

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 596 507**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/35** (2006.01)

**A61K 8/37** (2006.01)

**A61K 8/04** (2006.01)

**A61K 8/81** (2006.01)

**A61Q 17/04** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.02.2004 PCT/AU2004/000170**

87 Fecha y número de publicación internacional: **26.08.2004 WO04071479**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.02.2004 E 04710305 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **27.07.2016 EP 1594454**

54 Título: **Espuma hidroalcohólica formadora de película**

30 Prioridad:

**12.02.2003 US 447445 P**

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

**10.01.2017**

73 Titular/es:

**STIEFEL RESEARCH AUSTRALIA PTY LTD  
(100.0%)  
1061 Mountain Highway  
Boronia 3155, AU**

72 Inventor/es:

**HUGGINS, JOAN KATHLEEN y  
HOULDEN, ROBERT JAMES**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 596 507 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**

Espuma hidroalcoholica formadora de película

**Antecedentes de la Invención**

5 Se conoce bien la liberación tópica de compuestos activos. Desgraciadamente, muchas de las formulaciones que se administran de forma tópica no son a prueba de agua o resistentes al agua. Así, cuando se aplican estos agentes activos a la piel y se exponen a la humedad, la mayoría de los agentes activos frecuentemente se quitan lavándose de la piel, lo que reduce su efectividad.

10 Existen diferentes retos en la aplicación tópica de los agentes activos. Por ejemplo, la aplicación de los agentes activos debería ser fácil y agradable. Sin embargo, en algunos casos, la composición debe permanecer dentro del área aplicada durante un periodo prolongado, aun cuando se exponen a la humedad, para proporcionar una cantidad relativamente constante del agente activo dentro del área aplicada.

15 Las formulaciones resistentes al agua o muy resistentes al agua de sistemas de administración tópica son especialmente deseables porque eliminan la necesidad de una reaplicación después de la exposición al agua del área aplicada, como después de nadar, bañar o transpiración excesiva. Esto es particularmente apropiado para los productos de filtro solar.

20 Los productos de filtro solar proporcionan protección a la piel humana contra los daños producidos por la luz ultravioleta. Están disponibles productos con diferentes valores del factor de protección solar (FPS), permitiendo elegir así a los consumidores la cantidad de protección deseada. Aunque está disponible una amplia variedad de productos de filtro solar, se desean especialmente los filtros solares "resistentes al agua" o "muy resistentes al agua" debido a que eliminan la necesidad de la reaplicación después de nadar, bañar o por la transpiración excesiva. Generalmente las formulaciones de filtro solar "resistentes al agua" pueden aguantar al menos aproximadamente 40 minutos de inmersión en el agua sin la pérdida significativa del FPS, sin embargo las formulaciones de filtro solar "muy resistentes al agua" pueden aguantar al menos aproximadamente 80 minutos de inmersión en el agua sin la pérdida significativa del FPS.

25 Idealmente, los productos de filtro solar deben ser estables y ser fáciles de aplicar, y proporcionar una consistencia aceptable así como una sensación agradable en la piel. Los anteriores factores son importantes para lograr una distribución consistente sobre la piel, aun la protección solar, junto con la aceptación del consumidor y la disponibilidad comercial, son en gran parte funciones del vehículo que lleva los agentes de filtro solar.

30 El documento US 4.567.038 describe un mousse de protección solar, que es adecuado para su uso en la prevención del blanqueo del cabello por la luz solar. El mousse comprende un agente filtro solar, un tensioactivo catiónico y un polímero formador de película. La composición comprende agua, junto con 2 a 15 % de alcohol (por ejemplo, etanol). Un agente formador de película preferido es copolímero de acetato de vinilo/vinilpirrolidona (PVP/VA).

35 El documento US 5.204.090 describe composiciones de protección solar resistentes al agua que comprenden un copolímero insoluble en agua de acrílico carboxilado, un éter de polioxipropileno de un alcohol de cadena lineal o ramificada, un alcohol, y un componente de filtro solar. La referencia describe composiciones de gel de "alto" contenido en alcohol, por ejemplo los Ejemplos 1-7 ilustran composiciones de gel que tienen más de 50 % de etanol.

40 El documento WO 97/03559 describe composiciones de pulverización de protección solar que comprenden un polímero formador de película solubilizado por neutralización parcial con una base o emulsificación con emulsionantes apropiados. Un polímero formador de película en particular según el documento WO 97/03559 es el poli(éster monobutílico de metil vinil éter de ácido maleico). Las composiciones comprenden un medio de agua/alcohol

45 Por las anteriores razones, claramente se desea formular un vehículo tópico que es capaz de proveer una consistencia aceptable, buena sensación en la piel y estabilidad, y sea fácil de usar y aplicar los agentes de filtro solar, y por medio de esto lograr el carácter resistente al agua y altos valores de FPS. La presente invención cumple tales necesidades.

**Sumario de la invención**

La presente invención provee una composición en un recipiente presurizado para formar una espuma hidroalcohólica, comprendiendo dicha composición:

- 50 un componente de filtro solar;  
 un polímero formador de película insoluble en agua que es un copolímero acrílico carboxilado insoluble en agua;  
 un agente espumante hidroalcohólico que comprende un alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> presente en una cantidad de 5 % a 40 % en peso de la composición, agua, cera y tensioactivo;  
 y un propelente en aerosol.  
 y en la que dicha composición forma una espuma cuando se libera desde el recipiente y en la que un porcentaje

de los grupos de ácido carboxílico que están presentes en el copolímero acrílico carboxilado insoluble en agua se neutralizan y el porcentaje de neutralización es de entre 3 % y 35 %.

