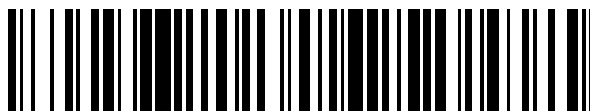


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 578 264**

51 Int. Cl.:

A61K 8/35 (2006.01)

A61K 8/88 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

A61K 8/02 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **08.08.2011 E 11745950 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **27.04.2016 EP 2618805**

54 Título: **Partículas compuestas de protector solar para protección contra rayos UVA y UVB**

30 Prioridad:

23.09.2010 US 888896

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

22.07.2016

73 Titular/es:

UNILEVER N.V. (100.0%)

Weena 455

3013 AL Rotterdam, NL

72 Inventor/es:

POLONKA, JACK

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 578 264 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

Partículas compuestas de protector solar para protección contra rayos UVA y UVB

Campo de la invención

5 La presente invención se refiere a la obtención de protección contra rayos UVA y UVB a partir de un protector solar contra rayos UVA tradicional. Más particularmente, la presente invención se refiere a partículas compuestas de protector solar adecuadas para uso en composiciones que exhiben protección contra rayos UVA y UVB. Las composiciones que comprenden dichas partículas compuestas de protector solar proporcionan sorprendentemente protección tanto contra rayos UVA como protección contra rayos UVB mejoradas, a pesar de que las partículas comprenden un protector solar contra rayos UVA tradicional y no comprenden protector solar contra rayos UVB suministrado a las mismas como un aditivo.

Antecedentes de la invención

La radiación ultravioleta puede ser dañina para la piel. El daño inmediato puede ser en forma de eritema. A más largo plazo está la preocupación por carcinomas o incluso melanoma. Por estas razones, se han incorporado agentes fotoprotectores, conocidos como protectores solares, en composiciones cosméticas.

15 En general, se conoce que la radiación UVA del sol tiene longitudes de onda entre 320 y 400 nm. Dicha radiación UVA puede quemar la piel y la sobre-exposición ha sido asociada a cáncer de piel. La radiación UVB del sol tiene una longitud de onda entre 280 y 320 nm y también ha sido asociada a daños de la piel a corto y largo plazo, incluyendo la formación de arrugas profundas, rotura del colágeno y pigmentación moteada. Por lo tanto, se desea una protección contra los rayos UVA y UVB del sol.

20 Los derivados de dibenzoilmetano son protectores solares conocidos capaces de absorber los rayos UVA. Aunque se usan frecuentemente, estos protectores solares son relativamente sensibles a los rayos UV y tienden a descomponerse tras la exposición a luz solar. Además, los derivados de dibenzoilmetano, los cuales son esencialmente inefectivos como un protector contra la radiación UVB, se formulan frecuentemente con protectores solares contra la radiación UVB, tal como ácido p-metoxicinámico. Desafortunadamente, los protectores solares contra la radiación UVB tienden a acelerar la fotodescomposición de los derivados de dibenzoilmetano. De esta manera, las composiciones que tienen tanto derivados de dibenzoilmetano como ácido p-metoxicinámico deben ser aplicadas frecuentemente por los consumidores con el fin de asegurar una protección adecuada contra los rayos solares.

25 Existe una necesidad de generar composiciones de protector solar tópicas que proporcionen tanto protección contra rayos UVA como protección contra rayos UVB y que no pierdan rápidamente su beneficio en presencia de luz solar. Además, existe una necesidad de generar composiciones de protector solar tópicas en las que los protectores solares contra rayos UVA y/o UVB no interfieran con ingredientes adicionales en las composiciones, ni entre sí.

30 Por lo tanto, la presente invención se refiere a partículas compuestas de protector solar y a composiciones que comprenden las mismas. Las partículas comprenden un protector solar contra rayos UVA tradicional y son inesperadamente adecuadas para proporcionar tanto protección contra rayos UVA como protección contra rayos UVB mejoradas y no comprenden protector solar contra rayos UVB suministrado como un aditivo a la partícula.

35 Dichas partículas pueden ser usadas para formular composiciones que no exhiben una degradación rápida del protector solar contra rayos UVA.

Información adicional

40 Se han divulgado esfuerzos para preparar composiciones de protector solar. En el documento US 4 387 089, se describen composiciones de filtro de luz con 4-(1,1-dimetiletil) 4'-metoxidibenzoilmetano.

Se han divulgado otros esfuerzos para preparar composiciones de protector solar. En el documento US 6 306 373, se describe una mezcla eutéctica específica usando alquil ftalimida inferior en una composición de protector solar.

Se han divulgado todavía otros esfuerzos para preparar composiciones de protector solar. En el documento US 2009/0324659, se describen partículas compuestas de protector solar para su uso en composiciones.

45 Ninguna de las informaciones adicionales anteriores describe una partícula compuesta de protector solar adecuada para su uso en una composición que exhibe tanto protección contra rayos UVA como protección contra rayos UVB, como se reivindica en la presente invención.

Sumario de la invención

En un primer aspecto, la presente invención se refiere a una partícula compuesta de protector solar que comprende:

- a) un protector solar contra rayos UVA adecuado para ser sometido a tautomerización ceto-enólica;
- b) una resina de condensación; y
- 5 c) un disolvente, siendo el disolvente uno en el que el protector solar contra rayos UVA es soluble y uno que tiene una constante dieléctrica de aproximadamente 5,5 a aproximadamente 9

en el que la partícula imparte protección de protector solar contra rayos UVA y rayos UVB y no comprende protector solar contra rayos UVB suministrado como un aditivo a la partícula.

10 En un segundo aspecto, la presente invención se refiere a una composición que comprende la partícula compuesta de protector solar del primer aspecto de la presente invención.

Todos los otros aspectos de la presente serán más fácilmente evidentes tras la consideración de la descripción detallada y los ejemplos siguientes.

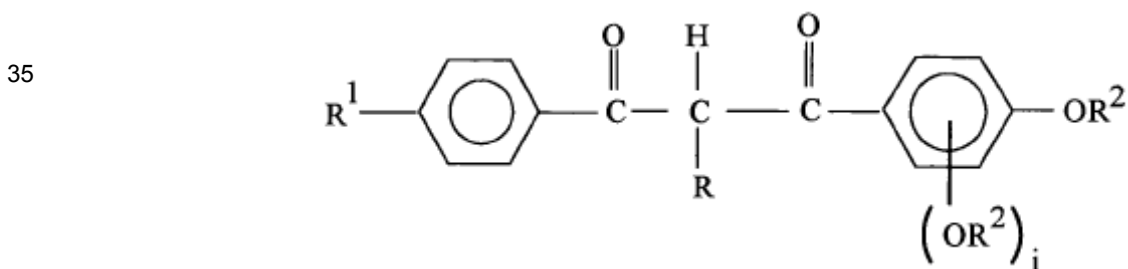
15 El término "piel", tal como se usa en la presente memoria, pretende incluir la piel de la cara, cuello, pecho, espalda, brazos, manos, piernas, nalgas y cuero cabelludo. El término "composición" pretende incluir la composición de uso final aplicada tópicamente por los consumidores en la piel. La expresión "protección contra rayos UVA mejorada" significa aproximadamente 1,5 veces más protección contra rayos UVA en comparación con las composiciones convencionales para protección contra rayos UVA, preparándose estas últimas sin las partículas compuestas de protector solar de la presente invención. La constante dieléctrica se mide según el procedimiento ASTM ISO/IEC 60250. El término "comprende", tal como se usa en la presente memoria, incluye "consiste esencialmente en" y "consiste en". Por lo tanto,

20 con respecto al peso total de los protectores solares, la partícula de la presente invención puede consistir esencialmente en o puede consistir en el protector solar contra rayos UVA definido en la presente memoria. Todos los intervalos identificados en la presente memoria pretenden incluir todos los intervalos incluidos en los mismos si no se hace referencia explícitamente a los mismos.

