

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 672 990**

51 Int. Cl.:

**A61Q 17/04** (2006.01)  
**A61K 8/02** (2006.01)  
**A61K 8/04** (2006.01)  
**A61K 8/29** (2006.01)  
**A61K 8/37** (2006.01)  
**A61K 8/39** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **15.11.2010 PCT/EP2010/067433**

87 Fecha y número de publicación internacional: **26.05.2011 WO11061133**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **15.11.2010 E 10776721 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **28.03.2018 EP 2501438**

54 Título: **Composiciones tópicas**

30 Prioridad:

**18.11.2009 EP 09176310**

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

**19.06.2018**

73 Titular/es:

**DSM IP ASSETS B.V. (100.0%)  
Het Overloon, 1  
6411 TE Heerlen, NL**

72 Inventor/es:

**SATZINGER, THOMAS y  
WESTENFELDER, HORST**

74 Agente/Representante:

**LEHMANN NOVO, María Isabel**

ES 2 672 990 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 tópicas

- 5 La presente invención se refiere a un método para mejorar la resistencia al agua de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas y micronizadas que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona en una composición tópica caracterizada por que dichas partículas se incorporan a la composición tópica en forma de dispersión de dichas partículas en benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2. Además, la invención se refiere a las composiciones tópicas que comprenden dichas dispersiones, así como a su uso como filtro solar.
- 10 Hay una necesidad constantemente creciente de filtros solares que comprendan cantidades constantemente crecientes de sustancias de filtro UV para proporcionar una protección eficaz contra la radiación UV. Dichos filtros solares deberían presentar un alto FPS (factor de protección solar) además de presentar una suficiente resistencia al agua y una sensación en la piel atractiva.
- 15 Los filtros UV de dióxido de titanio micronizados e inorgánicos son particularmente útiles en aplicaciones de filtro solar debido a su capacidad para aumentar el factor de protección solar (FPS) de las formulaciones por un amplio intervalo UV de 250 nm a 380 nm. Además, los dióxidos de titanio micronizados son considerados en general seguros para uso cosmético y no presentan la desventaja de una sensación pegajosa en la piel como en el caso de la mayoría de los filtros UV orgánicos. Sin embargo, aún quedan muchos problemas asociados al uso de los filtros UV de dióxido de titanio micronizado. En particular, el nivel de polvo de dióxido de titanio necesario para conseguir los niveles de FPS apropiados (y superiores) hace el producto estéticamente inaceptable, es decir, hay una sensación pesada y arenosa y un residuo blanco/azul en la piel. Además, la resistencia al lavado de las partículas de dióxido de titanio micronizadas, inorgánicas, en composiciones tópicas no es aún satisfactoria a la vista de la formulación de filtros solares "muy resistentes al agua" (también etiquetados como impermeables).
- 20
- 25 Sorprendentemente, se ha encontrado que las composiciones tópicas que comprenden una dispersión orgánica de dióxido de titanio, consistiendo dicha dispersión en partículas de dióxido de titanio micronizadas doblemente recubiertas que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona dispersadas en una mezcla de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> (CAS-núm.: 68411-27-8) y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2 (CAS-núm.: 137398-08-4) solucionan las desventajas de la técnica anterior. En particular, las composiciones tópicas que comprenden dicha dispersión presentan factores de protección solar (FPS) mejorados y resistencia al agua mejorada. Como un beneficio adicional, las composiciones tópicas que comprenden dichas dispersiones orgánicas de dióxido de titanio presentan una excelente sensación en la piel, muestran una transparencia aumentada evitándose así el denominado "efecto de blanqueamiento" en la piel y no muestran decoloración cuando se usan junto con derivados de dibenzoilmetano.
- 30
- 35 Así, en una realización, la invención se refiere a composiciones tópicas que comprenden en un portador cosméticamente aceptable una dispersión orgánica de dióxido de titanio, caracterizada por que dicha dispersión consiste en partículas de dióxido de titanio micronizadas doblemente recubiertas que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona (en lo que sigue referido como partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas) dispersadas en una mezcla de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2.
- 40
- 45 El término "consiste en" como se usa según la presente invención se refiere a dispersiones en donde la cantidad total de los ingredientes ascienden a 100 % en peso. Sin embargo, el término "consiste en" no excluye cantidades traza de aditivos adicionales o impurezas que se introduzcan, por ejemplo, por las respectivas materias primas que, sin embargo, no deberían exceder de un 5 % en peso, en particular un 3 % en peso basado en el peso total de la dispersión.
- 50
- 55 En una realización particular, la dispersión orgánica de dióxido de titanio usada según la presente invención consiste en un 10 % - 80 % en peso de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas, un 10 % - 80 % en peso de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y 0,5 % - 20 % en peso de dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2. En particular, la dispersión orgánica de dióxido de titanio consiste en un 25 % - 60 % en peso de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas, un 30 % - 70 % en peso de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y un 2 % - 15 % en peso de dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2. Lo más en particular, la dispersión orgánica de dióxido de titanio consiste en un 45 % - 55 % en peso de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas, 40 % - 50 % en peso de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y un 6 % - 8 % en peso de dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2. Lo más en particular, el contenido de las partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas en la dispersión es aproximadamente un 50 % en peso.
- 60
- 65 Todos los porcentajes y las relaciones mencionadas en esta memoria descriptiva son en peso si no se indica o es evidente lo contrario.

Se ha encontrado además, que las ventajas inventivas se acentúan en particular cuando la relación de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas a dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2 en la dispersión se selecciona en el intervalo de 20 a 1 a 10 a 1, lo más en particular 10 a 1 a 5 a 1.

5 Las partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas según la invención pueden prepararse según el procedimiento descrito en el ejemplo 1 de la patente europea EP 444798.

