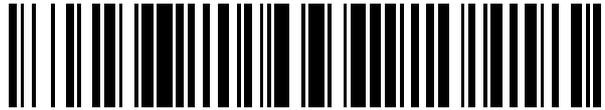


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 592 958**

51 Int. Cl.:

<b>A61K 8/35</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/06</b>	(2006.01)
<b>A61Q 17/04</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/31</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/34</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/36</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/37</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/86</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/891</b>	(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **18.01.2011 PCT/EP2011/050620**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **11.08.2011 WO11095392**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.01.2011 E 11700549 (6)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **22.06.2016 EP 2531263**

54 Título: **Composición de filtro solar fotoestable**

30 Prioridad:

**03.02.2010 IN MU02812010**

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

**02.12.2016**

73 Titular/es:

**UNILEVER N.V. (100.0%)  
Weena 455  
3013 AL Rotterdam, NL**

72 Inventor/es:

**DUGGAL, CHARU y  
RAUT, JANHAVI, SANJAY**

74 Agente/Representante:

**LINAGE GONZÁLEZ, Rafael**

ES 2 592 958 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 de filtro solar fotoestable

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a composiciones de filtro solar fotoestables, más particularmente a una composición en formato de microemulsión que comprende filtros solares de dibenzoilmetano.

10 **Antecedentes de la invención**

La radiación solar incluye aproximadamente el 5% de radiación ultravioleta (UV), cuya longitud de onda está entre 200 nm y 400 nm. Se clasifica adicionalmente en tres regiones: desde 320 hasta 400 nm (UV-A), de 290 a 320 nm (UV-B) y desde 200 hasta 290 nm (UV-C). Una gran parte de radiación UV-C la absorbe la capa de ozono. Estudios científicos han indicado que la exposición a radiación UV-A y UV-B durante un periodo corto provoca enrojecimiento de la piel e irritación localizada, mientras que una exposición continuada y prolongada puede conducir a quemadura solar, melanoma y formación de arrugas. También se notifica que la radiación UV provoca daño significativo al cabello. Por tanto, es deseable proteger la piel y otros sustratos queratinosos del cuerpo humano frente a los efectos dañinos tanto de la radiación UV-A como UV-B.

Se ha notificado que diversas preparaciones cosméticas previenen y/o protegen la piel frente a los efectos dañinos de la radiación ultravioleta. Se notifican numerosos agentes de filtro solar orgánicos que pueden absorber rayos UV-A en el campo de los cosméticos entre los que un filtro solar particularmente útil es de la clase del dibenzoilmetano. El ácido p-metoxicinámico y sus derivados se usan extensamente como filtros solares frente a UV-B. Muchos fabricantes de cosméticos prefieren incluir filtros solares tanto frente a UV-A como tanto frente a UV-B en composiciones fotoprotectoras de modo que se proporcione protección por todo el rango de la radiación UV.

Se sabe que el dibenzoilmetano y sus derivados son relativamente sensibles a la radiación ultravioleta y que se descomponen rápidamente bajo el efecto de la luz del sol. Esta descomposición se acelera en presencia de filtros solares frente a UV-B, especialmente ácido p-metoxicinámico y sus derivados. Debido a la inestabilidad fotoquímica de dibenzoilmetano y sus derivados en presencia de filtros solares frente a UV-B, especialmente ácido p-metoxicinámico y sus derivados, no puede garantizarse la protección constante durante la exposición prolongada al sol. Por tanto, esto justifica aplicaciones repetidas a intervalos regulares y frecuentes por parte del usuario, con el fin de mantener una protección eficaz frente a los rayos UV.

Por tanto, la estabilización del dibenzoilmetano y sus derivados es importante de modo que el usuario obtenga una ventaja completa de su eficacia y no tenga que recurrir a aplicaciones frecuentes.

Se han notificado diversos métodos para la estabilización del dibenzoilmetano y sus derivados en formulaciones cosméticas.

El documento US 5985251 (Roche Vitamins, 1999) describe cosméticos de filtro de luz en los que se estabilizan composiciones que comprenden derivados de dibenzoilmetano y derivados del ácido p-metoxicinámico mediante la incorporación del 0,5 al 12% en peso de derivados de acrilato de 3,3-difenilo o derivados de benciliden-alcanfor.

El documento US 5576354 (L'Oreal, 1996) da a conocer una composición cosmética de filtro fotoestable y un proceso para la protección de la epidermis humana frente a rayos UV de longitudes de onda de 280 a 380 nm, teniendo la composición al menos una fase grasa, del 1 al 5% en peso de un derivado de dibenzoilmetano y al menos el 1% en peso de un  $\beta,\beta$ -difenilacrilato de alquilo o  $\alpha$ -ciano- $\beta,\beta$ -difenilacrilato de una fórmula dada, siendo la proporción molar del compuesto de fórmula dada con respecto al dibenzoilmetano de no menos de 0,8.

Los derivados de acrilato de 3,3-difenilo o derivados de benciliden-alcanfor son filtros solares en sí mismos, que son costosos y así se suman al coste de las composiciones. Los investigadores, incluyendo los presentes inventores, han estado buscando por tanto soluciones más sencillas al problema, que pueden involucrar usar una combinación de componentes disponibles más comúnmente para resolver este problema.

El documento WO 01/37798 se refiere al problema de la fotoestabilidad de las composiciones de filtro solar y da a conocer composiciones que contienen dibenzoilmetano y p-metoxicinamato como filtros de UV y una mezcla de emulsionantes y componentes de aceite.

Por tanto, existe la necesidad de composiciones cosméticas que comprendan dibenzoilmetano o sus derivados, que sean estables, especialmente en presencia de ácido p-metoxicinámico o sus derivados, en las que no se requieran de manera esencial polímeros especializados y/o estabilizantes de filtro solar adicionales. Es altamente deseable tener composiciones cosméticas, que se estabilicen con componentes que están fácilmente disponibles, reduciendo de ese modo las complejidades de formulación y reduciendo sustancialmente los costes.

