

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 664 865**

51 Int. Cl.:

A61K 8/35 (2006.01)

A61K 8/37 (2006.01)

A61K 8/39 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.10.2010 PCT/US2010/052292**

87 Fecha y número de publicación internacional: **21.04.2011 WO11046919**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.10.2010 E 10765920 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **28.02.2018 EP 2488151**

54 Título: **Composiciones de protector solar**

30 Prioridad:

12.10.2009 US 250615 P

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

23.04.2018

73 Titular/es:

**WYETH LLC (100.0%)
235 East 42nd Street
New York, NY 10017-5755, US**

72 Inventor/es:

**PATEL, BHALCHANDRA, SOMABHAI;
DICKERSON, JAY, ROBERTS;
AGISIM, GARY, ROBERT y
KENNY, RICHARD, JOHN**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 664 865 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

Composiciones de protector solar

Campo

5 La invención se refiere a composiciones de tratamiento labial con enmascaramiento del sabor, nuevas y útiles, y a procedimientos para preparar las composiciones. Las composiciones de tratamiento labial de la invención comprenden cantidades eficaces de protectores solares UVA y UVB en las que el sabor de los componentes orgánicos del protector solar está enmascarado de manera eficaz.

Antecedentes

10 Los labios humanos son propensos a daño solar cuando se exponen a la radiación UVA y/o UVB. Una protección eficaz contra la radiación UVA y UVB requiere el uso de cantidades significativas de protector solar y, frecuentemente, una mezcla de protectores solares orgánicos para conseguir una protección eficaz contra las radiaciones UVA y UVB. La radiación UVB, que es radiación en el intervalo de longitudes de onda de 290 nm-320 nm, se ha caracterizado tradicionalmente como la radiación que provoca quemadura solar, ya que es la radiación que típicamente produce enrojecimiento de la piel. Además de producir enrojecimiento, puede disminuir los antioxidantes enzimáticos y no enzimáticos en la piel y afectar a los mecanismos naturales de protección en la piel, contribuyendo al daño del ADN y a un posible cáncer de piel. Los peligros de la radiación UVA, que es la radiación en el intervalo de longitudes de onda de 320 nm a 400 nm, se han reconocido solo recientemente. La exposición crónica a la radiación UVA puede causar daños en el gen P53 del ADN, que conduce posiblemente a cáncer. Además, las longitudes de onda de UVA más largas permiten una penetración relativamente profunda en los tejidos de la piel, causando daños en las fibras elásticas y el colágeno que proporcionan a la piel su forma, causando de esta manera arrugas y eventualmente un envejecimiento prematuro de la piel. De esta manera, la protección de la piel, incluyendo la piel de los labios, contra los rayos UVA y UVB es importante para el mantenimiento de la salud y la apariencia de la piel.

25 Desafortunadamente, los protectores solares, especialmente los protectores solares orgánicos, tienen mal sabor. Algunos protectores solares que incluyen avobenzona, que es particularmente útil para la protección UVA, tienen un sabor muy desagradable. Este mal sabor no es un problema para las lociones que se aplican al cuerpo para proteger las superficies del cuerpo contra el daño solar, pero se convierten en un problema importante cuando los protectores solares se incorporan en composiciones de tratamiento labial. Desafortunadamente, no hay otros protectores solares disponibles que proporcionen protección UVA de una manera tan efectiva como la avobenzona.

30 Antes de la presente invención, la formación de un protector labial o un tratamiento con niveles de protector solar que tuviese una eficacia de FPS 30 o superior (es decir, una protección UVB significativa) ha producido composiciones que tienen un sabor muy desagradable. El sabor es lo suficientemente desagradable como para desalentar el uso y/o resulta en un cumplimiento limitado. Los productos para labios comerciales que declaran proporcionar una protección FPS 30 o superior son reconocidas ampliamente por tener mal sabor. La adición de avobenzona a dichas composiciones para proporcionar protección UVA agrava significativamente el problema.

35 Convencionalmente, se han usado edulcorantes y/o aromatizantes para cubrir o enmascarar sabores desagradables. En este enfoque, el edulcorante y/o el aromatizante compiten con el sabor indeseable. Aunque esto puede tener éxito en algunas aplicaciones, no es satisfactorio para enmascarar los sabores muy fuertes y/o amargos de los protectores solares orgánicos. Además, el aromatizante y/o el edulcorante pueden carecer de persistencia del sabor durante todo el período de tiempo que el protector solar permanece en los labios, resultando en la evolución de una sensación desagradable después de un período de tiempo.

40 Los revestimientos y las formas de encapsulación son otros enfoques para enmascarar el sabor. Sin embargo, los revestimientos y/o la encapsulación pueden alterar la reactividad o la liberación del agente activo. Además, el revestimiento o la encapsulación de un material de mal sabor en un producto labial es típicamente un problema incluso más difícil que el enmascaramiento del sabor de un material ingerido, ya que, a diferencia de los materiales ingeridos, el producto está destinado a permanecer en los labios durante varias horas. La integridad del revestimiento sobre los labios debe mantenerse durante un período de varios minutos a varias horas. La integridad del revestimiento tras la exposición al aire, a la humedad y/o a la luz debe mantenerse durante un período de tiempo mucho más prolongado que el tiempo necesario para tragar una composición ingerible.

45 Además de la necesidad de mantener el enmascaramiento del sabor durante un largo período de uso, en el caso del protector solar en un bálsamo labial, el mecanismo de enmascaramiento del sabor no debe afectar negativamente a la función de protección solar del tejido labial contra la radiación UVA y/o UVB.

50 El documento US 6.231.838 divulga el uso de dióxido de silicio coloidal como ingrediente enmascarador del sabor en una composición de protector solar que puede aplicarse a los labios.

Una presentación titulada "Spider Esters - A new class of Polar Esters" con fecha del 7 de Noviembre de 2005 [disponible en <http://www.surfatech.com/pdfs/Spider%20Presentation%20Nov%202005.pdf>] divulga un bálsamo labial que contiene un éster araña ("spider") y un protector solar, pero no menciona el enmascaramiento del sabor.

Sumario

5 La invención proporciona un tratamiento labial que comprende una composición de protector solar con sabor enmascarado en la que la composición de protector solar con sabor enmascarado comprende el éster araña sorbet-2-hexaoleato, el fotoestabilizador 2,6-naftalato de dietilhexilo y los protectores solares homosalato, octilsalato, oxibenzona, octinoxato y avobenzona, en el que los protectores solares, el éster araña y el fotoestabilizador están en íntima asociación.

La avobenzona es un ejemplo de un protector solar orgánico.

10 En una realización ejemplar, la relación de la cantidad total de protector solar a éster araña es de aproximadamente 0,6 a aproximadamente 2 en peso.

En una realización ejemplar, el tratamiento labial es una barra de bálsamo labial extensible y retráctil.

Descripción detallada

15 La presente invención está dirigida a tratamientos labiales que incluyen bálsamos labiales con cantidades eficaces de protectores solares orgánicos en los que el protector solar orgánico tiene un sabor enmascarado. En una realización preferente, el tratamiento labial tiene en una presentación en barra. Los protectores solares con sabor enmascarado de la invención comprenden al menos un protector solar que tiene propiedades organolépticas desagradables y uno o más ésteres araña.

20 La expresión "propiedades organolépticas desagradables", como se usa en la presente memoria, significa un sabor y/o un olor asociado con una composición que un usuario razonable de la composición encontraría desagradable al contacto con la boca y/o la zona del labio y/o durante la ingestión. El sabor puede incluir sabores verdaderos como amargo y/o agrio por ejemplo y/o de manera alternativa un olor y/o un sabor que imparta una respuesta organoléptica desagradable debido al contacto con la zona del labio o de la boca.

25 La expresión "cantidad eficaz" de un protector solar es una cantidad de protector solar suficiente para proporcionar una protección medible contra la radiación solar determinada por tener un valor FPS (factor de protección solar) y/o un valor de protección UVA medibles.