Descripción detallada de las realizaciones preferentes

25 Las únicas limitaciones con respecto al protector solar contra rayos UVA que puede ser usado en la presente invención son que este pueda experimentar tautomerización ceto-enólica y sea soluble en el disolvente, donde "soluble" se define de manera que signifique que el protector solar contra rayos UVA puede disolverse en el disolvente para dar una solución, que es al menos aproximadamente el 15%, y preferentemente de aproximadamente el 25 a aproximadamente el 50%, y

30 más preferentemente de aproximadamente el 30 a aproximadamente el 45% en peso de protector solar contra rayos UVA (en base al peso total de protector solar contra rayos UVA y disolvente), a aproximadamente temperatura ambiente e incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos. Los protectores solares contra rayos UVA adecuados para su uso en la presente invención incluyen dibenzoilmetano y sus derivados. Típicamente, los derivados preferentes tienen la fórmula:



40 en la que

R es H o un alquilo de C₁₋₃;

R¹ es un alquilo C₁₋₅ lineal o ramificado; y

cada R₂ es independientemente un alquilo C₁₋₄ e i es cero o 1.

45 En una realización más preferente, R es hidrógeno, R¹ es ter-butilo, R² es un grupo metilo, i es cero y el protector solar contra rayos UVA más preferente es 4-(1,1-dimetiletil)-4'-metoxidibenzoilmetano (Avobenzone).

Las partículas compuestas de la presente invención se forman con protector solar contra rayos UVA en disolvente y una resina de condensación. Las resinas de condensación adecuadas para su uso en la presente invención se caracterizan típicamente por un número de ácido que varía de aproximadamente 3 a aproximadamente 15 y una constante dieléctrica que varía de aproximadamente 6,5 a aproximadamente 18, incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos. La resina puede ser un poliéster o una poliamida y preferentemente comprende grupos de ácido carboxílico. La elegida más preferentemente es la poliamida. Las poliamidas terminadas en éster son especialmente deseables. Dos ejemplos son resinas de polialquilenoxipoliamida (PAOPA) y resinas de poli(éster-amida) terminada en éster (ETPEA).

Las resinas de polialquilenoxipoliamida que pueden ser útiles para preparar la partícula compuesta de protector solar de la presente invención se describen en el documento US 6 492 458 B1. Estos materiales de PAOPA pueden ser preparados combinando reactivos comprendiendo un compuesto de ácido monocarboxílico, un compuesto de diamina y un ácido dibásico. Los detalles de estos reactivos se describen más adelante en la presente memoria. Las resinas están disponibles comercialmente en Arizona Chemical Company bajo la marca comercial Sylvaclear® PA 1200V, designada por la nomenclatura INCI como Polyamide-3, y como Sylvaclear® AF1900V. Los ácidos monocarboxílicos ejemplares de la fórmula R^1-COOH incluyen, sin limitación, ácido esteárico (C_{18}), ácido 1- eicosanoico (C_{20}), ácido 1-docasanoico (C_{22} , conocido también como ácido behénico), ácido dotriocontanoico (C_{32}), ácido tetratríacontanoico (C_{34}), ácido pentatríacontanoico (C_{35}), ácido tetracontanoico (C_{40}), ácido tetraacontanoico (C_{44}), ácido dopentaacontanoico (C_{54}), ácido tetrahexaacontanoico (C_{64}) y ácido dohexaacontanoico (C_{72}). Estos ácidos monocarboxílicos están disponibles a partir de muchos proveedores comerciales, incluyendo Aldrich Chemical (Milwaukee, Wis.; www.sigma-aldrich.com).

Otros ácidos monocarboxílicos adecuados son los materiales de polietileno oxidados (específicamente, terminados en carboxilo) comercializados por Baker-Petrolite (Sugar Land, Tex.; www.bakerhughes.com/bapt/; división de Baker Hughes; www.bakerhughes.com) como sus ácidos UNICID™. Los ácidos UNICID™ son ácidos carboxílicos lineales completamente saturados con longitudes medias de cadena de carbono que varían desde C_{24} a C_{50} . Los valores de ácido para los ácidos UNICID™ varían de 60 a 115.

Todavía otros ácidos monocarboxílicos adecuados son los ácidos carboxílicos alfa-ramificados preparados mediante la oxidación de alcoholes de Guerbet de mayor peso molecular. Dichos productos están disponibles en Jarchem Industries Inc. (Newark, N.J.; www.jarchem.com) como sus ácidos JARIC™. El ácido JARIC™ I-36 es frecuentemente un ácido monocarboxílico deseable para las resinas adecuadas para preparar las partículas compuestas de protector solar de la presente invención.

El reactivo o compuesto de diamina tiene dos grupos amina, ambos de los cuales son preferentemente aminas primarias, y está representado por la fórmula $HN(R^3)-R^4-N(R^3)H$. Cada R^3 es preferentemente hidrógeno, pero puede ser también un grupo alquilo o puede unirse también con R^4 u otro R^3 para formar una estructura heterocíclica. Una diamina preferente es etilendiamina, es decir, una diamina en la que R^3 es hidrógeno y R^4 es $-CH_2CH_2-$.

En la presente memoria, puede hacer referencia a las diaminas diferentes de etilendiamina como co-diaminas. Cuando están presentes, las co-diaminas se usan preferentemente en una cantidad menor en comparación con la etilendiamina.

Las co-diaminas ejemplares incluyen 1,2-diaminopropano, 1,3- diaminopropano, 1,4-diaminobutano, 1,2-diamino-2-metilpropano, 1,3- diaminopentano, 1,5-diaminopentano, 2,3-dimetil-1,3-propanodiamina, 1,6-hexanodiamina (conocida también como hexametilendiamina, HMDA), 2-metil-1,5-pentanodiamina, 1,7-diaminoheptano, 1,8- diaminooctano, 2,5-dimetil-2,5-hexanodiamina, 1,9-diaminononano, 1,10- diaminodecano, 1,12-diaminododecano, diaminofenantreno (todos los isómeros, incluyendo 9,10), 4,4'-metilbis(ciclohexilamina), 2,7-diaminofluoreno, fenilendiamina (1,3; isómeros 1,3 y/o 1,4), adamantano diamina, 2,4,6-trimetil-1,3-fenilendiamina, 1,3-ciclohexanobis(metilamina), 1,8-diamino-p-mentano, 2,3,5,6-tetrametil-1,4-fenilendiamina, diaminonaftaleno (todos los isómeros, incluyendo 1,5; 1,8; y 2,3) y 4-amino-2,2,6,6-tetrametilpiperidina.

Las co-diaminas aromáticas adecuadas (las cuales se refieren a moléculas que tienen dos grupos reactivos, preferentemente amina primaria ($-NH_2$), y al menos un anillo aromático ("Ar") incluyen xileno diamina y naftaleno diamina (todos los isómeros).

Co-diaminas basadas en óxido de polialquileno ejemplares incluyen, sin limitación, las diaminas JEFFAMINE™, es decir, poli(alquilenoxi)diaminas de Huntsman Chemical (Salt Lake City, Utah), conocidas también como poliéster diaminas. Las co-diaminas que contienen óxido de polialquileno preferentes son las aminas JEFFAMINE® series ED, XTJ y D.

En ciertas realizaciones, las resinas de poliamida adecuadas para uso en la presente invención se preparan a partir de co-diamina, donde la co-diamina se selecciona de entre 1,6-hexanodiamina, xilendiamina, 1,2- propanodiamina, 2-metilpentametilendiamina y 1,12-dodecanodiamina. Las diaminas adecuadas de la presente invención están disponibles en una diversidad de fuentes comerciales incluyendo Aldrich (Milwaukee, Wis.); EM Industries, Inc. (Hawthorne, N.Y.); Lancaster Synthesis, Inc. (Windham, N.H) y Spectrum Quality Product, Inc. (New Brunswick, N.J.).

