consecuentemente, las presentes partículas AO funcionan mejor que las anteriores partículas AO, es decir, la intensidad ha aumentado hasta 2.2 u. a. desde 1.6 u. a., y los inconvenientes asociados con la PMU, por ejemplo, el formaldehído libre, se han superado.

ES 2 280 776 T3

5 Cuando las partículas activadas ópticamente 12 se exponen a la luz UV ambiental, las partículas absorben una porción de la luz UV en forma de energía, liberan esta energía en forma de luz visible 40, según muestra la Fig. 2. Por lo tanto, la fijación de un compuesto fluorescente 22 al sustrato sólido 24 proporciona una fuente emisora radiante de luz visible 40. Sin pretender estar limitados por la teoría, se cree que la cantidad de luz visible 40 es muy pequeña, y no es percibida conscientemente por el observador, pero es detectada por la corteza visual. Por lo tanto, las partículas 12 realizan una función óptica que oscurece las imperfecciones de la piel y reduce la percepción visual de las imperfecciones de la piel.

10 Las partículas AO de la presente invención están encapsuladas en una cubierta transparente o translúcida de APV reticulado. Las intensidades de fluorescencia de las partículas encapsuladas son más del doble que las de las correspondientes partículas no encapsuladas. Sin desear estar limitados por ninguna teoría, se cree que la cubierta de APV actúa como una lente difusora para aumentar el patrón de difusión efectivo de la luz visible 40, que reduce adicionalmente la percepción visual de imperfecciones de la piel independientemente de la configuración de la superficie de la piel 14. Otra teoría no limitante es que la encapsulación de APV actúa como una lente para concentrar la luz UV incidente, 15 y por lo tanto, aumentar la fluorescencia. La cubierta de APV usada en la presente invención supera los problemas asociados con las anteriores cubiertas de polioximetileno urea, y mejora la eficacia de las partículas AO.

20 Consecuentemente, la presente invención proporciona partículas activadas ópticamente para su uso en composiciones aplicadas por vía tópica, en la que las partículas activadas ópticamente son capaces de absorber la energía de la luz a una longitud de onda de, (por ejemplo, aproximadamente 350 nm), y emitir y difundir luz a diferentes longitudes de onda visible (es decir, liberan energía en forma de luz desde aproximadamente 400 hasta aproximadamente 450 nm) con objeto de reducir el aspecto y la percepción visual de imperfecciones de la piel, incluyendo sombras, discromías de la piel, arrugas y celulitis, cuando se aplica a la superficie de la piel. Las partículas AO también ayudan a oscurecer la piel subyacente a las partículas.

25 Las partículas activadas ópticamente pueden usarse en diversas composiciones cosméticas, tales como, pero no limitadas, lociones para la piel, cremas, champús para el cabello, enjuagues corporales, geles del baño, agentes limpiadores de la piel, acondicionadores para el cabello, composiciones colorantes de la piel, colorantes del cabello, líquidos y polvos de base de maquillaje (comprimidos o sueltos), pastas de dientes, enjuagues orales, medicamentos 30 tópicos y productos para el tratamiento de la piel.

Puedan realizarse muchas modificaciones y variaciones de la invención según se ha indicado anteriormente sin desviarse del espíritu y el ámbito de la misma. Por lo tanto, sólo deberían imponerse tales limitaciones según se indica mediante las reivindicaciones anexas.

35

40

45

50

55

60

65

REIVINDICACIONES

1. Una partícula activada ópticamente que comprende

(a) un sustrato sólido

(b) un compuesto fluorescente fijado sobre el sustrato sólido; y

(c) una cubierta de alcohol polivinílico reticulado que recubre el sustrato sólido y el compuesto fluorescente.

2. La partícula de la reivindicación 1, en la que el sustrato sólido comprende un sustrato polimérico sintético, un material polimérico natural, una sal insoluble, un mineral o una mezcla de los mismos.

3. La partícula de la reivindicación 2 en la que el sustrato sólido comprende un sustrato polimérico sintético elegido del grupo constituido por una poliamida, un poliacetato, un poliéster, un poliacrílico, un polietileno, un polipropileno, un rayón, un cloruro de polivinilo y mezclas de los mismos.

4. La partícula de la reivindicación 2 en la que el sustrato sólido comprende un material polimérico natural elegido del grupo constituido por celulosa, celulosa regenerada, almidón, una celulosa microcristalina y mezclas de los mismos.