El término "FPS" (factor de protección solar) significa la energía UVB requerida para producir una dosis mínima de eritema en una piel tratada con protector solar dividida por la energía UVB requerida para producir una dosis mínima de eritema en la piel no protegida.

30 La expresión "éster araña" significa un compuesto constituido por grupos ácidos grasos esterificados a cadenas cortas de polioxialquileo que a su vez están unidas a un grupo de enlace común, como se describe, por ejemplo, en la patente US 7.473.707.

35 La expresión "cantidad efectiva de un éster araña", como se proporciona en la presente memoria, se define como una cantidad del éster araña al menos suficiente para proporcionar un enmascaramiento del sabor de un protector solar orgánico o una combinación de protectores solares orgánicos cuando entran en contacto con las áreas del labio o de la boca. En realizaciones preferentes, el enmascaramiento del sabor es suficiente para efectuar un enmascaramiento de sabor esencialmente completo del sabor desagradable del ingrediente activo. Sin embargo, se reconoce que la reducción del grado de sabor desagradable puede ser adecuada en algunas aplicaciones. Por consiguiente, una cantidad suficiente de éster araña para reducir el sabor desagradable o, de manera alternativa, para mejorar el sabor, debe considerarse que está dentro del alcance de la expresión "cantidad efectiva" de éster araña.

40 Como se usa en la presente memoria, un "tratamiento labial" es una composición semisólida para su aplicación a los labios que proporciona propiedades protectoras y/o hidratantes, y/o un agente beneficioso y/o protector solar y/o activo farmacéutico a la zona del labio o de la boca. Estas composiciones incluyen bálsamos labiales en una presentación en barra, así como bálsamos labiales blandos tales como, por ejemplo, los dispensados en tarros, potes o tubos.

45 La expresión "bálsamo labial en barra" significa un bálsamo labial con estructurante suficiente de manera que pueda formarse en una barra que es extensible y retráctil desde un recipiente y es suficientemente robusta para retener sustancialmente la forma de barra bajo las condiciones comerciales típicas de envío, almacenamiento y uso.

50 La expresión "barra de labios" significa un producto de barra cerosa que contiene pigmento, en la que el pigmento es transferible a los labios para impartir un color visible a los labios. Las barras de labios pueden ser cosméticas o tratamientos labiales. La barra de labios es un tratamiento labial si además de impartir color proporciona propiedades

protectoras y/o hidratantes, y/o un agente beneficioso y/o un protector solar y/o un activo farmacéutico al labio o a la zona del labio.

5 La expresión "protector solar orgánico" significa un compuesto o mezcla de compuestos que puede proteger la piel humana contra la radiación UVA y/o UVB y es la clase de compuestos clasificados por los expertos en la técnica de la química como productos químicos orgánicos. Los ejemplos de protectores solares orgánicos incluyen, pero no se limitan a, ácido aminobenzoico, avobenzona, cinotato, homosalato, meradimato, octocrileno, oxibenzona, octinoxato, octisalato, padimato O, ensulizola, sulisobenzona y salicilato de trolamina.

10 La expresión "protector solar inorgánico" significa un compuesto o mezcla de compuestos que puede proteger la piel humana contra la radiación UVA y/o UVB y es la clase de compuestos clasificados por los expertos en la técnica de la química como productos químicos inorgánicos. Los protectores solares inorgánicos ejemplares incluyen, pero no se limitan a, óxido de zinc y dióxido de titanio.

15 El término "aproximadamente" significa dentro de un intervalo aceptable para el parámetro particular especificado según lo determina un experto en la técnica, que dependerá, en parte, de cómo se mide o se determina el valor, es decir, las limitaciones del sistema de medición. Por ejemplo, "aproximadamente" puede significar un intervalo de hasta el 10% de un valor determinado.

"Porcentaje" o "%", como se usa en la presente memoria, se refiere al porcentaje en peso de la composición total, a menos que se especifique lo contrario.

20 El término "peso/peso", a menos que se indique lo contrario, significa la relación entre el peso de un componente determinado o una combinación especificada de componentes y el peso total de la composición expresada como un porcentaje.

Una designación de que una sustancia es semisólida debería entenderse que significa el estado físico de la sustancia en el intervalo de temperaturas de aproximadamente 20°C a aproximadamente 40°C.

25 El término "vaselina" se refiere a vaselina, que es una mezcla de los miembros más blandos de la serie de hidrocarburos de parafina o metano, obtenida del petróleo como un producto intermedio en la destilación. La vaselina se percibe típicamente como sedante cuando se aplica a la piel humana.

30 El sabor de los protectores solares orgánicos en las composiciones de tratamiento labial de la presente invención se enmascara usando ésteres araña sorbet-2-hexaoleato. El enmascaramiento del sabor se consigue formando una asociación íntima entre los protectores solares orgánicos, el éster araña y el fotoestabilizador, antes de combinar los protectores solares íntimamente asociados, el éster araña y el fotoestabilizador con otros componentes de la composición.

35 Los ésteres araña se han descrito y reivindicado para uso cosmético como emolientes en la patente US 7.473.707 y las solicitudes de patente US publicadas números 2008/0319069, 2009/0171057 y 2009/0170943 para su uso en humectación y emoliencia para la piel. Los denominados "ésteres araña" tienen un grupo ácido graso conectado a través de un polioxialquileo corto a un grupo de enlace común. El éster resultante tiene una estructura molecular tridimensional con la configuración general que se asemeja a una araña, en la que el grupo de enlace forma "el cuerpo" de la "araña", el bajo número de grupos polialqueno forma la primera parte de las "patas de araña" que conectan el cuerpo y los grupos éster de ácido graso forman el resto de la "araña". La combinación del grupo de enlace común y las cadenas cortas de polioxialquileo crea una estructura tridimensional con rotación limitada. Sin embargo, se cree, sin deseos de aferrarse a la creencia, que no forma una estructura cerrada tal como una jaula en el sentido convencional ya que se cree que los ésteres de ácidos grasos se extienden desde la estructura. Además, los ésteres araña tienen la característica inusual de carecer de propiedades tensioactivas a pesar de que los bloques constructivos de los ésteres araña son componentes constructivos comunes en los tensioactivos. Se cree que esta falta de propiedades tensioactivas es debida al impedimento estérico en la estructura molecular.

40 Los ésteres araña que tienen utilidad particular para enmascarar el sabor son ésteres araña que tienen un grupo de enlace común seleccionado de entre glicerol, glicol o sorbitol con cadena corta de unidades de óxido de etileno, cadena corta de unidades de óxido de propileno o una mezcla de las mismas unida a cada oxígeno del grupo de enlace. La cadena de polioxialqueno unida a cada oxígeno tiene preferentemente de 1-5 unidades de polioxialqueno. Los ésteres de ácidos grasos esterificados a las cadenas polioxialqueno tienen típicamente cadenas alquilo de 7-21 átomos de carbono. En una realización, son preferentes los ésteres araña que tienen el grupo de enlace común de sorbitol. Los ésteres araña que tienen grupos de enlace glicerol, glicol y sorbitol están disponibles comercialmente y/o pueden prepararse según la patente US 7.473.707.

45 En una realización ejemplar, que enmascara el sabor del protector o protectores orgánicos con éster araña que tiene sorbitol como el grupo de enlace común, el enmascaramiento del sabor se consiguió usando aproximadamente 1:1 +/-

10% en peso de la cantidad total de protector solar y éster araña. Más generalmente, la relación entre la cantidad de protector solar y la cantidad de éster araña puede variar de aproximadamente 0,6 a aproximadamente 2; de manera alternativa de aproximadamente 0,85 a aproximadamente 1,3; y de manera alternativa de aproximadamente 0,85 a aproximadamente 1,20 en peso. Sin desear aferrarse a la teoría, se cree que estas relaciones son las relaciones mínimas necesarias para conseguir el enmascaramiento del sabor, sin embargo, pueden usarse mayores cantidades de éster araña sin comprometer el enmascaramiento del sabor, por ejemplo, pueden usarse relaciones de éster araña a protector solar de aproximadamente 10:1, de manera alternativa aproximadamente 20:1, de manera alternativa 30:1, de manera alternativa 40:1 y de manera alternativa 50:1. Se cree que los protectores solares con sabor enmascarado de la presente invención son el resultado de la combinación física de los protectores solares en íntima asociación con al menos un éster araña.

