

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 540 330**

51 Int. Cl.:

A61K 8/44 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01)
A61K 8/58 (2006.01)
A61K 8/92 (2006.01)
A61K 8/97 (2006.01)
A61Q 19/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **31.03.2011 E 11160592 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **25.03.2015 EP 2505185**

54 Título: **Composición con efecto bronceador mejorado**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
09.07.2015

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

DOUCET, OLIVIER;
PUJOS, MURIEL;
ROBERT, CÉCILE y
BERNINI, DOROTHEE

74 Agente/Representante:

ESPIELL VOLART, Eduardo María

ES 2 540 330 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

Composición con efecto bronceador mejorado

La invención se refiere a una composición con efecto bronceador mejorado para la piel humana y al uso de la composición en aplicaciones dermatológicas y cosméticas.

5 La patente EP 380335 A2 describe composiciones acelerantes del bronceado solar que comprenden una sal de cobre tal como gluconato de cobre junto con una xantina tal como cafeína o teofilina.

La patente de Estados Unidos 7.731.942 B2 desvela un kit de modelación corporal de tres productos diferentes en los que el pre-producto comprende, entre otras cosas, también gluconato de cobre y cafeína. El producto secundario después de la irradiación solar comprende, entre otras cosas, también gluconato de cobre y opcionalmente un extracto hidrolizado de Citrus Aurantium para un bronceado más intenso.

10 El objetivo de la presente invención es el desarrollo de una nueva composición con un efecto bronceador mejorado y su uso cosmético y dermatológico.

La invención también se refiere a un método para el bronceado de la piel humana mediante la aplicación en la zona en cuestión de la composición bronceadora tal como se describe a continuación.

15 La composición bronceadora de la invención comprende cafeína, glicina, extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis, Metilsilanol lactato sódico y aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa así como adyuvantes dermatológicos o cosméticos. La composición se puede preparar en formas de aplicación cosméticas y dermatológicas usuales tales como emulsiones, aceites, geles, etc.

Con mayor detalle, la presente invención se refiere a una composición bronceadora que comprende

- 20 del 0,05 al 2,0 % de cafeína,
- del 0,01 al 1,0 % de glicina,
- del 0,001 al 0,2 % de extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis,
- del 0,05 al 0,5 % de Metilsilanol lactato sódico
- del 0,05 al 3,0 % de aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa,

25 y la diferencia hasta el 100 % de adyuvantes dermatológicos o cosméticos usuales , todos en % en peso y en relación con el peso total de la composición.

El extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis es un extracto preparado por extracción con agua a temperaturas de 20-35 °C. Una cantidad preferida del extracto en la composición es del 0,01-0,05 % en peso. Un producto conocido en el mercado es, por ejemplo, Biotanning®, Silab, Brive, Francia.

30 La cafeína es un polvo blanco sólido y está disponible en el mercado como materia prima cosmética usual, por ejemplo, suministrado como AEC Caffeine Powder® (A&E Connock), Coffeine (Merck KGaA), Caffeine naturelle Anhydre (Provital), o en un compuesto glicólico tal como Lipocare® (Sederma). Una cantidad preferida de cafeína en la composición de bronceado es del 0,1 al 1,2 % en peso.

35 El aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa es un aceite que se obtiene por prensado en frío de la pulpa del fruto. La Mauritia Flexuosa es una palmera muy alta nativa del noreste de América del Sur y es muy abundante en zonas del centro de Brasil en toda la cuenca del Amazonas. La fruta contiene carotenoides y ácidos grasos tales como ácido oleico y ácido palmítico. Una cantidad preferida en la composición de bronceado es del 0,05-1,0 % en peso, más preferiblemente del 0,05-0,6 % en peso. Productos conocidos en el mercado son, Melscreen Buriti® (Chemyunion), Croda Buriti® (Chrodarom), aceite Buriti (Beraca Ingredients).

40 El Metilsilanol lactato sódico es un silanol obtenido por condensación de un derivado sintético de silicio sobre ácido láctico. El derivado de silicio se obtiene por síntesis, el ácido láctico se obtiene por fermentación de azúcar. Un producto conocido en el mercado es Lasilium® (Exsymol SAM). Una cantidad preferida de Metilsilanol lactato sódico en la composición es del 0,05-0,25 % en peso.

45 Del estado de la técnica descrita anteriormente era de esperar un cierto efecto bronceador, pero en todo caso junto con el gluconato de cobre. Por tanto fue una sorpresa total que el efecto bronceador se mejorase significativamente hasta un efecto sinérgico sin el gluconato de cobre, sino en combinación con otro aceite de planta.

