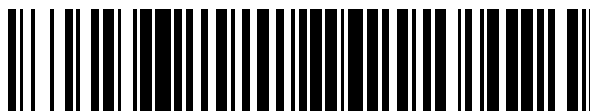


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 429 536**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/44** (2006.01)  
**A61K 8/365** (2006.01)  
**A61K 8/25** (2006.01)  
**A61K 8/34** (2006.01)  
**A61K 8/49** (2006.01)  
**A61K 8/97** (2006.01)  
**A61Q 19/04** (2006.01)  
**A61Q 17/04** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.12.2005 E 05815231 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.06.2013 EP 1855635**

54 Título: **Preparado cosmético para la prolongación del bronceado**

30 Prioridad:

**17.12.2004 DE 102004062170**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

**15.11.2013**

73 Titular/es:

**COTY GERMANY GMBH (100.0%)**  
**Rheinstrasse 4E**  
**55116 Mainz, DE**

72 Inventor/es:

**GOLZ-BERNER, KARIN y**  
**ZASTROW, LEONHARD**

74 Agente/Representante:

**IZQUIERDO FACES, José**

**ES 2 429 536 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**

Preparado cosmético para la prolongación del bronceado

5 La invención se refiere a un preparado cosmético para la prolongación del bronceado de la piel que se ha producido mediante radiación solar natural.

Phototan® LS 2261 E es un agente conocido para la estimulación de la actividad enzimática de dopa-oxidasa y acelera la formación de pigmentos de melanina epidérmicos. Se usa por tanto como acelerador del proceso de bronceado solar y como reforzador del bronceado solar.

Phototan® está compuesto de una mezcla de sorbitol, HCl de arginina, HCl de ornitina, tirosina y gel de sílice. Esta mezcla debe usarse según las indicaciones del fabricante en concentraciones del 3% al 5% en peso y puede reforzar también un bronceado solar existente, sin embargo como máximo en aproximadamente 3-4 días.

15 La invención se basa en el objetivo de mantener el bronceado solar existente durante más de 3-4 días en un porcentaje esencial y conseguir con ello una actividad duradera.

De acuerdo con la invención se soluciona este objetivo mediante un prolongador del bronceado solar de acuerdo con la reivindicación 1, que contiene como componente eficaz un complejo de del 0,1% al 3,0% en peso de cafeína, del 0,2% al 2% en peso de Phototan®, del 0,01% al 1,0% en peso de gluconato de cobre y otros coadyuvantes/vehículos cosméticos, otros principios activos y mezclas de los mismos hasta el 100% en peso, respectivamente con respecto al peso total del preparado.

Ciertas formas de realización ventajosas de la invención están mencionadas en las reivindicaciones dependientes.

30 Se encontró que la combinación de las sustancias mencionadas anteriormente en una formulación adecuada como emulsión o como gel conduce a una prolongación del bronceado solar y con ello a un refuerzo del bronceado solar hasta de 7 a 9 días.

35 Las sustancias usadas en esta combinación tales como cafeína y gluconato de cobre no hacían esperar una acción reforzadora de este tipo.

De la cafeína se sabe que tiene una cierta acción que favorece la circulación sanguínea y en la cosmética puede usarse para el tratamiento de acné, celulitis y caída del cabello.

40 El gluconato de cobre se usa para la regeneración celular como agente antiinflamatorio, como inmunomodulador y como activador de lisiloxidasa para la síntesis de colágeno y como cofactores de tirosinasa para la síntesis de melanina. El gluconato de cobre tiene ciertas propiedades que activan el bronceado, que sin embargo en total son por sí solas demasiado débiles para provocar un refuerzo significativo del bronceado.

45 Como otro principio activo puede usarse en el preparado de acuerdo con la invención el aminoácido glicina que se usa en cosmética por ejemplo en agentes de acondicionamiento de la piel y el cabello. Otra forma de realización de la invención contiene adicionalmente un extracto de fruta de *Citrus aurantium*. Los dos aditivos pueden prolongar el refuerzo del bronceado solar hasta 11 días y representan con ello una forma de realización preferente de la invención.

50 Ciertos agentes humectantes cosméticos especialmente preferentes para el preparado de acuerdo con la invención son propilenglicol, glicerina y por ejemplo Lubragel® y mezclas de los mismos.

55 Como principios activos con propiedades captadoras de radicales pueden usarse extractos de plantas, vitaminas, flavonas, flavonoides.