La asociación íntima entre el protector solar o los protectores solares y los ésteres araña puede formarse en presencia del fotostabilizador 2,6-naftalato de dietilhexilo. El uso de un fotoestabilizador es deseable debido a que la formulación incluye el protector solar avobenzona que es susceptible a la degradación. Los fotoestabilizadores representativos incluyen 2,6-naftalato de dietilhexilo, octocrileno, etilhexilmetoxicrileno, 4-metilbencilidenalcanfor, bemotrizinol, bisoctrizol, salicilato de butiloctilo, benzoato de hexadecilo, benzoato de butiloctilo, ácido tereftalidencanfor sulfónico y malonato de dietilhexil siringilideno. La lista anterior no es una lista exhaustiva de fotoestabilizadores y los expertos en la materia pueden considerar el uso de otros fotoestabilizadores. Puede usarse un fotoestabilizador en una cantidad de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 5%, de manera alternativa aproximadamente del 0,1 al 2% y de manera alternativa aproximadamente del 0,1% a aproximadamente el 1% de la composición total de bálsamo labial.

La formación de una asociación íntima entre el protector solar y el éster araña es un factor crítico para conseguir el enmascaramiento del sabor. El éster araña debería mezclarse con el protector solar o los protectores solares para enmascarar su sabor antes de combinar el protector solar y el éster araña con otros componentes. La mezcla del éster araña y el protector solar para enmascarar el sabor permite la formación de una asociación íntima entre el éster araña y el protector solar o los protectores solares para enmascarar el sabor. Se usa la expresión "asociación íntima" debido a que el éster araña y el protector solar forman una interacción estable o "complejo" que es estable a temperatura ambiente pero que puede separarse cuando se calienta a una temperatura superior a 100°C. En algunas realizaciones, es deseable calentar la mezcla éster araña - protector solar para facilitar la formación de la relación íntima entre el protector solar y el éster araña. En una realización ejemplar, el éster araña y el protector solar se mezclan entre sí y se calientan a entre aproximadamente 40°C y aproximadamente 80°C durante aproximadamente 30 minutos a aproximadamente 2 horas con agitación. Esta premezcla del éster araña y el protector solar, preferentemente en presencia de calentamiento, es necesaria para conseguir el enmascaramiento del sabor, es decir, la mera presencia de un éster araña y un protector solar en una composición no proporciona un enmascaramiento del sabor del protector solar. Se incluye un fotoestabilizador en esta premezcla para inhibir la degradación del protector solar.

Aunque los ésteres araña tienen la capacidad de enmascarar el sabor, el grado de enmascaramiento del sabor puede variar dependiendo del éster araña usado y/o del protector solar cuyo sabor debe ser enmascarado. Por ejemplo, dos mezclas idénticas de protector solar orgánico se colocaron en contacto íntimo con dos ésteres araña diferentes en una cantidad de aproximadamente una relación de 1:1 en peso. Una muestra de la mezcla de protector solar se puso en contacto con un éster araña basado en glicerol y la otra se puso en contacto con un éster araña basado en sorbitol y cada mezcla se calentó a entre aproximadamente 40°C y aproximadamente 50°C durante aproximadamente 30 minutos. con agitación. Los protectores solares tratados de esta manera se incorporaron a continuación a dos composiciones idénticas de bálsamo labial. En las composiciones de ensayo ejemplares, el sabor desagradable de los protectores solares orgánicos estaba esencialmente enmascarado por completo en la composición con el éster araña basado en sorbitol, mientras que la composición con el éster araña basado en glicerol se mejoró con respecto a una composición que carecía de un éster araña asociado con un protector solar, pero menos que el de la composición con el éster araña basado en sorbitol. El enmascaramiento del sabor se determinó mediante procedimientos de ensayo sensoriales usados comúnmente por los expertos en la materia, es decir, aplicación de la composición a ensayar a los labios de sujetos humanos, con sujetos humanos para proporcionar una evaluación.

Los protectores solares orgánicos representativos útiles en la práctica de la invención (con las cantidades máximas adecuadas de cada protector solar en% p/p enumeradas después del protector solar) incluyen, pero no se limitan a, ácido amino benzoico (aproximadamente 15%), avobenzona (aproximadamente 3%), cinoxato (aproximadamente 3%), metoxicinamato de octilo (aproximadamente 10%), homosalato (aproximadamente 15%), meradimato (aproximadamente 5%), octocrileno (aproximadamente 10%), octinoxato (aproximadamente 7,5%), oxibenzona (aproximadamente 6%), dioxibenzona (aproximadamente 3%), padimato O (aproximadamente 8%), ensulizol (aproximadamente 4%), sulisobenceno (aproximadamente 10%), salicilato de trolamina (aproximadamente 12%), benzofenona (aproximadamente 10%), compuestos de bencilidina (aproximadamente 6%), butil metoxidibenzoilmetano (aproximadamente 5%), bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina (aproximadamente 10%), metosulfato de alcanfor benzalconio (aproximadamente 6%), benzoato de dietil amino hidroxil benzoil hexilo (aproximadamente 10%), dietilhexil butamido trazolna (aproximadamente 10%), tetrasulfonato de fenil dibencilimidazol disódico (aproximadamente 10%), drometrizol trisiloxano (aproximadamente

15%), ácido etilhexil dimetil para-amino benzoico (aproximadamente 8%), metoxicinamato de etilhexilo (aproximadamente 10%), salicilato de etilhexilo (aproximadamente 5%), etilhexil triazona (aproximadamente 5%), p-metoxicinamato de isoamilo (aproximadamente 10%), 4-metilbencilideno alcanfor (aproximadamente 10%), metilen bis-benzotriazolil tetrametilbutilfenol (aproximadamente 10%), PEG-25 ácido paraaminobenzoico (aproximadamente 5%), fenilbenzamido metilbencilideno alcanfor (aproximadamente 6%), polisilicona-15 ácido tereftalilideno dicanfosulfónico (aproximadamente 10%), beta-2-glucopiranoxi propil hidroxil benzofenona (aproximadamente 5%), butil metoxidibenzoilmetano (aproximadamente 10%), diisopropil metil cinamato (aproximadamente 10%), dimetoxifenil-[1-(3,4)-4,4-dimetil]1,3 pentanodiona (aproximadamente 7%), propionato de etilhexil dimetiloxi bencilideno dioxoimidazolina (aproximadamente 3%), ácido ferúlico (aproximadamente 10%), gliceril etilhexanoato dimetoxicinamato (aproximadamente 10%), ácido glicerol para-aminobenzoico (aproximadamente 10%), ácido fenilbenzimidazol sulfónico (aproximadamente 3%) y cualquier combinación de cualquiera de los anteriores. La lista anterior no es una lista exhaustiva de protectores solares orgánicos y los expertos en la materia pueden considerar el uso de otros protectores solares orgánicos. Las cantidades enumeradas en la lista anterior son para cada protector solar individualmente. En algunas realizaciones en las que se usa una pluralidad de protectores solares, la cantidad combinada total de un protector solar debe ser menor o igual a la suma de las cantidades máximas adecuadas para cada protector solar componente.

Se usa una combinación de protectores solares en la composición de tratamiento labial debido a que cada protector solar tiene un intervalo de longitud de onda característico en el que proporciona protección y típicamente ese intervalo es menor que el intervalo completo para el que se desea protección. De esta manera, el uso de una combinación de protectores solares proporciona protección en un intervalo más amplio de longitudes de onda. Además, la eficacia de la protección está relacionada también con la cantidad de protector solar. Debido a que las agencias reguladoras limitan la cantidad de cada compuesto de protección solar que puede usarse, el uso de múltiples protectores solares puede mejorar el nivel de protección mientras se mantiene el cumplimiento de la normativa.