10 El recubrimiento interno del dióxido de titanio con sílice inorgánica puede prepararse según el estado de la técnica como por ejemplo se describe en las patentes europeas EP 44515, EP-A 988 853, EP-A 1 284 277, EP0988853 y la patente de EE.UU. 5562897, la patente japonesa JP 2000319128 así como según la patente alemana DE10333029. La capa de recubrimiento interno de sílice inorgánica está presente en una cantidad de al menos un 0,5 % en peso, preferiblemente en una cantidad de un 0,5 % - 50 % en peso, lo más preferiblemente en una cantidad de un 1 % - 20 % en peso basado en dióxido de titanio no recubierto.

15 El recubrimiento externo de silicona se selecciona de la clase de recubrimientos conocidos de silicona tales como por ejemplo derivados de silano tales como trietoxicaprililsilano o derivados de siloxano tales como aceites de silicona. Los aceites de silicona adecuados en particular son polidimetilsiloxanos (también conocidos como dimeticona tales como, por ejemplo, los polidimetilsiloxanos con CAS núm. [CAS 63148-62-9] o [CAS 9016-00-6], simeticonas [CAS 8050-81-5], polimetilhidrosiloxanos (también conocidos como meticonas [CAS 9004-73-3]) y polisilicona-15. En particular, el recubrimiento externo se selecciona de polidimetilsiloxanos [CAS 63148-62-9] o [CAS 9016-00-6]. La capa de recubrimiento externo consiste en mínimo un 0,25 % en peso basado en el dióxido de titanio. Preferiblemente, la capa de recubrimiento externo consiste en un 0,5 % - 50 % en peso, lo más preferiblemente de un 0,5 % - 10 % en peso basado en dióxido de titanio.

25 Puede pretratarse la superficie del dióxido de titanio antes del recubrimiento para reducir adicionalmente la actividad superficial. Dichos pretratamientos son conocidos para un experto en la materia y pueden realizarse, por ejemplo, con (a) fluoroácidos seleccionado de  $H_2SiF_6$ ,  $H_2TiF_6$ ,  $H_2ZrF_6$ ,  $H_2HfF_6$ ,  $H_2GeF_6$ ,  $H_2SnF_6$  y/o  $HBF_4$ ; (b) ácido carboxílico soluble en agua que contiene  $\geq 2$  grupos hidroxilo por grupo carboxilo en cada molécula de ácido (especialmente, ácido glucónico); (c) sales solubles en agua de dichos ácidos carboxílicos; (d) fuente de iones fosfato, especialmente  $H_3PO_2$  y/o sales de fosfato y/o ácidos organofosfóricos y sus sales; (e) ácido inorgánico tal como  $H_2SO_2$ ,  $HNO_3$ ,  $H_3PO_2$ , ácido bromhídrico, yodhídrico y/o perclórico (f) componente orgánico seleccionado de taninos y/o polímeros aminofenólicos y (h) óxido, hidróxido, opcionales.

30 Preferiblemente, no se aplica pretratamiento o se aplica pretratamiento con una fuente de iones fosfato, especialmente  $H_3PO_4$  y/o sales de fosfato y/o ácidos organofosfóricos y sus sales.

35 El término "doblemente recubierto" como se usa según la invención indica la presencia de dos recubrimientos sobre las partículas de dióxido de titanio, es decir, un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona. Preferiblemente, el recubrimiento externo consiste en meticona, polidimetilsiloxano o mezclas de los mismos; en particular el recubrimiento externo es polidimetilsiloxano.

40 Lo más preferiblemente, las partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas están en forma de polvo blanco que consiste en óxido de titanio de estructura cristalina rutilo recubierto con sílice y polidimetilsiloxano (CAS 63148-62-9) que está comercialmente disponible con el nombre comercial PARSOL® TX por DSM Nutritional Products Ltd.

45 El término partículas micronizadas de dióxido de titanio se refiere a partículas de dióxido de titanio que tienen tamaños de partícula que son principalmente útiles para incorporación en composiciones de filtro solar como filtros UV. Dichas partículas tienen preferiblemente un tamaño de partícula primario en el intervalo de 2 nm a 100 nm, más preferiblemente en el intervalo de 5 nm a 50 nm y un tamaño de partícula secundario entre 0,05  $\mu m$  y 50  $\mu m$ , más preferiblemente entre 0,1  $\mu m$  y 1  $\mu m$ . El tamaño de partícula de las partículas micronizadas de dióxido de titanio doblemente recubiertas que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona en la dispersión orgánica de dióxido de titanio está preferiblemente en el intervalo de 300 nm a 400 nm.

50 La dispersión orgánica de dióxido de titanio puede prepararse por métodos conocidos en la técnica, por ejemplo, por mezcla de benzoato de alquilo  $C_{12-15}$  con partículas de dióxido de titanio micronizadas doblemente recubiertas en presencia de dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2. Preferiblemente, se prepara una mezcla de benzoato de alquilo  $C_{12-15}$  y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2 antes de que se añadan las partículas micronizadas de dióxido de titanio doblemente recubiertas. La preparación de la dispersión orgánica de dióxido de titanio puede realizarse, por ejemplo, con un molino de rodillos, un molino de bolas, un homogeneizador o mezclado sónico.

55 Las composiciones tópicas según la presente invención pueden prepararse según el estado de la técnica. Se prefieren composiciones tópicas para protección de la piel frente a la radiación UV tales como composiciones tópicas de filtro solar.

La dispersión orgánica de dióxido de titanio se incorpora preferiblemente en las composiciones tópicas según la invención en una concentración de 0,5 % a 50 % en peso, preferiblemente 1 % a 25 % en peso (basado en el polvo seco).