60 Se prefiere especialmente una mezcla de extractos de plantas que contiene como componente captador de radicales del 0,4% al 1,5% en peso de una mezcla de extracto de plantas de base alcohólica, compuesta de los extractos de granos de café verdes, raíz de angélica, hojas de *Camellia sinensis* y *Pongamia pinnata* (documento WO 2004/105706).

65 Otro aditivo para el preparado cosmético de acuerdo con la invención es una preparación de principios activos de acuerdo con el documento WO99/66881 con alto factor de protección frente a radicales con un contenido en un producto obtenido mediante extracción de la corteza de quebracho blanco e hidrólisis enzimática posterior, que contiene al menos un 90% en peso de oligómeros de proantocianidina y como máximo el 10% en peso de ácido gálico, en microcápsulas, así como un extracto de gusanos de seda obtenido mediante extracción que contiene el

péptido cecropina, aminoácidos y una mezcla de vitaminas y un hidrogel no iónico, catiónico o aniónico o mezcla de hidrogeles y uno o varios fosfolípidos y agua.

El contenido en Phototan® puede encontrarse preferentemente en el intervalo del 0,4% al 0,8% en peso.

El contenido del componente captador de radicales (extracto de plantas de granos de café verdes, raíz de angélica, hojas de *Camellia sinensis* y *Pongamia pinnata*) puede ascender preferentemente del 0,4% al 1,5% en peso.

Se prefiere especialmente un contenido en cafeína del 0,1% al 2,0%, en particular del 0,1% al 0,5% en peso.

El preparado de acuerdo con la invención puede contener adicionalmente coadyuvantes y vehículos cosméticos, tales como se usan habitualmente en preparaciones de este tipo, por ejemplo agua, conservantes, colorantes, pigmentos con acción colorante, agentes espesantes, sustancias aromáticas, alcoholes, polioles, ésteres, electrolitos, formadores de gel, aceites polares y no polares, polímeros, copolímeros, emulsionantes, ceras, estabilizadores.

A los principios activos cosméticos pertenecen por ejemplo agentes fotoprotectores inorgánicos y orgánicos, captadores de radicales, agentes humectantes, vitaminas, enzimas, principios activos vegetales, polímeros, agentes antioxidantes, principios activos naturales antiinflamatorios y ablandadores.

Otro principio activo preferente es por ejemplo un caolín modificado con SiO<sub>2</sub> o TiO<sub>2</sub> esférico de acuerdo con el documento WO96/17588 ejemplo 1 o uno o varios agentes antioxidantes, flavonas, flavonoides o mezclas de principios activos de este grupo.

A los agentes antioxidantes y captadores de radicales pertenecen vitaminas tales como vitamina C y derivados de la misma, por ejemplo acetatos, fosfatos y palmitatos de ascorbilo; vitamina A y derivados de la misma; ácido fólico y sus derivados, vitamina E y sus derivados, tales como acetato de tocoferilo; flavonas o flavonoides; aminoácidos, tales como histidina, glicina, tirosina, triptófano y derivados de los mismos; carotinoides y carotinas, tales como por ejemplo  $\alpha$ -carotina,  $\beta$ -carotina; ácido úrico y derivados del mismo;  $\alpha$ -hidroxiácidos tales como ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico; estilbenos y sus derivados.

Es adicionalmente ventajoso añadir a las composiciones de acuerdo con la invención correspondientes filtros UVA o UVB solubles en agua y/o aceite o los dos. A los filtros UVB solubles en aceite ventajosos pertenecen derivados de ácido 4-aminobenzoico tales como el éster (2-etilhexílico) del ácido 4-(dimetilamino)-benzoico; ésteres del ácido cinámico tales como éster (2-etilhexílico) del ácido 4-metoxicinámico, derivados de benzofenona tales como 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona; derivados de 3-bencilidenalcanfor tales como 3-bencilidenalcanfor.

Los filtros UVB solubles en agua son por ejemplo derivados de ácido sulfónico de benzofenona o de 3-bencilidenalcanfor o sales tales como la sal de Na o K del ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico.

A los filtros UVA pertenecen derivados de dibenzoilmetano tales como 1-fenil-4-(4'-isopropilfenil)propano-1,3-diona, butilmetoxibenzoilmetanos o antranilatos de mentilo.

Se prefieren especialmente benzofenonas-3, butilmetoxidibenzoilmetanos, metoxicinamatos de octilo, salicilatos de octilo, 4-metilbencilidenalcanfor, homosalatos, octocrilenos, metoxicinamatos de etilhexilo, p-metoxicinamatos de isoamilo, octil dimetil PABA, etilhexiltriazonas, dietilhexilbutamidotriazonas, salicilatos de etilhexilo, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, fenil-dibencimidazol-tetrasulfonatos de disodio, bis-etilhexiloxifenolmetoxifenil-triazinas.

