



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 299 443**

51 Int. Cl.:

A61K 8/00 (2006.01)

A61K 8/02 (2006.01)

A61K 8/19 (2006.01)

A61K 8/30 (2006.01)

A61K 8/72 (2006.01)

A61Q 15/00 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

C08G 63/00 (2006.01)

C07C 69/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **00989715 .8**

86 Fecha de presentación : **26.10.2000**

87 Número de publicación de la solicitud: **1235548**

87 Fecha de publicación de la solicitud: **04.09.2002**

54 Título: **Formulaciones transparentes que contienen diésteres de ácido naftalendicarboxílico.**

30 Prioridad: **30.11.1999 US 451974**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.06.2008

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.06.2008

73 Titular/es: **Symrise GmbH & Co. KG.**
Mühlenfeldstrasse 1
37603 Holzminden, DE

72 Inventor/es: **Bonda, Craig, A.;**
Marinelli, Peter, J.;
Hessefort, Yin, Z.;
Trivedi, Jagdish y
Wentworth, Gary

74 Agente: **Curell Suñol, Marcelino**

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

Formulaciones transparentes que contienen diésteres de ácido naftalendicarboxílico.

5 **Campo de la invención**

La presente invención se refiere a formulaciones cosméticas transparentes o claras y a sus procedimientos de fabricación. En la forma de realización preferida, las formulaciones incluyen tanto la fase oleosa como la fase acuosa emulsionadas juntas para formar una emulsión aceite en agua o una emulsión agua en aceite. Más particularmente, la presente invención se refiere a formulaciones cosméticas claras o transparentes que incluyen un diéster de ácido naftalendicarboxílico que se añade durante la fabricación de una formulación cosmética para aumentar el índice de refracción de la fase oleosa para que se aproxime más al índice de refracción de la fase acuosa de forma que cuando las dos fases se mezclen y emulsionen, la formulación sea clara o transparente. Además de aumentar el índice de refracción de las composiciones, el diéster de ácido naftalendicarboxílico aumentará la emoliencia y el factor de protección de pantalla solar (SPF) de la formulación cosmética.

Antecedentes de la invención y técnica anterior

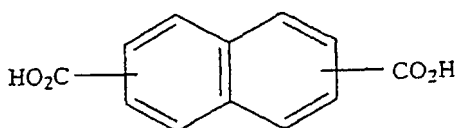
Las formulaciones cosméticas claras o transparentes se desean particularmente porque el consumidor prefiere la transparencia a la pureza y porque las formulaciones transparentes poseen un aspecto estético. Algunas veces ha sido difícil mantener las formulaciones cosméticas claras estables y transparentes, pero se han desarrollado en cada una de las áreas siguientes: productos con bola móvil y geles transparentes para productos contra el sudor; activadores de rizo en gel transparente (humectantes de cabello con niveles relativamente elevados de polioles); barras cosméticas transparentes, incluyendo barras de desodorante y barras de productos contra el sudor transparentes; soluciones transparentes; aceites bronceadores transparentes; soluciones de administración de fármacos transdérmicos transparentes, por ejemplo, soluciones de benzocaína transparentes; composiciones para después del afeitado transparentes; dentífricos de gel transparentes; y barras de labios transparentes. Según los principios de la presente invención, los diésteres y poliésteres de ácidos naftalendicarboxílicos particulares se pueden incluir en todas las formulaciones cosméticas mencionadas anteriormente para aumentar el índice de refracción, proporcionando de este modo formulaciones transparentes, en forma de emulsiones o de composiciones anhidras, mientras se proporciona protección de pantalla solar al área del cuerpo recubierta con la formulación cosmética.

