



MINISTERO DELLO SVILUPPO ECONOMICO
DIREZIONE GENERALE PER LA LOTTA ALLA CONTRAFFAZIONE
UFFICIO ITALIANO BREVETTI E MARCHI

DOMANDA DI INVENZIONE NUMERO	102019000004877
Data Deposito	01/04/2019
Data Pubblicazione	01/10/2020

Classifiche IPC

Sezione	Classe	Sottoclasse	Gruppo	Sottogruppo
A	61	K	8	14

Sezione	Classe	Sottoclasse	Gruppo	Sottogruppo
A	61	K	8	55

Sezione	Classe	Sottoclasse	Gruppo	Sottogruppo
A	61	K	8	37

Sezione	Classe	Sottoclasse	Gruppo	Sottogruppo
A	61	K	9	127

Sezione	Classe	Sottoclasse	Gruppo	Sottogruppo
A	61	K	8	02

Titolo

PROCESSO DI PREPARAZIONE DI SISTEMI COLLOIDALI CONCENTRATI

11451M Descrizione del brevetto per invenzione industriale avente per titolo:

FM/mc **“PROCESSO DI PREPARAZIONE DI SISTEMI COLLOIDALI
CONCENTRATI”**

a nome : **RES PHARMA INDUSTRIALE s.r.l.**

con sede in: Via Giacomo Leopardi, 10 - 20123 Milano

* * *

La presente invenzione ha per oggetto un processo di preparazione di sistemi colloidali concentrati, che - una volta diluiti in acqua - danno origine a emulsioni istantanee stabili. Queste emulsioni, da sole o arricchite da altri ingredienti, sono utili in campo dermatologico e cosmetico.

Sfondo dell'invenzione

I sistemi colloidali sono costituiti da sostanze che si trovano in uno stato finemente disperso, con dimensioni delle particelle comprese tra 10^{-9} e 10^{-6} m (a metà tra le soluzioni vere, $<10^{-9}$, e le dispersioni eterogenee, $>10^{-6}$).

Le particelle colloidali sono soggette ai moti browniani (rapidi e continui movimenti), mentre le particelle delle sospensioni eterogenee sono soggette soltanto ai moti convettivi e gravitazionali.

Spesso la fase dispersa assume strutture di organizzazione supramolecolare di tipo micellare.

Una delle proprietà caratteristiche che serve a distinguere i sistemi colloidali dalle soluzioni è l'effetto Tyndall: quando un raggio di luce attraversa un liquido puro o una soluzione, questa non viene diffusa lateralmente perché le particelle in soluzione sono troppo piccole, mentre nei sistemi colloidali le dimensioni delle particelle sono in grado di diffonderla, dando origine

all'opalescenza o addirittura all'aspetto torbido.

I sistemi colloidali disperdibili sono da tempo utilizzati come veicoli di sostanze biologicamente attive quali farmaci, agenti cosmetici, proteine, enzimi.

La preparazione e l'impiego di tali sistemi sono descritti in numerosi brevetti e pubblicazioni. Si veda ad esempio EP 349429, EP 2266546 ed EP 2405896.

Data la complessità dei sistemi colloidali, variazioni nel loro processo di preparazione possono determinare significative modifiche alle caratteristiche applicative e funzionali dei sistemi colloidali stessi.

Descrizione dell'invenzione

Si è ora trovato che utilizzando una fase idrofila con basso contenuto di acqua in combinazione con una fase lipofila e fosfolipidi è possibile ottenere in modo vantaggioso sistemi colloidali concentrati che, diluiti in acqua, a freddo e senza consumo di energia, danno origine a emulsioni istantanee e particolarmente stabili con dimensioni delle particelle nell'ordine dei nanometri (50 - 500 nm). I sistemi colloidali così ottenuti stabilizzano le emulsioni/formulazioni cosmetiche e sono facilmente disperdibili in forma di gel a base di acrilati o metacrilati.

Detti sistemi colloidali sono ottenibili secondo l'invenzione per miscelazione di una fase lipofila, una componente fosfolipidica e una fase idrofila comprendente glicerina, acqua ed eventualmente proteine e glicoli, la percentuale in peso dell'acqua sul totale della fase idrofila essendo compresa tra il 10 e il 20%. Preferibilmente, la fase acquosa è costituita da una miscela di

glicerina:acqua in rapporti in peso compresi tra 90:10 e 80:20.

La fase lipofila comprende uno o più componenti scelti fra trigliceride caprilico/caprico, octil palmitato, decil oleato, sorbitan oleato e stearato, isononil isononanoato, isoamil laurato, ottildodecanolo, dicaprilil etere, ceramidi, olio di jojoba, olio di cocco, olio di macadamia, burro di karitè, burro di cacao.

I fosfolipidi sono scelti fra lecitina, lecitina idrogenata o fosfatidilcolina.

Alla fase idrofila possono essere aggiunti glicoli e/o composti attivi per applicazioni cosmetiche, farmaceutiche o dermatologiche. In particolare, si possono ottenere sistemi colloidali e liposomiali utili in cosmetica contenenti nella fase idrofila proteine quali sericina o fibroina.

