

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 631 191**

21 Número de solicitud: 201630108

51 Int. Cl.:

**A61Q 17/00** (2006.01)

**A61Q 17/04** (2006.01)

**A61K 8/49** (2006.01)

12

PATENTE DE INVENCION

B1

22 Fecha de presentación:

**29.01.2016**

43 Fecha de publicación de la solicitud:

**29.08.2017**

Fecha de concesión:

**30.05.2018**

45 Fecha de publicación de la concesión:

**06.06.2018**

56 Se remite a la solicitud internacional:

**PCT/ES2016/070838**

73 Titular/es:

**RNB, S.L. (100.0%)**

**Ausias March, 14 Polg. Indal. La Pobla, L'Eliana  
46185 LA POBLA DE VALLBONA (Valencia) ES**

72 Inventor/es:

**ALONSO GRACIA, Manuel Jose;**

**POLO SOLER, Ana;**

**BALAGUER TIMOR, Angel;**

**GONZALVEZ ILLUECA, Ana;**

**CHORNET ORERO, Lidia Maria;**

**ALGARRA CARBONELL, Mercedes y**

**MONTORO MARTINEZ, Maria Del Pilar**

74 Agente/Representante:

**UNGRÍA LÓPEZ, Javier**

54 Título: **COMPOSICIÓN PARA LA PROTECCIÓN SOLAR Y REPARACIÓN DE LA PIEL MEDIANTE COMPLEJOS PROTECTORES**

57 Resumen:

Una composición o combinación para protección solar y/o reparación de la piel por exposición a la radiación solar que se caracteriza porque comprende componentes que actúan como filtros fotodérmicos (alantoína, pantenol, acetato de tocoferol, tocoferol, ascorbil fosfato de sodio, Aloe barbadensis), en porcentajes definidos. En un caso preferido, la combinación puede contener además al menos un compuesto fotoprotector frente a la radiación solar, que es preferentemente un filtro ultravioleta. Otro objeto de la invención es un producto, preferentemente cosmético y más preferentemente aún de uso tópico para el cuidado de la piel, que comprende la composición anterior como uno de sus ingredientes, así como el uso de ambos para el cuidado de la piel mediante protección y reparación ante la radiación solar.

ES 2 631 191 B1

Aviso: Se puede realizar consulta prevista por el art. 37.3.8 LP 11/1986.

## COMPOSICIÓN PARA LA PROTECCIÓN SOLAR Y REPARACIÓN DE LA PIEL MEDIANTE COMPLEJOS PROTECTORES

### DESCRIPCIÓN

#### 5 **Campo técnico**

La presente invención se engloba en el campo de la Química, concretamente de la Cosmética, estando su objeto relacionado con el desarrollo de composiciones para la protección de la piel mediante complejos fotoprotectores frente a los daños causados por la radiación solar (ultravioleta A –UVA-, ultravioleta B –UVB-, infrarroja –IR- y visible) y en particular frente a los daños causados por las especies reactivas de oxígeno (ROS, del inglés “*Reactive Oxygen Species*”) originadas principalmente por dicha radiación.

#### **Antecedentes de la invención**

15 La acción del sol sobre la piel humana tiene múltiples efectos, tanto positivos como negativos, que muestran una gran variabilidad principalmente en función de dos factores: el fototipo del individuo (capacidad de la piel para asimilar la radiación solar) y el tiempo de exposición a la radiación solar.

20 Desde un punto de vista beneficioso, la exposición solar estimula la producción de melanina causando el bronceado de la piel, que puede ser deseable desde un punto de vista estético. Además, la acción del sol es esencial para la síntesis en la piel de vitamina D, cuya función en el organismo consiste en mantener los niveles normales de calcio y fósforo en plasma. Deficiencias en vitamina D pueden ser causa de varias enfermedades, como por ejemplo el raquitismo.

Por el contrario, una exposición excesiva al sol deja de ser beneficiosa para producir efectos adversos en la salud. Así, una exposición prolongada es causante a corto plazo de agresiones leves como quemaduras, enrojecimiento e inflamación (eritema) y a largo plazo es responsable de enfermedades de mayor gravedad como la aceleración del envejecimiento cutáneo (aparición de arrugas, pérdida de volumen y de densidad que provocan cambios de apariencia y de funciones en la piel, como una mayor sensibilidad a la radiación UV y una reducción de la función inmunitaria) y diversos tipos de cáncer de piel.

35

Muchos de los mecanismos por los que el sol produce estos efectos adversos son conocidos y se deben fundamentalmente a la interacción de la radiación solar con los distintos componentes celulares, que varía en función de la banda del espectro solar electromagnético. Así, la radiación UVB, que posee una longitud de onda de entre 290  
5 y 320 nm, ataca sobre todo la epidermis y es la principal responsable de la quemadura solar y de la mayoría de los diferentes tipos de cáncer de piel (como el carcinoma espinocelular), al dañar directamente el ADN de las células e inducir mutaciones. Por su parte, se cree que la radiación UVA, que se caracteriza por una longitud de onda de entre 320 y 400 nm., está estrechamente relacionada con la génesis del melanoma y  
10 es la principal responsable del estrés oxidativo por la formación y liberación en el organismo de radicales libres o especies reactivas de oxígeno (ROS, del inglés "*Reactive Oxygen Species*"), responsables de cambios moleculares que se asocian con el foto-envejecimiento cutáneo. Con el paso del tiempo se producen daños en la piel que aceleran su envejecimiento debido a la acumulación de estos radicales libres,  
15 ya que son átomos o moléculas que contienen un único electrón desapareado en una capa externa y por tanto que poseen una gran capacidad para lesionar todas las estructuras celulares, incluyendo lípidos y proteínas. Si bien en circunstancias normales los antioxidantes de la piel consiguen atrapar y neutralizar estos ROS, esta capacidad se ve mermada drásticamente por la excesiva exposición a los rayos UVA,  
20 que aceleran el estrés oxidativo y provocan la lesión de todos los componentes de la célula cutánea.

Uno de los efectos de las especies reactivas de oxígeno generadas por la radiación solar es la peroxidación lipídica, que afecta a los lípidos de las membranas celulares,  
25 interfiriendo con eventos de señalización celular asociados a membrana. Otro efecto nocivo es daño al ADN de las células cutáneas, al formar 8-hidroxi-2'-desoxiguanosina que si no se repara por los mecanismos naturales de protección de las células, puede causar mutaciones por transversión GC a TA. Las especies reactivas de oxígeno pueden inducir asimismo la síntesis de metaloproteinasas, causar modificaciones en la  
30 estructura de proteínas y aumentar los depósitos de elastina en la dermis. Todos estos procesos biológicos están relacionados con el envejecimiento de la piel.

La piel presenta defensas naturales (fotoprotección endógena) de varios tipos frente a estas agresiones ambientales causadas por la exposición al sol. La melanina por  
35 ejemplo, pigmento cuya producción está estimulada por la radiación solar, es un buen

filtro frente a radiaciones de 305 y 365 nm. Otro mecanismo de defensa está constituido por moléculas antioxidantes presentes de manera natural en las células, que pueden ser proteínas con funciones enzimáticas antioxidantes o moléculas no proteicas de bajo peso molecular. Los antioxidantes no enzimáticos de bajo peso  
5 molecular incluyen la vitamina E, liposoluble en las membranas celulares.

Además de contar con las defensas naturales frente a la protección solar, los individuos que por su actividad vayan a sufrir exposiciones prolongadas al sol pueden aplicar estrategias eficaces de protección exógena. Una de estas estrategias consiste  
10 en evitar el sol, en lo posible, en las horas centrales del día, y usar sombreros, gafas de sol y ropa adecuada que protejan la piel. Otra estrategia ampliamente utilizada y conocida, en la que se engloba la presente invención, es el uso de composiciones tópicas fotoprotectoras en forma de cremas, lociones, o formulaciones similares. Estas composiciones comprenden sustancias capaces de absorber, reflejar o dispersar la  
15 radiación solar, disminuyendo sus efectos adversos.

Dentro del grupo de sustancias o complejos fotoprotectores de uso tópico se incluyen moléculas tales como las vitaminas, el pantenol, la alantoína y los extractos de aloe y de regaliz. Se ha demostrado que la exposición a la radiación solar reduce los niveles  
20 naturales de sustancias antioxidantes endógenas, que como se ha dicho previenen el envejecimiento de la piel de forma natural, por lo que se recomienda el uso de sustancias antioxidantes como suplementos sistémicos orales o como composiciones de uso tópico antes de una exposición intensa y/o prolongada al sol (Rossi T., et al., in vivo, 2005, 19: pp. 319-322).

25

Los antioxidantes son moléculas muy reactivas y por ello inestables. Además, para ser efectivos como agentes fotoprotectores han de ser utilizados en concentraciones adecuadas. Un problema de las formulaciones que emplean sustancias antioxidantes es encontrar la formulación idónea a concentraciones apropiadas que aseguren la  
30 estabilidad de la molécula mientras que a la vez mantengan un efecto terapéutico cuando son utilizadas para la protección solar (Gilaberte Y., et al., Actas Dermosifiliográficas, 2003, Vol. 94(5): pp. 271-93).