5. La partícula de la reivindicación 1 en la que el sustrato sólido tiene un tamaño medio de partícula desde aproximadamente 0,1 hasta aproximadamente 50 micrómetros de diámetro.

6. La partícula de la reivindicación 1 en la que el sustrato sólido tiene un tamaño medio de partícula desde aproximadamente 2 hasta aproximadamente 15 micrómetros de diámetro.

7. La partícula de la reivindicación 1 en la que el sustrato, sólido o hueco, es una esfera, un cubo, un cilindro, un tetraedro, un romboide, una placa o tiene una forma irregular.

8. La partícula de la reivindicación 1 en la que el sustrato es un sustrato dilatado con un disolvente, comprendiendo dicho disolvente un alcohol, diol, polioliol, o mezclas de los mismos.

9. La partícula de la reivindicación 1 en la que el compuesto fluorescente está presente en una cantidad desde aproximadamente el 0,01% hasta aproximadamente el 1%, en peso del sustrato sólido.

10. La partícula de la reivindicación 1 en la que el compuesto fluorescente está presente en una cantidad desde aproximadamente el 0,05% hasta aproximadamente el 0,5%, en peso del sustrato sólido.

11. La partícula de la reivindicación 1 en la que el compuesto fluorescente se elige del grupo constituido por un ácido 4,4'-diaminoestilbeno-2,2'-disulfónico, un 2-(estilben-4-il)naftotriazol, un 2-(4-fenilestilben-4-il)benzoxazol, un bis(azol-2-il)estilbeno, un 1,4-bis(estiril)benzeno, un 4,4'-bis(estiril)bifenilo, una 1,3-difenil-2-pirazolina, un bis(benzoxazol-2-il), un bis(bencimidazol-2-il), un 2-(benzofuran-2-il)bencimidazol, una cumarina, un carboestirilo, una naftalimida, un piridotriazol cuaternizado, un compuesto de pireno, un 3,7-diaminodibenzotiofeno-2,8-ácido disulfónico-5,5-dióxido, y mezclas de los mismos.

12. La partícula de la reivindicación 1 en la que el alcohol polivinílico reticulado está hidrolizado en aproximadamente del 70% al 100%.

13. La partícula de la reivindicación 1 en la que el alcohol polivinílico reticulado está presente en una cantidad desde aproximadamente el 0,01% hasta aproximadamente el 25%, en peso de la partícula.

14. La partícula de la reivindicación 1 en la que el alcohol polivinílico reticulado está reticulado por un aldehído multifuncional.

15. Una composición aplicada por vía tópica que comprende partículas activadas ópticamente de la reivindicación 1.

16. La composición de la reivindicación 15 en la que la composición es un líquido que comprende desde aproximadamente el 0,5% hasta aproximadamente el 20% de las partículas activadas ópticamente, en peso de la composición.

17. La composición de la reivindicación 15 en la que la composición es un sólido que comprende desde aproximadamente el 0,5% hasta aproximadamente el 50% de las partículas activadas ópticamente, en peso de la composición.

18. La composición de la reivindicación 15 elegida del grupo constituido por una loción para la piel, una crema, un champú para el cabello, un enjuague corporal, un gel del baño, un agente limpiador de la piel, un acondicionador para el cabello, una composición colorante de la piel, un colorante para el cabello, un líquido de base de maquillaje,

ES 2 280 776 T3

un polvo de base de maquillaje, una pasta de dientes, un enjuague oral, un medicamento tópico y un tratamiento para la piel.

5 19. Un procedimiento para reducir una percepción visual de imperfecciones de la piel que comprende aplicar por vía tópica partículas activadas ópticamente de la reivindicación 1 sobre la piel humana.

20. El procedimiento de la reivindicación 19 en el que la imperfección de la piel se elige del grupo constituido por arrugas, celulitis, discromías de la piel, sombras, poros, señales, venas varicosas, folículos y manchas.