El efecto sinérgico de casi el 300 % con respecto a la combinación de la patente EP 380335 se describe con más detalle en el ensayo de comparación.

5 En un segundo aspecto, la invención se refiere al uso de la composición de bronceado descrita en diferentes formas cosméticas de aplicación. Dichas formas de aplicación comprenden además los usuales ingredientes dermatológicos o cosméticos, por ejemplo antioxidantes, captadores de radicales, protectores solares inorgánicos y orgánicos (filtros UV), agentes emulsionantes, pigmentos, conservantes, formadores de gel, colorantes, perfumes, estabilizantes, agentes formadores de película, emolientes, agentes acondicionadores, sustancias hidratantes, agentes quelantes, potenciadores del FPS, humectantes, agentes antiinflamatorios activos naturales, reguladores del pH, etc.

10 Son preferidos en particular los antioxidantes, captadores de radicales, filtros UV, agentes emulsionantes, sustancias hidratantes, formadores de gel, potenciadores del FPS, emolientes, aceites de silicona, estabilizadores de emulsión, reguladores del pH, conservantes.

15 Adyuvantes dermatológicos o cosméticos adicionales que se pueden usar en la composición incluyen, por ejemplo agua, vitaminas, enzimas, otros extractos de plantas, polímeros, enzimas, fosfolípidos, pantenol, alantoína, éteres y ésteres sintéticos, ácidos grasos, alcoholes monovalentes y multivalentes, siliconas, minerales, otros aceites, especialmente aceites de plantas y/o extractos biotecnológicos. Dichos extractos biotecnológicos son, por ejemplo, el complejo reparador CLR o el complejo de levadura B, ambos de CLR, Lab. Quím. del Dr. Kurt Richter GmbH, Berlín, Alemania; o Stimulhyal, Primalhyal 50 o 300, todos de SOLIANCE, París, Francia.

Especialmente son preferidos el agua, las vitaminas y otros extractos de plantas y también las mezclas de extractos, polímeros sintéticos, ésteres, éteres, ácidos grasos, alcoholes monovalentes y multivalentes, siliconas, silicatos.

20 Un aceite vegetal opcional preferido es el aceite de palma roja el cual ayuda en la acción bronceadora, en particular junto con extracto de semilla de Bixa Orellana.

Otro ingrediente opcional preferido es el β -caroteno que usualmente está presente en forma de cristales micronizados dispersos en un aceite tal como aceite de maíz y junto con una cantidad antioxidante y estabilizante de α -tocoferol.

25 El aceite de palma roja (*Elaeis guineensis*) preferido comprende carotenoides, tocoferoles y tocotrienoles en un intervalo de 400-1600 ppm. Una cantidad preferida de este producto (por ejemplo, CEGESOFT® GPO, Cognis) es del 0,05-1,5 % en peso, más preferiblemente del 0,05-0,5 % en peso.

30 El extracto de semilla de Bixa Orellana adyuvante preferido es un extracto preparado mediante extracciones de la semilla con triglicérido caprílico/cáprico y comprende un elevado contenido de δ - y γ -tocotrienol (5-8 % en peso del concentrado de extracto). El extracto es un producto disponible en el mercado con el nombre INCI de triglicérido caprílico/cáprico y extracto de semilla de Bixa Orellana, con productos tales como por ejemplo Rocou HPG Titrated® (Alban Muller), Phytessence Urucum® (Croda), Paprika P-AC-3® (Heidelberger). Este producto tiene también efectos antioxidantes debido en especial a su elevado contenido de δ -tocotrienol. Además, aumenta el efecto de bronceado. Una cantidad preferida de semilla de Bixa Orellana es del 0,005-0,5 % en peso, preferiblemente del 0,01-0,2 %, especialmente preferido del 0,01-0,15 % en peso.

35 Una preparación cosmética que comprende la composición de bronceado de la invención también puede contener de manera ventajosa otros antioxidantes. Los antioxidantes incluyen, por ejemplo vitaminas tales como la vitamina C y sus derivados, por ejemplo, acetato, fosfato, y palmitato ascórbico; ácido fólico y sus derivados; vitamina E y sus derivados, tales como acetato de tocoferilo; flavonas o flavonoides; además de aminoácidos, tales como histidina, tirosina, triptófano y sus derivados; imidazoles tales como ácido cis- o trans-urocanínico y sus derivados; péptidos tales como D,L-carnosina, D-carnosina, L-carnosina y sus derivados; ácido hialurónico; licopeno; ácido úrico y sus derivados; α -hidroxiácidos tales como ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico; ω -hidroxiácidos grasos tales como ácido palmítico, ácido fítico, lactoferrina; manosa y sus derivados; ácido lipónico y sus derivados tales como el ácido dihidrolipónico; ácido ferúlico y sus derivados; tioles tales como glutatión, cisteína y cistina.