5 La dispersión orgánica de dióxido de titanio puede incorporarse directamente en las composiciones tópicas según la invención sin medidas preparatorias adicionales según métodos conocidos para un experto en la materia.

10 La invención también se refiere a un método de preparación de una composición tópica según la invención caracterizada por que se incorpora una dispersión que consiste en partículas micronizadas de dióxido de titanio doblemente recubiertas que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona, benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2 con todas las definiciones y las preferencias como se indica en líneas generales anteriormente, en un portador cosméticamente aceptable. La dispersión puede añadirse a la fase oleosa o al final en la formulación final por métodos conocidos para un experto en la materia.

15 Las nuevas composiciones tópicas presentan una resistencia al agua claramente mejorada y así una protección mejorada frente a los efectos perjudiciales de los rayos solares incluso después del baño o sudoración. Además, las composiciones tópicas muestran factores de protección solar mejorados comparado con la incorporación de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas como tales (es decir, no dispersadas).

20 Así, la invención también se refiere a un método para mejorar la resistencia al agua de las partículas micronizadas de dióxido de titanio doblemente recubiertas que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona en una composición tópica caracterizada por que dichas partículas se incorporan a la composición tópica en forma de dispersión de dichas partículas en benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2.

25 El término "composición tópica" como se usa en la presente memoria se refiere, en particular, a composiciones cosméticas que pueden aplicarse por vía tópica a tejido queratinoso de mamífero tal como, por ejemplo, la piel o el cabello humanos, en particular la piel humana.

30 El término "composición cosmética" como se usa en la presente solicitud se refiere a composiciones cosméticas como se define bajo el título "Kosmetika" en Römpp Lexikon Chemie, 10ª edición 1997, Georg Tieme Verlag Stuttgart, Nueva York así como a preparaciones cosméticas como se describe en A. Domsch, "Cosmetic Preparations", Verlag für chemische Industrie (ed. H. Ziolkowsky), 4ª edición, 1992.

35 El término portador cosméticamente aceptable se refiere a todos los portadores y/o excipientes y/o diluyentes usados convencionalmente en las composiciones o preparaciones tópicas.

40 Preferiblemente, las composiciones tópicas según la presente invención son en forma de una suspensión o dispersión en disolventes o sustancias grasas o alternativamente en forma de emulsión o microemulsión (en particular, de tipo O/W (aceite/agua) o W/O (agua/aceite)), emulsión PIT, emulsión múltiple (por ejemplo, de tipo O/W/O W/O/W), emulsión de Pickering, hidrogel, gel alcohólico, lipogel, disolución en una fase o de múltiples fases o dispersión vesicular u otras formas habituales, que también pueden aplicarse mediante plumas, como máscaras o como pulverizaciones. Si la preparación tópica es, o comprende, una emulsión también puede contener uno o más tensioactivos aniónicos, no iónicos, catiónicos o anfóteros.

45 En una realización particular, las composiciones tópicas según la invención son emulsiones O/W. Preferiblemente, el tensioactivo de la emulsión O/W se selecciona del grupo de estearato de glicerilo junto con ceteareth-20 y/o ceteareth-25, ceteareth-6 junto con alcohol estearílico, alcohol cetilestearílico junto con PEG-40-ricinusol y cetilestearilsulfato de sodio, fosfato de triceteareth-4, estearato de glicerilo, cetilestearilsulfato de sodio, fosfato de lecitina trilaureth-4, fosfato de laureth-4, ácido esteárico, estearato de propilenglicol SE, aceite de ricino hidratado PEG-25, aceite de ricino hidratado PEG-54 y/o glicéridos de ácido caprílico/ácido caprílico PEG-6, oleato de glicerilo junto con propilenglicol, estearato de PEG-9, estearato de PEG-20, estearato de PEG-30, estearato de PEG-40, estearato de PEG-100, ceteth-2, ceteth-20, polisorbato-20, polisorbato-60, polisorbato-65 y/o polisorbato-100, estearato de glicerilo junto con estearato de PEG-100, miristato de glicerilo, laurato de glicerilo, PEG-40-peroleato de sorbitán, laureth-4, ceteareth-3 y/ isoestearil gliceril éter, alcohol cetilestearílico junto con cetilestearilsulfato de sodio, laureth-23 y/o esteareth-2, estearato de glicerilo junto con estearato de PEG-30, estearato de PEG-40, diestearato de glicol, copolímero de PEG-22-dodeciliglicol, poligliceril-2-PEG-4-estearat, ceteareth-12, ceteareth-20, ceteareth-30, glucosasesquiestearato de metilo, esteareth-10 y/o estearato de PEG-20, esteareth-2 junto con diestearato de PEG-8, esteareth-21, esteareth-20, isosteareth-20, copolímero de PEG-45/dodeciliglicol, copolímero de metoxi-PEG-22/dodeciliglicol, PEG-40-peroleato de sorbitán, PEG-40-perisoestearatos de sorbitán, PEG-20-estearatos de glicerilo, PEG-20-estearatos de glicerilo, PEG-8-cera de abejas, poligliceril-2-laurato, succinato de isoestearildiglicerilo, estearamidopropil-PG-clorurofosfato de dimonio, ceteth-20, estearato de glicerilo SE, citrato de trietilo, PEG-20-glucosasesquiestearato de metilo, fosfato de cetilo, estearato-citrato de glicerilo, sulfato de cetearilo, sesquioleato de sorbitán, triceteareth-4-fosfatos, trilaureth-4-fosfato, diestearato de poliglicerilmetilglucosa, cetilfosfato de potasio, diestearato de poligliceril-3-metilglucosa, isoesteareth-10, poligliceril-2-sesquisoestearato, ceteth-10, oleth-20 y/o isoceteth-20, estearato de glicerilo junto con ceteareth-20, ceteareth-12, alcohol cetilestearílico y/o palmitato de cetilo, alcohol cetilestearílico