Ventajosamente, la espuma hidroalcohólico de la presente invención es útil para aplicación tópica, ya que es fácil de aplicar.

- 5 Preferiblemente, el componente de filtro solar comprende al menos un filtro solar UVB y/o al menos un filtro solar UVA.

Cuando se aplica a la piel, el polímero insoluble en agua forma una película delgada de una barrera resistente al agua, preferentemente muy resistente al agua. De esta manera, el componente de filtro solar permanece dentro del área de piel aplicada aun cuando esté húmeda.

- 10 Preferentemente la cantidad de agua presente en la composición es mayor que la cantidad de alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

Estos y otros objetivos, realizaciones y ventajas se volverán más aparentes con referencia a la descripción detallada que sigue.

### **Descripción detallada de la invención**

#### **1. Definiciones**

- 15 A menos que de otra forma requiera el contexto, los términos “agente activo”, “compuesto activo” y “componente activo” se usan intercambiamente en la presente y se refieren a una sustancia que tiene un efecto cosmético, farmacéutico, farmacológico o terapéutico.

A menos que se indique de otra forma, una composición “resistente al agua” incluye una composición “muy resistente al agua”.

- 20 A menos que se indique de otra forma, todos los porcentajes citados en la presente están en porcentajes en peso, basados en el peso de la composición total excluyendo el propelente.

A menos que se indique de otra forma “comprende/que comprende” y las variaciones gramáticas de estos cuando se usan en esta especificación se toman para especificar la presencia de las características declaradas, totalidad, pasos o componentes o grupos de estos, pero no excluyendo la presencia o adición de una o más características, totalidad, pasos, componentes o grupos de estos.

- 25

Todas las revelaciones referidas en la presente se incorporan como referencia.

#### **II. General**

- 30 La presente invención provee diferentes composiciones de espuma de administración tópica para componentes de filtro solar. En particular, las composiciones de la presente invención se dirigen a composiciones de espuma de administración tópica resistente al agua, preferentemente muy resistente al agua que comprende un componente de filtro solar. Se logra una propiedad de resistencia al agua del componente de filtro solar al aplicar la composición de espuma a un área tópica deseada, por ejemplo, la piel, la cual después forma una película delgada de una capa resistente al agua. Las composiciones de la presente invención están contenidas en un recipiente presurizado. Cuando la composición se surte desde el recipiente, ésta forma una estructura de espuma. La acción de frotación o remoción de la aplicación de la espuma rompe la estructura de espuma dejando una película resistente al agua de componente de filtro solar.

- 35

En particular, la composición que está contenida dentro del recipiente presurizado comprende: al menos un componente de filtro solar; un polímero formador de película insoluble en agua; un agente espumante hidroalcohólico; y un propelente en aerosol. La cantidad de cada uno de estos componentes puede variar dependiendo de la amplia variedad de factores, como las características deseables de la espuma, el grado de resistencia al agua, y las similares.

- 40

Típicamente, el recipiente presurizado es cualquier recipiente que tiene una resistencia mecánica suficiente para soportar la presión. El recipiente generalmente se acondiciona con una válvula, por ejemplo, una válvula verticalmente recta o invertida, y un dispensador accionador de espuma convencional.

- 45 Además, la presente invención proporciona diferentes aspectos relacionados con las composiciones, incluyendo los procedimientos para proteger la piel de un sujeto de la luz ultravioleta y el uso de las composiciones para proteger la piel contra los efectos negativos de la luz ultravioleta.

En ciertas realizaciones preferidas, las composiciones de la presente invención son emulsiones. En estos casos, aceite es preferentemente el líquido disperso (la fase discontinua) y la solución hidroalcohólica es la fase continua. Típicamente, el aceite en emulsiones hidroalcohólicas son difíciles de estabilizar. Por lo tanto, una ventaja de esta invención es una película hidroalcohólica estable tal como una espuma hidroetanólica y más preferentemente una

- 50

espuma que forma una película hidroalcohólica estable.

### III. Agentes activos

La composición comprende un componente de filtro solar.

5 En una realización, la composición comprende una mezcla de un componente de filtro solar y un agente farmacéutico sensible a la luz, por ejemplo, un compuesto antibiótico.

10 En ciertos aspectos preferidos, el componente de filtro solar es un fármaco sensible a la luz tal como un antibiótico (por ejemplo, amikacina, amoxicilina augmentine, ampicilina, cefazolina, cefoxitina, ceftazidima, ceftiofur, cefalotina, enrofloxacin, florfenicol, gentamicina, imipenem, kanamicina, sarafloxacin, tetraciclina, tecarcilina y tilmicosin) un antimicótico u otros activos farmacéuticos sensibles a la luz tal como tretinoína, isotretinoína, sulfacetamida de sodio, calcipotrieno e hidroquinona. Aquellas personas con experiencia en la técnica conocerán otros agentes activos sensibles a la luz adecuados para su uso en la presente invención.

15 El componente de filtro solar protege de la luz solar a los agentes farmacéuticos sensibles a la luz. Sin embargo, la propiedad de resistencia al agua permite al sujeto dedicarse a actividades a la intemperie, por ejemplo, nadar y otras actividades físicas, que pueden provocar transpiración, sin que el componente de filtro solar y el agente farmacéutico sensible a la luz se quiten lavándose.