45 La adición de ácido hialurónico y/o vitamina E es especialmente preferida.

50 Un captador de radicales preferido adicional que puede estar comprendido en la composición de bronceado es una mezcla de los siguientes extractos de plantas: extracto de raíz de Angelica Archangelica, extracto de hoja de Camellia Sinensis, extracto de semilla de Pongamia Pinnata, extracto de semilla de Coffea Arabica en una preparación alcohólica, en una versión liposómica encapsulada o en una versión oleosa no encapsulada. Todas las versiones además pueden contener extracto de cáscara de Citrus Aurantium (naranja amarga). Todos los extractos mencionados son productos conocidos y están comercialmente disponibles en el mercado.

La composición de bronceado de la invención se puede usar en diferentes productos cosméticos tales como lociones, aceites, cremas, geles, máscaras, bálsamos, polvos, brillos bronceadores, productos para antes de tomar

el sol, productos solares, productos para después de tomar el sol, auto-bronceadores, maquillajes, polvos compactos, productos fotoprotectores, aerosoles.

Los productos de emulsión incluyen emulsiones múltiples, microemulsiones y nanoemulsiones en forma de emulsiones de W/O, O/W, W/Si, Si/W, W/O/W, O/W/O, O/W/Si y W/Si/W (O = Aceite, W = Agua, Si = Silicona). También se incluyen otros productos tales como sistemas anhidros como Si/O.

5 Los productos para antes de tomar el sol son, por ejemplo, geles para antes de tomar el sol, lociones para antes de tomar el sol, cremas para antes de tomar el sol o aceites para antes de tomar el sol. Los productos solares son geles, cremas, lociones, aceites o aerosoles con diferentes Factores de protección solar (FPS) en el intervalo de FPS 6 a FPS 50+, por ejemplo, FPS 6, FPS 10, FPS 15, FPS 20, FPS 25, FPS 30, FPS 50 y FPS 50+. Los diferentes FPS dependen del tipo y cantidad de sustancias de filtración UV.

Los agentes formadores de gel cosméticos adecuados para la preparación de un gel son carbómero, goma de xantano, carragenina, goma arábiga, goma de guar, agar-agar, alginatos y tilosas, silicato de magnesio y aluminio, carboximetil celulosa, hidroxietil celulosa, celulosa cuaternizada, guar cuaternizado, ciertos poliacrilatos, tales como polímero reticulado de acrilatos/acrilato de alquilo C₁₀₋₃₀, alcohol polivinílico, polivinilpirrolidona.

15 Son especialmente preferidos la goma de xantano, carbómero, acriloldimetiltaurato de amonio/Copolímero VP de acriloldimetiltaurato de amonio/acrilatos de polímero reticulado de metacrilato de beheneth-25/copolímero de metacrilato de alquilo C₁₂₋₂₂, silicato de magnesio y aluminio, acrilato sódico/copolímero de acriloldimetiltaurato sódico, acrilato de hidroxietilo/copolímero de acriloldimetiltaurato sódico, poliéster-5 y polímero reticulado de acrilatos/neodecanoato de vinilo, poliacrilato o poliacrilamida de sodio/Isoparafina C₁₃₋₁₄/Laureth 7.

20 Para la preparación de los productos solares además es ventajoso usar en una composición filtros UVA o UVB solubles en agua y/o aceites correspondientes o ambos, junto con los ingredientes bronceadores de la invención. Los ventajosos filtros UVB solubles en aceite incluyen derivados del ácido 4-aminobenzoico tales como éster de (2-etilhexilo) del ácido 4-(dimetilamino)benzoico; ésteres del ácido cinámico tales como éster de (2-etilhexilo) del ácido 4-metoxicinámico, derivados de benzofenona, tales como 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona.

25 Los filtros UV solubles en aceite preferidos son metoxibenzoilmetano de butilo, metoxicinamato de etilhexilo, salicilato de etilhexilo, y bis-etil hexil fenol metoxifenil triazina.

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

Los filtros UVA incluyen derivados del dibenzoilmetano, tales como metoxibenzoilmetano de butilo.