junto con estearato de PEG-20, estearato de PEG-30, estearato de PEG-40 y/o estearato de PEG-100. En particular tensioactivos O/W preferidos son tensioactivos de éster de fosfato tales como fosfato de cetilo, fosfato de cetilo potásico y/o fosfato de DEA-cetilo, estearato de glicerilo, estearato de PEG-40, estearato de PEG-100 junto con estearato de glicerilo, diestearato de triglicerinametilglucosa, diestearato de poligliceril-3-metilglucosa, cetearilglucósido, polietilenglicol(21) estearil éter, polietilenglicol(2) estearil éter, estearato-citrato de glicerilo, cetearil-sulfato de sodio, alcohol setearílico, ácido esteárico y/o estearato de sorbitán.

Tensioactivos O/W preferidos en particular según la invención son tensioactivo de éster de fosfato, en particular seleccionado de fosfato de cetilo, fosfato de cetilo potásico y/ o fosfato de DEA-cetilo y/o estearato de PEG-100 junto con estearato de glicerilo. Los tensioactivos O/W más preferidos según la invención son los tensioactivos de éster de fosfato: fosfato de cetilo, fosfato de cetilo potásico y/o fosfato de DEA-cetilo.

La fase oleosa de las emulsiones O/W según la invención comprenden preferiblemente aceites seleccionados de: butilenglicoldicaprilat/-dicaprat, dicaprilil éter, triglicérido de ácido graso C<sub>18-38</sub>, adipato de dibutilo, ciclometicona, 2-feniletibenzoat, lauroilsarcosinato de isopropilo así como mezclas de los mismos. La cantidad del aceite (uno o varios) en la emulsión O/W según la invención se selecciona en general en el intervalo de 0,1 bis 40 % en peso, en particular en el intervalo de 1,0 % a 30 % en peso, lo más en particular en el intervalo de 5 % a 20 % en peso con respecto al peso total de la composición tópica.

En otra realización particular, las composiciones tópicas según la intención son geles, ya que la incorporación de la dispersión de dióxido de titanio con las preferencias y las definiciones como se indica en líneas generales anteriormente, en vez de otros grados de dióxido de titanio y dispersiones de dióxido de titanio, conducen sorprendentemente a un aspecto estéticamente agradable. Son particularmente preferidos los geles Pemulen tales como geles Pemulen TR.

Las composiciones tópicas preferidas según la presente invención son preparaciones para el cuidado solar, tales como en particular filtros solares muy resistentes al agua (también denominados filtros solares impermeables).

Las composiciones tópicas según la invención pueden estar en la forma de un líquido, loción, una loción espesada, un gel, una crema, una leche, una pomada, una pasta, un polvo, un maquillaje o una barra de tubo sólida y puede envasarse opcionalmente como aerosol y puede proporcionarse en forma de una mousse tal una mousse de aerosol, una espuma o una espuma de pulverización, una pulverización, un bastón.

Las composiciones cosméticas tópicas de la invención también pueden contener adyuvantes y aditivos cosméticos habituales tales como, por ejemplo, sustancias de filtro UV adicionales, conservantes, antioxidantes, sustancias grasas, aceites, agua, alcoholes, polioles, disolventes orgánicos, electrolitos, siliconas, espesantes, agentes formadores de película, ablandadores, emulsionantes, agentes complejantes, agentes antiespumantes, humectantes, componentes estéticos tales como fragancias, tensioactivos, cargas, agentes secuestrantes, polímeros aniónicos, catiónicos, no iónicos o anfóteros o sus mezclas, propelentes, agentes acidificantes o alcalinizantes, tintes, coloraciones/colorantes, abrasivos, absorbentes, aceites esenciales, sensaciones para la piel, astringentes, agentes antiespumantes, pigmentos o nanopigmentos, ingredientes cosméticamente activos o cualquier otro ingrediente, portador y/o excipiente o diluyente formulado habitualmente en composiciones cosméticas. Dichos ingredientes cosméticos usados comúnmente en la industria del cuidado de la piel, que son adecuados para uso en las composiciones de la presente invención, se describen, por ejemplo, en el CTFA Cosmetic Ingredient Handbook, segunda edición (1992) sin que se limite al mismo.

Las cantidades necesarias de los adyuvantes y aditivos cosméticos y dermatológicos -basado en el producto deseado- pueden elegirse fácilmente por el experto en este campo y se ilustrarán en los ejemplos sin limitarse a ellos.

Preferiblemente, las composiciones tópicas según la invención comprenden sustancias de filtro UV adicionales que se seleccionan preferiblemente de sustancias de filtro UVA y/o UVB y/o UV de amplio espectro convencionales que se sabe que se añaden a composiciones tópicas tales como productos para el cuidado solar cosmético o dermatológico. Dichas sustancias de filtro UV comprenden todos los grupos que absorben la luz en el intervalo de longitudes de onda de 400 nm a 320 nm (UVA) y 320 nm a 280 nm (UVB) o de longitudes de onda incluso más cortas (UVC) y que son o pueden usarse como sustancias de filtro UV cosméticamente aceptables. Dichas sustancias de filtro UV se enumeran por ejemplo en el CTFA Cosmetic Ingredient Handbook o "The Encyclopedia of violet Filters" (ISBN: 978-1-932633-25-2) por Nadim A. Shaath.