Adicionalmente pueden usarse como filtros de protección solar pigmentos inorgánicos a base de óxidos metálicos, tales como TiO<sub>2</sub>, SiO<sub>2</sub>, ZnO, Fe<sub>2</sub>O<sub>3</sub>, ZrO<sub>2</sub>, MnO, Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>, que pueden usarse también en mezcla.

Las composiciones cosméticas con la preparación de principios activos de acuerdo con la invención pueden encontrarse como emulsiones O/W o W/O. Los emulsionantes adecuados para emulsiones O/W son por ejemplo productos de adición de 2-30 mol de óxido de etileno a alcoholes grasos C<sub>8</sub>-C<sub>22</sub> lineales, a ácidos grasos C<sub>12</sub>-C<sub>22</sub> y a alquifenoles C<sub>8</sub>-C<sub>15</sub>; mono y diésteres de ácidos grasos C<sub>12</sub>-C<sub>22</sub> de productos de adición de 1-30 mol de óxido de etileno a glicerina.

Los emulsionantes adecuados para emulsiones W/O son por ejemplo productos de adición de 2-15 mol de óxido de etileno a aceite de ricino; ésteres de ácidos grasos C<sub>12</sub>-C<sub>22</sub> y glicerina, poliglicerina, pentaeritritol, alcoholes de azúcar (por ejemplo sorbitol), poliglucósidos (por ejemplo celulosa); polialquilenglicoles; alcoholes de lanolina; copolímeros de polisiloxano-polialquilpoliéter.

Los aceites usados para la invención pueden ser aceites cosméticos habituales, tales como un aceite mineral; poliisobuteno hidrogenado; escualeno sintético o preparado a partir de productos naturales; ésteres o éteres

cosméticos que pueden ser ramificados o no ramificados, saturados o insaturados; aceites vegetales; o mezclas de dos o varios de los mismos.

5 Los aceites especialmente adecuados son por ejemplo aceites de silicona, aceites minerales, poliisobuteno hidrogenado, poliisopreno, escualenos, trimelitato de tridecilo, triisosteato de trimetilpropano, citrato de isodecilo, diheptanoato de neopentilglicol, PPG-15-estearil-éter así como aceites vegetales, tales como aceite de caléndula, aceite de jojoba, aceite de aguacate, aceite de nuez de Macadamia, aceite de ricino, manteca de cacao, aceite de coco, aceite de maíz, aceite de semilla de algodón, aceite de oliva, aceite de palma, aceite de colza, aceite de cártamo, aceite de soja, aceite de girasol, aceite de germen de trigo, aceite de pepitas de uva, aceite de la nuez de  
10 kukui, aceite de alazor y mezclas de los mismos.

Dependiendo de qué aceites se seleccionen, se ven influidas las propiedades cosméticas de la composición sólida, tal como el grado de transparencia, blandura, dureza, acción de esparcimiento.

15 Como ablandadores pueden usarse normalmente una multiplicidad de compuestos, tales como alcohol estearílico, monoricinoleato de glicerilo, monoestearato de glicerilo, propano-1,2-diol, butano-1,3-diol, alcohol cetílico, isoestearato de isopropilo, ácido esteárico, palmitato de isobutilo, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, alcohol oleílico, laurato de isopropilo, oleato de decilo, octadecan-2-ol, alcohol isocetílico, palmitato de cetilo, aceites de silicona tales como dimetilpolisiloxano, polietilenglicol, lanolina, manteca de cacao, aceites  
20 vegetales tales como aceite de maíz, aceite de semilla de algodón, aceite de oliva, aceites minerales, miristato de butilo, ácido palmítico etc.

Ciertos agentes humectantes adecuados son por ejemplo glicerina, butilenglicol, propilenglicol y mezclas de los mismos.

25 Como pigmentos, mezclas de pigmentos o polvos con acción a modo de pigmento, entre los cuales ha de entenderse también aquéllos con efecto de brillo de perla, pueden usarse por ejemplo: óxidos de hierro, silicatos de aluminio naturales tales como ancorca, (di)óxido de titanio, mica, caolín, arcillas que contienen manganeso tales como tierra de sombra y bol rojo, carbonato de calcio, talco, mica-óxido de titanio, mica-óxido de titanio-óxido de  
30 hierro, mica-óxido de titanio-colorante orgánico y mezclas de los mismos.