En cuanto a las vitaminas, son sustancias antioxidantes naturales y pueden ser  
35 usadas en composiciones y preparados para prevenir los efectos negativos de las

ROS (Manela-Azulay M., et al., Clinics in Dermatology, 2009, 27: pp. 469–474). La vitamina E en particular está presente de manera natural en la piel. Es un eficaz compuesto antioxidante adecuado para combatir los efectos nocivos de la exposición al sol. Composiciones que comprenden vitamina E (principalmente en forma de tocoferol o acetato de tocoferol en concentraciones que van del 1% al 5%) se emplean en preparaciones de uso tópico por estas propiedades. La vitamina E contribuye a reducir el eritema cuando se usa antes de exponerse al sol, pero no parece tener ese mismo efecto si se usa después de la exposición. La vitamina C por su parte es uno de los principales antioxidantes naturales presentes en la piel humana. Su uso tópico viene avalado por su eficacia en proteger de manera natural estructuras intracelulares frente al estrés oxidativo. La vitamina C en su forma activa, el ácido L-ascórbico, es muy inestable debido a su oxidación por la acción del aire; para mejorar su estabilidad, se usan derivados esterificados, como por ejemplo el ascorbil fosfato.

Otro compuesto antioxidante útil como protector frente a los efectos de la radiación solar es el dexpanthenol, estereoisómero D del pantenol, un precursor del ácido pantoténico (vitamina B<sub>5</sub>). Este compuesto es usado frecuentemente en preparaciones cosméticas gracias a sus propiedades hidratantes. Es un compuesto estable y se ha demostrado en modelos de eritema causado por radiación ultravioleta que tiene un efecto anti-inflamatorio (Ebner F., et al., Am. J. Clin. Dermatol., 2002; 3(6): pp. 427-433).

La alantoína, un producto de la degradación de las purinas en la mayoría de los mamíferos, excluyendo los primates, presenta actividad antioxidante frente a las especies reactivas de oxígeno. Es conocida su acción como antioxidante sistémico de acción general (Guskov E.P., et al., Doklady Biochemistry and Biophysics, 2001, Vol. 379: pp. 239–242). Debido a sus propiedades hidratantes, es frecuente su uso en productos cosméticos y de higiene personal, incluyendo cremas de protección solar. Es también usado en productos farmacéuticos y se considera un compuesto seguro y no tóxico.

Se conoce también el uso de extractos de Aloe como agentes antioxidantes que han resultado muy eficaces. Estudios en un modelo de quemadura solar producido por UVB en ratas han demostrado que extractos de *Aloe saponaria* son eficaces en la reducción del dolor y la inflamación gracias a sus propiedades antioxidantes (Silva

M.A., et al., Journal of Photochemistry and Photobiology B: Biology 133, 2014: pp. 47–54); efectos anti-inflamatorios y antioxidantes similares son ya conocidos para otras especies de Aloe, como el *Aloe vera*.

5 Por último, se ha demostrado que los extractos de regaliz pueden utilizarse para reducir el daño causado por la radiación solar debido a sus propiedades antioxidantes y se ha sugerido su uso en formulaciones tópicas para la prevención del cáncer de piel (Rossi T., et al., in vivo, 2005, 19: pp. 319-322). Este estudio demuestra que uno de los compuestos activos de los extractos de regaliz, la glicirricina, incrementa la  
10 expresión de Bcl-2, en la línea celular SKMEL-28 de melanoma tras una irradiación por UVB, pese a que el mecanismo molecular implicado no es todavía del todo conocido.

Por todas estas propiedades beneficiosas, estos compuestos antioxidantes se usan cada vez con más frecuencia en la industria alimentaria, cosmética, cosmocéutica y  
15 farmacéutica, en particular en aplicaciones relacionadas con la protección al daño agudo producido por la exposición al sol, o relacionados con la prevención y/o tratamiento del fotoenvejecimiento de la piel.

Así, la solicitud de patente GB2478967 (A) divulga un producto específicamente  
20 diseñado para el cuidado del cabello (pero no de la piel) que comprende extracto de té verde, extracto de manteca de karité, acetato de vitamina E (acetato de tocoferol) y palmitato de vitamina A. Formulaciones preferidas de este producto pueden incluir opcionalmente componentes como la alantoína, el pantenol y/o un filtro UV (por ejemplo la benzofenona-4).

25

Por su parte, la solicitud de patente KR20120001597 (A) divulga una composición cosmética para la prevención del envejecimiento de la piel a largo plazo (aunque no para la protección solar inmediata) basado en un único ingrediente biológicamente activo: pantenol, así como otros ingredientes adicionales con la capacidad de bloquear  
30 la radiación UV. No se analizan sinergias entre ellos, y por lo tanto la composición es de protección solar limitada. La invención se basa en la aportación diaria de la composición cuyo efecto se obtiene a largo plazo y no inmediato (al contrario de la presente invención).

También la solicitud de patente KR20140143940 (A) divulga un extracto de *Aloe vera* para la prevención y el tratamiento del envejecimiento de la piel, en particular el fotoenvejecimiento de la piel causado por la exposición a radiación UV. El documento enseña asimismo una composición cosmética y una composición farmacéutica para  
5 prevenir y tratar el envejecimiento de la piel, que contienen dicho extracto de *Aloe vera*. Al igual que en la solicitud anterior, la composición se centra en un único ingrediente activo, sin sinergias, y no está dirigido a la protección solar inmediata.

La solicitud de patente japonesa JPH06172150 (A) divulga un producto cosmético para  
10 el cuidado de manchas en la piel (no de la protección solar inmediata), incluyendo pecas y quemaduras solares, devolviendo a la piel su coloración natural. El producto cosmético comprende al menos un compuesto seleccionado de entre el ácido glicirretínico y sus ésteres y al menos un compuesto seleccionado de entre el ascorbil fosfato y sus sales, es decir, se componen fundamentalmente de dos agentes  
15 biológicamente activos.

En cuanto a la solicitud internacional WO2013003803 (A1), está dirigida al desarrollo de nuevos vehículos de agentes activos en fórmulas tópicas, para deposición en la superficie de la piel, como son las microcápsulas de tocoferol y otros componentes,  
20 como por ejemplo agentes de protección solar.

La solicitud de patente US2015118334 (A1) está centrada en el tratamiento y prevención de enfermedades inflamatorias cutáneas crónicas o reacciones cutáneas alérgicas mediante extractos naturales con activos que en su mayor parte se  
25 consideran altamente degradables para composiciones de uso tópico, como glicirrizato dipotásico, ácido hialurónico, extracto de raíz de ruibarbo, extracto del fruto del *Cnidium*, extracto de raíz de escutelaria y un vehículo dermatológicamente aceptable.

Estas composiciones conocidas del estado de la técnica, si bien muestran efectos de  
30 defensa exógenos a las radiaciones solares gracias a los agentes activos que comprenden y los vehículos empleados para su deposición, no están enfocadas al problema de la fotoprotección inmediata y durante la exposición de sol, lo que reduce su eficacia y utilidad. Además, estas composiciones se suelen centrar en uno o dos agentes activos de protección solar, que como se ha visto tienen un rango específico  
35 de acción sobre las radiaciones del espectro y sus efectos particulares en el

organismo, y no analizan las posibles sinergias entre componentes de este tipo que pueden ofrecer una protección más amplia y global sobre las radiaciones. Este efecto sinérgico no es evidente ni inmediato ya que no se deriva de la suma de los efectos de los compuestos, de hecho un problema relacionado con la preparación de estas  
5 composiciones tópicas es su inestabilidad o indeterminación a la hora de saber cómo van a interactuar con la piel y con el resto de elementos de la composición, lo que hace muy incierto su uso desde el punto de vista de la salud.

Con objeto de resolver estos problemas del arte previo, la presente invención se dirige  
10 así a una composición basada en la inclusión de varios principios activos de protección frente a la radiación solar, vitaminas antioxidantes, antiinflamatorios, hidratantes y reparadores cutáneos, cada uno de ellos con su propio mecanismo de funcionamiento, cuya sinergia acentúa su efecto protector, y que en conjunto muestran además una gran estabilidad poco común para composiciones de este tipo.

15

### **Descripción de la invención**

Es objeto de la presente invención una composición para la protección y reparación solar de la piel que se caracteriza porque comprende:

- a) alantoína, en una concentración comprendida entre 0.1 y 1%;
- 20 b) pantenol, en una concentración comprendida entre 0.1 y 5%;
- c) acetato de tocoferol, en una concentración comprendida entre 0.05 y 2%;
- d) tocoferol, en una concentración comprendida entre 0.01 y 1%;
- e) ascorbil fosfato de sodio, en una concentración comprendida entre 0.01 y 3%; y
- f) *Aloe barbadensis*, en una concentración comprendida entre 0.001% y 5%.