Las sustancias de filtro UV adecuadas pueden ser compuestos orgánicos o inorgánicos. Las sustancias de filtro UV orgánicas ejemplares incluyen, por ejemplo, acrilatos tales como por ejemplo 2-ciano-3,3-difenilacrilato de 2-etilhexilo (octocrileno, PARSOL® 340), 2-ciano-3,3-difenilacrilato de etilo; derivados de alcanfor tales como por ejemplo 4-metilbencilidenoalcanfor (PARSOL® 5000), 3-bencilidenoalcanfor, metosulfato de alcanforbenzalconio, poli(acrilamido)metilbencilidenoalcanfor, sulfobencilidenoalcanfor, sulfometilbencilidenoalcanfor, ácido tereftalilidenoalcanforsulfónico (Mexoryl® SX); derivados de cinamato tales como por ejemplo metoxicinamato de etilhexilo (PARSOL® MCX), metoxicinamato de etoxietilo, metoxicinamato de isoamilo así como derivados de ácido cinámico unidos a siloxanos; derivados de ácido p-aminobenzoico tales como por ejemplo ácido p-aminobenzoico, p-

5 dimetilaminobenzoato de 2-etilhexilo, p-aminobenzoato de etilo N-oxipropileno, p-aminobenzoato de glicerilo; benzofenonas tales como por ejemplo benzofenona-3, benzofenona-4, 2,2',4,4'-tetrahidroxi-benzofenona, 2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetoxibenzofenona; ésteres de ácido benzalmalónico tales como por ejemplo 4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo); compuestos de organosiloxano que soportan grupos cromóforo tales como por ejemplo  
 10 polisiliconas-15 (PARSOL® SLX), drometrizol trisiloxano (Mexoryl® XL); derivados de salicilato tales como por ejemplo salicilato de isopropilbencilo, salicilato de bencilo, salicilato de butilo, salicilato de etilhexilo (PARSOL® EHS, Neo Heliopan® OS), salicilato de isoocitilo o salicilato de homomentilo (homosalato, PARSOL® HMS, Neo Heliopan® HMS); derivados de triazina tales como por ejemplo etilhexiltriazona (Uvinul® T-150), dietilhexilbutamidotriazona (Uvasorb® HEB), bis-etilhexiloxifenolmetoxifeniltriazina (Tinosorb® S), 2,4,6-tribifenil-4-il-1,3,5-triazina; derivados de benzotriazol tales como por ejemplo 2,2'-metileno-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol (Tinosorb® M); filtros UV encapsulados tales como por ejemplo metoxicinamato de etilhexilo encapsulado (Eusolex® perlas UV) o microcápsulas cargadas con filtros UV como se describe por ejemplo en la patente europea EP 1471995; derivados de dibenzoilmetano tales como por ejemplo 4-terc.-butil-4'-metoxidibenzoil-metano (PARSOL® 1789), dimetoxidibenzoilmetano, isopropildibenzoilmetano; ácidos fenileno-1,4-bis-benzimidazolsulfónicos o sales tales como por ejemplo 2,2-(1,4-fenileno)bis-(ácido 1H-benzimidazol-4,6-disulfónico) (Neoheliopan AP); hidroxibenzofenonas aminosustituidas tales como por ejemplo éster hexílico del ácido 2-(4-dietilamino-2-hidroxi-benzoil)-benzoico (aminobenzofenona, Uvinul® A Plus), 1,1'-(1,4-piperazindil)bis[1-[2-[4-(dietilamino)-2-hidroxibenzoil]fenil]-metanona; derivados de benzoxazol tales como por ejemplo 2,4-bis-[5-(1-dimetilpropil)benzoxazol-2-il-(4-fenil)-imino]-6-(2-etilhexil)-imino-1,3,5-triazina [Uvasorb® K2A], etilhexil-bis-isopentilbenzoxazolifenilmelamina y merocianinas como se describe por ejemplo en la patente alemana DE10 2007 024 345 en la página 4, párrafo 19 que se incorpora por referencia en la presente memoria.

25 Pueden estar presentes sustancias inorgánicas adicionales de filtro UV e incluyen pigmentos tales como por ejemplo óxido de zinc microparticulado (micronizado). El término "microparticulado" se refiere a un tamaño de partícula de 5 nm a 200 nm, en particular de 15 nm a 100 nm. Las partículas también pueden recubrirse por otros óxidos metálicos tales como por ejemplo óxidos de aluminio o de circonio o por recubrimientos orgánicos tales como por ejemplo polioles, meticona, estearato de aluminio, alquilsilano. Dichos recubrimientos se conocen en la técnica.

30 Para mejorar la fotoestabilidad de los productos para el cuidado solar puede ser deseable añadir un fotoestabilizante. Fotoestabilizantes ejemplares conocidos para el experto en la materia incluyen por ejemplo derivados de 3,3-difenilacrilato tales como por ejemplo octocrileno (PARSOL® 340) o Poliéster-8 (Polycrylene®); derivados de bencilidenoalcanfor tales como por ejemplo 4-metilbencilidenoalcanfor (PARSOL® 5000); derivados de benzalmalonato tales como por ejemplo polisiliconas-15 (PARSOL® SLX) o malonato de dietilhexilsiringilideno (OxyneX ST líquido); naftalatos de dialquilo tales como naftalato de dietilhexilo (Corapan TQ) sin limitarse a ellos. Una descripción de más estabilizantes se proporciona por ejemplo en 'SPF Boosters & Photostability of violet Filters', HAPPI, octubre de 2007, p. 77-83 que se incluye en la presente memoria como referencia. Los fotoestabilizantes se usan en general en una cantidad de 0,05 % a 10 % en peso con respecto al peso total de la composición tópica.

40 Las sustancias de filtro UV adicionales están presentes en general en las composiciones según la invención en proporciones que oscilan de 0,1 % a 30 % en peso, preferiblemente oscilando de 0,2 % a 15 % en peso, lo más preferiblemente oscilando de 0,5 % a 10 % en peso con respecto al peso total de la composición.