20 La expresión "componente filtro solar" como se usa en el presente documento incluye los compuestos bloqueadores de rayos ultravioleta usados habitualmente. Preferentemente, el componente de filtro solar comprende al menos un filtro solar de rayos UVB y/o al menos un filtro solar UVA. Más preferentemente, el componente de filtro solar comprende al menos un filtro solar UVB y al menos un filtro solar UVA. Como se espera, la combinación de los filtros solares de rayos UVB y UVA proporciona un amplio espectro de protección de los rayos UV. Una discusión más detallada de los agentes de filtro solar útiles en esta invención se proporciona por Roelandts y col., "A Survey of Ultraviolet Absorbers in Commercially Available Sun Products", Int. J. Dermatol., Vol. 22, pp. 247-255 (May, 1983).

25 En otra realización, el componente de filtro solar se selecciona preferentemente del grupo que consiste en: ácido aminobenzoico (ácido 4-aminobenzoico); Avobenzona (4-terc-butil-4-metoxidibenzoilmetano); benzofenona-2 (bis(2,4-dihidroxiifenil)metanona); benzofenona-3 (oxibenzona); benzofenona-4 (sulisobenzona); benzofenona-5 (sulisobenzona de sodio); benzofenona-8 (dioxibenzona); benciliden camfor (3-(4-metilbenciliden)-d-1camfor); cinoxato; ecamsule (ácido sulfónico de tereftaliliden dicamfor); ácido etil 4-aminobenzoico etoxilado (PEG25 PABA); homosalato (salicilato de homometilo); isoamilmetoxicinamato (isopentenil-4-metoxicinamato); salicilato de isopropilbencilo; antranilato de mentilo (2-aminobenzoato de metilo); Mexoryl XL (fenol, 2-(2h—benzotriazol-2-il)-4-metil-6[2-metil-3-[1,3,3,3-tetrametil-1-[(trimetilsilil)oxi]disiloxanil]propil]octil dimetilo PABA; octinoxato (metoxicinamato de octilo); salicilato de octilo (salicilato de 2-etilhexilo); octocrileno (ácido 2-ciano-3,3-difenil acrílico, 2-etil hexil éster); octil trizona (2,4,6-trianalino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'oxi)1,3,5-triazina); padimato o (4-dimetilaminobenzoato de 2-etilhexilo); ácido fenilbencimidazol sulfónico (ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico) y sus sales de potasio, sodio y trietanolamina; metilsulfato de n,n,n-trimetil-4-(oxoborn-3-ilidenmetil)anilinio; sales de ácido salicílico (potasio, sodio y trietanolamina); Tinosob M (2,2'-metilen-bis-6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(tetrametil-butyl)-1,1,3,3-fenol); dióxido de titanio; salicilato de trietanolamina; óxido de cinc; y mezclas de los mismos.

35 En una realización, el componente de filtro solar se selecciona del grupo que consiste en octinoxato, oxibenzona, metoxidibenzoilmetano de butilo, y una mezcla de los mismos.

40 La naturaleza y la cantidad del componente de filtro solar presente en la composición generalmente afectan el factor de protección solar (FPS) de la composición. Así, es posible un amplio intervalo de FPS en composiciones de la presente invención. Típicamente, sin embargo, la cantidad de un filtro solar particular se determina por el FPS deseado. Como tal, puede lograrse el FPS tan bajo como dos (2) y tan alto como 45 o mayor al ajustar la cantidad de filtro solar presente en la composición. Generalmente, sin embargo, los filtros solares que tiene FPS de aproximadamente 15 o aproximadamente 30 son los más comúnmente usados. Sin embargo, debería apreciarse que las composiciones de protección solar de la presente invención no se limitan a ningún valor de FPS en particular.

45 El componente de filtro solar también puede usarse como un agente para proteger los fármacos sensibles a la luz. Por lo tanto, en una realización, la presente invención proporciona una combinación de un agente activo sensible a la luz y un agente activo de filtro solar.

50 Como se ha indicado anteriormente, la cantidad de componente de filtro solar presente en las composiciones de la presente invención varía dependiendo del (los) componente(s) de filtro solar particular elegido(s) y el FPS deseado. Sin embargo, típicamente, las composiciones de la presente invención comprenden desde aproximadamente 1 a alrededor de 30 % en peso de la composición total en el recipiente, incluyendo el propelente. Preferentemente, la cantidad del componente de filtro solar presente en las composiciones de la presente invención es desde aproximadamente 5 a alrededor de 40 %. Alternativamente, al menos alrededor de 5 %, preferentemente al menos aproximadamente 10 %, del componente de filtro solar está presente en composiciones de la presente invención. La cantidad de filtro solar referido en la presente se refiere a la cantidad total de todos los compuestos de filtro solar que

están presentes en las composiciones de la presente invención. Como tal, para una composición que comprende una mezcla de compuestos de filtro solar, la cantidad de cada uno de los componentes de filtro solar puede variar significativamente dependiendo de las propiedades físicas y químicas así como también el FPS deseado.

#### IV. Polímero formador de película insoluble en agua

5 Típicamente, el polímero formador de película insoluble en agua es preferentemente un copolímero acrílico carboxilado. Se sabe que son útiles en esta invención los copolímeros acrílicos carboxilados insolubles en agua incluyen aquellos vendidos por la National Starch and Chemical Corporation bajo los nombres comerciales "Dermacryl", "Amphomer" y "Versacryl" (copolímero de acrilatos/octilacrilamida) (CFTA). Se prefiere particularmente el copolímero acrílico carboxilado el copolímero sólido vendido bajo el nombre comercial "Dermacryl-79", que provee satisfactoria propiedades de resistencia al agua y/o muy resistente al agua. Además "Amphomer", o "copolímero de octilacrilamida/acrilato/metacrilato de butilaminoetilo", un polímero formado de octilacrilamida, metacrilato de t-butilaminoetilo y dos o más monómeros de ácido acrílico, ácido metacrílico o cualquiera de sus ésteres simples. El Dermacryl 79 CAS Número 129702-02-9 es un copolímero acrílico carboxilado de alto peso molecular, hidrofóbico.

