



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 367 799**

51 Int. Cl.:

A61K 8/02 (2006.01)

A61K 8/27 (2006.01)

A61K 8/29 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06026516 .2**

96 Fecha de presentación : **21.12.2006**

97 Número de publicación de la solicitud: **1808156**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **18.07.2007**

54 Título: **Preparación protectora de la luz con micropigmentos.**

30 Prioridad: **22.12.2005 DE 10 2005 062 097**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
08.11.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
08.11.2011

73 Titular/es: **STADA ARZNEIMITTEL AG.**
Stadastrasse 2-18
61118 Bad Vilbel, DE

72 Inventor/es: **Rillmann, Thomas;**
Hansen, Peter y
Heppner, Andrea

74 Agente: **De Elzaburu Márquez, Alberto**

ES 2 367 799 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

Preparación protectora de la luz con micropigmentos

La invención se refiere a preparaciones protectoras de la luz con un valor de balance UV-A > 15, que contienen, como sustancias de filtro, exclusivamente micropigmentos inorgánicos.

5 Ya se conoce desde hace mucho tiempo que las porciones ultravioletas de la luz solar provocan daños en la piel. Estos daños pueden ser una simple irritación de la piel, por ejemplo una quemadura solar ligera, pero se pueden manifestar también en daños celulares. Se sabe que sobre todo a través de radiación UV-B (es decir, radiación con una longitud de onda entre 290 nm y 320 nm) se pueden provocar daños DNS, que pueden conducir a mutaciones celulares y, por lo tanto, a cáncer de piel.

10 También se aceleran el envejecimiento precoz de la piel, la formación de arrugas y la relajación del tejido conjuntivo de la piel a través de la luz; responsable de ello es sobre todo la radiación UV-A de onda larga (es decir, radiación de una longitud de onda entre 320 nm y 400 nm).

15 Para la prevención contra tales daños, se han desarrollado en los últimos años medios de protección solar cada vez más efectivos, poniendo la atención sobre todo en la mejora de la protección contra radiación UV-B. La protección contra radiación UV-B se indica en todo el mundo de forma unitaria como "factor de protección de la luz", de forma abreviada LF o SPF, cuya determinación está establecida en muchas normas nacionales. Los medios de protección solar modernos alcanzan un factor de protección de la luz por encima de 390, que se alcanza, en general, por medio de una combinación de diferentes filtros UV orgánicos con micropigmentos reflectantes.

20 La acción de protección de un medio de protección solar contra radiación UV-A ha sido indicada desde hace mucho tiempo de acuerdo con los requerimientos de la norma australiana, que se cumplen cuando un medio de protección solar reduce la transmisión en el intervalo de 320 – 360 nm al menos en un 90 %. La norma australiana no prevé ninguna diferenciación por encima de 90 % de absorción, de manera que manteniendo la norma australiana en productos con factor reducido de protección de la luz, se asegura todavía una protección contra UV-A aceptada, pero con factor de protección creciente, la protección contra UV-A puede paralizarse en el mismo nivel: la protección
25 contra UV-A no se eleva forzosamente con un factor de protección de la luz creciente, que define en último término solamente la acción de protección contra radiación UV-B.

30 Para una mejor caracterización de un medio de protección solar con respecto a su acción de protección contra UV-B y UV-A ha sido introducido el concepto de balance UV-A, que indica la relación entre la capacidad de protección UV-B y la capacidad de protección UV-A de un medio de protección solar. El procedimiento para la determinación del valor de balance UV-A se establece en la norma DIN 67502.

35 Se conocen desde hace mucho tiempo medios de protección solar con micropigmentos como filtros UV inorgánicos. Los micropigmentos actúan distribuidos sobre la piel como espejos pequeños, que reflejan y controlan la radiación UV. Normalmente, los micropigmentos utilizados en medios de protección solar se basan en dióxido de titanio u óxido de cinc. En virtud de su foto reactividad (que puede conducir a una coloración azulada de las formulaciones cosméticas que contienen estos pigmentos), los pigmentos de dióxido de titanio están provistos para la
40 estabilización con preferencia con un recubrimiento superficial hidrófilo o anfífilo. Para evitar un "blanqueo" sobre la piel, se utilizan micropigmentos con un tamaño de partículas lo más pequeño posible. Así, por ejemplo, el tamaño de las partículas de los pigmentos de dióxido de titanio que se pueden obtener en el mercado para aplicaciones cosméticas a partir de la Serie MT de la Firma Tayco, es por ejemplo 15 nm. Algunos fabricantes de micropigmentos ofrecen sus productos en forma de dispersiones acabadas, para asegurar que en el producto final se consiga una distribución fina uniforme del micropigmento, que es necesaria para la acción óptima de protección de la luz. Un tamaño de las partículas que se incrementa, por ejemplo, a través de aglomeración conduce a una reducción considerable de la acción de absorción de UV.