El ácido dibásico es una molécula orgánica que contiene dos grupos ácido carboxílico o sus equivalentes reactivos. Un ácido dibásico preferente es ácido graso polimerizado y, en particular, el componente de ácido dimérico de ácido graso polimerizado. Típicamente, el ácido graso polimerizado es una mezcla de estructuras, incluyendo ácido dimérico y ácido trimérico, en la que los ácidos diméricos individuales pueden ser saturados, insaturados, cíclicos, acíclicos y sus combinaciones. Típicamente, el ácido graso polimerizado se forma calentando ácidos grasos insaturados de cadena larga, por ejemplo, ácidos monocarboxílicos C_{18} , a aproximadamente 200-250°C en presencia de un catalizador de arcilla con el fin de que los ácidos grasos polimericen. Típicamente, el producto comprende ácido dimérico, es decir, ácido dicarboxílico C_{36} formado mediante dimerización del ácido graso, y ácido trimérico, es decir, ácido tricarboxílico C_{54} formado mediante trimerización del ácido graso. Una discusión más detallada de la polimerización de ácido graso puede encontrarse en el documento US 3 157 681.

Típicamente, debido a que la polimerización de ácido graso forma mucho más ácido dimérico que ácido trimérico, las personas con conocimientos en la materia pueden referirse frecuentemente al ácido graso polimerizado como ácido dimérico, aunque pueda haber cierta cantidad de ácido trimérico e incluso productos de polimerización superiores con el ácido dimérico. Es preferente que el ácido graso polimerizado contenga menos de aproximadamente el 20 por ciento en peso de ácido trimérico, en base al peso total del ácido graso polimerizado, y que el ácido dimérico constituya al menos aproximadamente el 80 por ciento en peso del ácido graso polimerizado. Más preferentemente, el ácido dimérico constituye esencialmente todo el ácido graso polimerizado.

Los ácidos grasos insaturados típicos usados para formar ácido graso polimerizado incluyen ácido oleico, ácido linoleico y ácido linolénico. El ácido graso de aceite de bogol, que es una mezcla que contiene ácidos grasos insaturados de cadena larga obtenidos como un subproducto del procedimiento de elaboración o procesamiento de pulpa de madera, es preferente para preparar ácido graso polimerizado.

El ácido graso polimerizado puede ser hidrogenado antes de ser usado en la reacción formadora de resina. La hidrogenación tiende a proporcionar un punto de fusión ligeramente más alto y una mayor estabilidad oxidativa y de color.

El ácido graso polimerizado, ácido dimérico y sus versiones hidrogenadas pueden obtenerse a partir de una serie de proveedores comerciales. Por ejemplo, Arizona Chemical (Jacksonville, Fla.) comercializa ácido graso polimerizado bajo su marca comercial UNDYME®.

Además del ácido graso polimerizado, o sus equivalentes reactivos, el ácido dibásico puede comprender un co-diácido. Un co-diácido ejemplar es un denominado diácido "lineal" de la fórmula $\text{HOOC-R}^1\text{-COOH}$, en la que R^1 es un grupo hidrocarburo C_{4-12} lineal y más preferentemente es un grupo hidrocarburo C_{6-8} lineal. Los co-diácidos lineales adecuados para la presente invención incluyen ácido 1,6- hexanodioico (ácido adipico), ácido 1,7-heptanodioico (ácido pimélico), ácido 1-8-octanodioico (ácido subérico), ácido 1,9-nonanodioico (ácido azelaico), ácido 1,10-decanodioico (ácido sebácico), ácido 1,11-undecanodioico, ácido 1,12-dodecanodioico (ácido 1,10- decanodicarboxílico), ácido 1,13-tridecanodioico (ácido brasílico) y ácido 1,14-tetradecanodioico (ácido 1,12-dodecanodicarboxílico).

Otro co-diácido ejemplar es el producto de reacción de ácido acrílico o ácido metacrílico (o su éster, con una etapa de hidrólisis subsiguiente para formar un ácido) y un ácido graso insaturado. Por ejemplo, un diácido C_{21} de este tipo puede ser formado haciendo reaccionar ácido acrílico con un ácido graso insaturado C_{18} (por ejemplo, ácido oleico), donde presumiblemente se produce una eno-reacción entre los reactivos. Un diácido C_2 ejemplar está comercialmente disponible en Westvaco Corporation, Chemical Division, Charleston Heights, S.C. como su número de producto 1550.

Los diácidos aromáticos pueden ser usados como el co-diácido. Un "diácido aromático", tal como se usa en la presente memoria, es una molécula que tiene dos grupos ácido carboxílico ($-\text{COOH}$) o sus equivalentes reactivos (por ejemplo, cloruro de ácido ($-\text{COCl}$) o éster ($-\text{COOR}$) y al menos un anillo aromático ("Ar"). Los ácidos ftálicos, por ejemplo, ácido isoftálico y ácido tereftálico, son diácidos aromáticos ejemplares.

En un aspecto, la resina se prepara con co-diácido y el co-diácido se selecciona de entre ácido 1,4-ciclohexano dicarboxílico, ácido isoftálico, ácido adipico, ácido azelaico, ácido sebácico y ácido dodecanodioico.

Una segunda clase de poliamidas útiles para la presente invención son las resinas de poli(éster-amida) terminadas en éster. Estas se preparan haciendo reaccionar componentes que comprenden ácido dibásico, diamina, poliol y monoalcohol, en el que al menos el 50 por ciento equivalente del ácido dibásico comprende ácido graso polimerizado, y al menos el 50 por ciento equivalente de la diamina comprende etilendiamina. Los ácidos dibásicos típicos y diaminas se han descrito ya anteriormente en la presente memoria.

Un constituyente adicional de las resinas de poli(éster-amida) terminadas en éster son los reactivos de monoalcohol. El monoalcohol puede ser representado por la fórmula $\text{R}^5\text{-OH}$, en la que R^5 es preferentemente un grupo hidrocarburo que tiene al menos diez átomos de carbono. De esta manera, el monoalcohol puede ser descrito también como un alcohol monohídrico. En un aspecto, R^5 es un hidrocarburo C_{10-30} , preferentemente un hidrocarburo C_{12-24} , todavía más preferentemente es un hidrocarburo C_{16-22} , y todavía más preferentemente es un hidrocarburo C_{18} . Preferentemente, R^5 es

lineal con el grupo hidroxilo situado en un átomo de carbono terminal, es decir, el monoalcohol es un monoalcohol primario. De esta manera, 1-dodecanol, 1-tetradecanol, 1-hexadecanol (alcohol cetílico), 1-octadecanol (alcohol estearílico), 1-eicosanol (alcohol araquidílico) y 1-docosanol (alcohol behenílico) son monoalcoholes preferentes para preparar las resinas de poliamida de la invención.

5 Otro reactivo de monoalcohol adecuado es uno denominado alcohol de Guerbet. Los alcoholes de Guerbet tienen la fórmula general $H-C(Ra)(Rb)-CH_2-OH$, en la que Ra y Rb pueden ser iguales o diferentes y representan preferentemente un grupo hidrocarburo de C_6-12 .

10 Otro reactivo de monoalcohol adecuado es un alcohol de cera lineal. Los alcoholes de cera lineales adecuados están comercialmente disponibles, por ejemplo, en Petrolite Corporation (Tulsa, Okla.) bajo su marca comercial UNILIN®. Típicamente, estos alcoholes de cera son una mezcla de alcoholes lineales que tienen al menos aproximadamente 20 átomos de carbono y, más típicamente al menos aproximadamente 24 átomos de carbono.

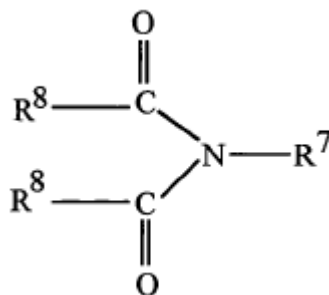
15 Un ingrediente final empleado cuando se prepara la resina de ETPEA adecuada para su uso en la presente invención es poliol, al cual puede hacerse referencia también como alcohol polihídrico. El poliol es de la fórmula $R^6(OH)_t$, en la que R^6 es un grupo orgánico n-valente. Por ejemplo, R^6 puede ser un grupo orgánico C_2-C_{20} sin sustitución hidroxilo. Como otro ejemplo, R^6 puede ser un hidrocarburo. Típicamente, t es un entero de aproximadamente 2 a 6. Los polioles adecuados para su uso en la preparación de una resina de EPTEA de la presente invención incluyen etilenglicol, propilenglicol, butilenglicol, glicerol, trimetilpropano, pentaeritrol, neopentilglicol, tris(hidroximetil)metanol, di-pentaeritrol y tri-pentaeritrol.