Los protectores solares orgánicos preferentes, su intervalo de longitud de onda eficaz y sus cantidades preferentes son los siguientes: ácido amino benzoico, 260 nm-313 nm, de aproximadamente el 5% a aproximadamente el 15%; padimato O, 290 nm-315 nm, de aproximadamente el 1,4% a aproximadamente el 8%; dioxibenzona, 260 nm-380 nm, de aproximadamente el 1% a aproximadamente el 3%; oxibenzona, 270 nm-350 nm, de aproximadamente el 2% a aproximadamente el 6%; sulisobenzona, 260 nm-375 nm; de aproximadamente el 5% a aproximadamente el 10%; cinoxato, 270 nm-328 nm, del 1% a aproximadamente el 3%; octocrileno, 250 nm-360 nm, del 7% a aproximadamente el 10%; avobenzona, 320 nm-400 nm, del 1% a aproximadamente el 3%; salicilato de octilo, 280 nm-320 nm, del 3% a aproximadamente el 5%; homosalato, 295 nm-315 nm, del 4% a aproximadamente el 15%; salicilato de trolamina, 260 nm-320 nm, del 5% a aproximadamente el 12%; octinoxato, 290 nm-320 nm, del 2% a aproximadamente el 7,5%.

El uso de avobenzona es para la protección UVA, ya que es eficaz en el intervalo de aproximadamente 320 nm a 400 nm, un intervalo en el que la mayoría de los protectores solares proporcionan protección limitada o nula. Sin embargo, como se observó anteriormente, la avobenzona tiene propiedades organolépticas particularmente desagradables. De esta manera, antes de la presente invención, el uso de cantidades eficaces de avobenzona en un tratamiento labial produjo una composición con un sabor tan ofensivo que la mayoría de los seres humanos eran bastante reacios a aplicarlo a sus labios.

En algunas realizaciones de bálsamo labial puede ser deseable incluir también protectores solares inorgánicos tales como dióxido de titanio y/u óxido de zinc, por ejemplo. Dichos compuestos pueden usarse en cantidades de aproximadamente el 2% a aproximadamente el 25% p/p, de manera que cantidades mayores proporcionan mayores niveles de protección. Desafortunadamente, aunque mayores cantidades de óxidos inorgánicos proporcionan una mejor protección, típicamente imparten también una capa gruesa de material blanco a la superficie de la piel, lo que es muy indeseable en los labios. De esta manera, para las composiciones labiales, los protectores solares inorgánicos se usan preferentemente en cantidades de menos de aproximadamente el 15% p/p de la cantidad total de protector solar inorgánico; de manera alternativa menos de aproximadamente el 10%, y de manera alternativa menos de aproximadamente el 5%. Para conseguir el nivel de protección deseado, los protectores solares inorgánicos se usan preferentemente en combinación con protectores solares orgánicos en composiciones labiales para obtener una protección eficaz.

Una composición de tratamiento labial con sabor enmascarado típica con protectores solares comprende además una cera u otro vehículo, emolientes, aceites farmacéuticamente aceptables y, opcionalmente, uno o más medicamentos y/u otros agentes activos y/o uno o más agentes beneficiosos.

Las ceras y/o los aceites y/o los materiales de hidrocarburos semisólidos proporcionan al labio típicamente propiedades protectoras y/u oclusivas asociadas con un tratamiento labial y/o un protector labial. Además, las ceras y/o los aceites y/o los materiales de hidrocarburos semisólidos funcionan como agentes acondicionadores de la piel y protectores de la piel. Los agentes acondicionadores de la piel ejemplares incluyen formulaciones de poli (olefina C6-14) hidrogenada, miristato de isopropilo, parafina, cera de abejas, perfluorononil dimeticona, coenzima Q10 y formulaciones de extracto de la flor *Spilanthes acmella*.

Un protector cutáneo ejemplar es la dimeticona. Típicamente, las ceras sirven también como estructurantes para los bálsamos labiales en barra, permitiendo que la barra sea extendida y retraída durante el uso mientras se mantiene la forma de la barra. Las ceras adecuadas para las composiciones en barra incluyen ceras animales, ceras vegetales, ceras minerales, ceras de silicona, ceras sintéticas y ceras derivadas de petróleo. Las ceras específicas ejemplares y las cantidades usadas incluyen, pero no se limitan a, cera de carnauba (de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 5%); cera de parafina (de aproximadamente el 10 a aproximadamente el 40%); cera blanca (de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 10%); cera de candelilla (de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10%); cera de abejas (de aproximadamente el 1% a aproximadamente el 50%), cera de jojoba (de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10%), ozoquerita (de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10%), polietileno (de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10%) y combinaciones de los mismos. La lista anterior no es una lista exhaustiva de ceras, aceites, materiales de hidrocarburos semisólidos, agentes acondicionadores de la piel y protectores de la piel y los expertos en la materia pueden considerar el uso de otras ceras, aceites, materiales de hidrocarburos semisólidos, agentes acondicionadores de la piel y protectores de la piel.

Además de proporcionar propiedades protectoras, los aceites y los materiales de hidrocarburos semisólidos pueden proporcionar, de diversas maneras, emoliencia, pueden solubilizar otros componentes, pueden contribuir a los atributos organolépticos/sensoriales, como la sensación labial, pueden contribuir a una apariencia brillante, pueden proporcionar deslizamiento y rendimiento de impacto en la aplicación, por ejemplo. Además, los aceites y los materiales de hidrocarburos semisólidos funcionan como agentes acondicionadores de la piel y protectores de la piel y en algunos casos como agentes de aumento de la viscosidad. Los aceites y los materiales semisólidos ejemplares que pueden usarse en la presente invención incluyen, pero no se limitan a, lanolina y derivados de lanolina, vaselina, polialfaolefinas tales como polideceno hidrogenado, propionato de araquidilo, alcohol cetílico, lanolato de isopropilo, miristato de isopropilo, aceite mineral, aceite mineral ligero, octildodecanol, alcohol oleílico, macadamio de polibuten etilo, aceite de ricino, aceites de éster de jojoba, aceite de almendra, aceite de germen de trigo, aceite de aguacate, perhidroescualeno, aceite de ricino hidrogenado, aceite vegetal hidrogenado, ricinoleato de cetilo, propilenglicol, palmitato de isopropilo, alcohol estearílico, mantequillas botánicas y aceites de silicona volátiles y no volátiles; y cualquier combinación de cualquiera de los anteriores. Los aceites de silicona adecuados incluyen, pero no se limitan a, polifenilmetil siloxano, dimeticonas, ciclometiconas, fluorosiliconas y cualquier combinación de cualquiera de los anteriores. La lista anterior no es una lista exhaustiva de aceites y materiales de hidrocarburos semisólidos, agentes acondicionadores de la piel, protectores cutáneos y agentes de aumento de la viscosidad, y los expertos en la técnica pueden considerar el uso de otras ceras, aceites, materiales de hidrocarburos semisólidos, agentes acondicionadores de la piel y protectores cutáneos. La cantidad de un aceite y/o un material de hidrocarburo semisólido determinado es típicamente de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 40%, de manera alternativa de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 25%, de manera alternativa de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 5% siendo la cantidad total de dichos materiales típicamente menor que aproximadamente el 50% para un producto de bálsamo labial en barra.