10 En una realización, el copolímero acrílico carboxilado insoluble en agua se selecciona del grupo que consiste en acrilato/t-octilpropanamida, copolímero de octilacrilamida/acrilato/metacrilato de butilaminoetilo, copolímero de acrilatos/octilacrilamida, y una mezcla de los mismos.

Ventajosamente, los grupos funcionales de ácido carboxílico de los polímeros formadores de película están al menos parcialmente neutralizados a fin de obtener buena dispersión del polímero formador de película en el medio acuoso. Un porcentaje de los grupos de ácido carboxílico presente en el copolímero acrílico carboxilado insoluble en agua se neutralizan. El porcentaje que se neutraliza está entre 3 % a aproximadamente 35 %, preferentemente, de 7 % a aproximadamente 33 %, y de manera más preferente de aproximadamente 10 % a aproximadamente 30 %, tal como 10 %, 11 %, 12 %, 13 %, 14 %, 15 %, 16 %, 17 %, 18 %, 19 %, 20 %, 21 %, 22 %, 23 %, 24 %, 25 %, 26 %, 27 %, 28 %, 29 % y 30 %.

Los grupos funcionales de ácido carboxílico pueden neutralizarse usando un compuesto básico, tal como una base inorgánica, tal como hidróxido de sodio, benzoato de sodio o hidróxido de potasio, o un amino-alcohol seleccionado por ejemplo de 2-amino-2-metil-1-propanol (AMP), trietanolamina, trisopropanolamina (TIPA), monoetanolamina, dietanolamina, tris-[2-hidroxi-1-propil]amina, 2-amino-2-metil-1,3-propanodiol (AMPD), sales alcalinas de ácido etileno diamino tetra acético tal como el ácido tetrasódico de etileno diamino tetra acético (Na<sub>4</sub>EDTA), o 2-amino-2-hidroximetil-1,3-propanodiol. También puede usarse lisina, arginina o cistina como agentes de neutralización o combinaciones de los antes mencionados. Preferentemente, el copolímero acrílico carboxilado se neutraliza utilizando benzoato de sodio y/o EDTA tetrasódico.

Generalmente, las composiciones de la presente invención tienen aproximadamente 0,01 a aproximadamente 15 por ciento en peso de un copolímero acrílico carboxilado. El intervalo está preferentemente de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 10 %, prefiriéndose de forma especial de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 5 %.

35 Se sabe que estos polímeros se vuelven dispersables/solubles en agua por la neutralización de sus grupos carboxílicos (es decir, ácido carboxílico) con una base, por ejemplo, un material alcalino. Así, en algunas realizaciones de la presente invención, una porción de los grupos carboxílicos en el copolímero acrílico carboxilado se neutraliza con una base. De esta manera, la cantidad de disolvente orgánico, por ejemplo, alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, usada en la composición puede reducirse significativamente.

#### 40 V. Agente espumante hidroalcohólico

El agente espumante hidroalcohólico comprende un alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, agua, cera y un tensioactivo.

##### A. Alcoholes

Los alcoholes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> adecuados, incluyen metanol, etanol propanol, butanol, pentanol, hexanol y sus isómeros. Sin embargo, ya que el metanol es venenoso, por razones de seguridad se prefieren el etanol, n-propanol o isopropanol. Prefiriéndose particularmente el etanol, tal como "SD Alcohol 40" o "SDA 40".

En una realización particular, la cantidad de agua en el agente espumante hidroalcohólico es mayor que la cantidad de disolvente alcohólico, por ejemplo, alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>. La cantidad de alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> presente en la composición de la presente invención varía desde aproximadamente 5 % a aproximadamente 40 % en peso, preferentemente desde alrededor de 10 % a aproximadamente 30 % y más preferentemente alrededor de 15 % a aproximadamente 25 % tal como 16 %, 17 %, 18 %, 19 %, 20 %, 21 %, 22 %, 23 %, 24 %, y las fracciones los mismos.

##### B. Agua

Típicamente al menos aproximadamente 40 % de la composición está comprendida por agua, preferentemente al menos alrededor de 45 % y más preferentemente por lo menos aproximadamente 50 %. Alternativamente, la cantidad de agua presente en las composiciones de la presente invención generalmente varía desde

aproximadamente 35 a aproximadamente 65 %, de forma preferida desde aproximadamente 40 a aproximadamente 60 % y más preferentemente desde alrededor de 50 a aproximadamente 55 %. Así, otras composiciones resistentes al agua convencionales, composiciones de la presente invención tienen significativamente una mayor cantidad de agua que la cantidad de alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

## 5 C. Cera

Diferentes ceras son adecuadas para utilizarlas en la presente invención. Estas incluyen por ejemplo, ceras no iónicas auto-emulsionantes. Por ejemplo, Polawax GP200 (alcohol estearílico y estearato de PEG-20)(Croda Surfactants) es una cera auto-emulsionante no-iónica que se usa en emulsiones de aceite en agua. El material ceroso se usó para impartir soporte estructural a la espuma y para mejorar las propiedades de formación de película y resistencia al agua de la emulsión sobre la piel. Otras ceras adecuadas para su uso en la presente invención incluyen, pero no se limitan a, ceras naturales tal como ceras animales tal como carnauba y cera de abeja, ceras vegetales, ceras minerales tal como ceras de petróleo, y ceras sintéticas.