30 Especialmente se prefieren metoxidibenzoilmetano de butilo, metoxicinamato de etilhexilo, salicilato de etilhexilo, octocrileno, metoxicinamato de etilhexilo, p-metoxicinamato de isoamilo, etilhexil triazona, dietilhexil butamido triazona, metilen-bis-benzotriazolil tetrametilbutilfenol, fenil dibenzimidazol tetrasulfonato de disodio, bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina, benzofenona-3. Los pigmentos inorgánicos como filtros de protección solar son óxidos metálicos tales como TiO₂, SiO₂, Fe₂O₃, ZrO₂, MnO, Al₂O₃, que también se pueden usar en mezclas.

35 Son posibles mezclas de las composiciones cosméticas de la invención junto con otros agentes de bronceado, aunque no es preferible. Dichos otros agentes de bronceado son, por ejemplo, isatina, aldehído de glicerina, aldehído del ácido meso-tartárico, glutaraldehído, eritrola, derivados de pirazolin-4,5-diona, dihidroxiacetona (DHA), derivados de 4,4-dihidroxi pirazolin-5-diona.

40 Las composiciones con los principios de bronceado de la invención también pueden comprender humectantes tales como glicerina, butilenglicol, propilenglicol y sus mezclas.

Ingredientes adicionales para los cosméticos de la presente invención son aceites, emulsionantes, ésteres y pigmentos.

45 Los aceites usados para la invención pueden ser los usuales aceites cosméticos, tales como aceite mineral, poliisobuteno hidrogenado, escualeno procedente de fuentes sintéticas o naturales, aceites vegetales saturados o insaturados, o mezclas de dos o más de los mismos.

50 Aceites especialmente adecuados son, por ejemplo, aceites de silicona, aceites minerales, poliisobuteno hidrogenado, poliisopreno, escualeno, trideciltrimelitato, triisosteato de trimetilpropano, isodecilcitrato, diheptanoato de neopentilglicol, éter estearílico de PPG-15, aceite de caléndula, aceite de jojoba, aceite de aguacate, aceite de nuez de macadamia, aceite de ricino, manteca de cacao, aceite de Inca inchi, aceite de coco, aceite de maíz, aceite de semilla de algodón, aceite de oliva, aceite de almendra de palma, aceite de colza, aceite de semilla de cártamo, aceite de semilla de sésamo, aceite de soja, aceite de semilla de girasol, aceite de germen

de trigo, aceite de semilla de uva, aceite de nuez de kukui, aceite de cardo y sus mezclas.

Dependiendo de los aceites seleccionados, se pueden ver afectadas las propiedades cosméticas de la composición sólida de la invención, tales como la suavidad, la dureza o los efectos del untado.

5 Los ésteres de polioles adecuados son ésteres de ácidos grasos C₁₀-C₁₅ y alcoholes, ésteres de ácidos grasos C₁₀-C₁₅ y glicoles, o ésteres de ácidos grasos hidroxilados. Los ésteres de alquilo C₁₂-C₁₅ ramificados junto con otros ésteres tales como di- o tri-ésteres de polioles son particularmente ventajosos en la fase oleosa, siendo particularmente favorables los ésteres de alcoholes de ácidos de cadena lineal y ramificada. Todos estos ésteres adecuados son derivados de alcoholes primarios. Los ésteres preferidos son carbonato de dicaprililo/cocoato de decilo, sebacato de diisopropilo/adipato de dibutilo y palmitato de isopropilo.

10 Sustancias adecuadas para la fase oleosa incluyen diheptanoato de neopentilglicol, dicaprilato de propilenglicol, adipato de dioctilo, cococaprilato/caprato, adipato de dietilhexilo, dilinoleato de diisopropilo dimérico, dilinoleato de diisosteairilo dimérico, manteca de *Butyrospermum parkii* (karité), lactato de alquilo C₁₂₋₁₃, tartrato de di-alquilo C₁₂₋₁₃, citrato de tri-alquilo C₁₂₋₁₃, lactato de alquilo C₁₂₋₁₅, dioctanoato de PPG, dioctanoato de dietilenglicol, aceite de hierbas de la pradera, aceite de babasú, aceite de jojoba, aceite de arroz, oleato de alquilo C₁₂₋₁₅, aceite de aguacate, neopentanoato de tridecilo, cera de abejas, alcohol cetearílico y Polisorbato 60, triglicéridos C₁₈₋₂₆, alcohol cetearílico y glucósido cetearílico, lanolina acetilada, copolímero de VP/eicoseno, hidroxiestearato de glicerilo, éster glicólico de ácido C₁₈₋₃₆, con sustancias como triglicéridos C₁₈₋₃₆, hidroxiestearato de glicerilo y sus mezclas. También son adecuados y preferidos el alcohol cetílico y estearato de glicerilo y estearato de PEG 75 y Ceteth-20 y Steareth-20, lauril glucósido y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2, beheneth-25, poliamida-3 e hidroxicinamato de pentaeritritil tetra-di-t-butilo, Poliamida-4, y estearato de PEG-100, cetilfosfato de potasio, ácido esteárico, y hectoritas.