Los presentes solicitantes han trabajado en el pasado con un enfoque que se publicó como el documento WO 2008/022946, que da a conocer composiciones cosméticas que comprenden dibenzoilmetano o sus derivados y ácido p-metoxicinámico o sus derivados, que pueden estabilizarse mediante la incorporación de una combinación de etoxilatos de alcoholes grasos y polialquilenglicol. Los presentes inventores han encontrado de manera sorprendente

5 que las composiciones cosméticas que comprenden dibenzoilmetano o su derivado pueden estabilizarse en una formulación de microemulsión específica que tiene componentes especificados en cantidades selectivas.

Por tanto, un objeto de la presente invención es obviar al menos algunas desventajas de la técnica anterior y proporcionar composiciones de filtro solar cosméticas fotoestables.

10 Otro objeto de la presente invención es proporcionar composiciones fotoestables que comprenden filtros solares de dibenzoilmetano, en las que la estabilización se produce usando componentes fácilmente disponibles y no costosos.

### 15 Sumario de la invención

Según un aspecto, la presente invención se refiere a una composición de filtro solar fotoestable en un formato de microemulsión con una fase dispersa de gotas en el intervalo de tamaño de 4 a 100 nm. La composición de filtro solar fotoestable comprende:

- 20 a. del 0,1% al 10% en peso de dibenzoilmetano o su derivado,
- b. del 10 al 40% en peso de un emulsionante,
- 25 c. del 5 al 40% en peso de un coemulsionante seleccionado del grupo que consiste en alcohol de cadena lineal o ramificada C2 a C8, alcohol polihidroxilado y ácido graso de peso molecular bajo C5 a C8,
- d. del 10 al 50% en peso de un líquido hidrófobo que tiene un valor de log P a 25 grados centígrados mayor de 3 y una solubilidad en agua a 25 grados centígrados menor del 0,1% en peso, y

- 30 e. del 10 al 50% en peso de agua;

en la que dicho emulsionante es un surfactante no iónico;

35 en la que el derivado de benzoilmetano se selecciona de 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano, 2-metildibenzoilmetano, 4-metil-dibenzoil-metano, 4-isopropildibenzoil-metano, 4-terc-butildibenzoilmetano, 2,4-dimetildibenzoilmetano, 2,5-dimetildibenzoilmetano, 4,4'-diisopropil-dibenzoilmetano, 2-metil-5-isopropil-4'-metoxidibenzoilmetano, 2-metil-5-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano, 2,4-dimetil-4'-metoxi-dibenzoilmetano o 2,6-dimetil-4-terc-butil-4'-metoxi-dibenzoilmetano.

### 40 Descripción detallada de la invención

Estos y otros aspectos, características y ventajas resultarán evidentes para los expertos habituales en la técnica a partir de la lectura de la siguiente descripción detallada y las reivindicaciones adjuntas. Para que no quede duda, cualquier característica de un aspecto de la presente invención puede usarse en cualquier otro aspecto de la invención. El término "que comprende" pretende significar "que incluye", pero no necesariamente "que consiste en" o "que se compone de". En otras palabras, no es necesario que las etapas u opciones enumeradas sean exhaustivas. Se indica que los ejemplos facilitados en la descripción a continuación pretenden aclarar la invención y no pretenden limitar la invención a esos ejemplos *per se*. De manera similar, todos los porcentajes son porcentajes en peso/peso a menos que se indique de otro modo. Excepto en los ejemplos de trabajo y comparativos, o cuando se indique explícitamente de otro modo, han de entenderse todas las cifras en esta descripción y las reivindicaciones que indican cantidades de material o condiciones de reacción, propiedades físicas de materiales y/o uso como modificadas por el término "aproximadamente". Se entiende que los intervalos numéricos expresados en el formato "desde x hasta y" incluyen x e y. Cuando para una característica específica se describen múltiples intervalos preferidos en el formato "desde x hasta y", se entiende que también se contemplan todos los intervalos que combinan los diferentes extremos.

Por "composición de filtro solar fotoprotectora" tal como se usa en el presente documento, pretende incluir una composición para aplicación tópica a zonas expuestas al sol de la piel y/o el cabello de mamíferos, especialmente seres humanos. Tal composición puede clasificarse en general como sin aclarado o con aclarado con agua, e incluye cualquier producto aplicado a un cuerpo humano también para mejorar el aspecto, la limpieza, el control de olores o la estética en general. La composición de la presente invención puede estar en forma de un líquido, una loción, crema, espuma, exfoliante, gel, barra de jabón o tonificante, o aplicarse con un accesorio o mediante una máscara, almohadilla o parche facial. Los ejemplos no limitativos de composiciones de filtro solar fotoprotectoras incluyen lociones y cremas para la piel sin aclarado con agua, champús, acondicionadores, geles de ducha, barras de tocador, antitranspirantes, desodorantes, barras de labios, bases de maquillaje, rímel, autobronceadores y lociones de filtro solar. "Piel" tal como se usa en el presente documento pretende incluir la piel en la cara y el

cuerpo (por ejemplo, cuello, tórax, espalda, brazos, axilas, manos, piernas, glúteos y cuero cabelludo), especialmente a las partes expuestas al sol del mismo. La composición de la invención también es de relevancia para aplicaciones sobre cualquier otro sustrato queratinoso del cuerpo humano diferente a la piel, por ejemplo, cabello, en el que los productos pueden formularse con el objetivo específico de proporcionar fotoprotección.

5 Por "composición de filtro solar fotoestable" quiere decirse una composición que es más estable que composiciones de filtro solar similares conocidas hasta ahora y/o proporciona tal fotoestabilidad a menor coste o con componentes más compatibles en la composición. Se prefiere que la fotoestabilidad sea tal que esté presente preferiblemente dibenzoilmetano en al menos el 65%, aún más preferiblemente al menos el 70% después de la exposición a la luz solar durante 30 minutos.

La presente invención se refiere a una composición de filtro solar en un formato de microemulsión que comprende los componentes especificados en la presente reivindicación 1.