El uso de las composiciones cosméticas de acuerdo con la invención puede realizarse por ejemplo en forma de cremas solares, geles solares, productos para después de tomar el sol, productos para antes de tomar el sol, cremas de día, cremas de noche, lociones corporales, leche limpiadora, polvo corporal, producto cosmético para  
35 ojos y en productos de la cosmética decorativa tales como barras desodorante, barras de perfume, barras de labios, geles, sombra de ojos, productos compactos tales como polvos compactos o cera compacta, coloretes, base, maquillaje etc. La fabricación de productos de este tipo se realiza de una manera tal como se conoce por el experto de este campo.

40 Otro objeto de la invención es el uso de un preparado cosmético, que contiene del 0,1% al 3,0% en peso de cafeína, del 0,2% al 2% en peso de Phototan®, del 0,01% al 1,0% en peso de gluconato de cobre y otros coadyuvantes/vehículos cosméticos, otros principios activos y mezclas de los mismos hasta el 100% en peso, respectivamente con respecto al peso total del preparado, para su aplicación sobre piel bronceada mediante  
45 radiación solar natural, realizándose la aplicación al menos dos veces al día con una distancia mínima de 10 horas.

Preferentemente se realiza el uso junto con otro principio activo, seleccionándose el principio activo entre glicina o un extracto de frutas *Citrus aurantium*.

50 La invención se explicará en más detalle a continuación mediante ejemplos. Todas las indicaciones se realizan en porcentaje en peso, siempre que no se indique lo contrario.

Ejemplo 1 Crema reforzadora de bronceado

<b>Fase A</b>	
H <sub>2</sub> O	c.s. hasta 100
Carbómero	2,0
Glicerina	4,0
<b>Phase B</b>	
Steareth 2	4,0
Steareth 21	3,0
Alcohol cetearílico	1,5
aceite mineral	1,5
<b>Fase C</b>	
Trietanolamina	2,0
<b>Fase D</b>	
Phototan®	0,8
Gluconato de cobre	0,01
Cafeína	0,5
<b>Fase E</b>	
Complejo RPF*	1,0
<b>Fase F</b>	
Aceite de perfume	0,5
Conservante	0,5

\* de acuerdo con el documento WO99/66881 ejemplo 2

5 Las fases A y B se preparan por separado a aproximadamente 75°C y entonces se combinan entre sí con agitación. Tras el enfriamiento de la mezcla hasta 50°C se añade la fase C con agitación. Tras el enfriamiento posterior hasta aproximadamente 35°C se añaden las fases D y E. Finalmente se añade a aproximadamente 30°C la fase F y se homogeneiza la mezcla a aproximadamente 20 minutos.

Ejemplo 2 Loción

<b>Fase A</b>	
H <sub>2</sub> O	c.s. hasta 100
Glicerina	4,0
<b>Fase B</b>	
Sesquiestearato de metil-glucosa de PEG-20	2,0
Tocoferol	3,2
parafina	2,0
Escualeno	6,0
Silicona	2,0
<b>Fase C</b>	
Phototan®	0,5
Gluconato de cobre	0,01
Cafeína	0,1
Glicina	0,01
<b>Fase D</b>	
Complejo RPF*	1,0
<b>Fase E</b>	
Perfume	0,5
Conservante	0,5

\* de acuerdo con el documento WO99/66881 ejemplo 1

Las fases A y B preparadas por separado se agitan conjuntamente a aproximadamente 65°C. A continuación se añaden con como máximo 800 r/min la fase C a 35°C y las fases D y E a 30°C a la mezcla y finalmente se homogeneizan durante varios minutos.

**Ejemplo 3 Crema de noche**

<b>Fase A</b>	
H <sub>2</sub> O	c.s. hasta 100
Carbómero	0,1
<b>Fase B</b>	
Ácido esteárico	2,0
Alcohol cetearílico	2,0
Estearato de glicerilo	2,0
<b>Fase C</b>	
Trietanolamina	0,1
<b>Fase D</b>	
Phototan®	0,4
Gluconato de cobre	0,01
Cafeína	2,0
Glicina	0,01
Biotanning® <sup>1</sup>	1,0
<b>Fase E</b>	
Complejo RPF*	0,5
<b>Fase F</b>	
Aceite de perfume	0,5
Conservante	0,5

\* de acuerdo con el documento WO99/66881 ejemplo 1

<sup>1</sup> INCI: extracto de fruto *Citrus Aurantium Dulcis* hidrolizado. El modo de procedimiento corresponde al del ejemplo 1

**Ejemplo 4 Ensayo comparativo**

5 Para un grupo de 10 personas de experimentación en la edad de 18 a 43 años con piel mixta se midió la prolongación del bronceado por medio de un preparado de acuerdo con la invención. Las personas de experimentación tenían un claro bronceado de la piel aproximadamente igual mediante bronceado natural. El valor de partida y los valores sucesivos se midieron por medio de MX18 Mexameter® (Courage + Khazaka electronic GmbH, Alemania) en el antebrazo. El antebrazo de las personas de experimentación no estuvo expuesto en el espacio de tiempo de prueba de 14 días a ninguna radiación UV.

