

PATENTE DE INVENCION

COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS Y/O COSMÉTICAS A BASE DE CÚRCUMA

SECTOR TECNOLÓGICO:

La presente invención se encuentra dentro del sector farmacéutico y/o cosmético, específicamente en el relacionado con las composiciones farmacéuticas y/o cosméticas con base en principios activos de origen natural, más específicamente, en donde el ingrediente activo corresponde a una planta o una fracción de la misma; así como el método para producir dichas composiciones.

ANTECEDENTES DE LA INVENCION:

La cúrcuma, *Cúrcuma longa*, es una especie originaria del sudeste asiático. Además de su uso como condimento, contiene sustancias antioxidantes, antimicrobianas y colorantes, como la curcumina. La importancia de esta planta deriva principalmente del uso de sus rizomas. Su uso en la medicina tradicional oriental está registrado como analgésico, estimulante, expectorante, carminativo, antihelmíntico, anti inflamatorio y dermatológico.

En esfuerzos de disponer la cúrcuma en composiciones farmacéuticas, el documento de patente GB2094144 da a conocer una composición para tratar el cabello y la piel que contiene al menos una sustancia vegetal pulverizada y un agente cohesivo. La composición corresponde a un emplasto, con dificultades en la formulación del principio activo relacionados con la naturaleza y tamaño de partícula del mismo, así como problemas asociados con la preservación. De igual manera, se presentan dificultades en la aplicación de la composición en razón al tamaño de partícula del activo.

El documento US20060110415 da a conocer composiciones tópicas que contienen ésteres de hidroxí ácidos y su aplicación en la liberación de penetración profunda de



agentes cosméticos y farmacéuticos. Estas composiciones comprenden uno de los principios activos presentes en la cúrcuma, esto es, la curcumina, sin que solucione la manera de integrar la planta directamente a composiciones farmacéuticas y/o cosméticas.

De igual manera, la publicación de patente WO2010011093 divulga una composición que comprende curcumina útil en el tratamiento postquirúrgico de colgajos. En estas composiciones tampoco se integra la planta directamente a composiciones farmacéuticas y/o cosméticas.

Teniendo en cuenta las dificultades en la formulación del material vegetal de la cúrcuma se prefiere el empleo de la curcumina en lugar de la planta como ingrediente activo en las composiciones farmacéuticas y/o cosméticas, tal como ocurre en las solicitudes de patente US20060110415 y WO2010011093.

Teniendo en cuenta que la obtención de curcumina implica la aplicación de procesos complejos y el uso de equipos calificados para tal fin, resulta necesario proporcionar una formulación que permita la incorporación del material vegetal de la cúrcuma en composiciones farmacéuticas y/o cosméticas, así como el método para elaborarlas, de manera que las composiciones sean tanto efectivas, como estables y permitan su fácil administración.

La invención descrita en la presente solicitud tiene por objeto proporcionar composiciones farmacéuticas y/o cosméticas tópicas estables que comprendan cúrcuma, así como el procedimiento para su elaboración; asimismo, proporcionar una composición para la reducción de manchas cutáneas y el mejoramiento del proceso de cicatrización de heridas.

BREVE DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

La presente invención está relacionada con composiciones farmacéuticas y/o cosméticas de aplicación tópica en forma de gel que comprende cúrcuma en su forma



natural, y excipientes; en donde los excipientes son seleccionados de viscosantes, preservantes, formadores de película, vehículos, entre otros. La composición es útil en la reducción de manchas cutáneas y mejoramiento del proceso de cicatrización de la piel.

Asimismo, la presente invención está relacionada con un procedimiento para la obtención de composiciones farmacéuticas y/o cosméticas a base de cúrcuma, que comprende las siguientes etapas:

- a) adicionar una fracción del vehículo en un recipiente;
- b) calentar;
- c) agregar los preservantes;
- d) agitar hasta disolución;
- e) enfriar la mezcla;
- f) adicionar cerca de la mitad del agua;
- g) adicionar el viscosante;
- h) agitar hasta completa dispersión;
- i) dejar la mezcla en reposo;
- j) adicionar otra fracción del vehículo, el formador de película y la cúrcuma;
- k) agitar hasta completa dispersión;
- l) agregar el resto del agua; y
- m) adicionar lentamente trietanolamina

Tanto la composición como el procedimiento para su elaboración dan lugar a composiciones estables a base de cúrcuma en su forma natural, esto es, la planta o una parte de la misma en sí.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION

La presente invención está relacionada con composiciones farmacéuticas y/o cosméticas de aplicación tópica en forma de gel que comprenden cúrcuma en su forma natural y excipientes.