15 La composición de la presente invención está en forma una microemulsión. Las microemulsiones se definen como monofase, disoluciones isotrópicas termodinámicamente estables de agua, aceite y anfífilos. Se caracterizan por una tensión interfacial ultrabaja y una interfase aceite-agua flexible. Estas pueden cumplirse mediante la elección apropiada de los surfactantes y cosurfactantes para un sistema de aceite-agua dado. Las microemulsiones se forman espontáneamente con el simple mezclado de los componentes y no requieren cizallamiento o aporte de energía. Debido a la interfase altamente flexible, las microemulsiones pueden evolucionar entre diversas estructuras que van de micelas hinchadas similares a gotas a estructuras biocontinuas. Las microemulsiones bicontinuas hacen irrelevante la distinción habitual entre "aceite en agua" y "agua en aceite". El tamaño de gota en una microemulsión está habitualmente en el intervalo de tamaño de 10-100 nm. Por tanto, las microemulsiones parecen transparentes debido a que el tamaño de gota es más pequeño que la longitud de onda de la luz visible.

25 La composición de la invención está en forma de microemulsión y es preferiblemente transparente. El formato de microemulsión líquida transparente de la composición se prefiere especialmente debido a que la forma transparente crea un impacto visual agradable en los consumidores. Por el término composición transparente o translúcida quiere decirse que la composición tiene un valor de turbidez de 0 a 200 unidades nefelométricas de turbidez (UNT), preferiblemente menos de 100 UNT, más preferiblemente menos de 10 UNT. La turbidez en unidades de UNT es tal como se mide usando un medidor de turbidez Turbiquant 1500T de Merck. La turbidez es la nubosidad o nebulosidad de un fluido provocada por la presencia de partículas individuales en suspensión (sólidas) o gotas (líquidas), que difieren en sus propiedades ópticas del fluido de suspensión. El grado de dispersión de un haz de luz por las partículas/gotas en suspensión se considera una medida significativa de turbidez. La turbidez medida de esta manera usa un instrumento llamado nefelómetro con la configuración de detector en el lado del haz de luz. La cantidad de luz que alcanza el detector es mayor si el grado de dispersión de las partículas en suspensión es mayor. Las unidades de turbidez de un nefelómetro calibrado se denominan unidades nefelométricas de turbidez (UNT). El grado de luz dispersada por las partículas/gotas en suspensión es una función de su concentración, tamaño, forma y propiedades ópticas relativas. De manera más importante, la forma de microemulsión de la composición de filtro solar de la invención se considera más estable que la forma de emulsión. En un aspecto preferido, las gotas de fase dispersa en la microemulsión están en el intervalo de tamaño de 4 a 100 nm, más preferiblemente en el intervalo de tamaño de 4 a 50 nm.

45 La composición de la invención comprende del 0,1 al 10% en peso de dibenzoilmetano o su derivado seleccionado de 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano, 2-metildibenzoilmetano, 4-metil-dibenzoilmetano, 4-isopropildibenzoilmetano, 4-terc-butildibenzoilmetano, 2,4-dimetildibenzoilmetano, 2,5-dimetildibenzoilmetano, 4,4'-diisopropildibenzoilmetano, 2-metil-5-isopropil-4'-metoxidibenzoilmetano, 2-metil-5-terc-butil-4'-metoxi-dibenzoilmetano, 2,4-dimetil-4'-metoxidibenzoilmetano o 2,6-dimetil-4-terc-butil-4'-metoxi-dibenzoilmetano. El derivado de dibenzoilmetano más preferido es 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano. El dibenzoilmetano o su derivado está presente preferiblemente en del 0,1 al 5%, más preferiblemente del 0,2 al 5%, aún más preferiblemente del 0,4 al 3% en peso de la composición.

55 La composición de la invención comprende del 10 al 40%, más preferiblemente del 10 al 30% en peso de un emulsionante, que es preferiblemente un surfactante, es decir, un agente tensioactivo, que reduce la tensión superficial cuando se disuelve en agua desde un valor de aproximadamente 72 dinas/cm<sup>2</sup> hasta menos de 10 dinas/cm<sup>2</sup>, más preferiblemente menos de 5 dinas/cm<sup>2</sup>. El emulsionante es un surfactante del tipo no iónico. El surfactante no iónico preferido para su uso en la presente invención se selecciona de monoetil éter de polietilenglicol (Brij), polisorbato (Tween), etoxilatos de alcohol o ésteres de polioxietileno de ácidos grasos. Se prefiere que el surfactante que actúe como el emulsionante en la presente invención tenga un valor de HLB mayor de 8.

60 La composición de la invención comprende del 5 al 40%, preferiblemente del 5 al 30% en peso de un coemulsionante seleccionado de alcohol de cadena lineal o ramificada C2 a C8, alcohol polihidroxilado o ácidos grasos de bajo peso molecular C5 a C8. Un coemulsionante más preferido se selecciona de alcoholes de cadena corta, dioles, polioles o ácidos grasos. Los coemulsionantes más preferidos son etanol, propanol, butanol, polietilenglicol, propilenglicol o ácido caprílico.