En algunas realizaciones, es preferible que una porción del aceite sea aceite de silicona, ya que facilita la persistencia de la composición en los labios y proporciona hidratación, una sensación suave y facilidad de dispersión. Algunos aceites de silicio como la dimeticona, por ejemplo, proporcionan también propiedades protectoras. En una realización ejemplar, la dimeticona puede usarse en una cantidad de aproximadamente el 0,15% a aproximadamente el 6%, de manera alternativa de aproximadamente el 1% a aproximadamente el 3,5% y de manera alternativa de aproximadamente el 1,5% a aproximadamente el 3,5%; y/o la perfluronil dimeticona puede usarse en una cantidad de aproximadamente el 0,05 a aproximadamente el 6%, de manera alternativa de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 5% y de manera alternativa de aproximadamente el 0,3% a aproximadamente el 5%. En algunas realizaciones en las que se usan dimeticona y/o flurosilicona, es deseable mezclarlas con un agente solubilizante tal como polideceno hidrogenado antes de combinarlas con otras ceras y aceites.

La composición puede comprender además aceites hidratantes. Los aceites hidratantes ejemplares adecuados para su uso en la composición incluyen, pero no se limitan a, aceite de girasol, aceite de coco, aceite de ricino, aceite vegetal, aceite de maíz, aceite de aloe vera, aceite de canola, aceite de soja, aceite de jojoba, aceite de oliva, aceite de babasú, aceite de aguacate, aceite de albaricoque, aceite de semilla de hierba de la pradera, aceite de semilla de macadamia, aceite de semilla de avena, aceite de semilla de palma, aceite de cártamo, aceite de sándalo, aceite de sésamo, aceite de almendra, aceite de germen de trigo, aceite de arándano y combinaciones de los mismos. La lista anterior no es una lista exhaustiva de aceites hidratantes y los expertos en la materia pueden considerar el uso de otros aceites hidratantes. Los aceites pueden incluirse en la composición en cantidades de aproximadamente el 1% a aproximadamente el 65%.

Opcionalmente, la composición de tratamiento labial puede comprender además uno o más antioxidantes. Los antioxidantes pueden proteger la composición contra la oxidación (por ejemplo, convirtiéndose en rancia) y/o puede proporcionar beneficios de acondicionamiento labial tras la aplicación a los labios. Los tocoferoles, el acetato de tocoferilo, algunas mantecas botánicas y los extractos de té verde son productos naturales antioxidantes ejemplares adecuados para su uso en la composición. Otros antioxidantes adecuados incluyen propil octil y dodecil ésteres de ácido gálico, hidroxianisol butilado, hidroxiltolueno butilado, ácido nordihidroguyarético. Puede usarse un único antioxidante o una

combinación de dos o más antioxidantes. La lista anterior no es una lista exhaustiva de antioxidantes y los expertos en la técnica pueden considerar el uso de otros antioxidantes. Típicamente, la cantidad total de antioxidante es menor de aproximadamente el 4%, de manera alternativa menor de aproximadamente el 2%, y de manera alternativa menor de aproximadamente el 1%.

5 Opcionalmente, la composición para el tratamiento labial puede comprender además un compuesto que reduce los signos de envejecimiento, por ejemplo, al menos temporalmente haciendo que las líneas finas y/o arrugas sean menos visibles. Los compuestos orgánicos que reducen los signos de envejecimiento incluyen, pero no se limitan a, coenzima Q, ácido hialurónico, sales de hialuronato y derivados de ácido hialurónico y flor de spilanthes. Las formulaciones de coenzima Q están disponibles comercialmente. Un ejemplo de una formulación de Coenzima Q10 comercialmente disponible contiene Coenzima Q10 (ubiquinona) (7,500%), acetato de dl- α -tocoferilo (Vitamina E) (20,000%) y éster de ácido alquilbenzoico (benzoato de alquilo C12-15) (72,500%). Las formulaciones de ácido hialurónico, derivados de ácido hialurónico e hialuronato están disponibles comercialmente. Un ejemplo de una formulación de sal hialurónica comercialmente disponible contiene palmitato de etilhexilo (95,300%), dimetilsililato de sílice (2,500%), butilenglicol (1,000%), caprililglicol (0,500%), fenoxietanol (0,350%), hexilenglicol (0,100%), hialuronato de sodio, bajo peso molecular (0,145%) e hialuronato de sodio, alto peso molecular (0,055%). Las formulaciones de flor de spilanthes están disponibles comercialmente. Un ejemplo de una formulación de flor de spilanthes comercialmente disponible contiene triglicérido caprílico/cáprico (97,050%) y extracto de flor de spilanthes acmella (2,950%). Puede usarse un único antioxidante o una combinación de dos o más antioxidantes. La lista anterior no es una lista exhaustiva de compuestos orgánicos que reducen los signos de envejecimiento y los expertos en la materia pueden considerar el uso de otros compuestos orgánicos que reducen los signos de envejecimiento. Típicamente, la cantidad total de compuestos orgánicos que reducen los signos de envejecimiento es menor de aproximadamente el 4%, de manera alternativa menor de aproximadamente el 2%, y de manera alternativa menor de aproximadamente el 1%.

20 Los compuestos inorgánicos que reducen los signos de envejecimiento lo hacen típicamente gracias a la difracción o a la dispersión de la luz. Los compuestos inorgánicos ejemplares que reducen los signos de envejecimiento incluyen, pero no se limitan a, dióxido de silicio coloidal y alúmina pirógena. Típicamente, la cantidad total de compuestos inorgánicos que reducen los signos de envejecimiento es menor de aproximadamente el 3%, de manera alternativa menor de aproximadamente el 2%, y de manera alternativa menor de aproximadamente el 1%.

25 Opcionalmente, la composición de tratamiento labial puede comprender además un conservante. Los conservantes adecuados incluyen parabenos, mezclas de parabenos, imidazolidinil urea, diazolidinil urea y mezclas de los mismos. La lista anterior no es una lista exhaustiva de conservantes y los expertos en la técnica pueden considerar el uso de otros conservantes. La cantidad total de conservante es preferentemente menor del 1%, de manera alternativa menor del 0,5% y de manera alternativa menor del 0,2%.

30 Opcionalmente, la composición de tratamiento labial puede comprender además un agente incrementador de la viscosidad para proporcionar dureza y soporte estructural útil en la formación de una barra que comprende la composición de la invención. Los agentes incrementadores de la viscosidad adecuados incluyen cera de carnauba, cera blanca, parafina, cera de candelilla, cera microcristalina, alcohol cetílico, alcohol estearílico, ozoquerita y mezclas de los mismos. La lista anterior no es una lista exhaustiva de agentes incrementadores de la viscosidad y los expertos en la técnica pueden considerar el uso de otros agentes incrementadores de la viscosidad. La cantidad total de agentes incrementadores de la viscosidad es de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 30% p/p de la composición.

35 Opcionalmente, la composición puede comprender además un aromatizante. Los aromatizantes se usan típicamente en cantidades de aproximadamente el 0,1% al 5%. Las cantidades pueden variar dependiendo de la potencia del aromatizante y la matriz en la que se presenta el aromatizante. Los aromatizantes pueden derivarse de productos naturales, aromatizantes sintetizados o combinaciones de los mismos. El aromatizante puede ser un único aroma o una combinación de aromas. Los aromatizantes están disponibles comercialmente. Un ejemplo de un aromatizante disponible comercialmente es un aroma de lima de pomelo que contiene aromas naturales y artificiales (99,95%), triglicéridos de cadena media y vitamina E (0,05%).

Opcionalmente, pueden incluirse edulcorantes tales como sucralosa, sacarina, aspartamo, estevia y combinaciones de los mismos en la composición en cantidades de aproximadamente el 0,01% a aproximadamente el 0,1%.

40 Opcionalmente, la composición puede comprender además medicamentos que incluyen, pero que no se limitan a, mentol, alcanfor, eucalipto, ácido salicílico, alantoina, benzocaína, derivados de ácido salicílico, fenol y pramoxina. En algunas realizaciones, la vaselina y/o la dimeticona pueden proporcionar también beneficios médicos. La lista anterior no es una lista exhaustiva de medicamentos y los expertos en la materia pueden considerar el uso de otros medicamentos. Típicamente, los medicamentos que se añaden solo con propósitos médicos se añadirán en cantidades de menos de aproximadamente el 3%. Las cantidades pueden variar dependiendo de la potencia del medicamento y de la matriz en la que se presenta el medicamento.