Sumario de la invención

En resumen, la presente invención se refiere a formulaciones cosméticas que incluyen uno o más emolientes y/o acondicionadores de la piel, tales como fluido de silicona, en la que las composiciones cosméticas son útiles como productos contra el sudor, desodorantes, emolientes, humectantes, aceites bronceadores, composiciones para después del afeitado, composiciones de fármacos transdérmicos y similares. En la forma de realización preferida, las formulaciones cosméticas comprenden una emulsión de una fase oleosa y de una fase acuosa; en las que la fase acuosa incluye un emoliente, humectante u otro componente orgánico que aumenta el índice de refracción de la fase acuosa y la fase oleosa incluye una cantidad suficiente de diésteres particulares de ácidos naftalendicarboxílicos para proporcionar la fase oleosa y la fase acuosa de las formulaciones cosméticas con aproximadamente el mismo índice de refracción, de forma que las formulaciones cosméticas son transparentes, o claras, según las percibe el ojo humano. En otras formas de realización, las formulaciones cosméticas claras pueden ser anhidras, o incluir sólo una fase oleosa, con agentes espesantes tales como una o más arcillas, por ejemplo, hectorita o laponita, de forma que no se requieran agentes emulsionantes, pero la composición incluye uno o más de los diésteres particulares de un ácido naftalendicarboxílico para la emoliencia y la transparencia.

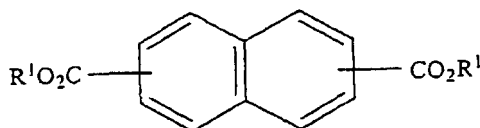
Los diésteres de un ácido naftalendicarboxílico de la presente invención poseen un índice de refracción elevado de por lo menos aproximadamente 1,5, preferentemente aproximadamente 1,53, y se añaden a la fase oleosa de una emulsión aceite y agua para proporcionar transparencia y emoliencia a la emulsión, particularmente para las formulaciones cosméticas. Los ésteres son productos de reacción de:

(a) un ácido naftalendicarboxílico que posee la estructura:



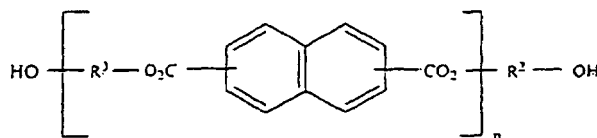
y (b) un alcohol que posee la estructura R^1-OH , o un diol que posee la estructura $HO-R^2-OH$, o un poliglicol que posee la estructura $HO-R^3-(-O-R^2)_m-OH$, en la que R^1 es un grupo alquilo, de cadena lineal o ramificada, que posee de 1 a 22 átomos de carbono, R^2 y R^3 , iguales o diferentes, son cada uno un grupo alquileo, que posee de 1 a 6 átomos de carbono, y en la que m y n son cada una de 1 a aproximadamente 100, preferentemente de 1 a aproximadamente 10, más preferentemente de 2 a aproximadamente 7, o una mezcla de las mismas.

Un diéster de la presente invención posee la estructura:



en la que R^1 es según se ha definido anteriormente.

Los diésteres de ácidos naftalendicarboxílicos poseen la fórmula general (I):



(I)

en la que R^2 y R^3 , iguales o diferentes, son cada uno un grupo alquileo que posee de 1 a 6 átomos de carbono, y $n = 1$.

De forma alternativa, los diésteres de la presente invención se pueden bloquear en los extremos con un alcohol o un ácido.

Los diésteres preferidos de la presente invención poseen un peso molecular promedio en peso de aproximadamente 244 a aproximadamente 4000, y más preferentemente de aproximadamente 450 a aproximadamente 1500. Para conseguir la ventaja total de la presente invención, el diéster posee un peso molecular promedio en peso de aproximadamente 500 a aproximadamente 1000.

El ácido naftalendicarboxílico se selecciona de entre el grupo que consiste en ácido 1,2-naftalendicarboxílico; ácido 1,3-naftalendicarboxílico; ácido 1,4-naftalendicarboxílico; ácido 1,5-naftalendicarboxílico; ácido 1,6-naftalendicarboxílico; ácido 1,7-naftalendicarboxílico; ácido 1,8-naftalendicarboxílico; ácido 2,3-naftalendicarboxílico; ácido 2,6-naftalendicarboxílico; ácido 2,7-naftalendicarboxílico, y mezclas de los mismos. Los ácidos dicarboxílicos preferidos son los ácidos 2,6-, 1,5- y 1,8-naftalendicarboxílicos.

El alcohol $\text{R}^1\text{-OH}$ puede ser, por ejemplo, metanol, etanol, propanol, alcohol isopropílico, n-butanol, sec-butanol, alcohol isobutílico, alcohol terc-butílico, alcohol amílico, 1-hexanol, 1-octanol, 1-decanol, alcohol isodecílico, 1-undecanol, 1-dodecanol, alcohol 1-tridecílico, 1-tetradecanol, 1-hexadecanol, 1-octadecanol, 1-eicosanol, 1-decosanol, alcohol 2-etilhexílico, 2-butiloctanol, 2-butildecanol, 2-hexildecanol, 2-octildecanol, 2-hexildodecanol, 2-octildodecanol, 2-deciltetradecanol y mezclas de los mismos.