- La composición de la invención comprende del 10 al 50%, preferiblemente del 10 al 40% en peso de un líquido hidrófobo que tiene un valor de log P a 25 grados centígrados mayor de 3 y una solubilidad en agua a 25 grados centígrados menor del 0,1% en peso. Log P es una propiedad definida en el artículo de Hiroshi Chuman, Atsushi Mori y Hideji Tanaka, "Prediction of the 1-Octanol/H<sub>2</sub>O Partition Coefficient, Log P, by *Ab Initio* MO Calculations: Hydrogen-Bonding Effect of Organic Solutes on Log P", *Analytical Sciences*, septiembre de 2002, vol. 18, 1015-1020. El Log P es básicamente el coeficiente de reparto en 1-octanol/agua y se determina experimentalmente mediante el método de matraz de agitación.
- Los líquidos hidrófobos que tienen un valor de log P a 25 grados centígrados mayor de 3,0 y solubilidad en agua de 25 grados centígrados menor del 0,1% en peso, incluyen hidrocarburos para, por ejemplo, octanos, nonano, decano, dodecano, hexadecano, aceite de parafina; alcoholes por ejemplo, dodecanol, alcohol oleílico; ácidos para por ejemplo, ácido oleico; aldehídos para, por ejemplo, dodecanal, hexadecanal; cetonas para por ejemplo, metil nonil cetona; ésteres para por ejemplo, estearato de metilo, éster metílico del ácido eicosanoico, éster de ácido graso de palma; éteres para por ejemplo, diisopentil éter, dihexil éter, diheptil éter, dioctil éter, didecil éter. El líquido hidrófobo más preferido para su uso en la composición de la invención son hidrocarburos, alcoholes grasos de cadena media o larga, ésteres de alcoholes grasos, triglicéridos, ácidos grasos o aceites de silicona. Los líquidos hidrófobos más preferidos según la presente invención son LLPO (aceite de parafina líquida ligera), IPM (miristato de isopropilo), IPP (palmitato de isopropilo) o aceite de silicona.
- La solubilidad en agua a 25 grados centígrados del líquido hidrófobo es preferiblemente menor del 0,01% y más preferiblemente menor del 0,001% en peso.
- La composición comprende del 10 al 50%, preferiblemente del 10 al 40% en peso de agua. El uso de emulsionantes, coemulsionantes, líquido hidrófilo y agua se conoce bien para preparar microemulsiones. Sin embargo, el elemento sorprendente en la presente invención es que microemulsiones específicas y emulsiones específicas cercanas a los límites de microemulsión dan como resultado estabilidad potenciada de compuestos de dibenzoilmetano y sus derivados cuando están presentes en las mismas.
- La composición puede comprender adicionalmente otros filtros solares frente a UV-A o UV-B o bloqueadores solares para proporcionar una protección solar más completa. De éstos, al menos un filtro solar frente a UV-B y al menos un bloqueador solar inorgánico se incorporan habitualmente en una composición de filtro solar fotoprotectora. Un filtro solar frente a UV-B preferido es el ácido p-metoxicinámico o su derivado. Los derivados preferidos se seleccionan de p-metoxicinamato de 2-etilhexilo, p-metoxicinamato de amonio, p-metoxicinamato de sodio, p-metoxicinamato de potasio, o sales de aminas primarias, secundarias o terciarias del ácido p-metoxicinámico y más preferiblemente es p-metoxicinamato de 2-etilhexilo. Un aspecto altamente preferido de la invención proporciona la incorporación del 0,1% al 10%, más preferiblemente del 0,1 al 5% en peso de ácido p-metoxicinámico o su derivado. El derivado de ácido p-metoxicinámico más preferido es 4-metoxicinamato de 2-etilhexilo. La inclusión del derivado del ácido p-metoxicinámico es especialmente útil puesto que además de proporcionar la protección frente a UV-B conocida, la composición de emulsión o microemulsión líquida garantiza una mejor estabilidad del derivado de dibenzoilmetano en presencia del derivado del ácido p-metoxicinámico.
- Pueden usarse preferiblemente bloqueadores solares inorgánicos útiles en la presente invención. Estos incluyen, por ejemplo, óxido de zinc, óxido de hierro, sílice, tal como sílice pirogénica y dióxido de titanio.
- El dióxido de titanio ultrafino en cualquiera de sus dos formas, concretamente dióxido de titanio dispersable en agua y dióxido de titanio dispersable en aceite, es especialmente adecuado para la invención. El dióxido de titanio dispersable en agua es dióxido de titanio ultrafino, cuyas partículas no están recubiertas o que están recubiertas con un material para conferir una propiedad de superficie hidrófila a las partículas. Los ejemplos de tales materiales incluyen óxido de aluminio y silicato de aluminio.
- El dióxido de titanio dispersable en aceite es dióxido de titanio ultrafino, cuyas partículas presentan una propiedad de superficie hidrófoba, y que, para este propósito, pueden recubrirse con jabones de metal, tales como estearato de aluminio, laurato de aluminio o estearato de zinc, o con compuestos de organosilicona.
- Por "dióxido de titanio ultrafino" quiere decirse partículas de dióxido de titanio que tienen un tamaño de partícula primaria promedio en número de menos de 100 nm, preferiblemente 70 nm o menos, más preferiblemente desde 10 hasta 40 nm y lo más preferiblemente desde 15 hasta 25 nm. Mediante aplicación tópica a la piel de una mezcla de dióxido de titanio ultrafino dispersable en agua y dióxido de titanio ultrafino dispersable en aceite, puede lograrse una protección potenciada de manera sinérgica de la piel frente a los efectos dañinos de rayos tanto UV-A como UV-B.
- El dióxido de titanio ultrafino es el agente bloqueador solar inorgánico preferido según esta invención. La cantidad total de bloqueador solar que se incorpora preferiblemente en la composición según la invención es de desde el 0,1 hasta el 5% en peso de la composición.
- La composición según la invención también puede comprender otros diluyentes. Los diluyentes actúan como un dispersante o portador para otros materiales presentes en la composición, de modo que se facilite su distribución

cuando se aplica la composición a la piel.