## D. Tensioactivos

Las composiciones de la presente invención también pueden incluir un sistema tensioactivo. La presencia de tensioactivos permite la emulsión de uno o más componentes que pueden de otra forma ser insolubles dentro de la composición. El sistema tensioactivo de la invención puede comprender un polioxialquilen éster de un ácido graso de cadena recta o ramificada, polisorbato o mezclas de estos. Los polioxialquilenos incluyen polipropilenglicol y polietilenglicol, prefiriéndose especialmente el último.

Los polioxialquilen ésteres de ácido graso útiles incluyen, pero no se limitan a, los ésteres de ácido graso de polioxietilenglicol vendido como "Cithrol" (Croda) y "Myrj 52" (Uniqema). El polisorbato útil incluye Polisorbato 85 vendido como "Crillet 45" (Croda). El sistema tensioactivo también puede incluir combinaciones de uno o más tensioactivos revelados en la presente.

Generalmente, la cantidad total de tensioactivo(s) presente(s) en las composiciones de la presente invención tiene intervalos desde aproximadamente 0,1 a aproximadamente 20 % en peso. El intervalo preferido es desde aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 15 %, prefiriéndose en gran medida alrededor de 2 % a aproximadamente 10 %.

## VI. Componentes opcionales

Las composiciones de la invención también pueden incluir cantidades adecuadas de aditivos cosméticamente y farmacéuticamente aceptables, es decir, excipientes y/o adyuvantes químicamente activos, incluyendo agentes quelantes, tal como EDTA y sus sales, y agentes protectores a la corrosión, tal como benzoato de sodio o conservantes.

Además, también pueden añadirse otros aditivos tales como colorantes, espesantes, perfumes, rellenos, diluyentes, vehículos, plastificantes, estabilizadores, agentes formadores de gel, conservantes, emolientes/solventes complementarios y los similares.

## 35 VII. Uso

Cuando se dispensan desde el recipiente, las composiciones de la presente invención forman una estructura de espuma. Cuando se aplica la espuma a un área deseada, se seca relativamente rápido para dejar sobre la piel una película con componente de filtro solar resistente al agua o muy resistente al agua.

El punto de fusión de la espuma hidroalcohólica que se produce a partir de composiciones de la presente invención es aproximadamente 35°C o mayor. Preferentemente, la temperatura de fusión de la espuma es aproximadamente 40°C o mayor. Una temperatura de fusión de la espuma especialmente preferida es de aproximadamente 45°C o mayor. El término "temperatura de fusión de la espuma" se refiere a la temperatura a la cual se rompe la estructura de la espuma sin ninguna aplicación de fuerza, por ejemplo, por frotación.

Objetivos adicionales, ventajas y características novedosas de esta invención se volverán aparentes para las personas con experiencia en la técnica con el examen de los siguientes ejemplos de esta, los cuales no se intenta que sean limitantes.

## VIII. Ejemplos

### 1. Ejemplo 1

Este ejemplo ilustra diferentes compuestos preferidos para formular una espuma de filtro solar estable para usarse en el cuero cabelludo, cara y cuerpo.

#### a) Componente de filtro solar

Parsol MCX (octinoxato) es un absorbedor de rayos UV-B solubles en aceite, altamente efectivo con una absorción máxima a 308 nm. Además, Parsol MCX es un disolvente excelente para Uvinul M40. Se eligió una concentración de 7,5 % p/p basada en los requisitos de monografía.

5 Uvinul M40 (oxibenzona) es un absorbedor de rayos UV-A y rayos UV-B soluble en aceite que ofrece absorción máxima en el espectro de onda corta de los rayos UV-B y UV-A. Uvinul M40 se emplea generalmente como un absorbedor complementario en combinación con un absorbedor específico de rayos UV-B (tal como Parsol MCX). Uvinul M40 requiere suficiente solubilidad en las emulsiones para asegurar que no ocurra una nueva cristalización.

10 Parsol 1789 (butil metoxidibenzolimetano) es un filtro de rayos UV-A soluble en aceite altamente efectivo. Frecuentemente se usa en conjunto con los filtros de rayos-UV-B para proporcionar una protección completa del espectro de rayos UV. La absorción máxima de Parsol 1789 está en o cerca de 360 nm.

### b) Excipientes

Polawax PG200 (alcohol estearílico y estearato de PEG-20) (Croda Surfactants) es una cera auto-emulsionante no iónica que se usa en emulsiones de aceite en agua. El material ceroso se usó para impartir soporte estructural a la espuma y para mejorar las propiedades de formación de película y resistencia al agua de la emulsión sobre la piel.

15 Dermacryl® 79 (copolímero de acrilatos/octilacrilamida) (National Starch & Chemical) es un polímero hidrofóbico, de alto peso molecular. Se usó con un nivel de aproximadamente 1,5-2,5 % p/p en la formulación. Cuando se aplica forma una película resistente al agua o a prueba de agua. Su propiedad de alta resistencia al agua se usó para producir un producto de protección solar resistente al agua.

20 Myrj 52 (Estearato de PEG-40) (Uniqema) es un emulsionante no iónico que se usó en conjunto con Crillet 45 para obtener un sistema HLB (equilibrio lipófilo hidrófilo) deseado para la formulación. Se prefiere Myrj 52 a otros emulsionantes porque es un material de ceroso sólido. Una concentración de 1,5-2,5 % se usó basada en un HLB de filtración (utilizando diferentes relaciones de Myrj 52 Crillet 45), y como resultado de la optimización de calidad de la espuma.

25 Crillet 45 (Polisorbato 85) (Croda Sufactants) es un emulsionante aceite en agua. Se usó con una concentración de 0,5-1,2 % en asociación con Myrj 52 para lograr un HLB deseado.