El glicol o poliglicol pueden ser, por ejemplo, etilenglicol, propilenglicol, 1,2-propanodiol, dietilenglicol, trietilenglicol, tetraetilenglicol, dipropilenglicol, tripropilenglicol, metilpropanodiol, 1,6-hexanodiol, 1,3-butanodiol, 1,4-butanodiol, PEG-4 por medio de PEG-100, PPG-9 por medio de PPG-34, pentilenglicol, neopentilglicol, trimetilpropanodiol, 1,4-ciclohexanodimetanol, 2,2-dimetil-1,3-propanodiol, 2,2,4,4-tetrametil-1,3-ciclobutanodiol y mezclas de los mismos.

De forma sorprendente, se ha encontrado que estos diésteres de ácidos naftalendicarboxílicos son bastante eficaces para formular formulaciones cosméticas claras o transparentes, que poseen una emoliencia incrementada y para proporcionar protección solar UV a la piel.

En consecuencia, un aspecto de la presente invención es proporcionar una composición de pantalla solar estable que incluye un diéster de uno o más ácidos naftalendicarboxílicos como medio para elevar el índice de refracción y aumentar la emoliencia de una formulación cosmética, poseyendo dicho diéster de ácido naftalendicarboxílico la fórmula (I) o (II), siendo capaz asimismo de estabilizar un filtro UV-A derivado de dibenzoilmetano, particularmente PARSOL[®] 1789, si la protección solar es un objetivo, por ejemplo, en una formulación de pantabios.

Otro aspecto de la presente invención es proporcionar una composición de pantalla solar estable, mejorada, que contiene un diéster de un ácido naftalendicarboxílico que aumenta la eficacia de los compuestos de pantalla solar derivados de dibenzoilmetano, particularmente 4-(1,1-dimetiletil)-4-metoxidibenzoilmetano (PARSOL[®] 1789) en SPF y en duración.

El anterior y otros aspectos y ventajas de la presente invención se pondrán más claramente de manifiesto a partir de la descripción detallada siguiente de las formas de realización preferidas.

Descripción detallada de las formas de realización preferidas

Las formulaciones cosméticas transparentes de la presente invención incluyen de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 20%, preferentemente de aproximadamente 1% a aproximadamente 10% en peso de un diéster de un ácido naftalendicarboxílico, tal como se indica en la reivindicación 1.

Las formulaciones típicas que deberían ser transparentes son como sigue, presentando suficiente diéster de un ácido naftalendicarboxílico para proporcionar transparencia y emoliencia incrementada. En formulaciones que incluyen fases emulsionadas oleosa y acuosa, se añaden uno o más de un diéster de un ácido naftalendicarboxílico a la fase oleosa en una cantidad suficiente de forma que las fases oleosa y acuosa presentan un índice de refracción de aproximadamente 0,1, preferentemente de aproximadamente 0,05, más preferentemente de aproximadamente 0,01. En algunos casos, es necesario añadir un material orgánico o inorgánico soluble en agua, por ejemplo, propilenglicol, a la fase acuosa para aumentar el índice de refracción de la fase acuosa para que coincida con el índice de refracción de la fase oleosa.

Una aproximación diferente para hacer transparentes los productos contra el sudor en gel es el siguiente:

Producto contra el sudor en gel firme transparente

Fase oleosa A:	Función	%
Procetyl 10 (Croda PPG 10 Cetyl Ether)	agente acondicionador de piel, emoliente	4,0
Dow Corning 344 Fluid (ciclometicona)	agente acondicionador de piel, emoliente	20,0
Procetyl AWS (Croda PPG 5-Ceteth 20)	tensioactivo	16,0
Naftalato de dietilhexilo	agente incrementador de índice de refracción, emoliente	14,0
Fase acuosa B:		
Clorhidrato de aluminio, 50% ac.	compuesto contra el sudor activo	46,0