Las partes de la cúrcuma empleadas corresponden a aquellas seleccionadas de las hojas y el rizoma, preferiblemente el rizoma, en donde dicha fracción se incorpora pulverizada a la composición. En la invención la cúrcuma en forma natural está presente entre 0,001% y 20% en peso de la composición, preferiblemente entre 0,01% y 15% en peso de la composición, más preferiblemente entre 0,05% y 10% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,5% y 5% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,7% y 4% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,8% y 1,9% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,8% y 1,5% en peso de la composición.

En una realización de la invención, los excipientes están seleccionados de viscosantes, preservantes, formadores de película, antioxidantes, fragancias, neutralizantes, vitaminas, agentes secuestrantes de radicales libres, vehículos, entre otros y mezclas de los mismos.

Los viscosantes son aquellas sustancias que incrementan viscosidad a la formulación de la invención. En la presente invención, los viscosantes son seleccionados de veegum, glucósidos, sarcosinato de sodio, coco sulfato de sodio, carbómeros, polímeros y copolímeros de acrilato, copolímeros de acrilamida, celulosas, polímeros y copolímeros de N-vinil pirrolidona, polietilen glicoles y trietanolamina, entre otros y mezclas de los mismos. En donde los polímeros y copolímeros de acrilato son seleccionados de carbopol, entre otros. En donde las celulosas son seleccionadas de carboximetil celulosa, hidroxipropil celulosa, hidroxipropil metil celulosa, hidroxietil celulosa, entre otros. En donde los polímeros y copolímeros de N-vinil pirrolidona son seleccionados de polivinil pirrolidona, entre otros. En la invención los viscosantes están presentes entre 0,001% y 20% en peso de la composición, preferiblemente entre 0,01% y 15% en peso de la composición, más preferiblemente entre 0,05% y 10% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,5% y 5% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,7% y 4% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,8% y 1,9% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,8% y 1,5% en peso de la composición.



Los preservantes son aquellas sustancias que contribuyen al control del crecimiento microbiológico de las formulaciones de la invención. En la presente invención, los preservantes son seleccionados de donantes de formaldehído y aquellos que no producen formaldehído. Específicamente, los preservantes son seleccionados de benzoato de sodio, sorbato de potasio, DMDM hidantoina, diazolidinil urea, imidazolidinil urea, quaternium 15, metilisotiazolinona, fenoxietanol, iodo propil butil carbamato y parabenos (ésteres de ácido p-hydroxybenzoico) o mezclas de los mismos. Preferiblemente, los preservantes son seleccionados de benzoato de sodio, sorbato de potasio, DMDM hidantoina, diazolidinil urea, imidazolidinil urea, quaternium 15 y parabenos o mezclas de los mismos. Más preferiblemente los preservantes son seleccionados de benzoato de sodio, sorbato de potasio, DMDM hidantoina y parabenos o mezclas de los mismos. En donde los parabenos son seleccionados de metil parabeno, etil parabeno, propil parabeno, butil parabeno, metil parabeno sódico, etil parabeno sódico, propil parabeno sódico, butil parabeno, entre otros. En la invención los preservantes están presentes entre 0% y 10% en peso de la composición, preferiblemente entre 0,01% y 7% en peso de la composición, más preferiblemente entre 0,05% y 5% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,07% y 2% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,08% y 1,4% en peso de la composición.

Los formadores de película corresponden a polímeros que permiten la formación de película una vez la composición sea aplicada. En la presente invención, los formadores de película son seleccionados de carbómeros, poliacrilatos de alto peso molecular, polioles, polímeros y copolímeros de acrilato y polímeros y copolímeros de N-vinil pirrolidona, entre otros y mezclas de los mismos. En donde los polímeros y copolímeros de acrilato son seleccionados de carbopol, entre otros. En donde los polímeros y copolímeros de N-vinil pirrolidona son seleccionados de polivinil pirrolidona, entre otros. En la invención los formadores de película están presentes entre 0,001% y 20% en peso de la composición, preferiblemente entre 0,01% y 15% en peso de la composición, más preferiblemente entre 0,05% y 10% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,5% y 5% en peso de la composición,



aún más preferiblemente entre 0,7% y 4% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,8% y 1,9% en peso de la composición, aún más preferiblemente entre 0,8% y 1,5% en peso de la composición.

Los vehículos son seleccionados de agua, lecitina, pantenol y alcoholes. En donde los alcoholes son seleccionados de etanol, 1,3-propanodiol, glicerol y propilenglicol, entre otros. En la invención el vehículo está presente una proporción entre 90% y 99%, más preferiblemente entre 92% y 98%, aún más preferiblemente entre 93% y 97%.