45 En general, la cantidad de cada sustancia de filtro UV en las composiciones tópicas según la invención se selecciona en el intervalo de 0,1 % a 10 % en peso, preferiblemente en el intervalo de 0,2 % a 7 % en peso, lo más preferiblemente en el intervalo de 0,5 % a 5 % en peso con respecto al peso total de la composición tópica.

50 La cantidad total de sustancia(s) de filtro UVA, en particular de butilmetoxidibenzoilmetano, en las composiciones tópicas según la invención se selecciona preferiblemente en el intervalo de 0,5 % a 7 % en peso, en particular en el intervalo de 1 % a 6 % en peso, lo más particular en el intervalo de 2 % a 5 % en peso con respecto al peso total de la composición tópica.

55 La cantidad total de sustancias de filtro UV en las composiciones tópicas según la invención está preferiblemente en el intervalo de 1 % a 40 % en peso, preferiblemente en el intervalo de 5 % a 30 % en peso, en particular en el intervalo de 20 % a 30 % en peso con respecto al peso total de la composición tópica.

Las sustancias de filtro UVB adicionales referidas para uso en las composiciones tópicas según la invención incluyen polisiliconas-15, octocrileno, metoxicinamato de etilhexilo, hexilsalicilato de etilo y/u homosalato.

60 Las sustancias de filtro UV de banda ancha preferidas para uso en las composiciones tópicas según la invención incluyen derivados asimétricos de s-triazina como 2,4-bis-[[4-(2-etilhexiloxi)-2-hidroxi]fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina y 2,4,6-tris-(bifenil)-1,3,5-triazina, ciertas benzofenonas tales como por ejemplo 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona y/o 2,2'-metileno-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol).

65 La sustancia de filtro UVA preferida para uso en las composiciones tópicas según la invención es butilmetoxidibenzoilmetano (comercialmente disponible como PARSOL® 1789 por DSM Nutritional Products Ltd.).

5 Las composiciones tópicas preferidas según la invención comprenden además uno o varios antioxidantes. Los antioxidantes adecuados para la incorporación a las composiciones tópicas según la invención son todos antioxidantes adecuados para aplicaciones cosméticas. Se prefieren en particular antioxidantes solubles en agua tales como vitaminas tales como por ejemplo ácido ascórbico así como sus derivados tales como por ejemplo fosfato de ascorbilo tal como Stay C (ascorbilmonofosfato de sodio) de DSM Nutritional Products Ltd.

10 Antioxidantes preferidos adicionales son BHT, vitamina E y derivados de los mismos así como vitamina A y derivados de los mismos.

15 La cantidad de antioxidante (uno o varios) en las composiciones tópicas según la invención se selecciona preferiblemente del intervalo de 0,001 % a 30 % en peso, en particular en el intervalo de 0,05 % a 20 % en peso, lo más particular en el intervalo de 0,1 % a 10 % en peso, con respecto a la cantidad total de la composición tópica.

20 Si se usa un derivado de vitamina E en las composiciones tópicas según la invención se usa preferiblemente acetato de tocoferilo. Puede estar presente acetato de tocoferilo en las preparaciones tópicas en una cantidad de 0,05 % a 25 % en peso, en particular 0,5 % a 5 % en peso. Otro derivado de vitamina E de interés es linoleato de tocoferilo. El linoleato de tocoferilo puede estar presente en la composición para el cuidado de la piel en una cantidad de 0,05 % a 25 % en peso, en particular 0,5 % a 5 % en peso.

25 La vitamina A y/o sus derivados en particular derivados retinoides tales como palmitato de retinilo o propionato de retinilo se usan preferiblemente en las preparaciones tópicas según la invención en una cantidad de 0,01 % a 5 % en peso, en particular 0,01 % a 0,3 % en peso.

30 Preferiblemente, las composiciones tópicas según la invención comprenden además un alcohol graso, tal como en particular alcohol cetílico, alcohol cetearílico y/o alcohol behenílico. La cantidad total de uno o varios alcoholes grasos en las composiciones tópicas según la invención se selecciona preferiblemente del intervalo de 0,1 % a 10,0 % en peso, en particular en el intervalo de 0,5 % a 6,0 % en peso con respecto al peso total de la composición tópica.

35 Ejemplos preferidos de ingredientes cosméticamente activos para la incorporación en las composiciones tópicas según la invención incluyen vitamina B<sub>6</sub>, vitamina B<sub>12</sub>, biotina, co-enzima Q10, EGCG, ácido alfa-lipónico, fitoeno, hidroxitiroso y/o extracto de oliva, manteca de karité, extracto de algas, manteca de cacao, extracto de aloe, aceite de jojoba, extracto de equinácea, extracto de camomila, alfa-glucosilrutina, carnitina, carnosina, isoflavonoides naturales y/o sintéticos, creatina, taurina, alanina, ácido glicirretínico, *Glycyryca glabra* y/o *Glycyrrhiza inflata*.

40 Los ingredientes cosméticamente activos están incluidos típicamente en una cantidad de al menos 0,001 % en peso basado en el peso total de la preparación tópica. En general, se usa una cantidad de un 0,001 % en peso a 30 % en peso, preferiblemente de 0,001 % en peso a 10 % en peso de un agente cosméticamente activo adicional. Se prefieren más que las composiciones tópicas según la invención comprendan además un humectante. Los humectantes son agentes químicos diseñados especialmente para hacer más suaves las capas externas de la piel (epidermis) y más flexibles por aumento de su hidratación (contenido de agua) que puede determinarse por ejemplo por medida de la pérdida de agua transepidérmica (PATE). Un humectante adecuado según la invención es por ejemplo, glicerina, ácido láctico y/o lactato tal como en particular lactato de sodio, butilenglicol, propilenglicol, biosacárido goma-1, glicina soja, etilhexiloxiglicerina, ácido pirrolidioncarbónico y/o urea.