25 Las composiciones cosméticas de acuerdo con la invención pueden existir preferiblemente como emulsiones de O/W o W/O así como en emulsión de tipo múltiple, micro- o nano-emulsiones mencionadas anteriormente. Los emulsionantes adecuados para emulsiones de O/W son, por ejemplo, productos de adición de 2-30 moles de óxido de etileno a alcoholes grasos lineales C₈-C₂₂, a ácidos grasos C₁₂-C₂₂ y a alquilfenoles C₈-C₁₅; monoésteres y diésteres de ácidos grasos C₁₂-C₂₂ de productos de adición de 1-30 moles de óxido de etileno a glicerina; monoésteres y diésteres de glicerina así como monoéster y diéster de sorbitán de ácidos grasos C₆-C₂₂, éster de poliol- y poliglicerina; productos de adición de óxido de etileno a aceite de ricino; así como agentes tensioactivos anfólicos.

30 Los emulsionantes adecuados para emulsiones de W/O son por ejemplo productos de adición de 2-15 moles de óxido de etileno a aceite de ricino, ésteres de ácidos grasos C₁₂-C₂₂ y glicerina, poliglicerina, glicoles, pentaeritritol, alcoholes de azúcar (por ejemplo, sorbitol), poliglicósidos (por ejemplo, celulosa), polialquilenglicoles, alcoholes de lana, copolímeros de poliéter polialquil polisiloxano.

35 Los emulsionantes adecuados para emulsiones múltiples y micro emulsiones son, por ejemplo, ésteres de PEG-20 tribehenina, polímero reticulado de PEG-12 dimeticona, lauril PEG/PPG-18/18 meticona, PEG-PPG-19/19 dimeticona incluyendo ciclopentasiloxano, dioleato de poliglicerilo-6 y glicéridos PEG-8 caprílicos/cápricos.

40 Pigmentos, mezclas de pigmentos o polvos con un efecto similar a un pigmento, incluyendo también aquellos con un efecto de brillo perlado, pueden incluir, por ejemplo, óxidos de hierro, silicatos de aluminio tales como ocre, dióxido de titanio, mica, caolín, arcillas que contienen manganeso, dióxido de silicio, óxido de cinc, carbonato de calcio, tiza francesa, mica-óxido de titanio, mica-óxido de titanio-óxido de hierro, cuentas de nailon, cuentas de cerámica, mica, polvos poliméricos sintéticos expandidos y no expandidos, compuestos pulverulentos orgánicos naturales tales como algas sólidas molidas, partes de plantas molidas, almidones de cereales encapsulados y no encapsulados y mica-óxido de titanio-colorante orgánico.

45 La invención se describirá ahora en detalle por medio de ejemplos. Todas las cifras dadas para los ingredientes están indicadas en % en peso si no se especifica lo contrario.

Ejemplos

Ejemplos 1 a 3 de lociones de bronceado con FPS 15

Fase A

	Ejemplo 1	Ejemplo 2	Ejemplo 3
p-metoxicinamato de isoamilo	2,0	2,0	2,0

ES 2 540 330 T3

Fase A

	Ejemplo 1	Ejemplo 2	Ejemplo 3
Etil hexil triazona	1,0	1,0	1,5
Metoxidibenzoilmetano de butilo	3,0	3,0	3,5
Bis-etilhexiloxifenol metoxi fenil triazina	1,0	1,0	0,8
Sebacato de diisopropilo	8,0	7,5,0	6,5
Alcohol cetílico y Estearato de glicerilo y Estearato de PEG-75 y Ceteth-20 y Steareth-20	1,3	1,6	1,8
Ciclopentasiloxano y Ciclohexa-siloxano	3,5	3,2	2,8
Glicéridos de almendra de palma hidrogenados y Glicéridos de palma hidrogenados	0,8	1,2	0,9
Aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa	0,1	0,5	1,5
Aceite vegetal y Aceite vegetal hidrogenado y Cera de Euphorbia Cerifera (Candelilla)	2,4	2,3	2,7