Los diluyentes diferentes de agua pueden incluir emolientes líquidos o sólidos, disolventes, humectantes, espesantes y polvos. Ejemplos de cada uno de estos tipos de vehículo, que pueden usarse individualmente o como mezclas de uno o más vehículos, son tal como sigue:

emolientes, tales como alcohol estearílico, monorrucinoleato de glicerilo, aceite de visón, alcohol cetílico, isoestearato de isopropilo, ácido esteárico, palmitato de isobutilo, estearato de isocetilo, alcohol oleílico, laurato de isopropilo, laurato de hexilo, oleato de decilo, octadecan-2-ol, alcohol isocetílico, alcohol eicosanílico, alcohol behenílico, palmitato de cetilo, aceites de silicona tales como dimetilpolisiloxano, sebacato de di-n-butilo, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, estearato de isopropilo, estearato de butilo, polietilenglicol, trietilenglicol, lanolina, manteca de cacao, aceite de maíz, aceite de semilla de algodón, aceite de oliva, aceite de palmiste, aceite de colza, aceite de semilla de cártamo, aceite de onagra, aceite de soja, aceite de semilla de girasol, aceite de aguacate, aceite de semilla de sésamo, aceite de coco, aceite de cacahuete, aceite de ricino, alcoholes de lanolina acetilados, vaselina, aceite mineral, miristato de butilo, ácido isoestearico, ácido palmítico, linoleato de isopropilo, lactato de laurilo, lactato de miristilo, oleato de decilo, miristato de miristilo;

disolventes, tales como alcohol etílico, isopropanol, acetona, monoetil éter de etilenglicol, monobutil éter de dietilenglicol, monoetil éter de dietilenglicol;

polvos, tales como creta, talco, tierra de batán, caolín, almidón, gomas, sílice coloidal, poliacrilato de sodio, esmectitas de tetraalquil y/o trialquilarilamonio, silicato de aluminio y magnesio químicamente modificado, arcilla de montmorillonita orgánicamente modificada, silicato de aluminio hidratado, sílice pirogénica, polímero de carboxivinilo, carboximetilcelulosa sódica, monoestearato de etilenglicol.

La base cosméticamente aceptable es habitualmente de desde el 10 hasta el 99,9%, preferiblemente desde el 50 hasta el 99% en peso de la composición, y puede, en la ausencia de otros agentes auxiliares cosméticos, formar el resto de la composición.

La composición de la invención puede comprender una base desodorante convencional como el portador cosméticamente aceptable. Por un desodorante quiere decirse un producto de medio de tipo *roll-on* o propulsor, que se usa para un beneficio desodorante personal, por ejemplo, la aplicación en la axila o cualquier otra zona, que puede contener o no agentes activos antitranspirantes.

Las composiciones desodorantes pueden estar generalmente en forma de geles, cremas y líquidos y se dispensan usando aplicadores apropiados para las características físicas de la composición.

Las composiciones desodorantes que se administra a través de productos de tipo *roll-on*, generalmente comprenden un portador líquido. Tal portador líquido puede ser hidrófobo o comprender una mezcla de líquidos tanto hidrófilos como hidrófobos. Pueden estar en forma de una emulsión o una microemulsión. El portador líquido o mezcla de portadores constituye frecuentemente desde el 30 hasta el 95% en peso de la composición y en muchos casos desde el 40 hasta el 80%.

Las composiciones antitranspirantes/desodorantes para el cuidado de la piel de la invención pueden incluir además sales de metales antitranspirantes bien conocidas de aluminio, zinc, zirconio y mezclas de aluminio y zirconio de sulfatos, cloruros, clorohidróxidos, tetraclorohidrex-glicinatos, alumbres, formiatos, lactatos, bencilsulfonatos, succinatos, sulfonatos de fenol y similares. Los niveles normales de agente antitranspirante/desodorante son desde aproximadamente el 0% hasta aproximadamente el 35%, preferiblemente desde aproximadamente el 0% hasta aproximadamente el 25% en peso de la composición. La composición puede incluir además un agente complejante, tal como un ácido orgánico o derivado del mismo que pueda formar complejos con la sal metálica antitranspirante. Los ejemplos de tales agentes complejantes incluyen, pero no se limitan a ácido acético, ácido propiónico, ácido oxálico, ácido malónico, ácido succínico, ácido tartárico, glicina y similares junto con sus sales cosméticamente aceptables. Los niveles normales de agente complejante son desde aproximadamente el 0% hasta aproximadamente el 15%, preferiblemente desde aproximadamente el 0% hasta aproximadamente el 10%, en peso de la composición.

Las composiciones de la presente invención pueden comprender una amplia gama de otros componentes opcionales. El CFTA Cosmetic Ingredient Handbook, segunda edición, 1992, que se incorpora como referencia en el presente documento en su totalidad, describe una amplia variedad de componentes cosméticos y farmacéuticos no limitativos usados comúnmente en la industria para el cuidado de la piel, que son adecuados para su uso en las composiciones de la presente invención. Los ejemplos incluyen: antioxidantes, aglutinantes, aditivos biológicos, agentes tamponantes, colorantes, espesantes, polímeros, astringentes, fragancia, humectantes, agentes opacificantes, acondicionadores, agentes exfoliantes, agentes de ajuste del pH, conservadores, extractos naturales, aceites esenciales, agentes refrescantes de la piel, agentes calmantes de la piel y agentes de cicatrización de la piel.

La invención se describe ahora adicionalmente por medio de los siguientes ejemplos no limitativos.

**Ejemplos**

5 Ejemplos 1 y 2: Estabilidad de composiciones de filtro solar de la invención en comparación con la composición convencional

Se prepararon una composición de filtro solar convencional (ejemplo 1) y una composición según la invención (ejemplo 2).

10 La composición del ejemplo 1, en forma de una crema, se facilita en la tabla 1. Se preparó la composición de crema según el siguiente proceso.

15 Se pesó una fase acuosa, que comprendía agua, glicerina, hidróxido de potasio y dióxido de titanio, y se calentó hasta una temperatura en el intervalo de 72 a 75°C con agitación constante usando un baño de agua. En un recipiente lateral 1, se cargó ácido histéarico y se calentó hasta 75°C para su fusión. En un recipiente lateral 2, se pesó la fase oleosa que comprendía alcohol cetílico, fenoxietanol, miristato de isopropilo, aceite de silicona y Parsol 1789, y se calentó hasta 75°C. Se añadió el ácido histéarico fundido a agua a una temperatura de 75°C y se homogeneizó el sistema durante de 3 a 5 minutos usando un mezclador Silverson. Se añadió entonces la fase oleosa del recipiente lateral 2 y se homogeneizó de nuevo durante de 2 a 4 minutos. Luego se enfrió la emulsión hasta la temperatura ambiente (aproximadamente 25°C) con mezclado lento hasta que se obtuvo la viscosidad requerida.