25

Los porcentajes indicados se refieren a porcentajes en peso respecto al peso total de la composición, y los límites de los intervalos están incluidos en el ámbito de la invención.

30 La composición protectora y reparadora de la piel frente a los efectos del sol puede ser una composición en sí misma tal como se ha descrito, es decir un producto, o como se verá más adelante puede entenderse como una combinación de los componentes que la constituyen, que combinados tienen los efectos pretendidos de protección y reparación de la piel.

35



La composición aquí descrita en su forma esencial consigue un aumento significativo de la protección de la piel frente a los efectos del sol gracias al uso combinado de los ingredientes. Los efectos beneficios se deben a la sinergia que se consigue empleando activos que actúan a diferentes niveles:

5

- Los antioxidantes acetato de tocoferol, tocoferol, ascorbil fosfato de sodio y *Aloe barbadensis* actúan reduciendo los radicales libres (ROS) generados por la radiación.
- Los activos pantenol y alantoína actúan como antiinflamatorios, evitando la producción adicional de ROS asociada a los procesos inflamatorios (éstos podrían desencadenarse debido a los radicales que no hayan sido eliminados por los antioxidantes anteriormente indicados).

10

De este modo, el daño real de la radiación solar se minimiza ya que se actúa en los diferentes niveles biológicos.

15

Los seis componentes enumerados como esenciales en la formulación objeto de protección, que se denominan en la presente memoria “protectores fotodérmicos” o “filtros fotodérmicos” para simplificar, tienen una función antioxidante y antiinflamatoria que consigue neutralizar el efectos de los ROS en la piel, actuando como filtros fotodérmicos.

20

Aparte de los agente activos de protección solar enumerados hasta ahora que se denominan protectores fotodérmicos, la composición puede contener opcionalmente uno o más de los siguientes elementos: extracto de regaliz (glicirrizato de dipotasio), en un porcentaje de hasta el 0.2% en peso del total de composición; ubiquinona, en un porcentaje de hasta el 0.2%; y bisabolol, en un porcentaje de hasta el 0.2%; así como hasta un 0.5% de materia prima que contiene otros compuestos antioxidantes naturales diferentes a los hasta ahora citados, preferiblemente de la familia de los polifenoles y/o carotenoides tales como hidroquinonas, resveratrol, taninos, ácido ferúlico, astaxantina y similares.

25

30

La presente composición puede comprender adicionalmente en un caso preferido uno o más compuestos fotoprotectores frente a la radiación solar. Estos compuestos fotoprotectores actúan también como filtros frente a la radiación solar, ejerciendo una

35

función complementaria a los demás protectores fotodérmicos y potenciando la protección y la reparación de la piel por la exposición al sol. Los compuestos fotoprotectores son preferentemente compuestos protectores frente a la radiación ultravioleta, UVA y/o UVB. Cada uno de estos compuestos fotoprotectores (que también se pueden denominar aquí filtros UV) puede estar comprendido en la composición en una concentración comprendida en los límites legales, y siendo esta concentración preferente de entre 0.1% y 30% en peso del total de la composición, más preferentemente todavía de entre 0.1% y 28%, más preferentemente aún 0.1% y 15% y en el caso más preferido de todos de entre 0.01% y 10%. Los compuestos fotoprotectores frente a la radiación ultravioleta pueden ser seleccionados de entre aquellos designados en el anexo VI (*“Lista de los filtros ultravioleta admitidos en los productos cosméticos”*) del Reglamento (CE) n. 1223/2009 del Parlamento Europeo y del Consejo de 30 de noviembre de 2009 sobre los productos cosméticos. A continuación se enumeran los componentes de esta lista, con el porcentaje en peso de composición máxima que no puede sobrepasarse al incluir este filtro en la formulación, de acuerdo con la ley:

- Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina: máximo del 10%
- Butil metoxidibenzoilmetano: máximo del 5%
- Dietilamino hidroxibenzoil Hexil Benzoato: Máximo del 10%
- 20 - Fenil dibenzimidazol tetrasulfonato disódico: Máximo del 10%
- Drometrizol Trisiloxano: Máximo del 15%
- Metilen bis-benzotriazolil tetrametilbutilfenol (nano): Máximo del 10%
- Ácido tereftalideno- dialcanfor sulfónico: Máximo del 10%
- 4-Metilbencilideno Alcanfor: Máximo del 4%
- 25 - 3-benzofenona: Máximo del 10%
- 4- benzofenona: Máximo del 5%
- Dietilhexil butamido triazona: Máximo del 10%
- Metoxicinamato de etilhexilo: Máximo del 10%
- Salicilato de etilhexilo: Máximo del 5%
- 30 - Triazona de etilhexilo: Máximo del 5%
- Etilhexil dimetil PABA: Máximo del 10%
- Homomentil salicilato (homosalato): Máximo del 10%
- Isoamil p-metoxicinamato: Máximo del 10%
- Octocrileno: Máximo del 10%
- 35 - Ácido fenilbenzimidazol sulfónico: Máximo del 8%

- Polisilicona 15: Máximo del 10%
- Dióxido de titanio: Máximo del 25%
- Bis-trifenil triazina (nano): Máximo del 10%

y cualquier combinación de los mismos.

5

Más preferentemente, los compuestos fotoprotectores son seleccionados dentro del grupo compuesto por los descritos en los ejemplos de la presente memoria, que son categorizados como filtros UV y que se enumeran a continuación con su porcentaje máximo de adición seguido del intervalo de porcentaje preferido con el que se incluye

10 en la composición final:

- Butil metoxidibenzoilmetano: máximo del 5%, preferentemente entre el 0.25% y el 4.5%;
- Fenil dibenzimidazol tetrasulfonato disódico: Máximo 10%, preferentemente entre el 0.5% y el 3%;
- 15 - Dietilhexil butamido triazona: Máximo del 10%, preferentemente entre el 0.5% y el 3%;
- Salicilato de etilhexilo: Máximo del 5%, preferentemente entre el 1.5% y el 4.8%;
- Triazona de etilhexilo: Máximo del 5%, preferentemente entre el 2.5% y el
- 20 4.5%
- Octocrileno: Máximo del 10%, preferentemente entre el 0.50% y el 10%;
- Ácido fenilbenzimidazol sulfónico: Máximo del 8%, preferentemente entre el 1 y el 3%;

25 y cualquier combinación de los mismos. Los filtros UV pueden incorporarse a la formulación en cualquiera de los valores comprendidos dentro de los intervalos de porcentaje preferidos, siendo los ejemplos solamente ilustrativos y no limitantes.

30 En una realización particular de la invención, la composición para la protección y reparación solar de la piel forma parte (es un componente) de un producto cosmético, por lo que otro objeto de la presente invención es un producto cosmético que comprende en su formulación la composición para la protección y reparación solar de la piel descrita anteriormente, en cualquiera de sus variantes. La composición objeto de la invención puede ser también, en otra realización particular, una composición cosmética en sí misma. En cualquiera de los casos, la composición cosmética o

35 producto cosmético se puede presentar en forma de formulación apropiada para uso

tópico, tal como una crema, una emulsión, una loción, un ungüento, un aerosol, o una formulación similar, que preferentemente está diseñada para el cuidado (protección y reparación) de la piel. Cuando la presente invención se refiere a una composición cosmética (que es preferentemente de uso tópico), en cualquiera de sus variantes anteriores y ya sea la propia composición o el producto cosmético que la comprende, se entiende que incluye además excipientes convencionales comúnmente empleados para este tipo de productos, y que puede presentarse en cualquiera de las formas enumeradas en este párrafo. Los excipientes pueden ser del tipo: gelificantes y emulsionantes, tensoactivos, factores de consistencia, conservantes, emolientes y humectantes, modificadores reológicos, ajustadores de pH, quelantes, siliconas, ceras, fragancias y perfumes, acondicionadores de la piel, etc. que comúnmente se emplean en formulaciones tipo crema, emulsión, loción, gel, ungüento, aerosol o similar, y aparecen en cantidades suficientes hasta completar el total de la composición. Es evidente que en un caso particular y preferido el producto comprende, además de la composición para la protección y reparación solar de la piel, uno o más compuestos fotoprotectores frente a la radiación solar, que son preferiblemente filtros frente a la radiación ultravioleta, UVA y/o UVB.

El producto cosmético puede ser preparado de modo convencional por métodos y técnicas conocidos en el campo, por ejemplo mediante preparación de una emulsión de componentes de fase acuosa y componentes de fase grasa, que se añaden y mezclan mediante agitación continua (por ejemplo, de manera preferida a 10000-15000 rpm durante 2-15 minutos, más preferentemente a 12000 rpm durante 5-10 minutos) a una temperatura comprendida entre 70°C-95°C, preferentemente entre 80°C-85°C. Posteriormente se enfría la emulsión, aún bajo agitación continua hasta una temperatura comprendida entre 35°C-45°C y preferentemente de 40°C, para a continuación añadir los componentes termolábiles del producto (activos, conservantes y perfume), agitando la mezcla total a una velocidad comprendida entre 10000-15000 rpm durante 2-5 minutos, más preferentemente a 12000 rpm durante 3 minutos, hasta garantizar la completa homogeneización del conjunto.