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

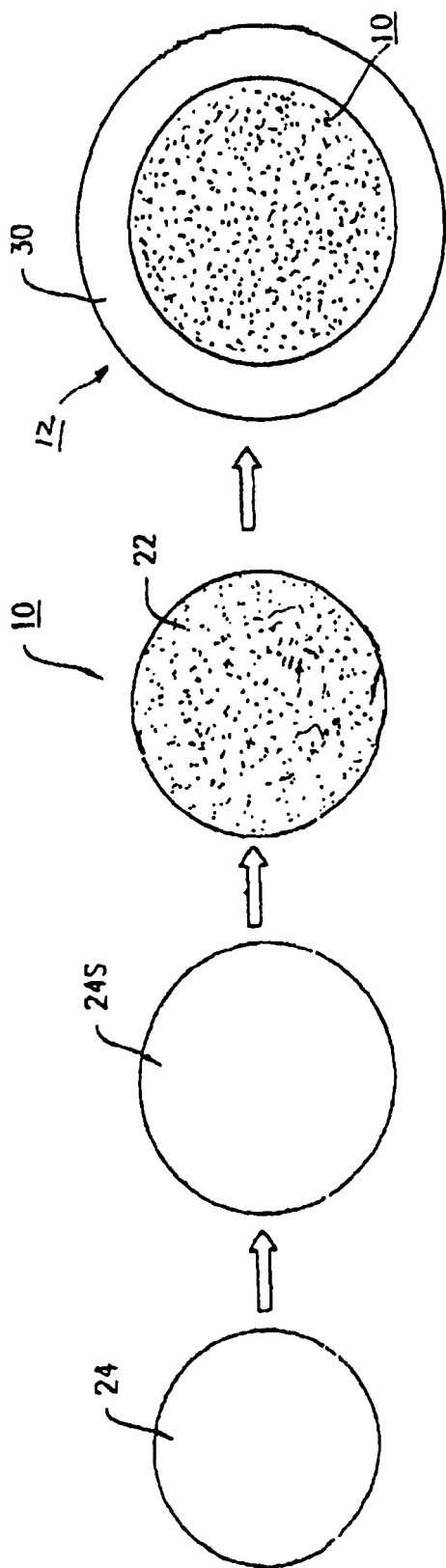


FIG. 1