Opcionalmente, puede incluirse en la composición un colorante que imparte color a la composición y/o a los labios. Para un bálsamo labial, el colorante no debería ni ser de una cantidad, ni tener un tamaño de partícula y/o ni presentarse en una matriz que permita la transferencia de colorante que imparte un color a los labios durante la aplicación. Para una barra de labios, debería usarse un colorante que se transfiera a los labios y que imparta color a los labios. Los colorantes incluyen, por ejemplo, colorantes naturales tales como extractos de plantas, minerales naturales o carmín, materiales colorantes sintetizados y/o procesados tales como óxidos de hierro, tintes sintéticos, compuestos orgánicos, colorantes laca y colorantes certificados por la FDA para su uso en los labios. La lista anterior no es una lista exhaustiva de colorantes y los expertos en la materia pueden considerar el uso de otros colorantes. Las formulaciones de colorantes están disponibles comercialmente. Un ejemplo de un colorante comercialmente disponible contiene triglicéridos caprílicos/cápricos (59,5%), dióxido de titanio (39,6%), fosfato de aceite de ricino (0,5%) y trietoxicaprililsilano (0,4%). El uso de un colorante que contiene dióxido de titanio puede afectar a la estabilidad de algunos protectores solares como Avobenzone. Se ha observado que los colorantes que contienen dióxido de titanio revestido pueden mejorar la estabilidad de Avobenzone. Opcionalmente, en algunas realizaciones, puede ser deseable incluir un potenciador de color tal como, por ejemplo, un material nacarado.

Opcionalmente, puede incluirse un "sensate" (producto o compuesto potenciador de sensaciones) en la composición. Un "sensate" es una composición que inicia una percepción sensorial, como calentamiento o enfriamiento, por ejemplo, cuando contacta con la piel y/o los labios. Los "sensates" ejemplares incluyen, pero no se limitan a, extractos de menta, extracto de canela y capsaicina. Preferentemente los "sensates" se derivan de fuentes naturales. Sin embargo, los "sensates" sintéticos están dentro del alcance de esta invención. Típicamente, los "sensates" tienen alta potencia y por consiguiente pueden producir un impacto significativo a bajos niveles. La lista anterior no es una lista exhaustiva de "sensates" y los expertos en la materia pueden considerar el uso de otros "sensates". Típicamente, se usan menos de aproximadamente el 3%, de manera alternativa menos de aproximadamente el 2%, y de manera alternativa menos de aproximadamente el 1% de "sensate".

Otros agentes beneficiosos conocidos por un experto en la técnica pueden incluirse también opcionalmente en la composición. Los extractos de aloe y los ácidos orgánicos naturales son ejemplos de otros agentes beneficiosos. Los ácidos orgánicos naturales, incluyendo los α -hidroxiácidos, pueden actuar como exfoliantes, por ejemplo. El ácido láctico es un α -hidroxiácido ejemplar.

En un procedimiento de fabricación ejemplar, el éster araña, los protectores solares orgánicos y el fotoestabilizador se combinan y se permite que formen una asociación íntima antes de la combinación con otros componentes de la composición de tratamiento labial. La composición de la invención puede prepararse fundiendo las ceras y añadiendo los otros componentes a la mezcla de cera fundida con agitación. Típicamente, los ingredientes se combinan por etapas con suficiente calentamiento para fundir cualquier material sólido y agitando para conseguir un mezclado completo. La asociación íntima preformada de éster araña, protector solar orgánico y opcionalmente un fotoestabilizador se añade a la mezcla de cera fundida.

Tras la combinación de todos los ingredientes, la composición se transfiere a un recipiente. Para bálsamos labiales blandos, la composición se coloca típicamente en un recipiente que facilita el almacenamiento y la retirada de un material blando tal como un tarro, o un bote o un tubo, por ejemplo. Para bálsamos labiales en barra, típicamente la composición fundida se coloca en un recipiente o unos recipientes formadores de barras y se deja solidificar. Opcionalmente, una vez colocada en el recipiente, la barra en formación puede someterse a uno o más ciclos de calentamiento y enfriamiento a medida que se solidifica para optimizar la formación de la barra. En el caso del bálsamo labial en barra, el recipiente formador de barra es el típico tubo dispensador. En dicho procedimiento, la composición fundida contacta con las paredes del recipiente y una vez solidificado, el bálsamo labial permanece en contacto con las paredes del recipiente.

De manera alternativa, la composición fundida puede llenarse en un molde y puede dejarse solidificar en el molde para formar una barra o bala. Una vez formado, la barra/bala se retira del molde y se coloca en un recipiente dispensador. El procedimiento de moldeado de barra/bala es preferente para las barras de labios ya que las composiciones típicas de barra de labios se deforman durante el uso si la composición de barra de labios fundida se transfiere directamente a un recipiente formador de barra que sirve también como un dispositivo dispensador. Las composiciones de barra de labios son típicamente más susceptibles a la deformación cuando tocan las paredes del tubo dispensador debido a los altos niveles de aceites usados típicamente para dispersar y transferir pigmentos.

Un recipiente dispensador adecuado ejemplar para barras o balas comprende una parte elevadora que permite extender la barra desde el recipiente dispensador para facilitar la aplicación a los labios del usuario y la retracción de la barra de nuevo al interior del recipiente para su almacenamiento.

Ejemplo 1

Composición de protector solar con sabor enmascarado

5 Se proporciona una composición de protector solar con sabor enmascarado ejemplar de una mezcla de protectores solares en asociación íntima con un éster araña de sorbitol y un procedimiento para formar las composiciones en asociación íntima. Esta composición y este procedimiento son representativos de las muchas composiciones y procedimientos que están dentro del alcance de la presente invención. Las realizaciones ejemplares se proporcionan con propósitos ilustrativos.

10 Los inventores creen, sin deseos de ceñirse a la teoría, que el orden de mezclado de algunos de los componentes está relacionado directamente con la capacidad de conseguir el enmascaramiento del sabor. Concretamente, el éster araña y el protector o los protectores solares a enmascarar y un fotoestabilizador deberían mezclarse entre sí y debería dejarse que formen una asociación íntima antes de la combinación con otros componentes de una composición de tratamiento labial.

15 En una realización ejemplar, el material de éster araña sorbet-2-hexaoleato se calentó a aproximadamente 50-55°C y se combinó con los protectores solares orgánicos para enmascarar su sabor y un fotoestabilizador con agitación mientras se mantenía la temperatura para formar la relación íntima antes de la combinación con los otros componentes. Para la composición de protección solar con sabor enmascarado usada en las composiciones de tratamiento labial de las Tablas 1, 2 y 3 del Ejemplo 2, el éster araña sorbet-2-hexaoleato se combinó con 2,6-naftalato de dietilhexilo (un fotoestabilizador) y una mezcla de protectores solares que incluía homosalato, octilsalato, oxibenzona, octinoxato y avobenzona antes de combinar esta mezcla con los otros componentes. Más particularmente en una realización ejemplar, los protectores solares y el fotoestabilizador se añadieron secuencialmente al éster araña calentado con agitación
20 continuada después de cada adición y manteniendo la temperatura hasta que la mezcla fue uniforme. En una realización ejemplar, la secuencia de adición fue oxibenzona, octil salicílico, avobenzona, homosalato y dietilhexil-2-naftalato.

Ejemplo 2

Composiciones de protector solar con sabor enmascarado

25 En las tablas 1, 2, 3 y 3A se proporcionan composiciones ejemplares de composición de bálsamo labial en barra con protectores solares con sabor enmascarado y funcionalidad mejorada. Se proporcionan también procedimientos ejemplares para preparar las composiciones de las Tablas 1, 2, 3 y 3A y formar un bálsamo labial en barra. Estas composiciones y estos procedimientos son representativos de la gran cantidad de composiciones y de procedimientos que están dentro del alcance de la presente invención. Las realizaciones ejemplares se proporcionan con propósitos ilustrativos.