Particularmente, partiendo de las indicaciones anteriores, el producto de la presente invención se prepara mediante una de las dos alternativas siguientes para obtener el mismo resultado: a) o bien se añade la composición para la protección y reparación solar de la piel de una única vez en una de sus etapas, como un único componente tal

cual se ha descrito aquí, b) o bien se añaden los componentes de dicha composición por separado, en diferentes etapas y según sus propiedades, con el resto de ingredientes de la formulación (o en la preparación de la emulsión de dos fases acuosa y grasa o como componentes termolábiles). En este caso, debe entenderse la  
5 composición para la protección y reparación solar de la piel como una combinación de los elementos que anteriormente se han descrito como parte de su composición, ya sean esenciales u opcionales. De este modo, la mezcla de los elementos definidos de manera general como protectores fotodérmicos (juntos o separadamente con los compuestos fotoprotectores o filtros UV cuando estos se añaden) tendrán los mismos  
10 efectos de protección y reparación de la piel durante y después de la exposición al sol tanto si son añadidos al producto cosmético como una composición única o de manera separada durante su preparación.

En cualquiera de los dos casos, el resultado objeto de la presente invención es un  
15 producto cosmético, preferentemente de uso tópico, que comprende en su formulación al menos:

- a) alantoína, en una concentración comprendida entre 0.1 y 1%;
- b) pantenol, en una concentración comprendida entre 0.1 y 5%;
- c) acetato de tocoferol, en una concentración comprendida entre 0.05 y 2%;
- 20 d) tocoferol, en una concentración comprendida entre 0.01 y 1%;
- e) ascorbil fosfato de sodio, en una concentración comprendida entre 0.01 y 3%; y
- f) *Aloe barbadensis*, en una concentración comprendida entre 0.001%-5%,

refiriéndose los porcentajes indicados a porcentajes en peso respecto al peso total del producto, y estando los límites de los intervalos incluidos en el ámbito de la invención.  
25 Todas las variantes y alternativas comentadas anteriormente para estos componentes (por ejemplo, comprendiendo o no compuestos fotoprotectores que son filtros UV) se aplican también aquí para el caso del producto cosmético.

También en cualquiera de los casos descritos, una formulación del producto cosmético  
30 preferida completa al 100% en peso comprende los denominados protectores fotodérmicos hasta un 10% en peso, más preferiblemente aún hasta un 5% y más preferiblemente aún hasta un 4% (todos en conjunto), con una cantidad suficiente de excipientes. Cuando comprende además al menos un compuesto fotoprotector, éste aparece en un porcentaje en peso del total comprendido entre 0.1% y 30%, incluidos  
35 ambos límites.

A continuación se describe la composición preferida sobre el 100% en peso de la misma que puede presentar cualquiera de los productos cosméticos preparados de acuerdo con la presente invención, independientemente del tipo que sean (leche solar corporal, crema solar facial, spray solar corporal, entre otros, como los ejemplos:

<b>Ingredientes</b>	<b>% en peso del total de producto</b>
Filtros Fotodérmicos	1% - 4%
Aromatizante (perfume)	0.2% - 0.7%
Conservantes	0.5% - 2%
Otros ingredientes	16% - 25%
Agua	Hasta completar el 100%, pudiendo estar entre 40%-75%

En un caso más preferido, en que la composición (y el producto) comprende además compuestos fotoprotectores que son filtros UV, la formulación del producto es:

10

<b>Ingredientes</b>	<b>% en peso del total de producto</b>
Filtros Fotodérmicos	1% - 4%
Filtros UV	0.5% - 28%
Aromatizante (perfume)	0.2% - 0.7%
Conservantes	0.5% - 2%
Otros ingredientes	16% - 25%
Agua	Hasta completar el 100%, pudiendo estar entre 40%-75%

15

De acuerdo a la presente memoria, como "otros ingredientes" aparte del agua, el perfume y los conservantes se incluyen los emolientes, reguladores del pH, emulsionantes, principios activos, quelantes y solubilizantes, entre los más importantes.

20

La composición (o combinación) objeto de protección en cualquiera de sus variantes, así como el producto cosmético que la comprende, presenta preferentemente un factor de protección solar (FPS) comprendido entre 6 y 60.

Es asimismo objeto de la presente invención un uso cosmético de la composición tópica anteriormente descrita (y por extensión, del producto cosmético de uso tópico), que se caracteriza porque resulta eficaz como agente para la protección solar de la

piel. De manera preferente, la composición tópica o producto tópico se usa para la protección solar de la piel facial ó corporal. Otro uso cosmético asociado de la composición y al producto que la comprende es como agente para la reparación de la piel (preferiblemente facial o corporal). Por “reparación de la piel” debe entenderse que

5 tiene y ejerce efectos antienvjecimiento, antioxidantes y antiinflamatorios propios del conjunto de activos incluidos, después de la exposición solar del individuo (por ejemplo en un *aftersun* o en una crema de uso diario).

### **Ejemplos**

10 A continuación se incluyen varios ejemplos que ilustran la invención, a partir de diferentes fórmulas que atienden a los requisitos anteriormente expuestos para la composición esencial y la formulación total. Estos ejemplos ponen de manifiesto los beneficios pretendidos para la combinación de componentes, y se refieren a composiciones con diferentes combinaciones cualitativas y cuantitativas de los

15 componentes que actúan como protectores fotodérmicos: los esenciales, que son alantoína, pantenol, acetato de tocoferol, tocoferol y ascorbil fosfato de sodio, además de *Aloe barbadensis* (cuya forma más común de empleo es en polvo de jugo de hojas); así como las opciones propuestas que se pueden añadir de forma adicional: al menos uno de extracto de regaliz (glicirrizato de dipotasio), ubiquinona, bisabolol y

20 materia prima que contiene otros compuestos antioxidantes naturales diferentes a los hasta ahora citados, preferiblemente de la familia de los polifenoles y/o carotenoides tales como hidroquinonas, resveratrol, taninos, ácido ferúlico, astaxantina y similares. En estos ejemplos también se ilustran casos en los que la composición comprende adicionalmente diferentes concentraciones de filtros protectores UV.

25

#### *Método de preparación de las composiciones de uso tópico objeto de la presente invención*

Con el fin de poder comparar todos los resultados en cuanto al grado de protección frente a la radiación solar y las propiedades sensoriales, se unificó en la medida de lo

30 posible el proceso de fabricación de las muestras de productos cosméticos que comprenden la composición en los ejemplos siguientes. De forma general, se pesaron y mezclaron los ingredientes de la fase acuosa (entre ellos, el acetato de tocoferol y parte de los filtros UV), calentando hasta 80-85°C bajo agitación continua. Se continuó añadiendo el resto de componentes de la fase grasa (entre ellos, la alantoína y la

35 parte restante de los filtros UV) manteniendo la temperatura entre 80-85°C. Se realizó

la emulsión con las dos fases bajo las condiciones de 80-85°C, 12000 rpm, durante 5-10 minutos. Posteriormente, se empezó el proceso de enfriamiento bajo agitación continua. Una vez alcanzada una temperatura inferior a 40°C, se añadió el resto de ingredientes termolábiles (activos y conservantes y perfume, entre ellos el pantenol, *Aloe barbadensis*, ascorbil fosfato de sodio y pantenol). Finalmente se agitó la mezcla a 12000 rpm durante 3 minutos para garantizar la completa homogeneización del conjunto.