La preparación y la descripción de las resinas de ETPEA se encuentran en el documento US 7 329 719 B2.

20 El protector solar contra rayos UVA puede ser dispersado a través de la resina o puede ser formado como un núcleo rodeado por resina. La dispersión a través de la resina es preferente. Típicamente, la resina de condensación conforma de aproximadamente el 25 a aproximadamente el 98%, y preferentemente de aproximadamente el 35 a aproximadamente el 85%, y más preferentemente de aproximadamente el 45 a aproximadamente el 75% en peso del peso total de partícula compuesta de protector solar, incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos, en el que la partícula es preparada con disolvente que comprende al menos aproximadamente el 15% en peso de protector solar contra rayos UVA disuelto en el mismo. La cantidad de protector solar contra rayos UVA (según se añade) que se encuentra frecuentemente en las partículas compuestas de protector solar de la presente invención está comprendida típicamente en el intervalo de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 55%, y preferentemente de aproximadamente el 2 a aproximadamente el 50%, y más preferentemente de aproximadamente el 3 a aproximadamente el 45% en peso, en base al peso total de la partícula e incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos.

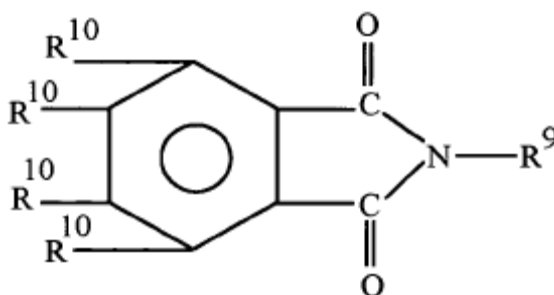
El disolvente adecuado para su uso para preparar la partícula compuesta de protector solar de la presente invención es limitado solo en el sentido de que el mismo sea uno en el que el protector solar sea soluble y que preferentemente tenga una constante dieléctrica de aproximadamente 5,5 a aproximadamente 9. En una realización especialmente preferente, el disolvente permite la tautomerización ceto-enólica del protector solar contra rayos UVA.

35 En una realización deseada, el disolvente es una imida, basada ftalimida o una mezcla de la misma. En una realización más deseada, el disolvente comprende compuestos representados por la fórmula:



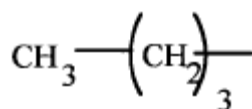
40 donde R^7 es un alquilo lineal o ramificado C_{1-8} y cada R^8 es independientemente H, OH, alcoxi C_{1-3} o un grupo alquilo C_{1-5} . También está dentro del alcance de la invención el empleo de di- y/o tri-imidas derivadas de la imida identificada anteriormente.

En una realización preferente, el disolvente es una mezcla de compuestos representados por la fórmula:

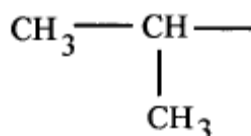


donde R⁹ es un alquilo lineal o ramificado C₁₋₆ y cada R¹⁰ es independientemente H o un alquilo C₁₋₃.

En una realización más preferente, R¹⁰ es hidrógeno y R⁹ es una mezcla eutéctica que comprende de aproximadamente el 60 a aproximadamente el 70% en peso



y de aproximadamente el 25 a aproximadamente el 40% en peso



A dicha mezcla se hace referencia en la presente como butil/isopropil ftalimida.

20 Cuando se prepara la partícula, típicamente, el disolvente representa de aproximadamente el 10 a aproximadamente el 55%, y preferentemente de aproximadamente el 12 a aproximadamente el 45%, y más preferentemente de aproximadamente el 15 a aproximadamente el 35% en peso de la partícula e incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos.

25 El tamaño de las partículas compuestas de protector solar (promedio en número) de la presente invención puede variar pero típicamente las partículas varían de aproximadamente 5 a aproximadamente 3000 nm, y preferentemente de aproximadamente 10 a 1.500 nm, y más preferentemente de aproximadamente 40 a aproximadamente 1.200 nm, incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos.

30 Cuando se preparan composiciones preparadas para ser usadas por los consumidores, dichas composiciones comprenden típicamente de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 40%, y preferentemente de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 20%, y más preferentemente de aproximadamente el 0,75 a aproximadamente el 12% en peso de partícula compuesta de protector solar, en base al peso total de la composición e incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos.

Las partículas compuestas de la presente invención pueden ser formuladas en composiciones cosméticas, tales como cremas y lociones. Estas exhibirán portadores cosméticamente aceptables generalmente preferentes.

35 El portador puede ser un material líquido o sólido. Los portadores pueden estar presentes en cantidades que varían desde aproximadamente el 5 a aproximadamente el 98%, preferentemente de aproximadamente el 20 a aproximadamente el 95%, de manera óptima, de aproximadamente el 40 a aproximadamente el 80% en peso de las composiciones cosméticas. El agua es el portador más común para la presente invención. Los portadores oleosos en presencia de agua y un emulsificante formarán sistemas de emulsión como portadores. Estos sistemas pueden ser sea emulsiones agua-en-aceite o aceite-en-agua. Además del agua, las clases de portadores adecuadas incluyen siliconas, alcoholes polihídricos, alcoholes grasos, hidrocarburos, triglicéridos y polvos espesantes.

40 Las concentraciones de la silicona fluida pueden variar de aproximadamente el 5 a aproximadamente el 60%, más preferentemente de aproximadamente el 5 a aproximadamente el 40%, en peso de la composición. Estos fluidos de silicona pueden ser orgánicos, pueden contener silicona o pueden contener flúor, volátiles o no volátiles, polares o no

polares.

Los aceites de silicona volátiles particularmente preferentes son siliconas volátiles cíclicas, en las que la unidad de repetición varía de aproximadamente 3 a aproximadamente 5; y siliconas lineales en las que la unidad de repetición varía de aproximadamente 1 a aproximadamente 7. Los ejemplos altamente preferentes de aceites de silicona volátiles incluyen ciclometiconas de viscosidades variadas, por ejemplo, Dow Corning 200, Dow Corning 244, Dow Corning 245 y Dow Corning 344 y Dow Corning 345 (comercialmente disponibles en Dow Corning Corp.) así como SWS Silicones Corp (disponibles comercialmente en SWS Silicones Corp.).

Los hidrocarburos pueden ser útiles como portadores cosméticamente aceptables para las composiciones de la presente invención. Pueden incluir aceite mineral, petrolato y polialfa-olefinas. Los ejemplos de hidrocarburos volátiles preferentes incluyen polidecanos, tales como isododecano e isodecano (por ejemplo, Permethyl-99A, que está disponible en Presperse Inc.) y las isoparafinas de C₇-C₈ a C₁₂-C₁₅ (tal como la serie Isopar disponible en Exxon Chemicals).

Los alcoholes polihídricos pueden servir como portadores. Son ilustrativos de este grupo propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, polietilenglicol, sorbitol, hidroxipropil sorbitol, hexilenglicol, 1,3-butilenglicol, isoprenglicol, glicerol etoxilado, glicerol propoxilado y sus mezclas. El más preferente es glicerol, conocido también como glicerina.

Los alcoholes grasos pueden ser también portadores útiles. El término "graso" se refiere a longitudes de cadena de carbono que varían de 10 a 30 átomos de carbono. Ilustrativos de esta categoría son alcohol laurílico, alcohol cetílico, alcohol estearílico, alcohol isoestearílico y sus combinaciones.

Los triglicéridos son otro grupo de materiales útiles como portadores. Son ilustrativos, pero no limitativos, aceite de semilla de girasol, aceite de algodón, aceite de canola, aceite de semilla de soja, aceite de ricino, aceite de borraja, aceite de oliva, manteca de karité, aceite de jojoba y sus mezclas. Los mono- y di-glicéridos pueden ser también útiles. Ilustrativos de estas categorías son monoestearato de glicerilo y diestearato de glicerilo. Son frecuentemente preferentes los triglicéridos a los que se hace referencia como triglicéridos caprílicos/cápricos.