TABLA 1

Ingrediente	Cantidad% p/p
Polideceno hidrogenado	4,71%
Cera parafina	20,00%
Miristato de isopropilo	1,00%
Perflurononil dimeticona	5,00%
Dimeticona	3,00%
Cera blanca	2,00%
Cera de carnauba	1,00%
Metilparabeno	0,10%
Propilparabeno	0,06%
Alcohol cetílico	0,50%
Sucralosa	0,03%
Composición preformada con sabor enmascarado	54,0%
(2,6-naftalato de dietilhexilo (fotostabilizador)	0,50%)

ES 2 664 865 T3

(Cont.)

(Homosalato)	7,00%
(Octilsalato)	5,00%
(Oxibenzona)	5,00%
(Octinoxato)	7,50%
(Avobenzona)	3,00%
(Sorbet-2-hexaoleato (éster araña))	26,10%
Óxido de zinc (50% en suspensión)	6,00%
Sabor	1,50%
Acetato de vitamina E	1,00%

TABLA 2

Ingrediente	Cantidad% p/p
Polideceno hidrogenado	9,47%
Cera parafina	20,00%
Miristato de isopropilo	1,00%
Perflurononil dimeticona	0,30%
Dimeticona	1,50%
Cera blanca	2,00%
Cera de carnauba	1,00%
Metilparabeno	0,10%
Propilparabeno	0,06%
Alcohol cetílico	0,50%
Sucralosa	0,03%
Composición preformada con sabor enmascarado	53,0%
(2,6-naftalato de dietilhexilo (fotostabilizador))	0,50%
(Homosalato)	6,00%
(Octilsalato)	4,50%
(Oxibenzona)	5,00%
(Octinoxato)	6,50%
(Avobenzona)	3,00%
(Sorbet-2-hexaoleato (éster araña))	25,0%
Óxido de zinc (50% en suspensión)	6,00%
Dióxido de silicio coloidal	0,50%
Sabor	2,94%

ES 2 664 865 T3

(Cont.)

Acetato de vitamina E	1,00%
Alúmina pirógena	0,30%
Formulación de hialuronato de sodio	0,50%
Coenzima Q10	0,30%
Extracto de flor de Spilanthes acmella	1,00%
Dióxido de titanio	1,00%

TABLA 3 (Ilustrativa)

Composición de protección solar que contiene dióxido de titanio no revestido

Ingrediente	Cantidad % p/p
Dimeticona	1,50%
Homosalato	6,00%
Benzofenona-3	5,00%
Salicilato de etilhexilo	4,50%
Metoxicinamato de butilo	3,00%
Metoxicinamato de etilhexilo	6,50%
2,6-naftalato de dietilhexilo	0,50%
Sorbet-2-hexaoleato	25,00%
Copernicia Cerifera	1,00%
Alcohol cetílico	0,50%
Miristato de isopropilo	1,00%
Olefina polihidrogenada (C6-14)	14,91%
Metilparabeno	0,10%
Propilparabeno	0,06%
Sucralosa	0,03%
Acetato de tocoferilo	1,00%
Parafina	20,00%
Cera de abejas	2,00%
Alúmina	0,30%
Perfluorononil	0,30%
Formulación de hialuronato de sodio	1,00%
Coenzima Q10	0,30%
Extracto de flor de Spilanthes acmella	1,00%
Dióxido de silicio coloidal	0,50%

(Cont.)

Dióxido de titanio	1,00%
Aromatizante	3,00%

TABLA 3A (Ilustrativa)

Composición de protección solar que no contiene dióxido de titanio

Ingrediente	Cantidad % p/p
Dimeticona	1,50%
Homosalato	6,00%
Benzofenona-3	5,00%
Salicilato de etilhexilo	4,50%
Metoxicinamato de butilo	3,00%
Metoxicinamato de etilhexilo	6,50%
2,6-naftalato de dietilhexilo	0,500%
Sorbet-2-hexaoleato	25,00%
Copernicia Cerifera	1,00%
Alcohol cetílico	0,50%
Miristato de isopropilo	1,00%
Olefina polihidrogenada (C6-14)	16,41%
Metilparabeno	0,100%
Propilparabeno	0,060%
Sucralosa	0,030%
Acetato de tocoferilo	1,00%
Parafina	20,00%
Cera de abejas	2,00%
Alúmina	0,300%
Perfluorononil	0,300%
Formulación de hialuronato de sodio	0,500%
Coenzima Q10	0,300%
Extracto de flor de Spilanthes acmella	1,00%
Dióxido de silicio coloidal	0,50%
Aromatizante	3,00%

- 5 En una realización ejemplar, las composiciones de las Tablas 1, 2, 3 y 3A se prepararon combinando las ceras incluyendo cera blanca, cera de carnauba, cera de parafina y alcohol cetílico y calentando a 85-90°C. Una vez que las ceras comenzaron a fundirse, la mezcla se agitó con una mezcladora Lightnin. El metilparabeno y el propilparabeno se disolvieron en miristato de isopropilo. La mezcla de parabeno miristato se añadió a las ceras fundidas con agitación continuada y la temperatura se redujo a 70-75°C. La composición éster araña-protector solar preparada previamente

5 como se ha descrito en el Ejemplo 1 se añadió a la mezcla de cera fundida con agitación. Todos los otros ingredientes excepto el edulcorante (sucralosa), el acetato de vitamina E y los componentes inorgánicos se combinaron y se añadieron a la mezcla de cera con agitación y manteniendo la temperatura a 70-75°C. Para las realizaciones que comprenden coenzima Q, la coenzima Q debería calentarse a aproximadamente 35-40°C para disolver las partículas sólidas. El acetato de vitamina E y la sucralosa pueden añadirse a la mezcla de cera y puede mezclarse hasta que se dispersen. Una vez completada la dispersión de la sucralosa, se añadió cualquier material inorgánico tal como materiales inorgánicos que incluyen, por ejemplo, óxido de zinc, dióxido de titanio, alúmina pirógena y/o dióxido de silicio coloidal.

10 La mezcla fundida formada de esta manera se dispensó directamente en tubos dispensadores. De manera alternativa, la mezcla fundida puede dispensarse en moldes formadores de barras y puede enfriarse para solidificarla y a continuación colocarla en tubos dispensadores.

Ejemplo 3 (Ilustrativo)

Composición de protector solar con sabor enmascarado

Composición de protector solar que contiene dióxido de titanio revestido

15 En la Tabla 4 se proporciona una composición de composición de bálsamo labial en barra con protectores solares con sabor enmascarado y funcionalidad mejorada. En el Ejemplo 2 se proporcionan procedimientos ejemplares para preparar la composición de la Tabla 4 y formar un bálsamo labial en barra. Las realizaciones ejemplares se proporcionan con propósitos ilustrativos.

TABLA 4

Ingrediente	Cantidad % p/p
Dimeticona	1,50%
Homosalato	6,00%
Benzofenona-3	5,00%
Salicilato de etilhexilo	4,5%
Metoxicinamato de butilo	3,00%
Metoxicinamato de etilhexilo	6,50%
2,6-naftalato de dietilhexilo	0,55%
Sorbet-2-hexaoleato	25,00%
Copernicia Cerifera	1,00%
Alcohol cetílico	0,500%
Miristato de isopropilo	1,00%
Olefina polihidrogenada (C6-14)	14,91%
Metilparabeno	0,100%
Propilparabeno	0,060%
Sucralosa	0,030%
Acetato de tocoferilo	1,00%
Parafina	20%
Cera de abejas	2,00%
Alúmina	0,300%

(Cont.)

Perfluorononil dimeticona	0,300%
Formulación de hialuronato de sodio	0,500%
Coenzima Q10	0,300%
Extracto de flor de Spilanthes acmella	1,00%
Dióxido de silicio coloidal	0,50%
Colorante	1,50%
Aromatizante	3,00%

Ejemplo 4

Evaluación de protector solar

5 Para confirmar que la protección UVA y UVB se mantiene en la asociación íntima entre el éster araña y los protectores solares, el bálsamo labial en barra de la Tabla 2 se ensayó usando ensayos *in vitro*.