45 Los conservantes adecuados según la invención incluyen por ejemplo productos químicos que liberan formaldehído tales como por ejemplo DMDM Hidantoína (por ejemplo como Glydant por Lonza), carbamato de yodopropilbutilo (por ejemplo como Glycacyl-L, Glycacyl-S por Lonza y/o Dekaben LMB por Jan Dekker), parabenos (por ejemplo, éster alquílico de ácido p-hidroxibenzoico tal como metil-, etil-, propil- y/o butilparabeno), fenoxietanol, etanol, ácido benzoico sin limitarse a ellos.

50 Preferiblemente, las composiciones tópicas según la invención comprenden un espesante en particular si la composición tópica está en forma de emulsión para ayudar a hacer adecuada la consistencia de un producto. Los espesantes preferidos son aluminosilicatos, goma xantana, hidroxipropilmetilcelulosa, poliacrilatos tales como carbopole® (por ejemplo Carbopole 980, 981, 1382, 2984, 5984) o mezclas de los mismos. Espesantes preferidos adicionales incluyen copolímeros de acrilato/acrilato de alquilo C<sub>10-30</sub> (tales como por ejemplo Pemulen TR 1, Pemulen TR 2, Carbopol 1328 por NOVEON) así como Aristoflex AVC (INCI: Copolímero de acriloldimetiltaurato de amonio / VP).

55 Por supuesto, un experto en esta materia tendrá cuidado en seleccionar el compuesto o los compuestos adicionales opcionales ya mencionados y/o sus cantidades de manera que las propiedades ventajosas asociadas de manera intrínseca a la combinación según la invención no se vean afectadas, o no sustancialmente, de manera perjudicial por la adición o las adiciones previstas.

60 Las composiciones cosméticas y/o dermatológicas según la invención tienen un pH en el intervalo de 3-10, preferiblemente en el intervalo de pH de 4-8, lo más preferido en el intervalo de pH 4-7.

## ES 2 672 990 T3

La invención se refiere además al uso de una composición tópica según la invención para la protección de la piel y/o cabello humanos contra la radiación UV.

5 Los siguientes ejemplos se proporcionan para ilustrar además los procedimientos y las composiciones de la presente invención. Estos ejemplos son sólo ilustrativos y no se pretende que limiten el alcance de la invención de ningún modo.

Ejemplo 1: Ensayo de resistencia al agua

10 Se han preparado cuatro emulsiones para el cuidado solar que comprenden Parsol® TX o una dispersión que consiste en un 50 % en peso de Parsol® TX, benzoato de alquilo C<sub>12</sub>-C<sub>15</sub> (43 % en peso) y PGPH (7 % en peso) en dos niveles de concentración diferentes según métodos estándar. Para cada formulación se han preparado cuatro placas de PMMA.

Medición de FPS in vitro:

Se midió el FPS in vitro usando un MUT Helias" (MUT Aviation-Technology GmbH) en placas de PMMA (2,5 x 50 x 50 mm) en cuatro puntos diferentes.

15 Aplicación:

20 Se aplicaron 18,7 mg ± 0,2 mg de la respectiva formulación con una jeringa *dot wise* en la placa PMMA y se extendió uniformemente en la placa frotando con un dedo que se saturó de antemano con la respectiva formulación. Se dejó que la muestra sedimentara durante 30 min en una estufa a 43 °C y se midió el FPS (inicial) in vitro.

25 Inmersión en agua: Las mediciones se han realizado usando vasos de precipitados de 3 l llenados con 2,5 l de agua osmotizada atemperada al ambiente. Después de haber fijado las placas PMMA con un espaciador a la pared de los vasos de precipitados se agitó el agua de manera constante usando un agitador magnético (450 l/min) para asegurar un flujo laminar óptimo del agua por las placas. Después de una inmersión de 20 min, se extrajeron las muestras y se retiró el agua excesiva a 43 °C durante 30 min. Después de alcanzar la temperatura ambiente, se midió de nuevo el FPS in vitro. Los resultados se resumen en la tabla 1.

Tabla 1

Ingredientes	Referencia	Dispersión	Referencia	Dispersión
Estol 3650	2,0	2,0	2,0	2,0
Lanette O	1,0	1,0	1,0	1,0
Myritol 318	15,0	15,0	15,0	15,0
Finsolv TN	10,0	5,0	10,0	0,0
Producto cosmético de Dow Corning	2,0	2,0	2,0	2,0
Amphiol K	2,0	2,0	2,0	2,0
Phenonip	0,8	0,8	0,8	0,8
BHT	0,05	0,05	0,05	0,05
Dispersión PARSOL TX	-	10,0	-	20,0
PARSOL TX	5,0	-	10,0	-
Pemulen TR 1	0,3	0,3	0,3	0,3
Glicerina	8,0	8,0	8,0	8,0
AEDT	0,1	0,1	0,1	0,1
TEA	0,4	0,4	0,4	0,4
agua	46,7	46,7	51,7	51,7
FPS antes de inmersión en agua	10,0 ± 1,6	11,1 ± 1,7	19,8 ± 4,0	24,4 ± 9
FPS después de inmersión en agua	5,2 ± 0,2	7,5 ± 0,8	15,1 ± 3,1	21,3 ± 4,8
Δ FPS (antes - después)	4,8	3,6	4,7	3,1
% disminución de FPS	-47,00 %	-32,50 %	-23,73 %	-12,70 %



Como se puede extraer de la tabla 1 después de un aumento del FPS la resistencia al agua mejora significativamente por el uso de la dispersión de dióxido de titanio ilustrada por una disminución significativamente reducida del FPS in vitro después del procedimiento de lavado.