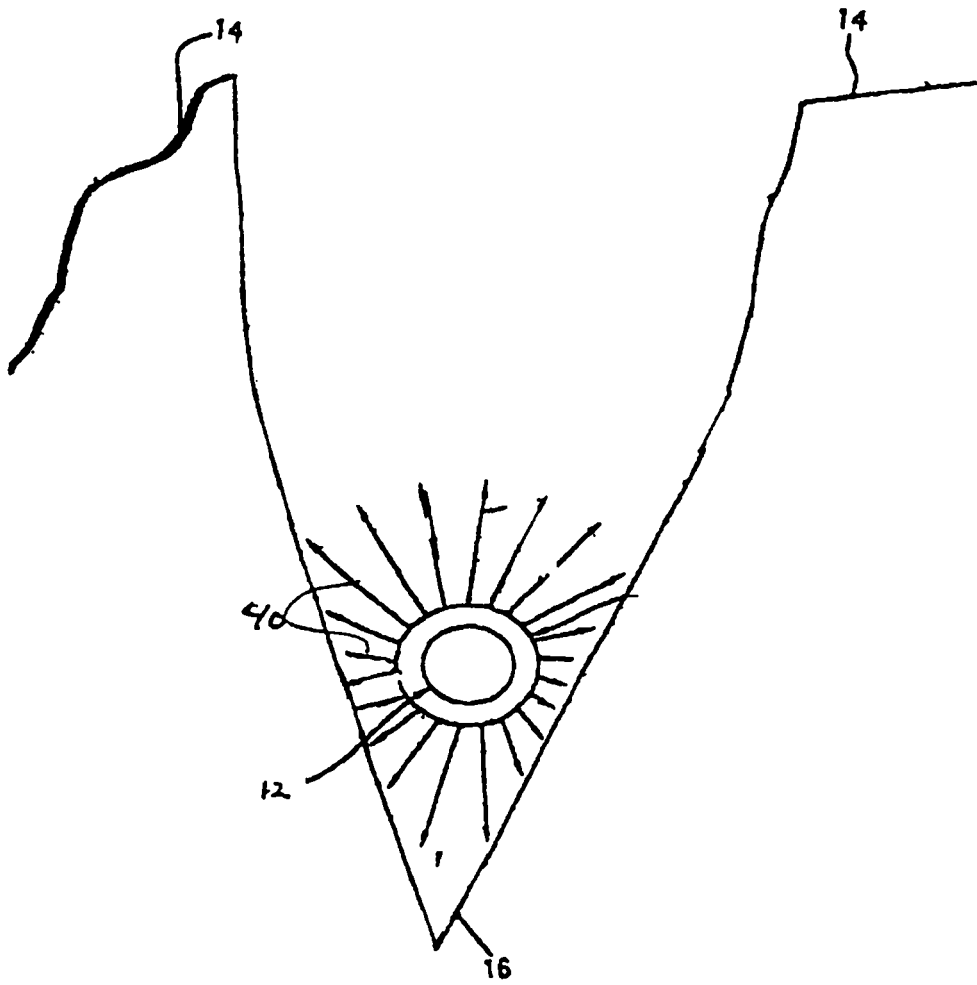


FIG. 2

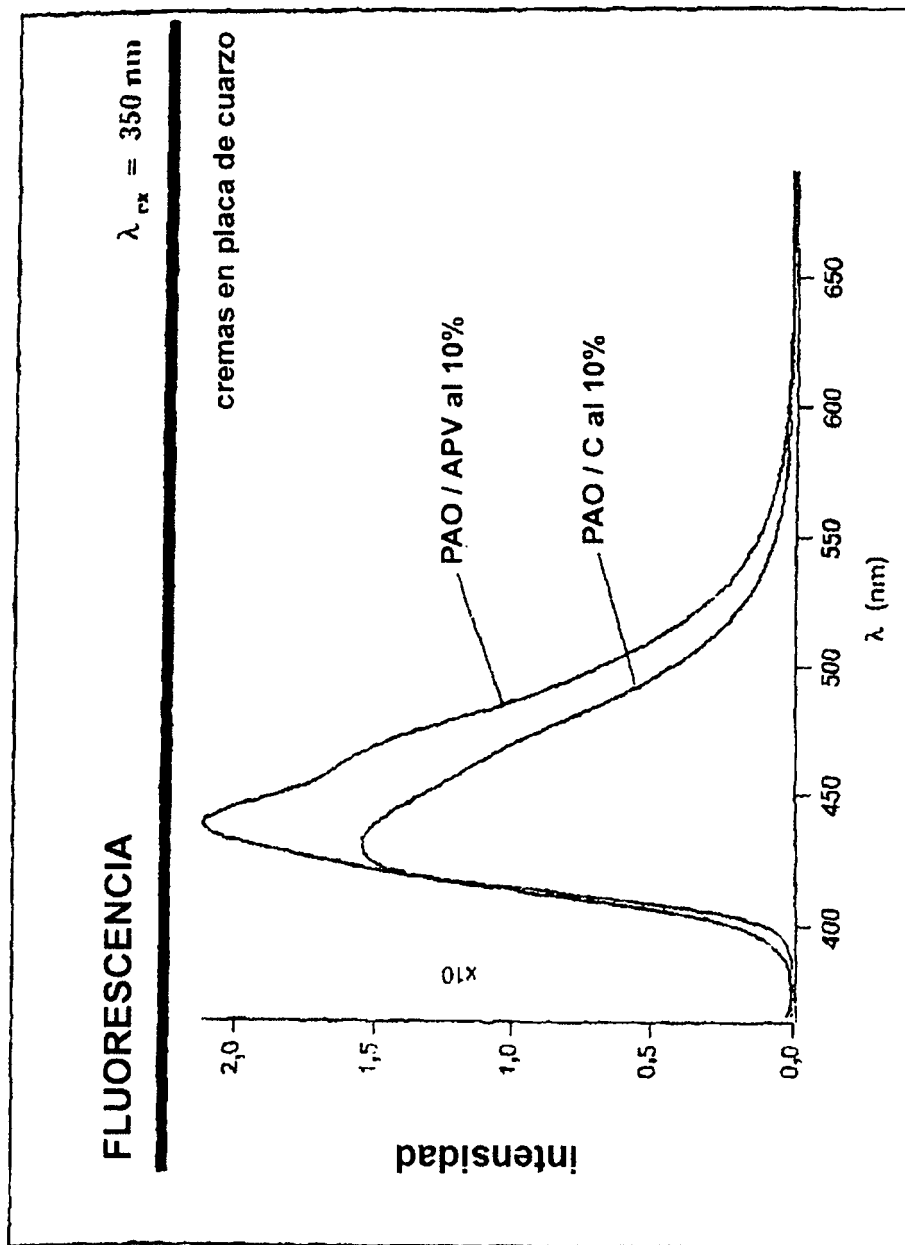


FIG. 3