45 Los micropigmentos se emplean en medios de protección solar la mayoría de las veces en combinación con filtros orgánicos de protección de la luz. Los filtros orgánicos de protección de la luz tienen el inconveniente de que pueden conducir a incompatibilidades de la piel, que se observan sobre todo en niños. Los productos conocidos anteriormente, que contienen solamente micropigmentos como filtros de protección de la luz, tienen el inconveniente de valores de balance UV-A reducidos por debajo de 15, con frecuencia por debajo de 10. El inconveniente de estos productos reside en una protección inadecuada en la zona UV-A, en particular en productos con alto factor de
50 protección de la luz UV-B.

Ante estos antecedentes, el problema de la presente invención consiste en indicar preparaciones de protección de la luz con un valor de balance UV-A alto así como con un factor alto de protección de la luz, que se caracterizan por una compatibilidad muy buena con la piel.

Este problema se soluciona porque como sustancias de filtro se emplean micropigmentos con un tamaño medio de

las partículas primarias de al menos 20 nm.

5 Sorprendentemente se ha encontrado que utilizando determinados pigmentos como sustancias de filtro, también sin la utilización de sustancias orgánicas de filtro, se pueden fabricar medios de protección solar, que presentan un factor UV-B alto y al mismo tiempo un valor de balance UV-A alto de al menos 15 hasta más de 40. Los pigmentos utilizados de acuerdo con la invención tienen un tamaño medio de las partículas primarias de al menos 20 nm, con preferencia de 20 a 200 nm, y, por lo demás, no están sometidos a limitaciones de ninguna clase. Así, por ejemplo, se basan en dióxido de titanio u óxido de cinc y presentan recubrimientos superficiales habituales. Especialmente preferidos son pigmentos de dióxido de titanio con un tamaño de las partículas primarias de 10 nm, 15 nm, 20 nm, 35 nm, 60 nm o 150 nm así como pigmentos de óxido de cinc con un tamaño de las partículas primarias de 20 nm, 60 – 100 nm o 120 nm.

10 Los pigmentos de acuerdo con la invención pueden estar contenidos en cantidades de 1 a 50 % en peso con respecto al peso de la formulación que los contiene. Con preferencia, los contenidos están entre 5 y 40 % en peso, de manera especialmente preferida los contenidos están entre 10 y 35 % en peso.

15 Las preparaciones de protección de la luz de acuerdo con la invención se pueden formular de manera habitual, por ejemplo como emulsión O/W, emulsión W/O, hidrogel, hidrodispersión o también en forma de productos libres de agua.

20 Las emulsiones O/W o bien W/O comprenden, en principio, una fase de aceite, aguay, dado el caso, alcohol así como al menos un micropigmento orgánico con un tamaño de las partículas de al menos 20 nm. La fase de aceite se puede formar en este caso a partir de grasas, aceites, ceras disueltas u otros componentes lipófilos. Como aceites pueden estar contenidos aceite de parafina, triglicéridos de cadena media, como por ejemplo Marytol 318, octildodecanol, isopropilmiristato, aceite de jojoba, aceite de coco o aceite de ricino. La fase acuosa de las emulsiones de acuerdo con la invención se forma habitualmente de agua, dado el caso en mezcla con alcohol.

25 Las hidrodispersiones de acuerdo con la invención comprenden, en principio, una fase de aceite, un agente espesante adecuado, agua así como un contenido efectivo de al menos un micropigmento. La fase de aceite se puede formar de nuevo a partir de grasas, aceites, ceras disueltas otros componentes lipófilos, pudiendo estar contenidos como aceites de manera ventajosa los aceites mencionados anteriormente.

Los hidrogeles de acuerdo con la invención comprenden, además del micropigmento, en principio, agua, un agente espesante adecuado así como, dado el caso, alcohol.

30 Como agentes espesantes se contemplan para los geles de hidrodispersión e hidrogeles todos los agentes dispersantes utilizados normalmente, pero con preferencia se emplean derivados del ácido poliacrílico, como por ejemplo poliacrilatos del grupo de los llamados carbopoles, copolímeros del ácido acrílico, como por ejemplo Pemulen TR1 o xantano. El contenido en agentes espesantes en los geles de acuerdo con la invención está entre 0,05 y 20 % en peso, con preferencia entre 0,1 y 3 % en peso y de manera especialmente preferida entre 0,5 y 1 % en peso.