Componente	% en peso
Glicerina	1,00
Acido histérico	18,00
Hidróxido de potasio	0,67
Alcohol cetílico	0,53
Parsol 1789	0,40
Fenoxietanol	0,20
Miristato de isopropilo	0,75
Aceite de silicona	0,50
Dióxido de titanio	0,90
Agua	Hasta 100

25 La composición del ejemplo 2 se facilita en la tabla 2. La composición está en forma de una microemulsión transparente líquida. Se preparó la composición de microemulsión según el siguiente proceso.

30 Para preparar la microemulsión, se disolvió en primer lugar el filtro solar en el líquido hidrófobo en un vaso de precipitados usando un agitador magnético. A continuación se añadieron al vaso de precipitados cantidades pesadas del emulsionante y el coemulsionante. Finalmente, se añadió al sistema la cantidad requerida de agua. Se mezclaron los componentes o bien mediante agitación suave (manualmente o usando un agitador magnético) para obtener una microemulsión transparente.

Componente	% en peso
Miristato de isopropilo (líquido hidrófobo)	14,00
Brij 35 (emulsionante)	28,00
1-butanol (coemulsionante)	28,00
Parsol 1789	0,40
Agua	Hasta 100

35 Se midió la estabilidad de la formulación usando el siguiente método.

Se midió la estabilidad de las formulaciones usando el instrumento SPF-290S (Optometrics Corporation).

Se usó una cinta Transpore (3M) como sustrato para valorar la estabilidad de todas las formulaciones. Se estiró la

## ES 2 592 958 T3

cinta Transpore sobre un portamuestras y se aplicaron 2 mg/cm<sup>2</sup> de muestra sobre la misma, distribuida uniformemente como pequeños puntos usando una jeringa. Usando parafina como dedil, se extendió la muestra sobre la cinta Transpore barriendo uniformemente de manera alterna, vertical y horizontalmente según el protocolo proporcionado por los fabricantes de los instrumentos. Se permitió que la película se secase durante quince minutos.

- 5 Después de los quince minutos, se expuso la placa de muestra a una lámpara UV y se realizó una exploración de transmitancia basada en el tiempo. Esta exploración facilita la transmitancia a través del intervalo de longitud de onda para una muestra dada en un solo punto. Se expuso la mancha de manera continua a la lámpara UV y se tomaron las exploraciones de transmitancia a intervalos de cinco minutos. La transmitancia a 360 nm corresponde a la longitud de onda específica de Parsol 1789. Se registraron los valores de transmitancia a 360 nm y se usaron para  
10 obtener el porcentaje de Parsol 1789 restante en el sistema, usando la fórmula:

$$\% \text{ restante} = \frac{100 - T360_t}{100 - T360_{\text{inicial}}} \times 100$$

- 15 Se obtuvo la exploración de transmitancia de referencia usando una placa de blanco, sin muestra sobre la cinta Transpore.

Los datos en porcentaje de Parsol 1789 restante después de la exposición a radiación UV para los ejemplos 1 y 2 se muestran en la tabla 3.

Tiempo, minutos	% Parsol 1789 restante	
	Ejemplo 1	Ejemplo 2
0	100	100
10	74,4	90,0
20	67,0	78,4
25	64,8	72,7

- 20 Los datos en la tabla 3 indican que el filtro solar frente a UV-A en una composición según la invención (ejemplo 2) es más estable a lo largo del transcurso temporal en comparación con una composición convencional (ejemplo 1).

25 Ejemplos 3 a 7: Estabilidad de composiciones de filtro solar (que también contienen filtros solares frente a UVB) de la invención en comparación con una composición convencional

Se prepararon otras diversas composiciones de microemulsión de filtro solar según los ejemplos de invención (4 a 7) y se compararon con una composición de crema convencional (ejemplo 3). En todos los ejemplos 3 a 7, se incluyó un filtro solar frente a UVB (Parsol MCX) además de un filtro solar frente a UVA (Parsol 1789).

- 30 La composición del ejemplo 3 es tal como se muestra en la tabla 4. Se preparó esta composición usando un proceso similar al del ejemplo 1.

Componente	% en peso
Glicerina	1,00
Acido histérico	18,00
Hidróxido de potasio	0,67
Alcohol cetílico	0,53
Parsol 1789	0,40
Parsol MCX	0,75
Fenoxietanol	0,20
Miristato de isopropilo	0,75
Aceite de silicona	0,50
Dióxido de titanio	0,90
Agua	Hasta 100

- 35 Las composiciones de los ejemplos 4 a 7 se muestran en la tabla 5.

## ES 2 592 958 T3

	Ejemplo 4	Ejemplo 5	Ejemplo 6	Ejemplo 7
Componente	Componente, %p	Componente, %p	Componente, %p	Componente, %p
Emulsionante	Brij 97, 18,00	AOT, 14,00	C <sub>12</sub> EO <sub>3</sub> , 34,50	Brij 35, 28,00
Líquido hidrófobo	IPP, 31,30	IPP, 56,52	LLPO, 34,50	IPM, 14,00
Coemulsionante	1-butanol, 18,00	1-butanol, 7,73	IPA, 15,00	1-butanol, 28,00
Parsol 1789	0,40	0,40	0,40	0,40
Parsol MCX	0,75	0,75	0,75	0,75
Agua	Hasta 100	Hasta 100	Hasta 100	Hasta 100

En la tabla anterior, se usaron las siguientes notaciones:

- 5 IPP – palmitato de isopropilo  
 Brij 97 es un surfactante de la clase del monoetil éter de polietilenglicol no iónico  
 AOT es un surfactante de la clase aniónica y significa Aerosol OT, que es di-2-etilhexil-sulfosuccinato de sodio  
 C12EO3 (dodecil éter de trioxietileno) es un surfactante de la clase de etoxilatos de alquilo no iónicos  
 LLPO es aceite de parafina líquida ligera  
 10 IPA es alcohol isopropílico  
 IPM es miristato de isopropilo

Se prepararon las composiciones de microemulsión transparentes líquidas de los ejemplos 4 a 7 usando un proceso similar al usado para preparar el ejemplo 2.