El benzoato de sodio es un inhibidor de corrosión comúnmente usado y se adicionó aproximadamente 0,10-0,30 % al sistema para prevenir la corrosión de la lata durante el almacenamiento.

30 EDTA disódico (BASF) es un agente quelante que se adiciona al sistema con 0,05-0,20 %. Una persona con experiencia en la técnica sabe que el Parsol 1789 reacciona con los metales, particularmente  $Fe^{2+}$ , durante la elaboración o almacenamiento y desarrolla un complejo rojo que decolora la formulación.

La formulación de espuma de filtro solar es un producto espumoso con FPS 15 no grasoso, resistente al agua, que puede usarse en la cabeza, cara y cuerpo. Una formulación del componente de filtro solar particular se muestra enseguida continuación.

35 Parsol MCX – 7,5 % p/p (en ausencia de propelente)  
Uvinul M40 – 4,0 % p/p (en ausencia de propelente)  
Parsol 1789 – 2,0 % p/p (en ausencia de propelente)

La temperatura de fusión de la espuma de la formulación se encontró que fue aproximadamente 40 °C.

### c) Resistencia al agua

40 Dermacryl requiere de neutralización y calentamiento para ser incorporada a las cremas estándar. En una realización, la presente invención utiliza un nuevo procedimiento de elaboración, por medio de este disolviendo primero el Dermacryl en etanol, después combinando este con la fase oleosa caliente (40-45°C) antes de formar la emulsión tiene la ventaja de no tener que calentar el etanol, proporcionando así un procedimiento de elaboración más seguro que las técnicas tradicionales donde se adiciona una fase caliente de aceite/etanol a una fase acuosa caliente.

45 El copolímero acrílico con grupos carboxilos como el Dermacryl 79, es insoluble en agua, por medio de esto se imparte resistencia al lavado en una formulación. Si los grupos carboxilo se neutralizan completamente, el copolímero acrílico sería soluble en agua, por lo tanto no imparte resistencia al lavado. Un copolímero neutralizado parcialmente (por ejemplo, 29 % de neutralización), sorprendentemente se ha encontrado que muestran solubilidad mejorada en agua sobre una formulación sin neutralización, y resistencia al lavado mejorada sobre una formulación neutralizada totalmente. Un ejemplo de una fórmula neutralizada totalmente (100 %) se da enseguida: Un ejemplo de una fórmula neutralizada totalmente (100 %) se da enseguida en la Tabla 1:

50

Tabla 1

N.º de elemento.	Ingrediente	% p/p
1	Agua Purificada	52,1
2	Benzoato de sodio	0,19
3	EDTA disódico	0,10
4	Polawax GP200	2,85
5	Parsol MCX	7,13
6	Uvinul M40	3,80
7	Parsol 1789	1,90
8	Crillet 45	0,83
9	Ethomeen C25	3,92
10	Dermacryl-79	1,90
11	Etanol SDA 40-2	20,27
	<b>TOTAL</b>	<b>95,00</b>

más propelente con 5 % p/p.

- 5 El efecto del Dermacryl-79 neutralizado parcialmente y neutralizado totalmente en la formulación se investigó. Los resultados de FPS de las formulaciones se muestran enseguida: Dermacryl-79 100 % neutralizado – PFS 3.9 (resistencia al lavado 40-minutos) Tabla 1. Dermacryl-79 29 % neutralizado – PFS 16.1 (resistencia al lavado 40-minutos) (Tabla 3).

#### d) Neutralización de Dermacryl

- 10 El Dermacryl 79 se carboxiló y se neutralizó normalmente con un material alcalino en la formulación. La persona que realiza la formulación puede usar materiales tal como trietanolamina, 2-amino-2metil-1-propanol, hidróxidos de amonio o potasio, o aminas de cadenas largas. La cantidad de base requerida para neutralizar los grupos carboxilo en DERMACRYL 79 puede determinarse por la siguiente relación:

$$B = W \times 2,4 \times N \times E / 1000$$

- 15 en la que: B = peso (gramos) de la base necesaria; W = peso (gramos) de DERMACRYL 79 usados; N = % de neutralización requerida (decimal); y E = peso equivalente de la base (eq/g). Un ejemplo específico del 1005 de neutralización de 100 gramos de DERMACRYL 79 con trietanolamina es como sigue: EJEMPLO: W = 100 gramos; N = 1,00; E = 149,2;

$$B = 100 \times 2,4 \times 1,00 \times 149,2 / 1000 = 3,8 \text{ gramos de TEA.}$$

- 20 Las Tablas 2 y 3 muestran diferentes composiciones de espuma con FPS 15 de la presente invención. La fórmula parcialmente neutralizada se expone enseguida (Tabla 3).