**Ejemplo 1: Fórmula leche solar corporal con FPS 15 teórico, con y sin filtros fotodérmicos**

Se preparó una fórmula de acuerdo con la presente invención, denominada Fórmula 1, en dos variantes: sin parte de la mayoría de componentes esenciales enumerados en la reivindicación 1 (denominados por simplificar “filtros fotodérmicos” o “protectores fotodérmicos”) y con ellos, para comprobar los efectos de su adición y de la posible sinergia con el resto de componentes (filtros fotoprotectores o UV, y excipientes), con la composición concreta que se presenta en la Tabla 1 en porcentajes en peso con respecto al total de la composición:

Tabla 1a – Composición de la Fórmula 1, con y sin filtros fotodérmicos

Fase de adición	Ingredientes	% (sin filtros)	% (con filtros)	Categoría / función
Grasa	Cetil fosfato de potasio (y) glicéridos de palma hidrogenado	1,500000	1,500000	Emulsionante
Grasa	Estearato de glicerilo	0,300000	0,300000	Emulsionante
Grasa	Cetearil alcohol	1,500000	1,500000	Aditivo Reológico
Grasa	Caprilato fenoxietilo	4,000000	4,000000	Emoliente
Grasa	Isononanoato de etilhexilo	3,000000	3,000000	Emoliente
Grasa	Hidroxiacetofenona	0,500000	0,500000	Conservante
Grasa	Acetato de tocoferol	-----	0,250000	F. fotodérmico
Grasa	Butil metoxidibenzoilmetano	3,000000	3,000000	Filtro UV
Grasa	Octocrileno	5,250000	5,250000	Filtro UV
Grasa	Salicilato de etilhexilo	4,500000	4,500000	Filtro UV
Acuosa	Agua	66,733000	65,100000	
Acuosa	Carbómero	0,100000	0,100000	Aditivo



				Reológico
Acuosa	Goma Xantana	0,200000	0,200000	Aditivo Reológico
Acuosa	Glicerina	5,000000	5,000000	Emoliente
Acuosa	Alantoína	-----	0.500000	F. fotodérmico
Acuosa	Ácido fenilbenzimidazol sulfónico	1,000000	1,000000	Filtro UV
Acuosa	Hidróxido de sodio	0,257000	0,279500	Regulador de pH
Termolábiles	Ciclopentasiloxano	2,000000	2,000000	Emoliente
Termolábiles	1,2-hexanediol y caprilil glicol	0,300000	0,300000	Conservante
Termolábiles	Fenoxietanol	0,200000	0,200000	Conservante
Termolábiles	Pantenol	-----	0.500000	F. fotodérmico
Termolábiles	<i>Aloe barbadensis</i> (polvo de jugo de hojas)	-----	0,500000	F. fotodérmico
Termolábiles	Ascorbil fosfato de sodio	-----	0.150000	F. fotodérmico
Termolábiles	Glizarrato dipotásico	-----	0.200000	F. fotodérmico
Termolábiles	Tocoferol	-----	0.020000	F. fotodérmico
Termolábiles	Diacetato glutamato tetrasódico	0,200000	0,200000	Quelante
Termolábiles	Pefume	0,400000		Perfume
TOTAL		100,000000	100,000000	

A las dos fórmulas presentadas en el Ejemplo 1 se les aplican los mismos estudios de propiedades para poder realizar un análisis comparativo. Se realizan estudios tanto In silico, In vitro e In vivo siguiendo la legislación vigente en el estudio de FPS.

5

Tabla 1b – Resultados de los estudios realizados In silico, In vitro e In vivo con las composiciones de Fórmula 1 respecto al grado de la protección solar, y propiedades de sensorialidad de las composiciones

Método	Sin filtros fotodérmicos	Con filtros fotodérmicos	Referencia
In silico	17.8	17.8	Se realizó una simulación del factor de protección solar in vivo (SPF, ISO24444). Una descripción de los cálculos realizados puede encontrarse en "In silico Determination of Topical Sun Protection", Bernd Herzog and Uli

			Osterwalder, Cosmetic Science Technology 2011, 62-70
In vitro	18	15	ISO 24444
In vivo	19.2	53	ISO 24443
Viscosidad	(0.7 – 1.6) PaS	(0.6 – 1) PaS	Reómetro
Sensorialidad	Leche de fácil extensión y rápida absorción.	Leche ligera de fácil extensión y rápida absorción	Inspección visual

Las conclusiones de la comparación realizada entre las dos variantes de la Formulación 1 son las siguientes:

- 5 - La incorporación de los componentes denominados filtros fotodérmicos aumenta el FPS In vivo 2.8 veces respecto a la fórmula sin filtros fotodérmicos, manteniéndose la concentración de filtros UV y por tanto sus valores de FPS In vitro e In silico.
- La adición de los filtros fotodérmicos mejora la sensorialidad del producto final.

10 Ejemplo 2: Fórmula crema solar facial con FPS 30 teórico, con y sin filtros fotodérmicos

Se preparó una fórmula de acuerdo con la presente invención, denominada Fórmula 2, en dos variantes: sin parte de la mayoría de componentes esenciales enumerados en la reivindicación 1 (denominados por simplificar “filtros fotodérmicos”) y con ellos, para  
15 comprobar los efectos de su adición y de la posible sinergia con el resto de componentes (filtros fotoprotectores o UV, y excipientes), con la composición concreta que se presenta en la Tabla 2 en porcentajes en peso con respecto al total de la composición:

20 Tabla 2a – Composición de la Fórmula 2, con y sin filtros fotodérmicos

Fase de adición	Ingredientes	% (sin filtros)	% (con filtros)	Categoría / función
Grasa	Cetil fosfato de potasio (y) glicéridos de palma hidrogenado	2.200000	2.200000	Emulsionante
Grasa	Docosanol (behenyl alcohol)	1.500000	1.500000	Aditivo reológico

ES 2 631 191 B1

Grasa	PEG-100 estearato y Estearato de glicerilo	1.200000	1.200000	Emulsionante
Grasa	Isononanoato de etilhexilo	1,000000	1,000000	Emoliente
Grasa	Triglicérido de ácido caprílico/caprínico	2,000000	2,000000	Emoliente
Grasa	Hidroxiacetofenona	0,500000	0,500000	Conservante
Grasa	Acetato de tocoferol	-----	0.250000	F. fotodérmico
Grasa	Butil metoxidibenzoilmetano	4,000000	4.000000	Filtro UV
Grasa	Octocrileno	10.000000	10.000000	Filtro UV
Grasa	Salicilato de etilhexilo	4,500000	4,500000	Filtro UV
Grasa	Dietilhexil butamido triazona	1.000000	1.000000	Filtro UV
Grasa	Silice	1.500000	1.500000	Emoliente
Acuosa	Agua	53.780000	51.140000	
Acuosa	Goma Xantana	0,200000	0,200000	Aditivo Reológico
Acuosa	Glicerina	4,000000	4,000000	Emoliente
Acuosa	Alantoína	-----	0.500000	F. fotodérmico
Acuosa	Acido fenilbenzimidazol sulfónico	2.000000	2.000000	Filtro UV
Acuosa	Fenil dibenzimidazol tetrasulfonato disódico	0.500000	0.500000	Filtro UV
Acuosa	Hidróxido de sodio	0.420000	0.420000	Regulador de pH
Termolábiles	Alcohol denat.	6.000000	6.000000	Solubilizante
Termolábiles	Caprilil meticona	2.000000	2.000000	Emoliente
Termolábiles	1,2-hexanediol y caprilil glicol	0,300000	0,300000	Conservante
Termolábiles	Fenoxietanol	0.200000	0.200000	Conservante
Termolábiles	Pantenol	-----	0.500000	F. fotodérmico
Termolábiles	<i>Aloe barbadensis</i> (polvo de jugo de hojas)	-----	0.020000	F. fotodérmico
Termolábiles	Ascorbil fosfato de sodio	-----	0.150000	F. fotodérmico
Termolábiles	Glizarrato dipotásico	-----	0.200000	F. fotodérmico
Termolábiles	Tocoferol	-----	0.020000	F. fotodérmico
Termolábiles	Acridoildimetiltaurato de amonio / VP copolímero	0.500000	0.500000	Aditivo reológico
Termolábiles	Diacetato glutamato tetrasódico	0.200000	0.200000	Quelante

ES 2 631 191 B1

Termolábiles	Pefume	0.5000000	0.5000000	Perfume
TOTAL		100,000000	100,000000	

A las dos fórmulas presentadas en el Ejemplo 2 se les aplican los mismos estudios para poder realizar un análisis comparativo. Se realizan estudios tanto In silico, In vitro e In vivo siguiendo la legislación vigente en el estudio de FPS.

5

Tabla 2b – Resultados de los estudios realizados In silico, In vitro e In vivo con las composiciones de Fórmula 2 respecto al grado de la protección solar, y propiedades de sensorialidad de las composiciones

Método	Sin filtros fotodérmicos	Con filtros fotodérmicos	Referencia
In silico	35.7	35.7	Se realizó una simulación del factor de protección solar in vivo (SPF, ISO24444). Una descripción de los cálculos realizados puede encontrarse en "In silico Determination of Topical Sun Protection", Bernd Herzog and Uli Osterwalder, Cosmetic Science Technology 2011, 62-70
In vitro	30	34	ISO 24444
In vivo	36.5	54.2	ISO 24443
Viscosidad	(1.1 – 1.9) PaS	(1.1 – 1.9) PaS	Reómetro
Sensorialidad	Crema de fácil extensión y rápida absorción.	Crema de fácil extensión y rápida absorción	Inspección visual

10 Las conclusiones de la comparación realizada entre las dos variantes de la Formulación 2 son las siguientes:

- La incorporación de los componentes denominados filtros fotodérmicos aumenta el FPS In vivo 1.5 veces respecto a la fórmula sin filtros fotodérmicos, manteniéndose la concentración de filtros UV y por tanto sus valores de FPS In vitro e In silico.

15

- La adición de los filtros fotodérmicos mantiene la sensorialidad del producto final.