Los portadores pueden comprender uno o más agentes espesantes, preferentemente de aproximadamente el 0,05 a aproximadamente el 10%, más preferentemente de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 5%, y todavía más preferentemente de aproximadamente el 0,25 a aproximadamente el 4%, en peso para la composición. Las clases no limitativas de agentes espesantes incluyen aquéllas seleccionadas del grupo que consiste en:

a. Polímeros de ácido carboxílico

Estos polímeros son compuestos reticulados que contienen uno más monómeros derivados de ácido acrílico, ácidos acrílicos substituidos y sales y ésteres de estos ácidos acrílicos y ácidos acrílicos substituidos, en los que el agente reticulante contiene dos o más dobles enlaces carbono-carbono y se deriva de un alcohol polihídrico.

Los ejemplos de polímeros de ácido carboxílico disponibles comercialmente útiles en la presente memoria incluyen los Carbómeros, que son homopolímeros de ácido acrílico reticulados con éteres de alilo de sacarosa o pentaeritritol. Los carbómeros están disponibles como la serie Carbopol® 900 en Noveon Corporation (por ejemplo, Carbopol® 954). Además, otros agentes poliméricos de ácido carboxílico adecuados incluyen copolímeros de acrilatos de alquilo C₁₀₋₃₀ con uno o más monómeros de ácido acrílico, ácido metacrílico o uno de sus ésteres de cadena corta (es decir, alcohol C₁₋₄), en el que el agente reticulante es un alil éter de sacarosa o pentaeritritol. Estos copolímeros son conocidos como polímeros cruzados de acrilatos/acrilato de alquilo C₁₀₋₃₀ y están disponibles comercialmente como Carbopol® 1342, Carbopol® 1382, Ultrez® 21, Pemulen® TR-1 y Pemulen® TR-2, en Noveon Corporation.

b. Polímeros de taurato

Las composiciones de la presente invención pueden comprender opcionalmente polímeros de taurato reticulados útiles como espesantes o agentes gelificantes que incluyen polímeros aniónicos, catiónicos y no iónicos. Los ejemplos incluyen acrilato de hidroxietilo/acriloldimetil taurato de sodio (por ejemplo, Simulgel® NS e INS 100), acrilato/acriloldimetil taurato de sodio (por ejemplo, Simulgel® EG), acriloldimetil taurato de sodio (por ejemplo, Simulgel® 800) y acriloldimetil taurato de amonio/vinil pirrolidona (por ejemplo, Aristoflex® AVC).

c. Polímeros de poliacrilamida

Las composiciones de la presente invención pueden comprender opcionalmente polímeros de poliacrilamida polimerizados con vinilo, especialmente polímeros de poliacrilamida no iónicos que incluyen polímeros ramificados o no ramificados substituidos. Entre los polímeros de poliacrilamida preferentes, es preferente el polímero no iónico con la designación CTFA poliacrilamida e isoparafina y lauret-7, disponible bajo el nombre comercial Sepigel® 305 en Seppic Corporation.

Otros polímeros de poli(acrilamida) útiles en la presente memoria incluyen copolímeros multi-bloque de acrilamidas y acrilamidas substituidas con ácidos acrílicos y ácidos acrílicos substituidos. Los ejemplos disponibles comercialmente de estos copolímeros multi-bloque incluyen Hypan SR150H, SS500V, SS500W, SSSA100H, en Lipo Chemicals, INC.

d. Polisacáridos

- 5 Una amplia diversidad de polisacáridos son útiles en la presente memoria. "Polisacáridos" se refiere a agentes gelificantes que contienen una cadena principal de unidades de azúcar (es decir, carbohidrato) repetitivas. Los ejemplos no limitativos de agentes gelificantes de polisacáridos incluyen aquéllos seleccionados de entre el grupo que consiste en celulosa, carboximetil hidroxietilcelulosa, hidroxietilcelulosa, hidroxietil etilcelulosa, hidroxipropilcelulosa, hidroxipropil metilcelulosa, metil hidroxietilcelulosa, celulosa microcristalina, sulfato de celulosa de sodio y sus mezclas.

10 e. Gomas y arcillas

- 15 Otros agentes espesantes y gelificantes útiles en la presente memoria incluyen materiales que se derivan principalmente de fuentes naturales. Los ejemplos no limitativos incluyen materiales seleccionados de entre el grupo que consiste en acacia, agar, alga, ácido algínico, alginato de amonio, amilopectina, alginato de calcio, carragenina de calcio, carnitina, carragenina, dextrina, gelatina, goma Gellan, goma guar, cloruro de guar hidroxipropiltrimonio, hectorita, laponita, bentonita, ácido hialurónico, sílice hidratada, hidroxipropil quitosán, hidroxipropil guar, goma karaya, alga marina, goma de algarroba, goma natto, carragenina de potasio, alginato de propilenglicol, goma de esclerocio, carboximetil dextrano de sodio, carragenina de sodio, goma de tragacanto, goma xantana y sus mezclas.

- 20 Las composiciones de la presente invención pueden contener uno o más materiales en partículas diferentes. Los ejemplos no limitativos de otros materiales en partículas incluyen pigmentos coloreados y no coloreados, pigmentos de interferencia, polvos inorgánicos, polvos orgánicos, polvos compuestos, partículas abrillantadoras ópticas y sus combinaciones. Los materiales en partículas pueden estar presentes de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 20%, más preferentemente de aproximadamente el 0,05 a aproximadamente el 10%, todavía más preferentemente de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 5% en peso de la composición.

- 25 Otros materiales en partículas útiles en la presente memoria incluyen pero no están limitados a oxiclورو de bismuto, sericita, mica, mica tratada con sulfato de bario o dióxido de titanio, zeolita, caolín, sílice, nitruro de boro, lauroil lisina, nylon, talco, estireno, poliestireno, copolímero de etileno/ácido acrílico, óxido de aluminio, sulfato de bario, carbonato de calcio, acetato de celulosa, PTFE, metacrilato de polimetilo, almidón, almidones modificados, seda, vidrio y sus mezclas. Los polvos/cargas orgánicas preferentes incluyen partículas poliméricas elegidas de entre las microesferas de resina de metilsilsesquioxano, tales como las comercializadas por Toshiba Silicone bajo el nombre Tospearl 145A; microesferas de polimetilmetacrilatos, tales como aquéllas vendidas por Seppic bajo el nombre Micropearl M 100; las partículas esféricas de polidimetilsiloxanos reticulados, especialmente tales como aquéllas comercializadas por Dow Corning Toray Silicone bajo el nombre Trefil E 506C o Trefil E 505C; partículas esféricas de poliamida y más específicamente Nylon 12, especialmente las comercializadas por Atochem bajo el nombre Orgasol 2002N Nat C05; microesferas de poliestireno, tales como las comercializadas por Dyno Particles bajo el nombre Dynospheres; copolímero de acrilato de etileno comercializado por Kobo bajo el nombre FloBead EA209; PTFE; polipropileno; octenilsuccinato de aluminio almidón tal como es comercializado por National Starch bajo el nombre Dry Flo; microesferas de polietileno, tales como las comercializadas por Equistar bajo el nombre de Microthene FN510-00; resina de silicona; polvo conformado como plaquetas que comprende L-lauroil lisina y sus mezclas. Son especialmente preferentes los polvos esféricos con un tamaño de partícula primario promedio de 0,1 a 75 micrómetros, preferentemente de 0,2 a 30 micrómetros.

- 30 40 Las composiciones (es decir, no la partícula compuesta de protector solar) pueden tener opcionalmente protector solar adicional añadido a las mismas. Los ejemplos ilustrativos incluyen benzofenonas, óxido de cinc grado UV, así como metoxicinamato de octilo, fenilbencimidazol, antranilato de metilo, homosalato, octisalato, octocrileno, octildimetil PABA, orto-aminobenzoatos, TiO₂ grado UVA, sus mezclas o similares. Dichos protectores solares cuando se añaden, típicamente conforman menos del 30% en peso de la composición y frecuentemente de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 15% en peso de la composición, incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos.