En una modalidad preferida de la invención los viscosantes son seleccionados de veegum, glucósidos, sarcosinato de sodio, coco sulfato de sodio, carbómero, carbopol, polivinil pirrolidona y trietanolamina, entre otros y mezclas de los mismos; en donde los glucósidos son seleccionados de decil glucósido y lauril glucósido, entre otros. Preferiblemente, los viscosantes son seleccionados de veegum, glucósidos, sarcosinato de sodio, coco sulfato de sodio, carbopol, polivinil pirrolidona y trietanolamina, entre otros y mezclas de los mismos. Más preferiblemente, la formulación tiene viscosantes seleccionados de carbopol, glucósidos, sarcosinato de sodio, coco sulfato de sodio y trietanolamina y mezclas de los mismos.

En una modalidad preferida de la invención los preservantes son seleccionados de benzoato de sodio, sorbato de potasio, DMDM hidantoina, diazolidinil urea, imidazolidinil urea, quaternium 15, metilisotiazolinona, fenoxietanol, iodo propil butil carbamato, metil parabeno, etil parabeno, propil parabeno, butil parabeno, metil parabeno sódico, etil parabeno sódico, propil parabeno sódico, butil parabeno, entre otros y mezclas de los mismos. Preferiblemente, los preservantes son seleccionados de benzoato de sodio, sorbato de potasio, metil parabeno, etil parabeno, propil parabeno, butil parabeno, metil parabeno sódico, etil parabeno sódico, propil parabeno sódico, butil parabeno, entre otros y mezclas de los mismos.

En una modalidad preferida de la invención, los formadores de película son seleccionados de carbómero, carbopol y polivinil pirrolidona, entre otros y mezclas de los mismos. Preferiblemente, los formadores de película son seleccionados de carbopol



y polivinil pirrolidona, entre otros y mezclas de los mismos. Más preferiblemente, la formulación tiene un formador de película seleccionado de polivinil pirrolidona.

En una modalidad preferida de la invención, los vehículos son seleccionados de agua, etanol, lecitina, pantenol, 1,3-propanodiol, glicerol y propilenglicol, entre otros y mezclas de los mismos. Más preferiblemente, los vehículos son seleccionados de agua, lecitina, pantenol, 1,3-propanodiol, glicerol y propilenglicol, entre otros y mezclas de los mismos.

En una modalidad de la invención, los viscosantes son seleccionados de carbopol, glucósidos, sarcosinato de sodio, coco sulfato de sodio, polivinil pirrolidona y trietanolamina, entre otros y mezclas de los mismos; los preservantes son seleccionados de benzoato de sodio, sorbato de potasio, metil parabeno, etil parabeno, propil parabeno, butil parabeno, metil parabeno sódico, etil parabeno sódico, propil parabeno sódico, butil parabeno, entre otros y mezclas de los mismos; los formadores de película son seleccionados de carbopol y polivinil pirrolidona, entre otros y mezclas de los mismos; los vehículos son seleccionados de agua, lecitina, pantenol, 1,3-propanodiol, glicerol y propilenglicol, entre otros y mezclas de los mismos.

En una modalidad preferida de la invención, los viscosantes son seleccionados de carbopol, glucósidos, sarcosinato de sodio, coco sulfato de sodio y trietanolamina y mezclas de los mismos; los preservantes son seleccionados de benzoato de sodio, sorbato de potasio, metil parabeno y propil parabeno y mezclas de los mismos; los formadores de película son seleccionados de polivinil pirrolidona y, los vehículos son seleccionados de agua, lecitina, pantenol, 1,3-propanodiol, glicerol y propilenglicol y mezclas de los mismos.

En una realización de la invención, la composición farmacéutica y/o cosmética comprende cúrcuma en su forma natural en una proporción entre 0,8% y 1,9% en peso de la composición; viscosantes en una proporción entre 0,8% y 1,9% en peso de la composición; preservantes en una proporción entre 0,07% y 2% en peso de la



composición; formadores de película en una proporción entre 0,8% y 1,9% en peso; y vehículos en cantidad suficiente para completar el 100% de peso de la composición.

En otra realización de la invención, la composición farmacéutica y/o cosmética comprende uno o más filtros solares. El filtro solar es seleccionado de filtros, protectores o bloqueadores solares seleccionados, pero no limitados a aceite de semilla de frambuesa, aceite de semilla de zanahoria o el aceite de germen de trigo, salicilatos, bencimidazoles, benzofenonas, antranilatos, dibenzoilmetanos, dióxido de titanio, óxido de zinc, carbonato de calcio, carbonato de magnesio, óxido de magnesio y cloruro de hierro entre otros. Preferiblemente los filtros, protectores o bloqueadores solares se seleccionan de, sin limitarse a, aceite de semilla de frambuesa, aceite de semilla de zanahoria o el aceite de germen de trigo, oxibenzona, benzofenona, salicilato de octilo, octocrileno, avobenzona y metoxidibenzoilmetano, entre otros y mezclas de los mismos.