Ejemplo 3: Fórmula spray solar corporal con FPS 50 teórico con y sin filtros fotodérmicos

Se preparó una fórmula de acuerdo con la presente invención, denominada Fórmula 3, en dos variantes: sin parte de la mayoría de componentes esenciales enumerados en la reivindicación 1 (denominados por simplificar “filtros fotodérmicos”) y con ellos, para comprobar los efectos de su adición y de la posible sinergia con el resto de componentes (filtros fotoprotectores o UV, y excipientes), con la composición concreta que se presenta en la Tabla 3 en porcentajes en peso con respecto al total de la composición:

Tabla 3a – Composición de la Fórmula 2, con y sin filtros fotodérmicos

Fase de adición	Ingredientes	% (sin filtros)	% (con filtros)	Categoría / función
Grasa	Cetil fosfato de potasio (y) glicéridos de palma hidrogenado	2.500000	2.500000	Emulsionante
Grasa	Fenoxietil caprilato	6,000000	6,000000	Emoliente
Grasa	Isononanoato de etilhexilo	3,000000	3,000000	Emoliente
Grasa	Acetato de tocoferol	-----	0.500000	F. fotodérmico
Grasa	Poliisobuteno	2.500000	2.500000	Emoliente
Grasa	Butil metoxidibenzoilmetano	4,500000	4.500000	Filtro UV
Grasa	Octocrileno	10.000000	10.000000	Filtro UV
Grasa	Salicilato de etilhexilo	4,500000	4,500000	Filtro UV
Grasa	Dietilhexil butamido triazona	3.500000	3.500000	Filtro UV
Acuosa	Agua	49.594500	45.654500	
Acuosa	Alantoína	-----	1.000000	F. fotodérmico
Acuosa	Poligliceril-6 estearato / poligliceril-6 behenato	1.000000	1.000000	Emulsionante
Acuosa	Hidroxiacetofenona	0.500000	0.500000	Conservante
Acuosa	Celulosa microcristalina / Goma celulosa	0.500000	0.500000	Aditivo reológico
Acuosa	Goma Xantana	0.400000	0.400000	Aditivo reológico
Acuosa	Glicerina	3.000000	3.000000	Emoliente
Acuosa	Ácido fenilbenzimidazol sulfónico	2.500000	2.500000	Filtro UV

Acuosa	Fenil dibenzimidazol tetrasulfonato disódico	2.000000	2.000000	Filtro UV
Acuosa	Hidróxido de sodio	0.705500	0.705500	Regulador de pH
Termolábiles	Ciclopentasiloxano	2.000000	2.000000	Emoliente
Termolábiles	1,2-hexanediol y caprilil glicol	0,500000	0,500000	Conservante
Termolábiles	Pantenol	-----	2.000000	F. fotodérmico
Termolábiles	<i>Aloe barbadensis</i> (polvo de jugo de hojas)	-----	0.100000	F. fotodérmico
Termolábiles	Ascorbil fosfato de sodio	-----	0.300000	F. fotodérmico
Termolábiles	Tocoferol	-----	0.040000	F. fotodérmico
Termolábiles	Diacetato glutamato tetrasódico / Hidróxido de sodio	0.2000000	0.2000000	Quelante
Termolábiles	Pefume	0.6000000	0.6000000	Perfume
TOTAL		100,000000	100,000000	

A las dos fórmulas presentadas en el Ejemplo 3 se les aplican los mismos estudios para poder realizar un análisis comparativo teórico (midiendo el FPS In vivo exclusivamente en la muestra con filtros fotodérmicos).

5

Tabla 3b – Resultados de los estudios realizados In silico, In vitro e In vivo con las composiciones de Fórmula 1 respecto al grado de la protección solar, y propiedades de sensorialidad de las composiciones

Método	Sin filtros fotodérmicos	Con filtros fotodérmicos	Referencia
In silico	49.6	49.6	Se realizó una simulación del factor de protección solar in vivo (SPF, ISO24444). Una descripción de los cálculos realizados puede encontrarse en "In silico Determination of Topical Sun Protection", Bernd Herzog and Uli Osterwalder, Cosmetic Science Technology 2011, 62-70
In vitro	52	51	ISO 24444
In vivo	50 (teórico)	61.4	ISO 24443
Viscosidad	(0.6 – 1) PaS	(0.6 – 1) PaS	Reómetro

Sensorialidad	Spray de fácil extensión y rápida absorción.	Spray de fácil extensión y rápida absorción	Inspección visual
---------------	--	---	-------------------

- Las conclusiones de la comparación realizada entre las dos variantes de la Formulación 3 son las siguientes: En este ejemplo se consigue alcanzar un FPS In vivo 50+ (>60) empleando filtros UV equivalentes a un FPS 50 más la combinación de filtros fotodérmicos.
- La incorporación de los filtros fotodérmicos permite partir de un FPS teórico (In silico) 20% menor del FPS necesario In vivo en este ejemplo (60).
- La adición de los filtros fotodérmicos mantiene la sensorialidad del producto final.

Ejemplo 4: Fórmula crema facial con FPS 2 teórico con y sin filtros fotodérmicos, comparación con FPS 6 sin filtros fotodérmicos.

Se preparó, como en los ejemplos anteriores, una fórmula de acuerdo con la presente invención, denominada Fórmula 4, en dos variantes: sin parte de la mayoría de componentes esenciales enumerados en la reivindicación 1 (denominados por simplificar “filtros fotodérmicos”) y con ellos, para comprobar los efectos de su adición y de la posible sinergia con el resto de componentes (filtros fotoprotectores o UV, y excipientes), con la composición concreta que se presenta en la Tabla 4 en porcentajes en peso con respecto al total de la composición. Además, se preparó una tercera composición de la Fórmula 4, sin filtros fotodérmicos con FPS6:

Tabla 4a – Composición de la Fórmula 4, con y sin filtros fotodérmicos y sin filtros fotodérmicos con FPS6

Fase de adición	Ingredientes	% (sin filtros)	% (con filtros)	% (sin filtros, con FPS6)	Categ / función
Acuosa	EDTA disódico	0.100000	0.100000	0.100000	Quelante
Acuosa	Agua	75.820000	73.900000	71.870000	
Acuosa	Alantoína	-----	0.500000	-----	F. fotod.
Acuosa	Éster hidrolizado de jojoba	0.400000	0.400000	0.400000	Emolient.

ES 2 631 191 B1

Acuosa	Celulosa microcristalina	0.200000	0.200000	0.200000	Aditivo reológico
Acuosa	Goma Xantana	0.400000	0.200000	0.150000	Aditivo reológico
Acuosa	Glicerina	0.200000	4.000000	4.000000	Emolient.
Grasa	Fenoxietil caprilato	3.000000	3.000000	3.000000	Emolient.
Grasa	Etilhexil palmitato	3,000000	3,000000	3.000000	Emolient.
Grasa	Aceite olus	3,000000	3,000000	3.000000	Emolient.
Grasa	Octocrileno	0.500000	0.500000	3.000000	Filtro UV
Grasa	Etilhexil salicilato	-----	-----	1.500000	Filtro UV
Grasa	Butil metoxidibenzoilmetano	0.250000	0.250000	1.000000	Filtro UV
Grasa	Cetearil alcohol / Gliceril estearato / PEG-40 estearato / Cetearith-20	3.000000	3.000000	3.000000	Emulsio.
Grasa	Docosanol (behenyl alcohol)	2.000000	2.000000	1.250000	Aditivo reológ.
Termoláb.	Hidroxiacetofenona	0.600000	0.600000	0.600000	Conser.
Termoláb.	Acetato de tocoferol	-----	0.200000	-----	F. fotodér.
Termoláb.	Dimeticona / Dimeticonol	0.500000	0.500000	0.500000	Emolient.
Termoláb.	Fenoxietanol	0.400000	0.400000	0.400000	Conserv.
Termoláb.	Aceite de soja (glicina de soja)	2.000000	2.000000	2.000000	Emolient.
Termoláb.	Tocoferol	-----	0.020000	-----	F. Fotodér.
Termoláb.	Ascorbil fosfato de sodio	-----	0.150000	-----	F. fotodér.
Termoláb.	<i>Aloe barbadensis</i> (polvo de jugo de hojas)	-----	0.050000	-----	F. fotodér.
Termoláb.	Pantenol	-----	1.000000	-----	F.



					fotodér.
Termoláb.	Pefume	0.250000	0.250000	0.250000	Perfume
Termoláb.	Hidróxido de sodio	0.030000	0.030000	0.030000	Regu. pH
Termoláb.	Poliacrilato sódico / Polidiceno hidrogenado / Trideceth-6	0.750000	0.750000	0.750000	Adit. reol.
TOTAL		100,000000	100,000000	100,000000	

A las tres fórmulas presentadas en el ejemplo 4 se les aplican los mismos estudios para poder realizar un análisis comparativo teórico (midiendo el FPS In vivo en la muestra con filtros fotodérmicos y en la FPS 6 sin filtros fotodérmicos).