Las composiciones cosméticas formuladas con partículas compuestas de protector solar de la presente invención pueden contener también componentes para mejorar las propiedades físicas y el rendimiento.

- 50 Dichos componentes, cuando se incorporan a las composiciones cosméticas, deben ser adecuados para su uso en contacto con tejido queratinoso humano sin toxicidad, incompatibilidad, inestabilidad, respuesta alérgica indebidas y similares dentro del alcance de un juicio razonable. El Manual de ingredientes cosméticos de la CTFA (CTFA Cosmetic Ingredient Handbook), segunda edición (1992) describe una amplia diversidad de ingredientes cosméticos y farmacéuticos no limitativos usados comúnmente en la industria del cuidado de la piel, que son adecuados para su uso en las composiciones de la presente invención. Los ejemplos de estas clases incluyen: abrasivos, absorbentes, componentes estéticos, tales como fragancias, pigmentos, colores/colorantes, aceites esenciales, emulsificantes (tales como alcohol

5 cetearílico y cetearé comercializado como Promulgen D, estearato de PEG-100, colesterol NF, jabón, alquil éter sulfatos, alquil sulfonatos, cloruro de diestearil dimonio, triaquil C₁₂₋₂₀ betaínas y sus mezclas), sensibilizadores de la piel, astringentes, etc. (por ejemplo, aceite de clavo, mentol, alcanfor, aceite de eucalipto, eugenol, lactato de mentilo, destilado de hamamelis), agentes anti-acné, agentes anti-torta, agentes antiespumantes, agentes antimicrobianos, antioxidantes, aditivos biológicos, agentes tampón, agentes de volumen, agentes quelantes, aditivos químicos (tales como EDTA disódico), colorantes, astringentes cosméticos, biocidas cosméticos, desnaturalizantes, astringentes farmacológicos, analgésicos externos, polímeros formadores de película (tales como isohexadecano), agentes opacificantes (tales como TiO₂), ajustadores de pH, propulsores, agentes reductores, secuestrantes, agentes blanqueadores y aclaradores de la piel, agentes acondicionadores de la piel, agentes calmantes y/o sanadores de la piel y sus derivados, agentes de tratamiento de la piel, espesantes (tales como ácidos grasos que tienen de 10 a 30 átomos de carbono tales como ácido esteárico, isoesteárico, hidroxiesteárico y ricinoleico), y vitaminas y sus derivados.

Una cantidad segura y efectiva de un anti-oxidante/depurador de radicales puede ser añadida en cantidades de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 10%, más preferentemente de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 5% en peso de la composición.

15 Pueden emplearse antioxidantes/depuradores de radicales, tales como ácido ascórbico (vitamina C) y sus sales, ésteres de ascorbilo de ácidos grasos, derivados de ácido ascórbico (por ejemplo, ascorbil fosfato de magnesio), tocoferol (vitamina E), sorbato de tocoferol, acetato de tocoferol, otros ésteres de tocoferol, ácidos hidroxi benzoicos butilados y sus sales, ácido 6-hidroxi-2,5,7,8- tetrametilcroman-2-carboxílico (disponible comercialmente bajo el nombre comercial Trolor®), aminas (por ejemplo, N,N-dietilhidroxilamina, amino-guanidina); ácido nordihidroguaiarético, bioflavonoides, aminoácidos, silimarina, extractos de té, y extractos de piel/semilla de uva. Los antioxidantes /depuradores de radicales preferentes se seleccionan de entre ésteres de tocoferol, más preferentemente acetato de tocoferol.

25 Las composiciones que comprenden las partículas compuestas de protector solar de la presente invención pueden comprender, si se desea, un compuesto flavonoide. Los flavonoides se divulgan en los documentos US 5 686 082 y US 5 686 367. Los ejemplos de flavonoides particularmente adecuados son flavonas, isoflavonas, coumarinas, cromonas, discoumaroles, cromanonas, cromanoles, sus isómeros (por ejemplo, isómeros cis/trans), y sus mezclas.

30 Las preferentes para su uso son las flavonas y las isoflavonas, en particular diadzeína (7,4'-dihidroxi isoflavona), genisteína (5,7,4'-trihidroxi isoflavona), eucol (7,4'-dihidroxi isoflavan), 5,7-dihidroxi-4'-metoxi isoflavona, isoflavonas de soja (una mezcla extraída a partir de soja) y sus mezclas. Los compuestos flavonoides útiles en la presente memoria están comercialmente disponibles a partir de una diversidad de fuentes, por ejemplo, Indofine Chemical Company, Inc., Stearoids, Inc., y Aldrich Chemical Company, Inc. Los compuestos flavonoides descritos en la presente memoria están presentes preferentemente de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 20%, más preferentemente de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10%, y todavía más preferentemente de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 5% en peso.

35 Los agentes anti-inflamatorios útiles en la presente memoria incluyen alantoína y compuestos de la familia del regaliz (la planta género/especie Glycyrrhiza glabra), incluyendo ácido glicirrético, ácido glicirrízico y sus derivados (por ejemplo, sales y ésteres).

40 Las composiciones pueden comprender un activo bronceador. Cuando están presentes, es preferente que las composiciones comprendan de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 20%, más preferentemente de aproximadamente el 2 a aproximadamente el 7% en peso de activo bronceador en base al peso total de la composición. Un activo bronceador preferente es dihidroxiacetona.

45 Las composiciones pueden comprender un agente aclarador de la piel. Cuando se usan, las composiciones comprenden preferentemente de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10%, más preferentemente de aproximadamente el 0,2 a aproximadamente el 5%, también preferentemente de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 2%, en peso de la composición, de un agente aclarador de la piel. Los agentes aclaradores de la piel adecuados incluyen niacinamida, ácido cójico, arbutina, ácido tranexámico, extracto de placenta, ácido ascórbico y sus derivados (por ejemplo, ascorbil fosfato de magnesio, ascorbil fosfato de sodio, glucósido de ascorbilo y tetraisopalmitatos de ascorbilo). Otros materiales aclaradores de la piel adecuados para su uso en la presente memoria incluyen Actiwhite® (Cognis), Emblica® (Rona); Azeloglicina (Sinerga) y extractos (por ejemplo, extracto de mora).

50 Las composiciones de la presente invención pueden comprender un activo antimicrobiano o antifúngico. Dichos activos son capaces de destruir microbios, previniendo el desarrollo de microbios o previniendo la acción patogénica de los microbios. Una cantidad segura y efectiva de un activo antimicrobiano o antifúngico puede ser añadida a las presentes composiciones, preferentemente, de aproximadamente el 0,001 a aproximadamente el 10%, más preferentemente de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 5%, y todavía más preferentemente de aproximadamente el 0,05 a aproximadamente el 2% en peso de la composición.

Idealmente, pueden incorporarse conservantes a las composiciones que comprenden las partículas compuestas de protector solar de la presente invención para proteger contra el crecimiento de microorganismos potencialmente dañinos. Los conservantes tradicionales adecuados para las composiciones de la presente invención son alquil ésteres de ácido para-hidroxibenzoico. Otros conservantes que han entrado más recientemente en uso incluyen derivados de hidantoína, sales de propionato y una diversidad de compuestos de amonio cuaternario. Los químicos cosméticos están familiarizados con los conservantes apropiados y los eligen de manera rutinaria para satisfacer el ensayo de estimulación con conservante y para proporcionar estabilidad de producto. Los conservantes particularmente preferentes son yodopropinil butil carbamato (incluyendo mezclas con DMDH hidantoína comercializada bajo el nombre Glydant Plus®), fenoxietanol, metil parabeno, propil parabeno, imidazolidinil urea, dehidroacetato de sodio y alcohol bencílico. Los conservantes deberían ser seleccionados teniendo consideración el uso de la composición y las posibles incompatibilidades entre los conservantes y otros ingredientes en la emulsión. Los conservantes se emplean preferentemente en cantidades que varían de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 2% en peso de la composición, incluyendo todos los intervalos incluidos en los mismos. Dichos conservantes pueden ser añadidas a la composición directamente o a la partícula compuesta de protector solar durante la fabricación de la misma.