Tabla 2: Espuma con FPS 15

Nombre comercial	% p/p (sin propelente)	% p/p (con propelente)
Etanol SDA 40-2	24,96	23,71
Dermacryl 79	2,00	1,90
Polawax GP200	3,00	2,85
Parsol MCX	7,50	7,13
Uvinul M40	4,00	3,80
Parsol 1789	2,00	1,90
Myrj 52	1,20	1,14

(Continuación)

Nombre comercial	% p/p (sin propelente)	% p/p (con propelente)
Agua Purificada	54,24	51,53
Benzoato de Sodio	0,20	0,19
EDTA disódico	0,10	0,095
Crillet 1	0,80	0,76
Propelente P70	0	5,00

**Tabla 3:** Espuma con FPS 15

Nombre comercial	% p/p (sin propelente)	% p/p (con propelente)	Función
Agua desionizada	56,30	53,49	Solvente
Alcohol SDA 40-2	21,90	20,81	Solvente
Parsol MCX	7,50	7,13	Filtro solar-UVB
Propelente P45	0,00	5,00	Propelente
Uvinul M-40	4,00	3,80	Filtro solar-UVA
Polawax GP200	3,00	2,85	Emulsionante
Myrj 52	2,13	2,02	Emoliente
Parsol 1789	2,00	1,90	Filtro Solar-UVA
Dermacryl-79	2,00	1,90	Formador de Película
Crillet 45	0,87	0,83	Emulsionante
Benzoato de sodio	0,20	0,19	Protección contra la corrosión
EDTA disódico	0,10	0,10	Agente quelante

## 5 2. Ejemplo 2

Este ejemplo ilustra un procedimiento para elaborar las composiciones de la presente invención.

Las formulaciones de filtro solar de la presente invención pueden producirse utilizando el siguiente procedimiento. El tamaño de partícula y apariencia de emulsión se evaluó utilizando un microscopio Olympus BX50. El procedimiento de elaboración a temperatura ambiente se expone a continuación:

### 10 a) Fase acuosa:

1. Pesar agua purificada dentro de un recipiente. Calentar a 45-50 °C.
2. Mientras se agita adicionar Myrj 52, continuar con la agitación hasta que el Myrj 52 se haya disuelto.
3. Mientras se agita, adicionar Benzoato de Sodio, agitando hasta disolver.
4. Mientras se continúa con la agitación del producto, adicionar EDTA Disódico, agitar hasta disolver.
5. Agitar para enfriar a 20-30 °C.

15

6. Corregir cualquier pérdida de agua.

**b) Pase etanol:**

7. Pesar etanol dentro de un tanque separado.

8. Mientras se agita, adicionar lentamente Dermacryl 79, continuar agitando hasta disolver.

5 Fase Oleosa:

9. Pesar Parsol MCX dentro de un recipiente separado y calentar a 50-55°C.

10. Mientras se agita, adicionar Crillet 45, Uvinul M40, Parsol 1789 y Polawax GP200, continuar agitando hasta disolver todos los compuestos.

11. Agitar para enfriar a 40-45°C.

10 12. Mientras se agita, adicionar lentamente la fase oleosa a la fase de etanol y continuar agitando hasta disolver.

13. Corregir cualquier pérdida de etanol.

14. Mantener a 20-30 °C.

**c) Formación de emulsión:**

15 15. Mientras se agita la fase acuosa, adicionar lentamente la fase Etanol/Aceite dentro del vórtice.

16. Homogeneizar el lote hasta que el tamaño de partícula esté dentro de la especificación.

17. Agitar lentamente para permitir que el lote se desaire.

**3. Ejemplo 3**

Este ejemplo muestra el por ciento de neutralización que puede tener un efecto en la resistencia al agua.

20 Como se muestra enseguida en la Tabla 4, 0 % y 25 % de neutralización muestran excepcionales capacidades de resistencia al agua.

La prueba de resistencia al agua in vitro involucra aplicar una masa de la formulación de espuma de filtro solar pesada con exactitud a un sustrato pesado con exactitud (es decir, portaobjeto de vidrio de microscopio). El producto se colocó en un incubador y se permitió secar hasta formar una película.

25 El sustrato con la película seca se colocó dentro de un baño de agua con agitación, después de esto se regresó a un incubador y volvió a secar.

Se calculó la resistencia al agua de cada una de las películas como el porcentaje del remanente de película sobre el sustrato.

30 Los resultados indican que con neutralización de 0 % y con 25 % de neutralización de Dermacryl, la resistencia al agua de la película fue mayor que con el 100 % de película neutralizada. Mientras la neutralización parcial del Dermacryl permitió que se disolviera en la formulación, la formulación aun proporciona buena resistencia al agua. De esto, se puede esperar que la formulación de Dermacryl parcialmente neutralizado proporcionara mejor FPS que la formulación de Dermacryl neutralizado al 100 % posterior a la inmersión en agua.

Tabla 4

Producto	Espuma de filtro solar F210/04/05 E210/04/05 30 % EtOH 25 % Neutralización		Espuma de filtro solar F210/04/13 E210/04/13' 10 % EtOH 0 % Neutralización		Espuma de filtro solar F210/04/18 E210/04/18 10 % EtOH 100 % Neutralización	
	1	2	1	2	1	2
Peso del portaobjeto de microscopio (T):	16,8371	17,2195	16,7635	16,7936	17,5840	17,1021
Peso del portaobjeto de microscopio más producto	18,1036	16,3680	17,7508	17,8898	18,6974	18,1176

ES 2 596 507 T3

(continuación)

Producto	Espuma de filtro solar F210/04/05 E210/04/05 30 % EtOH 25 % Neutralización		Espuma de filtro solar F210/04/13 E210/04/13' 10 % EtOH 0 % Neutralización		Espuma de filtro solar F210/04/18 E210/04/18 10 % EtOH 100 % Neutralización	
	1	2	1	2	1	2
*peso del producto aplicado al portaobjeto de microscopio	1,2665	1,1485	0,9873	1,0962	1,1134	1,0155
Después de 15h a 25°C/5 min. a T. ambiente	17,0993	17,4681	16,9861	17,0297	17,8473	17,3413
Después de 60 min. a 50°C/5 min. a T. ambiente	17,0953	17,4641	16,9861	17,0264	17,8445	17,3392
Después de 135 min. a 50°C/5 min. a T. Ambiente	17,0939	-	-	17,0258	17,8442	17,3390
Después de 180 min. a 50°C/5 min. a T. Ambiente	-	17,4628	16,9860	-	-	-
Después de 210 min. a 50°C/5 min. a T. ambiente	-	-	-	-	-	-
<MF1>	17,0939	17,4628	16,9860	17,0258	17,8442	17,3390

Sumergir en baño de agua estática a 25°C durante 20 min.