5

Tabla 4b – Resultados de los estudios realizados In silico, In vitro e In vivo con las composiciones de Fórmula 4 respecto al grado de la protección solar, y propiedades de sensorialidad de las composiciones

Método	Sin filtros fotodérmicos	Con filtros fotodérmicos	Sin filtros fotodérmicos FPS 6	Referencia
In silico	1.8	1.8	6	Se realizó una simulación del factor de protección solar in vivo (SPF, ISO24444). Una descripción de los cálculos realizados puede encontrarse en "In silico Determination of Topical Sun Protection", Bernd Herzog and Uli Osterwalder, Cosmetic Science Technology 2011, 62-70
In vitro	2.9	3.0	5	ISO 24444
In vivo	2 (teórico)	7.1	7.1	ISO 24443
Viscosidad	(3.5 – 4.5) PaS	(2.5 – 3.5) PaS	(4.1 – 5.1) PaS	Reómetro
Sensorialidad	Crema viscosa de fácil extensión y rápida	Crema ligera de fácil extensión y rápida	Crema viscosa de fácil extensión y rápida	Inspección visual

	absorción.	absorción	absorción.	
--	------------	-----------	------------	--

Las conclusiones de la comparación realizada entre las dos variantes de la Formulación 2 son las siguientes:

- 5 - En este ejemplo se consigue alcanzar un FPS In vivo 7.1 (>6) empleando filtros UV equivalentes a un FPS 2 más la combinación de filtros fotodérmicos.
- Se puede conseguir el FPS deseado en este ejemplo (>6), empleando 7.3 veces menos concentración de filtros UV.
- La incorporación de los filtros fotodérmicos permite partir de un FPS teórico (In silico) 66% menor del FPS necesario In vivo en este ejemplo (6).
- 10 - La adición de los filtros fotodérmicos mejora la sensorialidad del producto final.

*Ejemplo 5: Fórmula leche solar corporal con FPS 12 teórico, con y sin filtros fotodérmicos*

Se preparó una fórmula de acuerdo con la presente invención, denominada Fórmula 5, en dos variantes: sin parte de la mayoría de componentes esenciales enumerados en la reivindicación 1 (denominados por simplificar “filtros fotodérmicos”) y con ellos, para comprobar los efectos de su adición y de la posible sinergia con el resto de componentes (filtros fotoprotectores o UV, y excipientes), con la composición concreta que se presenta en la Tabla 5 en porcentajes en peso con respecto al total de la composición:

Tabla 5a – Composición de la Fórmula 5, con y sin filtros fotodérmicos

Fase de adición	Ingredientes	% (sin filtros)	% (con filtros)	Categoría / función
Grasa	Cetil fosfato de potasio (y) glicéridos de palma hidrogenado	1.500000	1.500000	Emulsionante
Grasa	Gliceril estearato	0.300000	0.300000	Emoliente
Grasa	Cetearil alcohol	1.500000	1.500000	Aditivo Reológico.
Grasa	Fenoxietil caprilato	4.000000	4.000000	Emoliente
Grasa	Isononanoato de etilhexilo	3.000000	3.000000	Emoliente
Grasa	Hidroxiacetofenona	0.500000	0.500000	Conservante
Grasa	Acetato de tocoferol	-----	0.250000	F. fotodérmico
Grasa	Butil metoxidibenzoilmetano	2.000000	2.000000	Filtro UV

ES 2 631 191 B1

Grasa	Octocrileno	5.000000	5.000000	Filtro UV
Grasa	Salicilato de etilhexilo	4.800000	4,800000	Filtro UV
Acuosa	Agua	68.880000	66.910000	
Acuosa	Alantoína	-----	1.000000	F. fotodérmico
Acuosa	Carbómero	0.100000	0.100000	Aditivo reológico
Acuosa	Goma Xantana	0.300000	0.300000	Aditivo reológico
Acuosa	Glicerina	5.000000	5.000000	Emoliente
Acuosa	Alantoína	-----	0.500000	F. fotodérmico
Termolábiles	Ciclopentasiloxano	2.000000	2.000000	Emoliente
Termolábiles	1,2-hexanediol y caprilil glicol	0.300000	0.300000	Conservante
Termolábiles	Fenoxietanol	0.200000	0.200000	Conservante
Termolábiles	Pantenol	-----	1.000000	F. fotodérmico
Termolábiles	<i>Aloe barbadensis</i> (polvo de jugo de hojas)	-----	0.050000	F. fotodérmico
Termolábiles	Ascorbil fosfato de sodio	-----	0.150000	F. fotodérmico
Termolábiles	Tocoferol	-----	0.020000	F. fotodérmico
Termolábiles	Hidróxido de sodio	0.019800	0.019800	Regulador pH
Termolábiles	Diacetato glutamato tetrasódico	0,200000	0,200000	Quelante
Termolábiles	Pefume	0.4000000	0.4000000	Perfume
TOTAL		100,000000	100,000000	

A las dos fórmulas presentadas en el ejemplo 5 se les aplican los mismos estudios para poder realizar un estudio comparativo teórico (midiendo el FPS In vivo exclusivamente en la muestra con filtros fotodérmicos).

5

Tabla 5b – Resultados de los estudios realizados In silico, In vitro e In vivo con las composiciones de Fórmula 5 respecto al grado de la protección solar, y propiedades de sensorialidad de las composiciones

Método	Sin filtros fotodérmicos	Con filtros fotodérmicos	Referencia
In silico	12.2	12.2	Se realizó una simulación del factor de protección solar in vivo (SPF, ISO24444). Una descripción de los cálculos realizados puede encontrarse en "In silico Determination of Topical

			Sun Protection”, Bernd Herzog and Uli Osterwalder, Cosmetic Science Technology 2011, 62-70
In vitro	15	11	ISO 24444
In vivo	15 (teórico)	32.2	ISO 24443
Viscosidad	(0.6 – 1) PaS	(0.6 – 1) PaS	Reómetro
Sensorialidad	Leche de fácil extensión y rápida absorción.	Leche de fácil extensión y rápida absorción	Inspección visual

Las conclusiones de la comparación realizada entre las dos variantes de la Formulación 3 son las siguientes:

- 5
- En este ejemplo se consigue alcanzar un FPS In vivo 32.2 (>30) empleando filtros UV equivalentes a un FPS 15 más la combinación de filtros fotodérmicos.
  - La incorporación de los filtros fotodérmicos permite partir de un FPS teórico (In silico) 59% menor del FPS necesario In vivo en este ejemplo (30).
  - La adición de los filtros fotodérmicos mantiene la sensorialidad del producto final.
- 10

*Ejemplo 6: Fórmula spray solar corporal con FPS 6 teórico con y sin filtros fotodérmicos*

Se preparó una fórmula de acuerdo con la presente invención, denominada Fórmula 6, en dos variantes: sin parte de la mayoría de componentes esenciales enumerados en la reivindicación 1 (denominados por simplificar “filtros fotodérmicos”) y con ellos, para comprobar los efectos de su adición y de la posible sinergia con el resto de componentes (filtros fotoprotectores o UV, y excipientes), con la composición concreta que se presenta en la Tabla 6 en porcentajes en peso con respecto al total de la composición:

15

20

Tabla 6a – Composición de la Fórmula 6, con y sin filtros fotodérmicos

Fase de adición	Ingredientes	% (sin filtros)	% (con filtros)	Categoría / función
Grasa	Cetil fosfato de potasio (y) glicéridos de palma hidrogenado	1.500000	1.500000	Emulsionante
Grasa	C12-C15 Alquil benzoato	3.000000	3.000000	Emoliente

ES 2 631 191 B1

Grasa	Isononanoato de etilhexilo	3,000000	3.000000	Emoliente
Grasa	Acetato de tocoferol	-----	0.250000	F. fotodérmico
Grasa	Polisobuteno	1.500000	1.500000	Emoliente
Grasa	Butil metoxidibenzoilmetano	1.000000	1.000000	Filtro UV
Grasa	Octocrileno	3.000000	3.000000	Filtro UV
Grasa	Salicilato de etilhexilo	2.000000	2.000000	Filtro UV
Grasa	Hidroxiacetofenona	0.500000	0.500000	Conservante
Grasa	Poligliceril-6 estearato / Poligliceril-6 behenato	2.500000	2.500000	Emulsionante
Grasa	Celulosa microcristalina	0.500000	0.500000	Aditivo reológico
Grasa	Goma Xantana	0.300000	0.300000	Aditivo reológico
Acuosa	Agua	75.170000	73.200000	
Acuosa	EDTA disódico	0.100000	0.100000	Quelante
Acuosa	Glicerina	4.000000	4.000000	Emoliente
Acuosa	Alantoína	-----	0.500000	F. fotodérmico
Termolábiles	Ciclopentasiloxano	2.000000	2.000000	Emoliente
Termolábiles	1,2-hexanediol y caprilil glicol	0.500000	0.500000	Conservante
Termolábiles	Pantenol	-----	1.000000	F. fotodérmico
Termolábiles	<i>Aloe barbadensis</i> (polvo de jugo de hojas)	-----	0.050000	F. fotodérmico
Termolábiles	Ascorbil fosfato de sodio	-----	0.150000	F. fotodérmico
Termolábiles	Tocoferol	-----	0.020000	F. fotodérmico
Termolábiles	Hidróxido de sodio	0.010500	0.010500	Regulador pH
Termolábiles	Perfume	0.400000	0.400000	Perfume
TOTAL		100,000000	100,000000	

A las dos fórmulas presentadas en el ejemplo 6 se les aplican los mismos estudios para poder realizar un análisis comparativo teórico (midiendo el FPS In vivo exclusivamente en la muestra con filtros fotodérmicos).