Fase B

	Ejemplo 1	Ejemplo 2	Ejemplo 3
Agua	c.s.p. 100	c.s.p. 100	c.s.p. 100
EDTA disódico	0,09	0,06	0,08
Poliacrilato sódico	0,25	0,3	0,2
Glicerina	5,0	4,0	6,0
Copolímero de acriloldimetiltaurato de amonio/VP	0,15	0,3	0,5
Cafeína	0,3	0,8	0,6
Butilenglicol	1,0	2,5	3,0

Fase C

Ciclopentasiloxano y Dimeticonol	2,0	2,1	2,5
----------------------------------	-----	-----	-----

Fase D

Mezcla ¹ de extracto vegetal de Alcohol y extracto de semilla de Coffea arabica (café) y extracto de hoja de Camellia Sinensis y extracto de semilla de Pongamia Pinnata y extracto de raíz de Angelica	0,2	0,8	0,5
Agua	5	6	8
Glicina	0,07	0,1	0,5
Extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis	0,03	0,2	0,07
Metilsilanol lactato sódico	0,25	0,02	0,3

ES 2 540 330 T3

Fase A

	Ejemplo 1	Ejemplo 2	Ejemplo 3
PEG-8 y Tocoferol y Palmitato de ascorbilo y Ácido cítrico y Ácido ascórbico	0,1	0,09	0,08
Fragancia	0,25	0,2	0,4
Alcohol (Etanol)	3,0	4,5	5,5

¹Concentración de extractos de plantas cada uno al 0,2 % en peso y etanol al 2-9 % en peso en relación con el peso total de la mezcla de extracto de plantas

Los ingredientes de la Fase A se mezclan y se funden juntos a 75 °C aproximadamente. La Fase B se calienta hasta 75 °C.

5 La Fase A se añade a la Fase B y se emulsiona mientras se agita, y a continuación se enfría a 50 °C. La Fase C se añade mientras se agita. Se enfría adicionalmente mientras se agita a <30 °C.

Después de esto, la Fase D se añade mientras se agita hasta conseguir la homogeneidad.

Ejemplo 4: Loción de bronceado de FPS 30

Fase A

Palmitato de etilhexilo	3,8
Benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	8,0
Palmitato de isopropilo	3,0
Dióxido de titanio/hidróxido de aluminio/ácido esteárico	2,0
Metoxidibenzoilmetano de butilo	2,0
Metoxicinamato de octilo	0,5
Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina	2,0
Octocrileno	2,0
Dietilhexil butamido triazona	2,5
Ácido esteárico	2,1
Ésteres de tribehenina PEG-20	2,9
Aceite de Zea Mays (maíz) y Beta Caroteno	0,01

Fase B

Agua desionizada	c.s.p.
EDTA disódico	0,05
Cafeína	0,8
Glicerina	8,0
Propilenglicol	3,0
Hidroxipropilmetil celulosa	0,35
Polímero reticulado de acrilatos/acrilato de alquilo C ₁₀₋₃₀	0,2

ES 2 540 330 T3

Fase A

Cetil fosfato de potasio	0,5
Fenoxietanol	0,7
Clorfenesina	0,2

Fase C

Ciclopentasiloxano	5,0
--------------------	-----

Fase D

Metileno bis-benzotriazolil tetrametilbutilfenol/agua/ decilglucósido/propilenglicol/goma de xantano	4,0
Aceite de Elaeis guineensis (palma)	0,15
Extracto de semilla de Bixa Orellana	0,175
Aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa	1,3
Glicina	0,1
Metilsilanol lactato sódico	0,25
Alcohol de extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis/extracto de semilla de Coffea Arabica (café)/extracto de hoja de Camellia Sinensis/extracto de semilla de Pongamia Pinnata/extracto de raíz de Angelica Archangelica	1,0
Trietanolamina	0,3

Proceso

- 5 La Fase A se calienta hasta 75 °C, la Fase B se calienta por separado. La Fase A y la Fase B se emulsionan a continuación mientras se agita a 75 °C. Se enfría mientras se agita a 50-55 °C. Se añade la Fase C mientras se agita hasta la homogeneidad y se vuelve a enfriar a <30 °C. Se añade la Fase D con agitación final y homogeneizándose.