Los ejemplos preferentes de estos activos incluyen los seleccionados de entre el grupo que consiste en ácido salicílico, peróxido de benzoilo, ácido 3-hidroxi benzoico, ácido glicólico, ácido láctico, ácido 4-hidroxi benzoico, ácido acetyl salicílico, ácido 2-hidroxibutanoico, ácido 2-hidroxipentanoico, ácido 2-hidroxihexanoico, ácido cis-retinoico, ácido trans-retinoico, retinol, ácido fítico, N-acetil-L-cisteína, ácido lipoico, ácido zelaico, ácido araquidónico, benzoilperóxido, tetraciclina, ibuprofeno, naproxeno, hidrocortisona, acetaminofeno, resorcinol, fenoxietanol, fenoxipropanol, fenoxiisopropanol, 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxi difenil éter, 3,4,4'-triclorocarbanilida, octopirox, ciclopirox, clorhidrato de lidocaína, clotrimazol, climbazol, miconazol, cetoconazol, sulfato de neocicina y sus mezclas.

Las composiciones de la presente invención pueden comprender un agente acondicionador seleccionado de entre el grupo que consiste en humectantes, hidratantes o acondicionadores de la piel. Pueden emplearse una diversidad de estos materiales y cada uno puede estar presente a un nivel de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 40%, más preferentemente de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 30%, y todavía más preferentemente de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 15% en peso de la composición. Estos materiales incluyen, pero no se limitan a, guanidina; urea; ácido glicólico y sales de glicolato (por ejemplo, amonio y alquil amonio cuaternario); ácido láctico y sales de lactato (por ejemplo, amonio y alquil amonio cuaternario); aloe vera en cualquiera de su variedad de formas (por ejemplo, gel de aloe vera); compuestos de polihidroxi, tales como sorbitol, manitol, glicerol, hexanotriol, butanotriol, propilenglicol, butilenglicol y hexilenglicol; polietilenglicoles; azúcares y derivados de almidón (por ejemplo, glucosa, fructosa, sacarosa, trehalosa alcoxiladas); ácido hialurónico; lactamida monoetanolamina; acetamida monoetanolamina; poliéster de sacarosa; petrolato; y sus mezclas.

Las partículas compuestas de protector solar y las composiciones generalmente se preparan mezclando los ingredientes deseados bajo corte y presión atmosférica moderados. Frecuentemente, se desea un calentamiento de manera que las temperaturas no excedan preferentemente 120°C.

Las composiciones de la presente invención incluyen, pero no se limitan a, lociones, leches, mousses, sueros, pulverizaciones, aerosoles, espumas, barras, lápices, geles, cremas y ungüentos. Las composiciones pueden ser aplicadas también vía un textil de fibra natural y/o sintética, tejido o no tejido (toallita o paño).

Los ejemplos a continuación se proporcionan para ilustrar adicionalmente una comprensión de la invención reivindicada. Los ejemplos no pretenden limitar el alcance de las reivindicaciones.

Ejemplo 1

En la presente memoria se describe un procedimiento típico de preparación de partículas compuestas de protector solar de la presente invención. Se cargó agua, en la cantidad de 300 gramos, a un recipiente equipado con un mezclador Escolabor™ (modelo de 1 litro fabricado en Riehn, Suiza), que tiene cuchillas de superficie raspada (Scraper). A continuación, el agua se calentó a 60°C. Un vaso de precipitados de metal se cargó con 50 gramos de Sylvaclear AF1900V® similar a resina, 20 gramos de protector solar contra rayos UVA, tal como 4-(1,1-dimetiletil)-4'-metoxidibenzoilmetano (Avobenzone) y 30 gramos de disolvente, es decir, butil/isopropil ftalimida (constante dieléctrica 7,0). El vaso de precipitados se colocó en un baño de agua. La mezcla de resina se calentó hasta aproximadamente 90-105°C y se mezcló hasta que la homogeneidad. A continuación, la resina del vaso de precipitados se añadió lentamente al recipiente de agua calentada con mezclado lento (20% de uso de energía en el raspador) seguido por un periodo de enfriamiento. A continuación, las partículas compuestas de la presente invención se separaron (mediante centrifuga) como material en partículas a partir de la fase acuosa. Se encontró que el material en partículas tenía un pH de aproximadamente 5,8, una constante dieléctrica de 7,4, y un diámetro (tamaño de partícula promedio en número) de aproximadamente 280 nm.

Ejemplo 2

5 Las partículas compuestas de este ejemplo se prepararon en una manera similar a la usada para preparar las partículas del ejemplo 1, excepto que se usaron 50 gramos de resina Sylvaclear® PA1200V en lugar de 50 gramos de resina Sylvacare® AF1900V, 35 gramos de adipato de dibutilo (constante dieléctrica 4,2) como disolvente en lugar de 30 gramos de butil/isopropil ftalimida y se usaron 15 gramos de Avobenzone en lugar de 20 gramos.

Ejemplo 3

10 Se prepararon una serie de composiciones/muestras comparativas con partículas compuestas de protector solar para demostrar los aspectos inesperados de la presente invención. Los resultados obtenidos son un resultado directo de las valoraciones realizadas con las composiciones identificadas a continuación.

15 Las composiciones se prepararon combinando las fases en la Tabla I a continuación. Las fases A y B se combinaron con mezclado y con calentamiento a una temperatura de aproximadamente 80 a 85°C. Las fases C a H se añadieron con agitación moderada de manera que la temperatura de la mezcla resultante se mantuvo a aproximadamente 55 a 60°C. La mezcla preparada se homogeneizó y la fase I se añadió a la misma durante la homogeneización y a una temperatura de aproximadamente 45°C. Se consiguió un mezclado completo en 5 a 10 minutos. La fase J se añadió con la temperatura mantenida a aproximadamente 40°C. Las condiciones eran atmosféricas y el agua representó el resto de las composiciones.

Tabla I

Composiciones/Muestras		1% (p/p)	2% (p/p)	3% (p/p)	4% (p/p)	5% (p/p)	6% (p/p)	7% (p/p)	8% (p/p)	9% (p/p)	10% (p/p)	11% (p/p)
FASE A												
Agua desionizada	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto	Resto
EDTA disodio	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10
Glicerina	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00
Conservante	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10	0,10
FASE B												
Emulsionante no iónico	2,77	2,77	2,77	2,77	2,77	2,77	2,77	2,77	2,77	2,77	2,77	2,77
Estearato PEG-100	1,65	1,65	1,65	1,65	1,65	1,65	1,65	1,65	1,65	1,65	1,65	1,65
Avobenzona	1,00	1,00	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--
Triglicéido caprílico/cáprico	8,75	8,75	8,75	8,75	8,75	8,75	8,75	8,75	8,75	8,75	8,75	8,75
Ácido esteárico	0,46	0,46	0,46	0,46	0,46	0,46	0,46	0,46	0,46	0,46	0,46	0,46
Conservante	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
Colesterol NF	0,92	0,92	0,92	0,92	0,92	0,92	0,92	0,92	0,92	0,92	0,92	0,92
FASE C												
TiO2	2,00	--	2,00	2,00	--	--	--	--	--	--	--	--
FASE D												
Isohexadecao	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50
DC 200 Dimeticona	0,25	0,25	0,25	0,25	0,25	0,25	0,25	0,25	0,25	0,25	0,25	0,25

Mediciones del SPF

El factor de protección solar (SPF) se midió in vitro usando un instrumento Optometrics SPF 290. El procedimiento de ensayo requirió calibración del monocrómetro y una etapa de muestreo del instrumento Optometrics SPF 290. Posteriormente, el instrumento se calibró con una placa de cuarzo de muestra de blanco (10 cm x 10 cm y 3 mm de espesor). La calibración pone en cero el detector de UV. Las composiciones se aplicaron y esparcieron uniformemente sobre las placas para dejar una película de 2 mg/cm². Las películas se dejaron secar durante 30 minutos. Posteriormente, se tomaron lecturas de SPF y de intensidad espectral sobre las películas secadas usando doce mediciones en diferentes partes de las placas de cuarzo revestidas y se registraron los valores promedio.