- 15 Se midió la estabilidad de las composiciones para los ejemplos 3 a 7 usando el método descrito para los ejemplos 1 y 2.

- 20 Los datos en porcentaje de Parsol 1789 restante después de la exposición a radiación UV para los ejemplos 3 a 7 se muestran en la tabla 6.

Tiempo, minutos	% Parsol 1789 restante				
	Ejemplo 3	Ejemplo 4	Ejemplo 5	Ejemplo 6	Ejemplo 7
0	100	100	100	100	100
10	64,9	88,1	90,1	96,0	96,9
20	55,1	75,3	81,3	86,1	89,8
30	51,1	66,5	74,4	74,7	81,8

- 25 Los datos en la tabla 6 indican que el filtro solar frente a UV-A en composiciones según la invención (ejemplos 4 a 7) es más estable a lo largo del tiempo en comparación con una composición convencional (ejemplo 3). Además, se examinaron las composiciones de microemulsión de los ejemplos 4 a 7 y se encontró que eran claras y transparentes a simple vista, confirmando así que los tamaños de gota en las mismas son más pequeños que 100 nanómetros.

### 30 Ejemplos 8 y 9: Comparación de composiciones de microemulsión en comparación con composiciones de emulsión

Se prepararon las composiciones de emulsión (ejemplos 8 y 9), que se muestran en la tabla 7, en las que las composiciones de composiciones de microemulsión correspondientes (ejemplos 7 y 4) también son reiteradas. Por las microemulsiones correspondientes quiere decirse que las composiciones están próximas en el diagrama de fases.

35

	Ejemplo 7	Ejemplo 8	Ejemplo 4	Ejemplo 9
Componente	Componente, %p	Componente, %p	Componente, %p	Componente, %p
Emulsionante	Brij 35, 28,00	Brij 35, 25,50	Brij 35, 18,00	Brij 35, 15,00
Líquido hidrófobo	IPM, 14,00	IPM, 18,00	IPM, 31,30	IPM, 32,00
Coemulsionante	1-butanol, 28,00	1-butanol, 25,50	1-butanol, 18,00	1-butanol, 15,00

Parsol 1789	0,40	0,40	0,40	0,40
Parsol MCX	0,75	0,75	0,75	0,75
Agua	Hasta 100	Hasta 100	Hasta 100	Hasta 100

Se midió el % de transmitancia de las diversas composiciones enumeradas en la tabla 7 usando un procedimiento tal como se describe más adelante.

- 5 Se realizaron las mediciones de transmitancia usando un instrumento SPF-290S (Optometrics Corporation). Se usó una cinta Transpore (3M) como sustrato para valorar la estabilidad de todas las formulaciones. Se estiró la cinta Transpore sobre un portamuestras y se aplicaron 2 mg/cm<sup>2</sup> de una muestra en la misma, distribuida uniformemente como pequeños puntos usando una jeringa. Usando parafina como dedil, se extendió la muestra sobre la cinta Transpore barriendo uniformemente de manera alterna, vertical y horizontalmente según el protocolo proporcionado por los fabricantes de instrumentos. Se permitió que la película se secase durante quince minutos. Después de los 10 quince minutos, se expuso la placa de muestra a una lámpara UV y se realizó una exploración de transmitancia. Esta exploración facilita la transmitancia en función de la longitud de onda para una muestra dada. Para una sola placa, el instrumento explora seis puntos diferentes. Se notificó lo mismo para 2 placas más. Los datos notificados son por tanto un promedio de 18 lecturas.

- 15 Se obtuvo exploración de transmitancia de referencia usando una placa de blanco, sin muestra sobre la cinta Transpore. Los datos en % de transmitancia a lo largo de un amplio intervalo de longitud de onda (290 a 400 nm) se muestran en las figuras 1 y 2. Los datos indican que el % de transmitancia de composiciones de microemulsión de la invención (ejemplos 7 y 4) es menor en comparación con composiciones de emulsión de la invención (ejemplos 8 y 9), proporcionando por tanto mejor fotoprotección.

Ejemplos 10 a 12: Estabilidad de composiciones de filtro solar dentro de la invención en comparación con aquellas fuera de la invención

- 25 Se prepararon las composiciones tal como se muestran en la tabla 8 y se midió la transmitancia de las diversas composiciones de manera similar a la de las composiciones 7 a 9. Se midieron los datos a tiempo cero y después de 30 minutos de exposición a radiación UV. Los datos en % de transmitancia se muestran en la tabla 8.

	Ejemplo 10	Ejemplo 11	Ejemplo 12
Componente	%p	%p	%p
Emulsionante, Brij-35	28,50	15,00	5,00
Líquido hidrófobo, IPM	14,00	18,00	18,00
Coemulsionante, 1-butanol	28,00	25,50	25,50
Parsol 1789	1,20	1,20	1,20
Parsol MCX	2,25	2,25	2,25
Agua	Hasta 100	Hasta 100	Hasta 100
% de transmitancia, tiempo cero	13,4	35,1	71,3
% de transmitancia, 30 minutos	29,2	43,4	78,4

- 30 Los datos en la tabla 8 indican que composiciones dentro de la invención (ejemplos 10 y 11), que tienen una concentración de emulsionante dentro del intervalo reivindicado proporcionan buena fotoprotección (bajos valores de % de transmisión) en comparación con una composición fuera de la invención (ejemplo 12, que tiene una concentración de emulsionante menor que el intervalo reivindicado).