35 De manera especialmente preferida, las composiciones de acuerdo con la invención están libres de sustancias aditivas que influyen potencialmente de forma negativa en la compatibilidad de la piel, en particular no contienen emulsionantes PEG, sustancias conservantes y sustancias aromáticas. Con preferencia, las preparaciones son resistentes al agua o bien al agua del mar.

40 Además de pigmentos con unos tamaños de las partículas primarias de 20 a 200 nm, las formulaciones de protección de la luz de acuerdo con la invención pueden contener, adicionalmente pigmentos con tamaños de las partículas más pequeños.

Los siguientes ejemplos de realización ilustran composiciones de acuerdo con la invención, en las que las sustancias del contenido se designan de acuerdo con la nomenclatura INCI.

Ejemplo 1: Crema W/O que contiene micropigmentos

45

Sustancia del contenido	Contenido (% en peso)
Poligliceril-2-dipolihidroxiestearatos	3,0
Gliceril oleatos	1,0
Isopropilpalmitatos	5,0

Estearatos de magnesio	1,0
Dióxido de titanio 60 nm	20,0
Óxido de cinc 20 nm	5,0
Butileno glicol	5,0
Disodio EDTA	0,05
Sulfato de magnesio	0,7
Lactato de sodio	0,25
Ácido láctico	0,25
Glicina	1,2
Alcohol desnaturalizado	4,0
Tocoferil acetato	0,5
Agua	Hasta 100

5 Los isopropilpalmitatos y los estearatos de magnesio se funden a 120 °C. Luego se añaden poligliceril-2-dipolihiidroxiestearatos, gliceril oleatos, dióxido de titanio con un tamaño de las partículas primarias de 60 nm, óxido de cinc con un tamaño de las partículas primarias de 20 nm así como tocoferil acetatos y se funden a 85 °C. En paralelo, se disuelven butileno glicol, disodio EDTA, sulfato de magnesio, lactatos de sodio, ácido láctico y glicina en agua y se combinan los dos preparados. A continuación se homogeneiza y se refrigera con agitación a 45 °C. A 45 °C se añade con agitación alcohol desnaturalizado, se homogeneiza y se refrigera con agitación a 28 °C.

10 Para la crema obtenida se determinó, de acuerdo con el Método COLIPA conocido por el técnico, un SPF de aproximadamente 35 y de acuerdo con el método según DIN 67502 un valor de balance UV-A de aproximadamente 27.

Ejemplos 2 y 3

15 Se prepararon cremas W/O según el Ejemplo 1, pero utilizando, por una parte, 20 % peso de dióxido de titanio con un tamaño de las partículas primarias de 20 nm y 5 % en peso de óxido de cinc con un tamaño de las partículas primarias de 60 – 100 nm (Ejemplo 2) y, por otra parte, 20 % en peso de dióxido de titanio con un tamaño de las partículas primarias de 150 nm y 5 % en peso de óxido de cinc con un tamaño de las partículas primarias de 20 nm (Ejemplo 3).

Los valores de balance SPF y UV-A determinados para estas formulaciones se resumen en la tabla siguiente.

Tabla 1

	Ejemplo 2	Ejemplo 3
SPF	Aprox. 40	Aprox. 25
Balance UV-A	Aprox. 18	Aprox. 40

20

REIVINDICACIONES

- 1.- Utilización de filtros de protección de la luz de micropigmentos con un tamaño de las partículas primarias de 20 nm a 200 nm para la consecución de un valor de balance UV-A de al menos 15 en formulaciones de protección de la luz, que están libres de sustancias orgánicas de filtro.
- 5 2.- Utilización de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizada porque los micropigmentos son micropigmentos inorgánicos.
- 3.- Utilización de acuerdo con las reivindicaciones 1 ó 2, caracterizada porque los micropigmentos sin dióxido de titanio y/u óxido de cinc.
- 10 4.- Utilización de acuerdo con una de las reivindicaciones 1, 2 ó 3, caracterizada porque los micropigmentos están contenidos con un tamaño de las partículas primarias de 20 a 200 nm en cantidades de 1 – 50 % en peso, con preferencia de 5 – 40 % en peso y de manera especialmente preferida de 10 – 35 % en peso en la formulación de protección de la luz.
- 5.- Utilización de acuerdo con una de las reivindicaciones 1, 2, 3 ó 4, caracterizada porque el valor de balance UV-A está entre 15 y 40.

15