En otra realización de la invención, la composición farmacéutica y/o cosmética es libre de preservantes.

En una realización, la presente invención está dirigida a una composición farmacéutica de aplicación tópica en forma de gel.

En una realización, la presente invención está dirigida a una composición cosmética de aplicación tópica en forma de gel.

En una realización, la presente invención corresponde a una composición farmacéutica y/o cosmética de aplicación tópica en forma de gel útil para el tratamiento de problemas dermatológicos.

En una modalidad de la invención la presente invención corresponde a una composición farmacéutica y/o cosmética de aplicación tópica en forma de gel útil para el mejoramiento en la cicatrización de heridas.



En una realización, la presente invención está dirigida a una composición farmacéutica y/o cosmética de aplicación tópica en forma de gel útil para la disminución de manchas cutáneas.

En una realización, la presente invención está dirigida a una composición farmacéutica y/o cosmética de aplicación tópica en forma de gel útil para el tratamiento de pañalitis y/o quemaduras.

En una realización, la presente invención está dirigida a una composición farmacéutica y/o cosmética de aplicación tópica en forma de gel útil para el tratamiento de acné.

La invención también está referida al procedimiento para la elaboración de composiciones farmacéuticas y/o cosméticas que comprenden cúrcuma en forma natural, el cual comprende las siguientes etapas:

- a) Adicionar una fracción del vehículo en un recipiente
- b) Calentar a una temperatura entre 30°C y 80°C, preferiblemente entre 40°C y 70°C, más preferiblemente entre 50°C y 60°C.
- c) Agregar los preservantes
- d) Agitar hasta disolución
- e) Enfriar la mezcla
- f) Adicionar cerca de la mitad del agua
- g) Adicionar el viscosante
- h) Agitar hasta completa dispersión
- i) Dejar la mezcla en reposo
- j) Adicionar otra fracción del vehículo, el formador de película y la cúrcuma en su forma natural; en donde el formador de película se adiciona disuelto en una relación de 1 g de povidona por 30 ml de agua caliente a una temperatura entre 30°C y 80°C, preferiblemente entre 40°C y 70°C, más preferiblemente entre 50°C y 60°C.
- k) Agitar hasta completa dispersión
- l) Agregar el resto del agua



m) Adicionar lentamente trietanolamina

EJEMPLOS

Ejemplo 1

Se elaboró una composición a base de cúrcuma que comprende:

Rizoma de cúrcuma pulverizado 0,9%

Carbopol 0,9%

Propilparabeno 0,1%

Metilparabeno 0,1%

Glicerina 4,5%

Povidona 0,9%

Trietanolamina 0,3%

Propilenglicol 1,8%

Agua c.s.p. 100%

Para la preparación del gel se agregó propilenglicol en un recipiente y se calentó a una temperatura entre 50°C y 60°C. Luego, se agregó al mismo recipiente bajo agitación el propilparabeno y el metilparabeno hasta completa disolución. Después, se dejó enfriar, hasta temperatura ambiente, y se agregó la mitad del agua y el carbopol. Posteriormente, se agitó la mezcla hasta completa dispersión. El polímero en la mezcla se dejó hinchar de un día para otro.

Luego del envejecimiento del polímero se adicionó al recipiente de preparación, la glicerina, la povidona previamente disuelta, en una relación 1 g de povidona por 30 ml de agua caliente entre 50°C y 60°C, y finalmente la cúrcuma; lo anterior bajo agitación continua hasta completa dispersión entre el adicionamiento de cada componente. Posteriormente, se agregó el resto del agua purificada; asimismo, se adicionó lentamente, gota a gota, y con agitación constante la trietanolamina hasta llegar a la viscosidad adecuada. Finalmente, se midió el pH y la viscosidad, para envasar la composición en el envase correspondiente.



Ejemplo 2

La composición obtenida del Ejemplo 1 se almacenó a 25°C aproximadamente y humedad relativa de 55% aproximadamente. Cada mes se realizó revisión de la estabilidad de la composición. En el mes 36 se evidencia que la composición aún se mantiene estable, conservando sus propiedades fisicoquímicas iniciales a pesar de haberse empleado la cúrcuma en forma natural, en lugar del principio activo aislado de la planta.

Ejemplo 3

La composición obtenida del Ejemplo 1 se aplicó sobre la piel. Presentó una sensación suave al tacto.

Aunque algunas modalidades de la invención se describen en la presente descripción, se apreciará que numerosas modificaciones y otras modalidades pueden concebirse por aquellos expertos en la materia con posterioridad a la divulgación de la presente invención. Por ejemplo, las características para las diferentes modalidades pueden usarse en otras modalidades. Por lo tanto, se entenderá que las reivindicaciones anexas pretenden cubrir todas las modificaciones y modalidades que están dentro del espíritu y alcance de la presente descripción.