La ligera modificación del sistema anterior puede convertirlo para ser utilizado como un vehículo para “activos” más que para sales de aluminio contra el sudor. Una de dichas bases es esta microemulsión (agua-en-silicona) con propiedades estéticas excelentes:

Microemulsión emoliente

Fase oleosa A:	Función	%
Procetyl A WS (Croda PPG 5-Cetareth 20)	tensioactivo	25
Procetyl 10 (Croda PPG 10-Cetyl Ether)	agente acondicionador de la piel, emoliente	5
Naftalato de dietilhexilo	agente incrementador de índice de refracción, emoliente	14
Dow Corning 344 Fluid (ciclometicona)	agente acondicionador de la piel, emoliente	25
Fase acuosa B:		
Agua		31

ES 2 299 443 T3

Gel emoliente anhidro

		Función	%
5	Naftalato de dietilhexilo	agente incrementador de índice de refracción, emoliente	46
10	Dow Corning 345 Fluid (ciclometicona)	agente acondicionador de la piel, emoliente	25
	Laponita OP2 (LaPorte)	agente incrementador de viscosidad	20
15	Etanol SD 40 (anhid.)	vehículo, disolvente	9

Aceite bronceador solar

		Función	%
20	Dow Corning X2-1401 Fluid (dimeticona en ciclometicona)	agente acondicionador de la piel, emoliente	20
25	Dow Corning 344 Fluid (tetramero de ciclometicona)	agente acondicionador de la piel, emoliente	40
30	Dow Corning 345 Fluid (pentamero de ciclometicona)	agente acondicionador de la piel, emoliente	16
35	Adipato de diisopropilo	agente acondicionador de la piel, emoliente	10
	Naftalato de dietilhexilo	agente incrementador del índice de refracción, emoliente	10
40	Escalol 507 (octildimetil PABA)	agente de pantalla solar activo	4

Ciclometicona para después del afeitado

		Función	%
50	Alcohol SD 39C (anhid.)	disolvente, vehículo	35
55	Naftalato de dietilhexilo	Agente incrementador del índice de refracción, emoliente	50
	Pantenol (Roche)	emoliente	10
60	Fragancia		5

Procedimiento de fabricación: añadir en último lugar la ciclometicona, lentamente, después de la premezcla de los otros ingredientes. Dejar reposar 72 horas antes de filtrar.

65 Como ejemplo de composición transparente contra el sudor con bola móvil que de hecho se ha reducido a la práctica, en el que la fase oleosa y la fase acuosa poseen exactamente el mismo índice de refracción, la composición siguiente, que posee 2% en peso de naftalato de dietilhexilo proporciona una excelente transparencia y emolencia.

PRODUCTO CONTRA EL SUDOR DE BOLA MOVIBLE TRANSPARENTE

Fase oleosa (índice de refracción = 1,4078) A:			
Nombre químico	Denominación comercial	Función	% peso/peso
A. Decametilpentaciclometicona	DC 345 (Dow Corning)	agente incrementador del índice de refracción, emoliente	11,00
A. Naftalato de dietilhexilo	HallBrite TQ (C. P. Hall)	agente incrementador del índice de refracción, emoliente	2,00
A. Dimeticona 100 cps	SF-96-100 (GE Silicones)	agente acondicionador de la piel, emoliente	4,00
A. Copoliol de ciclometicona	DC 3225C (Dow Corning)	agente acondicionador de la piel, emoliente	12,00

Fase acuosa (índice de refracción = 1,407) B:			
Nombre químico	Denominación comercial	Función	% peso/peso
B. Al Zr tetraclorhidrex-gly	35B X3 43% ac (Westchlor)	Compuesto contra el sudor activo	47,00
B. Metilpropilenglicol	MPDiol (Arco)	Humectante	13,50
B. Agua desionizada		Vehículo	10,50

Procedimiento:

1. Mezclar ingredientes "A". Medir el índice de refracción de la fase oleosa.
2. Mezclar ingredientes "B". Medir el índice de refracción de la fase acuosa.
3. Ajustar el índice de refracción de la fase acuosa mediante la adición de agua (índice de refracción bajo) o metilpropilenglicol (elevado) para igualarlo al índice de refracción de la fase oleosa.
4. Añadir una pequeña porción de la fase acuosa a la fase oleosa con agitación baja.
5. Ir añadiendo pequeñas porciones de fase acuosa hasta completarla, aumentando gradualmente la cizalladura.