Ejemplo 5: Gel para después de tomar el sol

Fase A

Agua desionizada	c.s.p. 100
EDTA	0,04
Alantoína	0,1
Cafeína	1,2
Goma de xantano	0,1
Glicerina	4,0
Propilenglicol	3,0
Silicato de magnesio y aluminio	0,1
Polímero reticulado de acrilatos/acrilato de alquilo C ₁₀₋₃₀	0,7

Fase B

ES 2 540 330 T3

Fase B	
Trietanolamina	c.s.p. pH 5,5
Glicina	0,08
Extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis	0,07
Metilsilanol lactato sódico	0,25
Aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa	0,5
Extracto de semilla de Bixa Orellana	0,1
Triglicérido caprílico/cáprico	1,8
Aceite de palma Elaeis guineensis	0,1
Aceite de Zea Mays (maíz) y Beta Caroteno	0,01
Aceite de ricino PEG-40 hidrogenado	1,0
Fase C	
Fenoxietanol	0,5
1,2-hexanodiol/Caprilil Glicol	0,3
Alcohol	5,0

Proceso

La Fase A se calienta en agua a 45 °C mientras se agita hasta la homogeneidad. Se prosigue con agitación mientras se añaden los ingredientes de la Fase B a la Fase A, neutralizando primero. Se enfría a 30 °C mientras se agita. Se finaliza mediante la adición de la Fase C mientras se agita hasta conseguir la homogeneidad. Se ajusta el pH a 5,5.

5

Ejemplo 6: Ungüento dermatológico de bronceado (antes de tomar el sol)

Fase A	
Steareth-2 (Macrogolesteariléter)	2,7
Steareth-21	1,7
Miristato de isopropilo	4,0
Isononanoato de cetosteárido	5,0
Triglicéridos	2,0
Manteca de Butyrospermum parkii (karité)	1,5
Vaselina	5,0
Fase B	
Agua desionizada	c.s.p. 100
Propilenglicol	2,0

ES 2 540 330 T3

EDTA	0,03
Cafeína	0,2
Interpolímero de carbómero tipo B	0,2
Glicerol 99 %	4,0
Silicato de magnesio y aluminio	0,4
Goma de xantano	0,4
Fase C	
<hr/>	
Ciclometicona NF	3,0
Pantenol	1,5
Fase D	
<hr/>	
Aceite de jojoba	2,0
DL alfa-acetato de tocoferol	0,3
Aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa	3,0
Aceite de Zea Mays (maíz) y Beta Caroteno	0,01
Extracto de semilla de Bixa Orellana	0,15
Aceite de Palma (Elaeis guineensis)	0,3
Agua desionizada	3,0
Glicina	0,05
Extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis	0,1
Metilsilanol lactato sódico	0,2
Bronopol	0,1
Agua desionizada	c.s.
Hidróxido sódico (20 %) para ajustar el pH	c.s.p. pH 5,5

Proceso

5 Los ingredientes de la Fase A se mezclan y se calientan hasta 75 °C. La Fase B se calienta hasta 75 °C mientras se agita hasta la homogeneidad. Se añade la Fase A a la Fase B mientras se agita hasta la homogeneidad a 75 °C. Se prosigue con la agitación y el enfriamiento a 50 °C. Se añade la Fase C de forma homogénea a la emulsión, y se vuelve a enfriar a 30 °C.

La Fase D se añade a la emulsión mientras se agita hasta conseguir la homogeneidad.

Se ajusta el pH a 5,5.

Ejemplo 7: Ensayo Comparativo

10 Melanocitos humanos normales diluidos en un cultivo de MGM-4 (MGM = Medio de Crecimiento de Melanocitos) se trataron con los ingredientes activos de la composición de bronceado durante 8 días. Durante este período, las células se expusieron a seis radiaciones UVB independientes, una cada día (día 1, día 2, día 3, día 4, día 7, día 8). Para ello, las células se enjuagaron con PBS y se expusieron a una UVB de 40 mJ/cm² durante 40 segundos. Inmediatamente después de la irradiación, se retiró el PBS y se reemplazó por un medio fresco que contiene ingredientes activos.

15 24 horas después de la última exposición a la luz UV, se cuantificó el contenido de la melanina intracelular. El medio se retiró, las células se lavaron con PBS y la melanina se extrajo mediante una solución de NaOH-DMSO. Los

extractos de melanina se calentaron a 80 °C durante 2 horas. A continuación, los extractos se transfirieron a una microplaca de 96 pocillos y se midieron las densidades ópticas a 405 nm usando un espectrofotómetro. Se realizó una curva patrón de melanina sintética en las mismas condiciones.