10 La protección UVA se determinó usando la relación UVA/UV del procedimiento de datos de transmitancia *in vitro* según lo establecido en la Federal Register Proposed Rule, de clasificación por estrellas para la protección solar UVA. Este procedimiento de ensayo se basa en el procedimiento descrito en el Federal Register 21 CFR Partes 347 y 352, Sunscreen Drug Products for Over-the-Counter Human Use; Proposed amendment of Final Monograph; Proposed Rule Federal Register, Vol. 72, N° 165, 27 de Agosto de 2007.

15 El ensayo se basa en la evaluación de la transmitancia UV a través de una película delgada de muestra de producto extendida sobre un sustrato rugoso, después de la exposición a una dosis controlada de radiación UV. La muestra del producto que contenía protector solar se expuso a una dosis de radiación equivalente a 2/3 del valor FPS multiplicado por 20 mJ/cm². Una dosis de radiación UV de 20 mJ/cm² es igual a una dosis mínima de eritema (MED). A continuación, la relación UVA-I/UV calculada se usó para clasificar la protección UVA ofrecida por la muestra de ensayo.

El valor FPS (es decir, el valor de protección UVB) se determinó a partir del porcentaje de transmitancia promedio del material de ensayo obtenido a partir de los 25 escaneos, 5 portaobjetos con 5 escaneos por cada portaobjeto. La absorbancia promedio en cada longitud de onda para el material de ensayo se registró en una tabla y se generó un gráfico.

20 Estos resultados de ensayo mostraron que la Composición de la Tabla 2 tenía un valor FPS de 62 y una clasificación por estrellas de 2 de un máximo potencial de 4. Los ensayos sensoriales con sujetos humanos usando procedimientos convencionales de ensayo de panel sensorial confirmaron un buen enmascaramiento del sabor incluso en presencia de avobenzona.

Ejemplo 5

25 Evaluación del sabor

Los protectores solares orgánicos son bien conocidos por impartir un sabor desagradable. Es ampliamente reconocido que los productos labiales que contienen protectores solares orgánicos en una cantidad y combinación que resultan en un FPS de 30, sin protección UVA apreciable, tienen mal sabor.

30 La avobenzona, el único protector solar orgánico UVA eficaz, tiene un sabor muy malo. La incorporación de UVA al nivel efectivo del 3% resulta en un producto labial que tiene un sabor extremadamente malo, hasta el punto que no pueda conseguirse un cumplimiento confiable por parte del consumidor para un producto comercial. Esta observación fue la motivación para buscar una composición y un procedimiento para protectores solares con sabor enmascarado.

35 Las composiciones que contienen éster araña de ESO, que representan los ejemplos enumerados en la Tabla I, se evaluaron con relación a su sabor por parte de un panel de cinco personas frente a composiciones labiales que contenían una composición de protector solar idéntica, pero sin el éster araña de ESO. Ambos productos proporcionaron valores FPS de 50+ y actividad de protección solar UVA efectiva. Los productos que contenían éster araña de ESO mostraron excelentes características de sabor. El producto sin éster araña de ESO mostró un sabor extremadamente malo, mucho peor que incluso los productos comerciales de FPS 30 sin protector solar UVA. La diferencia de sabor entre las composiciones FPS 50+ (con 3% de Avobenzona), con y sin éster araña de ESO, fue muy dramática e inequívoca. La composición FPS 50+ (con 3% de Avobenzona), sin éster araña de ESO, no sería comercialmente viable debido a su

40

muy mal sabor, esta composición tampoco sería un producto candidato adecuado, o comparativo, para ensayos adicionales de panel de sabor, una vez más debido a su muy mal sabor.

5 Se proporcionó a 20 personas una composición de producto labial que representa el ejemplo enumerado en la Tabla I, en lo que respecta a la composición y al procedimiento de fabricación. Esta composición representaba un protector solar UVA con FPS 50+ efectivo (Avobenzona 3%) y contenía éster araña de ESO. Las 20 personas recibieron también un
10 producto labial con FPS 30 comercial sin protector solar UVA efectivo. Las veinte personas encontraron que la composición de la Tabla I mostraba un sabor excelente. Las veinte personas encontraron que el producto comercial con FPS 30 tenía mal sabor. Este resultado representa una preferencia unánime por el producto labial con protector solar más efectivo (FPS 50+ con protección UVA efectiva) con éster araña versus el producto con protector solar menos efectivo (FPS 30, sin protección UVA).

Ejemplo 6

Estudio de estabilidad de la avobenzona

15 Para una eficacia adicional de protección UVA, la Avobenzona y el dióxido de titanio son una combinación permitida según la monografía de protección solar final propuesta. Desafortunadamente, los metales de transición, como el titanio, pueden promover la inestabilidad de la Avobenzona. Se realizó un estudio comparativo de la estabilidad de la Avobenzona en las composiciones de protector solar con sabor enmascarado de la Tabla 3 y la Tabla 4 a 40°C y a una humedad
20 relativa del 75% para supervisar la estabilidad de la Avobenzona en la composición de la Tabla 4 que contenía dióxido de titanio revestido frente a composición de la Tabla 3 que contenía dióxido de titanio no revestido. La composición de protector solar de la Tabla 3A no contenía dióxido de titanio y sirvió como control en el estudio. La Figura 1 muestra que la estabilidad de la Avobenzona se mejora en presencia de dióxido de titanio revestido. En el punto temporal de 3 meses, se midió un 96,00% de la Avobenzona inicial en presencia de dióxido de titanio revestido con trietoxilcaprililsilano; mientras que, en el mismo punto temporal, solo se midió un 94,37% de la Avobenzona inicial en presencia de dióxido de titanio no revestido. Los datos en la Figura 1 demuestran que el uso de dióxido de titanio revestido retarda la degradación de la Avobenzona observada con el dióxido de titanio no revestido.

25

REIVINDICACIONES

- 5 1. Un tratamiento labial que comprende una composición de protector solar con sabor enmascarado en la que la composición de protector solar con sabor enmascarado comprende el éster araña sorbet-2-hexaoleato, el fotostabilizador 2,6-naftalato de dietilhexilo y los protectores solares homosalato, octilsalato, oxibenzona, octinoxato y avobenzona, en el que los protectores solares, el éster araña y el fotoestabilizador están en íntima asociación.
2. Tratamiento labial con sabor enmascarado según la reivindicación 1, en el que el tratamiento labial es una barra de bálsamo labial extensible y retráctil.
- 10 3. Barra de bálsamo labial con sabor enmascarado según la reivindicación 2, en la que el bálsamo labial comprende además un estructurante seleccionado de cera de parafina, cera de carnauba, cera de candelilla y mezclas de las mismas.
4. Tratamiento labial con sabor enmascarado o barra de bálsamo labial según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que la relación de la cantidad total de protector solar a éster araña es de 0,6 a 2 en peso.
5. Barra de bálsamo labial con sabor enmascarado según la reivindicación 2 o la reivindicación 3, que comprende los siguientes ingredientes (% peso/peso):

2,6-naftalato de dietilhexilo	0,50
homosalato	6,00
octilsalato	4,50
oxibenzona	5,00
octinoxato	6,50
avobenzona	3,00
sorbet-2-hexaoleato	25,00

15

o

2,6-naftalato de dietilhexilo	0,50
homosalato	7,00
octilsalato	5,00
oxibenzona	5,00
octinoxato	7,50
avobenzona	3,00
sorbet-2-hexaoleato	26,10

20

6. Un procedimiento de producción de una composición de tratamiento labial que comprende formar una asociación íntima entre el éster araña sorbet-2-hexaoleato, el fotostabilizador 2,6-naftalato de dietilhexilo y los protectores solares homosalato, octilsalato, oxibenzona, octinoxato y avobenzona, antes de combinarlos con los otros componentes de la composición.

FIGURA 1