5

Tabla 6b – Resultados de los estudios realizados In silico, In vitro e In vivo con las composiciones de Fórmula 6 respecto al grado de la protección solar, y propiedades de sensorialidad de las composiciones

Método	Sin filtros fotodérmicos	Con filtros fotodérmicos	Referencia
--------	-----------------------------	-----------------------------	------------

In silico	6.6	6.6	Se realizó una simulación del factor de protección solar in vivo (SPF, ISO24444). Una descripción de los cálculos realizados puede encontrarse en "In silico Determination of Topical Sun Protection", Bernd Herzog and Uli Osterwalder, Cosmetic Science Technology 2011, 62-70
In vitro	7.5	8	ISO 24444
In vivo	7 (teórico)	17.6	ISO 24443
Viscosidad	(0.2 – 0.3) PaS	(0.2 – 0.3) PaS	Reómetro
Sensorialidad	Spray de fácil extensión y rápida absorción.	Spray de fácil extensión y rápida absorción	Inspección visual

Las conclusiones de la comparación realizada entre las dos variantes de la Formulación 6 son las siguientes:

- 5
- En este ejemplo se consigue alcanzar un FPS In vivo 17.6 (>15) empleando filtros UV equivalentes a un FPS 7 más la combinación de filtros fotodérmicos.
  - La incorporación de los filtros fotodérmicos permite partir de un FPS teórico (In silico) 56% menor del FPS necesario In vivo en este ejemplo (15).
  - La adición de los filtros fotodérmicos mantiene la sensorialidad del producto final.

## REIVINDICACIONES

1. Una composición para protección solar y/o reparación de la piel por exposición a la radiación solar que se caracteriza por que comprende:
- 5 a) alantoína, en una concentración comprendida entre 0.1 y 1%, incluidos ambos límites;
  - b) pantenol, en una concentración comprendida entre 0.1 y 5%, incluidos ambos límites;
  - c) acetato de tocoferol, en una concentración comprendida entre 0.05 y 2%,  
10 incluidos ambos límites;
  - d) tocoferol, en una concentración comprendida entre 0.01 y 1%, incluidos ambos límites;
  - e) ascorbil fosfato de sodio, en una concentración comprendida entre 0.01 y 3%,  
incluidos ambos límites, y
  - 15 f) *Aloe barbadensis*, en una concentración comprendida entre 0.001% y 5%,  
incluidos ambos límites
- como protectores fotodérmicos, en porcentaje en peso respecto del peso total de la composición.
- 20 2. La composición según la reivindicación 1, que comprende adicionalmente al menos uno de los siguientes protectores fotodérmicos: extracto de regaliz, en un porcentaje de hasta el 0.2% en peso del total de composición; ubiquinona, en un porcentaje de hasta el 0.2% en peso del total de composición; bisabolol, en un porcentaje de hasta el 0.2% en peso del total de composición; y materia prima que contiene compuestos  
25 antioxidantes naturales de la familia de los polifenoles y/o carotenoides, hasta un 0.5% en peso del total de composición.
3. La composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 ó 2, que comprende además al menos un compuesto fotoprotector frente a la radiación solar, estando  
30 comprendido en una concentración de entre 0.1% y 30% en peso del peso total de la composición.
4. La composición según la reivindicación 3, donde el al menos un compuesto fotoprotector es un compuesto protector frente a la radiación ultravioleta UVA y/o UVB.

35

5. La composición según la reivindicación anterior, donde el al menos un compuesto fotoprotector es seleccionado del grupo compuesto por:

- Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina, en un máximo del 10%
- Butil metoxidibenzoilmetano, en un máximo del 5%
- 5 - Dietilamino hidroxibenzoil Hexil Benzoato, en un máximo del 10%
- Fenil dibenzimidazol tetrasulfonato disódico, en un máximo del 10%
- Drometrizol Trisiloxano, en un máximo del 15%
- (Nano) Metilen bis-benzotriazolil tetrametilbutilfenol, en un máximo del 10%
- Ácido tereftalideno- dialcanfor sulfónico, en un máximo del 10%
- 10 - 4-Metilbencilideno Alcanfor, en un máximo del 4%
- 3-benzofenona, en un máximo del 10%
- 4- benzofenona, en un máximo del 5%
- Dietilhexil butamido triazona, en un máximo del 10%
- Metoxicinamato de etilhexilo, en un máximo del 10%
- 15 - Salicilato de etilhexilo, en un máximo del 5%
- Triazona de etilhexilo, en un máximo del 5%
- Etilhexil dimetil PABA, en un máximo del 10%
- Homomentil salicilato, en un máximo del 10%
- Isoamil p-metoxicinamato, en un máximo del 10%
- 20 - Octocrileno, en un máximo del 10%
- Ácido fenilbenzimidazol sulfónico, en un máximo del 8%
- Polisilicona 15, en un máximo del 10%
- Dióxido de titanio, en un máximo del 25%
- (Nano) Bis-trifenil triazina, en un máximo del 10%
- 25 y cualquier combinación de los mismos.

6. La composición según la reivindicación anterior, donde el compuesto fotoprotector está presente en el siguiente porcentaje en peso respecto del peso total de la composición:

- 30 - Butil metoxidibenzoilmetano: entre 0.25% y 4.5%;
- Fenil dibenzimidazol tetrasulfonato disódico: entre 0.5% y 3%;
- Dietilhexil butamido triazona: entre 0.5% y 3%;
- Salicilato de etilhexilo: entre 1.5% y 4.8%;
- Triazona de etilhexilo: entre 2.5% y 4.5%
- 35 - Octocrileno: entre 0.50% y 10%;



- Ácido fenilbenzimidazol sulfónico: entre 1 y 3%;  
y cualquier combinación de los mismos.

7. Un producto caracterizado por que comprende la composición descrita según una  
5 cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que es un producto cosmético de uso  
tópico para la protección y reparación solar de la piel.

8. Un producto cosmético de uso tópico para la protección y reparación solar de la piel,  
que comprende:

- 10 a) alantoína, en una concentración comprendida entre 0.1 y 1%;  
b) pantenol, en una concentración comprendida entre 0.1 y 5%;  
c) acetato de tocoferol, en una concentración comprendida entre 0.05 y 2%;  
d) tocoferol, en una concentración comprendida entre 0.01 y 1%, incluidos ambos  
límites;  
15 e) ascorbil fosfato de sodio, en una concentración comprendida entre 0.01 y 3%,  
y  
f) *Aloe barbadensis*, en una concentración comprendida entre 0.001% y 5%  
como protectores fotodérmicos, en porcentaje en peso respecto del peso total del  
producto, e incluidos ambos límites.

20

9. El producto según una cualquiera de las reivindicaciones 7 ú 8, que es seleccionado  
dentro del grupo compuesto por: crema, emulsión, loción, gel, ungüento y aerosol.

10. El producto según una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9, que comprende:

- 25 - el conjunto de los protectores fotodérmicos en una concentración máxima del  
10% en peso del peso total de la composición;  
- al menos un compuesto fotoprotector en una concentración comprendida entre  
el 0.1% y el 30%, ambos límites incluidos; y  
- una cantidad suficiente de excipientes.

30

11. El producto según la reivindicación anterior, donde los excipientes son  
seleccionados dentro del grupo compuesto por: gelificantes, emulsionantes,  
tensoactivos, factores de consistencia, conservantes, emolientes, humectantes,  
modificadores reológicos, ajustadores de pH, quelantes, siliconas, ceras, fragancias y  
35 perfumes, acondicionadores de la piel y cualquier combinación de los mismos.

12. El producto según una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 11, que presenta un factor de protección solar comprendido entre 6 y 60.

5 13. Un uso cosmético de la composición descrita en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, para la protección solar de la piel y/o para la reparación de la piel por exposición a la radiación solar.

10 14. Un uso cosmético del producto descrito en una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 12, para la protección solar de la piel y/o para la reparación de la piel por exposición a la radiación solar.

15 15. El uso cosmético descrito en una cualquiera de las reivindicaciones 13 ó 14, para la protección y/o reparación de la piel facial o corporal por exposición a la radiación solar.