REIVINDICACIONES

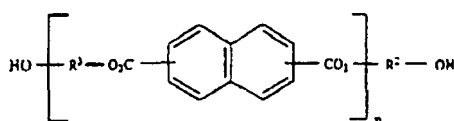
1. Composición transparente,

(a) que incluye una fase oleosa y una fase acuosa emulsionadas juntas para formar una emulsión aceite y agua transparente, o

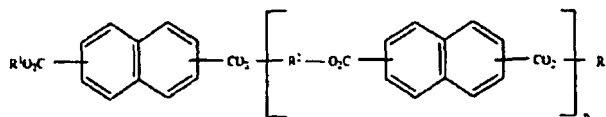
(b) que incluye sólo una fase oleosa,

incluyendo la composición un vehículo seleccionado de entre el grupo que consiste en agua, un compuesto orgánico y mezclas de los mismos,

comprendiendo la composición de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 20% en peso de un diéster de un ácido naftalendicarboxílico seleccionado de entre el grupo que consiste en la fórmula (I) y en la fórmula (II) y mezclas de los mismos:



(I)



(II)

en las que cada R^1 , igual o diferente, se selecciona de entre el grupo que consiste en un grupo alquilo que posee de 1 a 22 átomos de carbono; un diol que posee la estructura $\text{HO}-\text{R}^2-\text{OH}$; y un poliglicol que posee la estructura $\text{HO}-\text{R}^3-(\text{O}-\text{R}^2)_m-\text{OH}$, en las que R^2 y R^3 , iguales o diferentes, son cada uno un grupo alquileno, de cadena lineal o ramificada, que poseen de 1 a 6 átomos de carbono, y en las que $n = 1$ y m está comprendido entre 1 y aproximadamente 100, o una mezcla de los mismos.

2. Composición según la reivindicación 1, en la que la composición incluye además un derivado de dibenzoilmetano, y la proporción molar entre dicho compuesto que posee la fórmula (I) o (II) y dicho derivado de dibenzoilmetano es de aproximadamente 0,1:1 a aproximadamente 10:1.

3. Composición según la reivindicación 1, en la que la proporción molar entre dicho compuesto que posee la fórmula (I) o (II) y dicho derivado de dibenzoilmetano es de aproximadamente 0,1:1 a aproximadamente 0,3:1.

4. Composición según la reivindicación 3, en la que el derivado de dibenzoilmetano es 4-(1,1-dimetil-4'-metoxidibenzoil)metano.

5. Composición según la reivindicación 4, en la que el derivado de dibenzoilmetano se incluye en la composición en una cantidad de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 5% en peso de la composición.

6. Composición según la reivindicación 1, en la que el vehículo cosméticamente aceptable comprende un fluido de silicona en una cantidad de aproximadamente 1% a aproximadamente 20% en peso de la composición.

7. Procedimiento para la aplicación de una composición cosmética sobre la piel humana, que comprende la aplicación tópica a dicha piel de una composición según la reivindicación 1.

8. Procedimiento según la reivindicación 7, en el que la composición cosmética incluye un compuesto contra el sudor activo en una cantidad eficaz.

9. Procedimiento según la reivindicación 8, en el que el compuesto contra el sudor es clorhidrato de aluminio.

10. Procedimiento según la reivindicación 7, en el que la composición incluye un emoliente en una cantidad de aproximadamente 1% a aproximadamente 50% de la composición.

ES 2 299 443 T3

11. Procedimiento según la reivindicación 7, en el que el vehículo cosméticamente aceptable comprende un fluido de silicona en una cantidad de aproximadamente 1% a aproximadamente 20% en peso de la composición.

5 12. Utilización de un diéster de un ácido naftalendicarboxílico seleccionado de entre el grupo que consiste en la fórmula (I) y la fórmula (II) según se han definido en la reivindicación 1, para hacer transparente una formulación cosmética que incluye una fase oleosa y una fase acuosa emulsionadas juntas.

10 13. Utilización de un diéster de un ácido naftalendicarboxílico seleccionado de entre el grupo que consiste en la fórmula (I) y la fórmula (II) según se han definido en la reivindicación 1, para aumentar el índice de refracción de una formulación cosmética adecuada para la preparación de composiciones cosméticas claras o transparentes.

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65