5 Ejemplo 2 Preparaciones de filtro solar

Filtro solar O/W

<b>Fase</b>	<b>Ingredientes</b>	<b>Nombre INCI</b>	<b>% en peso</b>
A	Dermofeel BGC	Dicaprilato/dicaprato de butilenglicol	3,00
	PARSOL® 1789	Butilmetoxidibenzoilmetano (Avobenzona; USAN)	4,50
	PARSOL® 340	Octocrileno (Octocrileno; USAN)	4,00
	Eutanol G	Octildodecanol	3,00
	Cetiol OE	Dicaprilil éter	3,00
	Tinosorb S	Bis-etilhexiloxifenolmetoxifeniltriazina	2,00
	Cetiol CC	Carbonato de dicaprililo	2,00
	Imwitor 372 P Schuppen	Estearato - citrato de glicerilo	1,00
	Lanette 18	Alcohol estearílico	1,00
	Pastillas de Lipocire Na 10	Cocoglicéridos hidrogenados	1,00
	Acetato de dl-alfa-tocoferilo	Acetato de tocoferilo	0,50
	Antaron V-216	Copolímero VP/Hexadeceno	1,00
	BHT	Hidroxitolueno butilado	0,05
	Phenonip	Fenoxietanol y metilparabeno y etilparabeno y butilparabeno y propilparabeno e isobutilparabeno	0,80
PARSOL TX50 AB	Benzoato de alquilo C12-15 y % dióxido de titanio y dimeticona y sílice y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2	10,00	
B	Glicerina	Glicerina	8,00
	Keltrol CG-T	Goma xantana	0,30
	Pemulen TR-1	Polímero reticulador de acrilatos/acrilato de alquilo C10-30	0,30
	Edeta BD	AEDT sódico	0,10
	Agua desm.	Agua	a 100
C	Sensiva SC 50	Etilhexilglicerina	0,50
	Etanol	Alcohol	4,00
	Trietanolamina (T.E.A.)	Trietanolamina	0,35

Gel Pemulen

<b>Fase</b>	<b>Ingredientes</b>	<b>Nombre INCI</b>	<b>% en peso</b>
A	Myritol 318	Triglicérido Caprílico/Cáprico	5,0
	Phenonip	Fenoxietanol y metilparabeno y etilparabeno y butilparabeno y propilparabeno e isobutilparabeno	0,8
	BHT	Hidroxitolueno butilado	0,1

ES 2 672 990 T3

<b>Fase</b>	<b>Ingredientes</b>	<b>Nombre INCI</b>	<b>% en peso</b>
	PARSOL TX50 AB	Benzoato de alquilo C12-15 y % dióxido de titanio y dimeticona y sílice y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2	10
	Pemulen TR 1	Polímero reticulador de acrilatos/acrilato de alquilo C10-30	0,6
	AEDT	AEDT sódico	0,1
	KOH 30 %	Hidróxido de potasio	1,70
	agua	agua	a 100

## REIVINDICACIONES

- 5 1. Una composición tópica que comprende en un portador cosméticamente aceptable una dispersión orgánica de dióxido de titanio, caracterizada por que la dispersión consiste en partículas micronizadas de dióxido de titanio doblemente recubiertas que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona, benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2.
- 10 2. La composición tópica según la reivindicación 1, caracterizada por que la dispersión consiste en un 10 % - 80 % en peso de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas, un 10 % - 80 % en peso de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y 0,5 % - 20 % en peso de dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2.
- 15 3. La composición tópica según la reivindicación 1, caracterizada por que la dispersión consiste en un 25 % - 60 % en peso de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas, un 30 % - 70 % en peso de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y un 2 % - 15 % en peso de dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2.
- 20 4. La composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizada por que el recubrimiento externo de las partículas de dióxido de titanio es polidimetilsiloxano.
- 25 5. La composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizada por que las partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas están en forma de un polvo blanco, que consiste en óxido de titanio de estructura cristalina rutilo recubierto con sílice y polidimetilsiloxano.
- 30 6. La composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizada por que la relación (p/p) de las partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas a dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2 se selecciona del intervalo de 20 a 1 a 10 a 1.
- 35 7. La composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizada por que la dispersión orgánica de dióxido de titanio (basada en el polvo seco) está presente en una cantidad de un 0,5 % a 50 % en peso basado en el peso total de la composición tópica.
- 40 8. La composición tópica según la reivindicación 7, caracterizada por que dicha composición comprende además de un 0,5 %- 7 % en peso de un derivado de dibenzoilmetano, que es butilmetoxidibenzoilmetano.
- 45 9. La composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizada por que dicha composición está en forma de una emulsión O/W o un gel.
- 50 10. Composición tópica según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, para uso en la protección de la piel humana frente a radiación UV.
11. Uso de una composición tópica según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, para la protección del cabello frente a radiación UV.
12. Método para mejorar la resistencia al agua de partículas de dióxido de titanio doblemente recubiertas, micronizadas, que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona en una composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado por que dichas partículas se incorporan a la composición tópica en forma de dispersión de dichas partículas en benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2.
13. Método de preparación de una composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado por que se incorpora una dispersión que consiste en partículas micronizadas de dióxido de titanio doblemente recubiertas que tienen un recubrimiento interno de sílice inorgánica y un recubrimiento externo de silicona, benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> y dipolihidroxiestearato de poliglicerilo-2 en un portador cosméticamente aceptable.