- 5 Para determinar el número de células se usó una segunda placa tratada y expuesta a UVB en las mismas condiciones utilizando el método de rojo neutro. Las células se lavaron con PBS y se incubaron con una solución de rojo neutro durante tres horas. A continuación se retiró el colorante y se añadió una solución de ácido acético-etanol para hacer soluble el rojo neutro intracelular. A continuación, las soluciones se transfirieron a una microplaca de 96 pocillos y se midieron las densidades ópticas a 540 nm usando un espectrofotómetro. Se realizó una curva patrón en las mismas condiciones con cantidades conocidas de melanocitos. El contenido de melanina intracelular se normalizó con el número de células, y el bronceado se expresó comparando el contenido de melanina de los melanocitos tratados con los ingredientes activos frente a las células expuestas a UVB pero sin ningún ingrediente.
- 10

Los resultados se muestran en la Tabla 1.

Tabla 1

Ingrediente activo	Bronceado (%)
(1) Cafeína (0,003 %) + glicina (0,0005 %) + Metilsilanol lactato sódico 0,005 + Gluconato de cobre (0,00013 %) [EP 0380335]	20
(2) Cafeína (0,5 %) + glicina (0,05 %) + Metilsilanol lactato sódico (0,1 %)	12
(3) Extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis (0,02 %)	27
(4) Aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa (0,1 %)	205
(5) Cafeína (0,05 %) + glicina (0,005 %) + Metilsilanol lactato sódico (0,099 %) + Extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis (0,02 %) + Aceite de la fruta de Mauritia Flexuosas (0,1 %) (ingredientes de bronceado de la invención)	300

- 15 El resultado muestra que la suma de los efectos de bronceado individuales (12 + 27 + 205 = 244 %) es notablemente inferior que el 300 % de la composición de bronceado de la invención.

REIVINDICACIONES

1. Composición para su uso en el bronceado de la piel humana en la que la composición comprende:
 - del 0,05 al 2,0 % de cafeína,
 - del 0,01 al 1,0 % de glicina,
- 5 del 0,001 al 0,2 % de extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis;
 - del 0,05 al 0,5 % de Metilsilanol lactato sódico, y
 - del 0,05 al 3,0 % de aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa,

y la diferencia hasta el 100 % de adyuvantes dermatológicos o cosméticos usuales, estando todos los porcentajes del % en peso y relacionados con el peso total de la composición.
- 10 2. Composición de acuerdo con la reivindicación 1, en la que la composición comprende adicionalmente aceite de palma roja (*Elaeis guineensis*), extracto de semilla de Bixa Orellana o sus mezclas.
3. Composición de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, en la que la cantidad de cafeína es del 0,1 al 1,2 % en peso.
- 15 4. Composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 1-3, en la que la cantidad de extracto hidrolizado de la fruta de Citrus Aurantium Dulcis es del 0,01 al 0,05 % en peso.
5. Composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 1-4, en la que la cantidad de aceite de la fruta de Mauritia Flexuosa es del 0,05 al 1,0 % en peso, preferiblemente del 0,05 al 0,6 % en peso.
- 20 6. Composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 1-5, en la que la cantidad de Metilsilanol lactato sódico es del 0,02 al 0,25 % en peso.
7. Composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 1-6, en la que la cantidad de aceite de palma roja es del 0,05 al 1,5 % en peso, preferiblemente del 0,05 al 0,5 % en peso.
8. Composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 1-7, en la que la cantidad de extracto de semilla de Bixa Orellana es del 0,005 al 0,5 % en peso, preferiblemente del 0,01 al 0,15 % en peso.
- 25 9. Composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 1-8, en la que la composición comprende una mezcla de los extractos de plantas siguientes: extracto de raíz de Angelica Archangelica, extracto de hoja de Camellia Sinensis, extracto de semilla de Pongamia Pinnata, extracto de semilla de Coffea Arabica encapsulado en liposomas y junto con el 5-10 % en peso de un alcohol, con respecto al peso de la mezcla.

DOCUMENTOS INDICADOS EN LA DESCRIPCIÓN

En la lista de documentos indicados por el solicitante se ha recogido exclusivamente para información del lector, y no es parte constituyente del documento de patente europeo. Ha sido recopilada con el mayor cuidado; sin embargo, la EPO no asume ninguna responsabilidad por posibles errores u omisiones.

Documentos de patente indicados en la descripción

- EP 380335 A2 [0002]
- US 7731942 B2 [0003]
- EP 380335 A [0013]
- EP 0380335 A [0063]