**REIVINDICACIONES**

1. Composición de filtro solar fotoestable en un formato de microemulsión con gotas de fase dispersa en el intervalo de tamaño de 4 a 100 nm, comprendiendo la composición de filtro solar fotoestable:
- 5 del 0,1% al 10% en peso de dibenzoilmetano o su derivado,
- del 10 al 40% en peso de un emulsionante,
- 10 del 5 al 40% en peso de un coemulsionante seleccionado del grupo que consiste en alcohol de cadena lineal o ramificada C2 a C8, alcohol polihidroxilado y ácido graso de bajo peso molecular C5 a C8,
- del 10 al 50% en peso de un líquido hidrófobo que tiene un valor de log P a 25 grados centígrados mayor de 3 y una solubilidad en agua a 25 grados centígrados menor del 0,1% en peso, y
- 15 del 10 al 50% en peso de agua;
- en la que dicho emulsionante es un surfactante no iónico;
- 20 en la que el derivado de benzoilmetano se selecciona de 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano, 2-metildibenzoilmetano, 4-metil-dibenzoil-metano, 4-isopropildibenzoil-metano, 4-terc-butildibenzoilmetano, 2,4-dimetildibenzoilmetano, 2,5-dimetildibenzoilmetano, 4,4'-diisopropil-dibenzoilmetano, 2-metil-5-isopropil-4'-metoxidibenzoilmetano, 2-metil-5-terc-butil-4-metoxi-dibenzoilmetano, 2,4-dimetil-4'-metoxi-dibenzoilmetano o 2,6-dimetil-4-terc-butil-4'-metoxi-dibenzoilmetano.
- 25 2. Composición según la reivindicación 1, en la que dicho surfactante no iónico se selecciona del grupo que consiste en monoetil éter de polietilenglicol, polisorbato, etoxilatos de alcohol y ésteres de polioxietileno de ácido graso.
- 30 3. Composición según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, que comprende del 10 al 30% en peso de emulsionante.
4. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho coemulsionante se selecciona del grupo que consiste en etanol, propanol, butanol, polietilenglicol, propilenglicol y ácido caprílico.
- 35 5. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que comprende del 5 al 30% en peso de coemulsionante.
6. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho líquido hidrófobo se selecciona del grupo que consiste en hidrocarburos, alcoholes grasos, ésteres de alcoholes grasos, triglicéridos o
- 40 ácidos grasos y aceites de silicona.
7. Composición según la reivindicación 6, en la que dicho líquido hidrófobo se selecciona del grupo que consiste en aceite de parafina líquida ligera, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo y aceite de silicona.
- 45 8. Composición según la reivindicación 1, en la que la microemulsión está en una forma líquida transparente.
9. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que el derivado de dibenzoilmetano es 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano.
- 50 10. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que comprende del 0,1% al 10% en peso de ácido p-metoxicinámico o su derivado.
11. Composición según la reivindicación 10, en la que dicho derivado del ácido p-metoxicinámico es 4-metoxicinamato de 2-etil-hexilo.

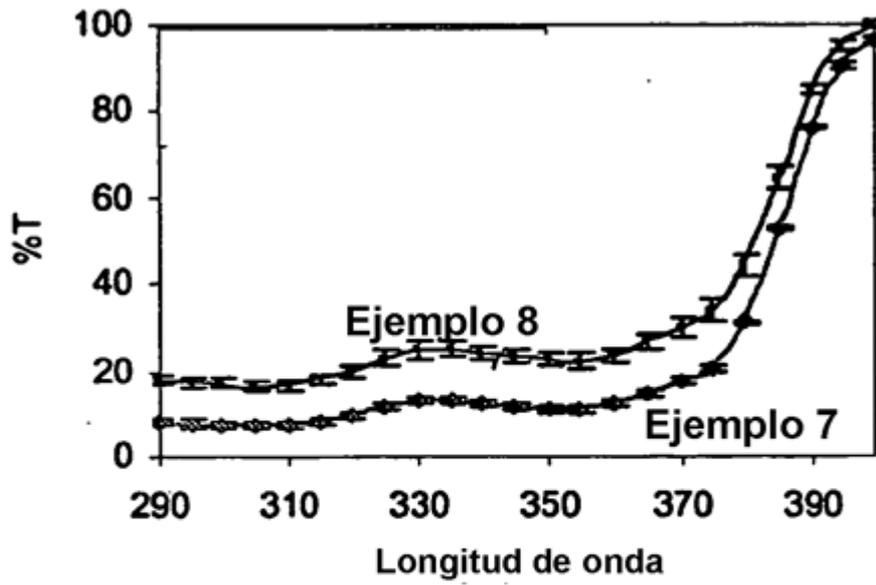


Figura 1

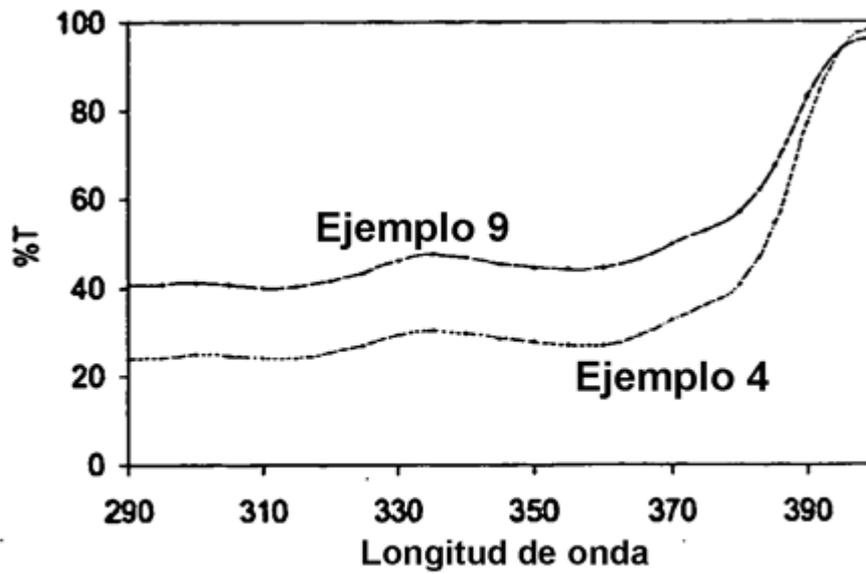


Figura 2