10 De cada punto de medición se determinaron 8 valores de medición para el valor de melanina. Las personas de experimentación se aplicaron los preparados cosméticos tal como sigue:

Persona de experimentación 1-5 loción del ejemplo 2 por la mañana y noche

Persona de experimentación 6-10 crema del ejemplo 1 por la mañana y noche.

15 En la siguiente tabla 1 está expuesta la reducción porcentual de los valores de melanina en el transcurso de 14 días.

**Tabla 1**  
Desarrollo de los valores de melanina (MX18 Mexameter®) en %  
Días

P	0	4	7	9	11	14
1	100	95	88	84	81	62
2	100	92	90	86	79	60
3	100	90	86	80	74	64
4	100	89	83	77	72	58
5	100	93	87	81	76	62
6	100	96	89	83	72	59
7	100	90	85	78	68	58
8	100	93	89	85	72	60
9	100	91	88	84	74	59
10	100	94	87	80	71	61
K 1	100	88	79	70	62	52
K 2	100	85	70	63	58	48
K 3	100	84	68	60	49	43

P = número de personas de experimentación K = número de controles

De la tabla se deduce claramente que el bronceado de la piel tras 7 días se encontraba todavía claramente por

5 encima del 80% del valor de partida, de promedio en aproximadamente el 87%, mientras que el control (aplicación de una loción o crema sin la fase C del ejemplo 2 o la fase D del ejemplo 1) se encontraba en aproximadamente el 72%. También la prolongación posterior mediante componentes adicionales de acuerdo con el ejemplo 2 muestra valores promedio tras 11 días de aproximadamente el 76%, mientras que el control se encontraba en aproximadamente el 56%. De esto se deduce una prolongación del bronceado significativa.

REIVINDICACIONES

1. Uso de un preparado cosmético que contiene como componente eficaz un complejo de
- 5 del 0,1% al 3,0% en peso de cafeína,  
del 0,2% al 2% en peso de Phototan® con el nombre INCI sorbitol (y) HCl de arginina (y) HCl de ornitina (y)  
tirosina (y) sílice y con los ingredientes: sorbitol >50%, HCl de arginina del 5 - 10%, HCl de ornitina del 1 -  
5%, tirosina del 1 - 5% y sílice del 0,1 - 1%, refiriéndose estas indicaciones en % al peso total de Phototan®,  
10 del 0,01% al 1,0% en peso gluconato de cobre y  
otros coadyuvantes, vehículos cosméticos, otros principios activos y mezclas de los mismos hasta el 100% en  
peso, respectivamente con respecto al peso total del preparado, para la prolongación del bronceado de la piel  
que se ha producido mediante radiación solar natural.
2. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado por que** el preparado cosmético contiene como otro principio activo  
15 del 0,01% al 1,0% en peso del aminoácido glicina.
3. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado por que** el preparado cosmético contiene como otro principio activo  
del 0,001% al 0,002% en peso de un extracto de frutas *Citrus aurantium*, preferentemente del 0,001% al 0,0015% en  
20 peso.
4. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado por que** el preparado cosmético contiene como otros principios  
activos componentes captadores de radicales.
5. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado por que** el preparado cosmético contiene como componente  
25 captador de radicales del 0,4% al 1,5% en peso de una mezcla de extracto de plantas de base alcohólica, que está  
constituida por los extractos de granos de café verdes, raíz de angélica, hojas de *Camellia sinensis* y *Pongamia  
pinnata*.
6. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado por que** el preparado cosmético contiene preferentemente del 0,1%  
30 al 2,0%, en particular del 0,1% al 0,5% en peso de cafeína.
7. Uso según la reivindicación 1, aplicándose el preparado cosmético al menos dos veces al día con una separación  
mínima de 10 horas.
- 35 8. Uso según la reivindicación 7, **caracterizado por que** ésta se realiza junto con otro principio activo,  
seleccionándose el principio activo entre glicina o un extracto de frutos de *Citrus aurantium*.