60 min. a 50°C/5 min. a T. ambiente	-	17,4000				
90 min. a 50°C/5 min. a T. ambiente	17,0281					
140 min. a 50°C/5 min. a T. ambiente	17,0169					
170 min. a 50°C/5 min. a T. ambiente	17,0119					
Después de 62h. A 25°C/5 min. a t. Ambiente	16,9976					
120 min. a 50°C/5 min. a T. ambiente	16,9964					
<MF2>	16,9964	17,3833	16,9201	16,9461	17,6531	17,1623
Capacidad de Lavado (en agua) % Pérdida de Peso	62	67	70	66	27	25

ES 2 596 507 T3

(continuación)

<b>RESISTENCIA PROMEDIO AL AGUA</b>	65	68	26
---	----	----	----

## REIVINDICACIONES

1. Una composición en un recipiente presurizado para formar una espuma hidroalcohólica, comprendiendo dicha composición
- 5 un componente de filtro solar;  
un polímero formador de película insoluble en agua que es un copolímero acrílico carboxilado insoluble en agua;  
un agente espumante hidroalcohólico que comprende un alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> presente en una cantidad de 5 % a 40 % en peso de la composición, agua, cera y tensioactivo; y  
un propelente en aerosol;
- 10 y en la que dicha composición forma una espuma cuando se libera desde el recipiente y  
en la que un porcentaje de los grupos de ácido carboxílico que están presentes en el copolímero acrílico carboxilado insoluble en agua se neutralizan y el porcentaje de neutralización es de entre 3 % y 35 %.
2. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho componente de filtro solar comprende al menos un filtro solar de rayos UVB y/o al menos un filtro solar de rayos UVA.
3. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho componente de filtro solar se selecciona del grupo que  
15 consiste en: ácido aminobenzoico (Ácido 4-aminobenzoico); avobenzona (4-terc-butil-4-metoxidibenzoilmetano); benzofenona-2 (bis(2,4-dihidroxifenil)metanona); benzofenona-3 (oxibenzona); benzofenona-4 (sulisobenzona); benzofenona-5 (sulisobenzona de sodio); benzofenona-8 (dioxibenzona); benciliden camfor (3-(4-metilbenciliden)-d-1camfor); cinoxato; ecamsule (ácido sulfónico de tereftaliliden dicamfor); ácido etil 4-aminobenzoico etoxilado (PEG25 PABA); homosalato (salicilato de homometilo); isoamilmetoxicinamato (isopentenil-4-metoxicinamato);  
20 salicilato de isopropilbencilo; antranilato de mentilo (2-aminobenzoato de metilo); mexoryl XL (fenol, 2-(2H—benzotriazol-2-il)-4-metil-6[2-metil-3-[1,3,3,3-tetrametil-1-[(trimetilsilil)oxi]disiloxanil]propil); octil dimetilo PABA; octinoxato (metoxicinamato de octilo); salicilato de octilo (salicilato de 2-etilhexilo); octocrileno (ácido 2-ciano-3,3-difenil acrílico, 2-etil hexil éster); octil trizona (2,4,6-trianalino-(p-carbo-2-etilhexil-1'oxi)1,3,5-triazina); padimato o (4-dimetilaminobenzoato de 2-etilhexilo); ácido fenilbencimidazol sulfónico (ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico) y sus sales de potasio, sodio y trietanolamina; metilsulfato de N,N,N-trimetil-4-(oxoborn-3-ilidenmetil)anilinio; sales de ácido salicílico (potasio, sodio y trietanolamina); Tinosob M (2,2'-metilen-bis-6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(tetrametil-butyl)-1,1,3,3-fenol); dióxido de titanio; salicilato de trietanolamina; óxido de cinc; y mezclas de los mismos.
- 25 4. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho componente de filtro solar se selecciona del grupo que consiste en octinoxato, oxibenzona, butil metoxidibenzoilmetano, y una mezcla de los mismos.
- 30 5. La composición de la reivindicación 1, en la que la cantidad total de dicho componente de filtro solar es de 1 % a 30 % en peso.
6. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho copolímero acrílico carboxilado insoluble en agua se selecciona de entre el grupo que consiste en acrilato/t-octilpropenamida, copolímero de octilacrilamida/acrilato/metacrilato de butilaminoetilo, copolímero de acrilatos/octilacrilamida, y una mezcla de los  
35 mismos.
7. La composición de la reivindicación 6, en la que dicho copolímero acrílico carboxilado insoluble en agua es copolímero de acrilatos/octilacrilamida.
8. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho porcentaje de neutralización está entre 7 % y 33 %.
9. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho copolímero acrílico carboxilado se neutraliza utilizando  
40 benzoato de sodio.
10. La composición de la reivindicación 1, en la que la cantidad total de dicho copolímero acrílico carboxilado es de 0,1 % a 10 % en peso.
11. La composición de la reivindicación 1, en la que la cantidad de alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> es de 10 % a 30 % en peso de la composición total.
- 45 12. La composición de la reivindicación 1, que además comprende un agente quelante.
13. La composición de la reivindicación 1, que además comprende un agente de protección de la corrosión.
14. Una composición de la reivindicación 1, para su uso en la protección de la piel humana de los efectos dañinos de la luz ultravioleta.