Secondo il processo dell'invenzione, si prepara una fase A lipofila miscelando gli ingredienti lipofili, scaldando a 40 - 50°C sotto agitazione. A questa fase viene aggiunta la componente fosfolipidica omogeneizzata fino a scomparsa di eventuali aggregati.

Si prepara quindi la fase idrofila B miscelando sotto agitazione glicerina, acqua ed eventualmente glicoli e si aggiunge quindi la fase B alla fase A lasciando in agitazione fino a completa dispersione.

Se desiderato, si aggiungono le proteine (sericina, fibroina) o altri ingredienti attivi e si riscalda fino a 60 - 70°C per poi omogeneizzare sotto vuoto.

Si effettuano un trattamento in omogeneizzatore ad alta pressione.

Nella forma concentrata così ottenuta, il sistema è organizzato in forma micellare con un core oleoso e una fase dispersa idrofila. Nel momento in cui il

sistema viene diluito in acqua si verifica una riorganizzazione della struttura in forma liposomiale (principalmente *small unilamellar vescicles* - SUV - ma anche *median e large unilamellar vescicles* - MUV e LUV -, *multilamellar vescicles* - MLV - e *multivescicular* - MVV).

Questa riorganizzazione avviene spontaneamente senza che vi sia necessità di somministrare energia meccanica o termica.

I sistemi liposomiali ottenuti possono essere formulati in sospensioni, creme, gel, schiume, lozioni eventualmente in combinazione con ingredienti ed eccipienti convenzionali nel settore cosmetico, ad esempio oli, additivi reologici, tensioattivi, umettanti, emollienti, profumi, filtri solari, etc.

Gli esempi seguenti illustrano ulteriormente l'invenzione.

Esempio 1

Si prepara una fase A in cui viene scaldato il trigliceride caprilico/caprico (10 – 25% in peso sul totale del sistema colloidale) a 45°C sotto agitazione. Ad esso si aggiunge lecitina (2 - 10% in peso sul totale del sistema colloidale) e si turboemulsiona sotto vuoto.

Si prepara la fase B miscelando glicerina (90 - 80% in peso) e acqua (10 - 20% in peso).

Si aggiunge la fase B alla fase A e si lascia in agitazione fino a completa dispersione.

A questo punto si aggiunge sericina (0,5 - 5% in peso sul totale del sistema colloidale) e si riscalda fino a 60 - 70°C per poi turboemulsionare a questa temperatura sotto vuoto.

Il prodotto viene quindi omogeneizzato ad alta pressione.

Esempio 2

Si prepara una fase A in cui viene scaldato l'octil palmitato (10 - 25% in peso sul totale del sistema colloidale) a 45°C sotto agitazione. Ad esso si aggiunge lecitina idrogenata (2 - 10% in peso sul totale del sistema colloidale) e si turboemulsiona a sotto vuoto.

Si prepara la fase B miscelando glicerina (80-90% in peso) e acqua (10 - 20% in peso).

Si aggiunge la fase B alla fase A e si lascia in agitazione fino a completa dispersione.

A questo punto si aggiunge sericina (0,5 - 5% in peso sul totale del sistema colloidale) e si riscalda fino a 60 - 70°C per poi turboemulsionare a questa temperatura sotto vuoto.

Il prodotto viene quindi omogeneizzato ad alta pressione.

RIVENDICAZIONI

1. Processo per la preparazione di sistemi colloidali tramite miscelazione di una fase lipofila, una idrofila e una componente fosfolipidica caratterizzato dal fatto che la fase idrofila comprende glicerina, acqua ed eventualmente proteine e glicoli, la percentuale in peso dell'acqua sul totale della fase idrofila essendo compresa tra il 10 e il 20%.
2. Processo secondo la rivendicazione 1 in cui la fase lipofila comprende uno o più componenti scelti fra trigliceride caprilico/caprico, octil palmitato, decil oleato, sorbitan oleato e stearato, isononil isononanoato, isoamil laurato, ottildodecanolo, dicaprilil etere, ceramidi, olio di jojoba, olio di cocco, olio di macadamia, burro di karitè, burro di cacao.
3. Processo secondo la rivendicazione 1 o 2 in cui i fosfolipidi sono scelti fra lecitina, lecitina idrogenata o fosfatidilcolina.
4. Processo secondo una o più delle rivendicazioni da 1 a 3 in cui la fase acquosa è costituita da una miscela di glicerina:acqua in rapporti in peso compresi tra 90:10 e 80:20.
5. Processo secondo una o più delle rivendicazioni da 1 a 4 in cui le proteine sono sericina o fibroina.
6. Processo secondo una o più delle rivendicazioni da 1 a 5 in cui la miscelazione delle fasi viene effettuata per mezzo di un turboemulsore.
7. Sistemi colloidali ottenuti dal processo delle rivendicazioni 1-6.
8. Formulazioni liposomiali ottenute per diluizione in acqua dei sistemi della rivendicazione 7.
9. Formulazioni liposomiali della rivendicazione 8 contenenti fibroina o

sericina.

Milano, 1° aprile 2019