Los resultados del ensayo SPF y cada una de las composiciones se resumen a continuación. Se valoraron el valor de SPF promedio y las intensidades de absorción en unidades de factor de protección monocromática y a longitudes de onda de 360 nm (región UVA) y 290 nm (región UVB).

Resultados

Las composiciones 1, 3 y 4, subsiguientes a la valoración, revelan inesperadamente que la composición preparada de manera consistente con la presente invención y que tiene partículas compuestas de protector solar según se define en la presente memoria, tiene una mayor absorción UVA (aproximadamente tres veces) (a 360 nm) que el protector solar en aceite (composición 1) y aproximadamente un 25% superior (a 360 nm) cuando se compara con la partícula preparada con adipato de dibutilo (composición 3). Para la absorción UVB (a 290 nm), las composiciones 1 y 3 tenían una absorción UVB similar, atribuible al uso de TiO₂. Por otra parte, la composición 4 tenía inesperadamente aproximadamente dos veces la absorción UVB en comparación con las composiciones 1 y 3. Los resultados muestran de manera sorprendente que la composición preparada de manera consistente con la presente invención exhibe excelentes características de absorción UVB en ausencia de un protector solar contra rayos UVB suministrado.

Las composiciones 2, 5 y 6 muestran que el protector solar compuesto (composición 5) exhibe una mejor (aproximadamente 2,5 veces) absorción de UVA (a 360 nm) que el protector solar en aceite (composición 2). Los resultados muestran sorprendentemente que una composición preparada de manera consistente con la presente invención (composición 6) muestra aproximadamente una absorción UVA un 25% mayor en comparación con la composición 5 que tiene protector solar compuesto no preparado de manera consistente con la presente invención. Para la absorción UVB (290 nm), la composición 6 mostró inesperadamente al menos 10 veces más absorción UVB que las composiciones 2 y 5, en las que no hay contribución a TiO₂ debido a que las composiciones carecen de opacificante.

Se valoraron las composiciones 7, 8 y 9, en las que las composiciones carecían de opacificante TiO₂ y protector solar. Las composiciones no mostraron absorción UVA o UVB, indicando de manera sorprendente que el sistema compuesto de disolvente/polímero no tenía esencialmente ningún efecto sobre la absorción en ausencia de un protector solar adecuado para experimentar tautomerización ceto-enólica.

Las composiciones 10 y 11 no muestran absorción UVB, demostrando que el protector solar adecuado para experimentar tautomerización ceto-enólica en disolvente no proporciona absorción UVB si está físicamente fuera de la partícula compuesta de protector solar descrita en la presente invención.

Tabla 2

Composición/Muestra	Absorción UVA	Absorción UVB	Valor SPF
1	26,1	24,8	13,4
2	16,2	2	3,9
3	63,4	25,7	23,2
4	80,5	50,2	33,4
5	52,1	1,8	10,2
6	65,1	21,0	21,1
7	1,0	0,96	1,0
8	1,0	1,4	1,0

(Cont.)

9	1,0	0,95	1,0
10	17,1	1,3	4,1
11	16,4	1,6	3,8

Los resultados confirman de manera inesperada una excelente protección contra rayos UVA y UVB cuando se preparan composiciones consistentes con la presente invención.

5

REIVINDICACIONES

1. Una partícula compuesta de protector solar que comprende:

- a) un protector solar contra rayos UVA adecuado para ser sometido a tautomerización ceto-enólica;
- b) una resina de condensación; y

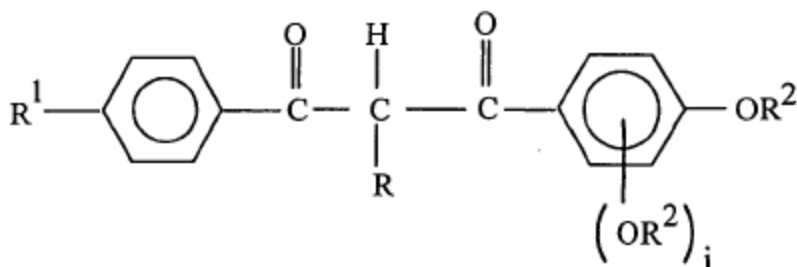
5 c) un disolvente, siendo el disolvente uno en el que el protector solar contra rayos UVA es soluble y uno que tiene una constante dieléctrica de 5,5 a 9,

en la que la partícula imparte protección de protector solar contra UVA y UVB y no comprende protector solar contra rayos UVB suministrado como un aditivo a la partícula.

10 2. Una partícula compuesta de protector solar según la reivindicación 1, en la que el protector solar contra rayos UVA puede disolverse en el disolvente para proporcionar una solución que es al menos el 15% de protector solar contra rayos UVA en base al peso total de protector solar y disolvente.

3. Una partícula compuesta de protector solar según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en la que el protector solar es dibenzoil metano o un derivado del mismo.

15 4. Una partícula compuesta de protector solar según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que el protector solar tiene la fórmula:



20 en la que

R es H o un alquilo C₁₋₃;

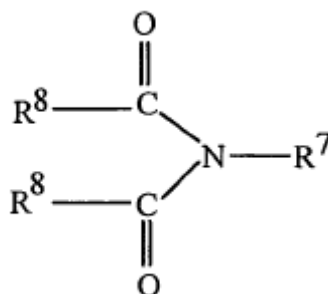
R¹ es un alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado; y

25 cada R² es independientemente un alquilo C₁₋₄ e i es cero o 1.

5. Una partícula compuesta de protector solar según la reivindicación 3 o la reivindicación 4, en la que el protector solar es 4-(1,1-dimetiletil)-4'-metoxidibenzoilmetano.

6. Una partícula compuesta de protector solar según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que la resina es un poliéster o una poliamida, y el disolvente es una imida o una ftalimida.

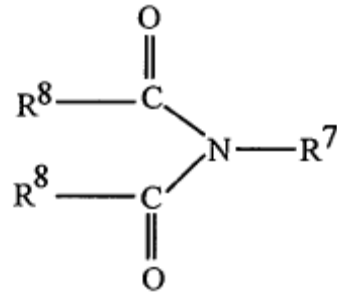
30 7. Una partícula compuesta de protector solar según la reivindicación 6, en la que el disolvente tiene la fórmula:



35 en la que R⁷ es un alquilo C₁₋₈ lineal o ramificado y cada R⁸ es independientemente H, OH, alcoxi C₁₋₃ o un grupo alquilo C₁₋₅.

8. Una composición según la reivindicación 6, en la que el disolvente es una di- o tri-imida derivada del disolvente representado por la fórmula:

5

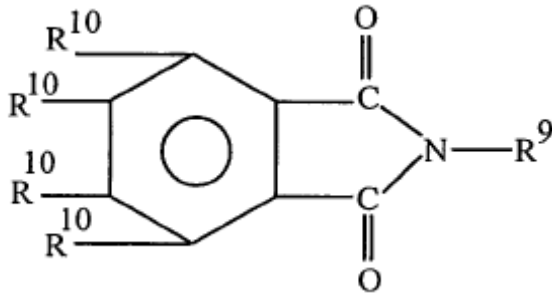


10

en la que R⁷ es un alquilo C₁₋₃ lineal o ramificado y cada R⁸ es independientemente H, OH, alcoxi C₁₋₃ o un grupo alquilo.

9. Una partícula compuesta de protector solar según la reivindicación 6, en la que el disolvente tiene la fórmula:

15



20

en la que R⁹ es un alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y cada R¹⁰ es independientemente H o un alquilo C₁₋₃.

10. Una partícula compuesta de protector solar según la reivindicación 9, en la que el disolvente es butil/isopropil ftalimida.

11. Una composición para proporcionar protección contra rayos UVA y UVB, en la que la composición comprende una partícula compuesta de protector solar según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores.