

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 700 504**

51 Int. Cl.:

A61K 8/368	(2006.01) A61K 8/06	(2006.01)
A61K 9/12	(2006.01) A61K 8/02	(2006.01)
A61Q 17/04	(2006.01)	
A61K 8/37	(2006.01)	
A61K 8/49	(2006.01)	
A61K 8/34	(2006.01)	
A61K 8/891	(2006.01)	
A61K 8/895	(2006.01)	
A61K 8/25	(2006.01)	
A61K 8/73	(2006.01)	

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **02.09.2011** **E 11179856 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.10.2018** **EP 2425810**

54 Título: **Composiciones de protección solar**

30 Prioridad:

03.09.2010 US 875163

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
18.02.2019

73 Titular/es:

JOHNSON & JOHNSON CONSUMER INC.
(100.0%)
199 Grandview Road
Skillman, NJ 08558, US

72 Inventor/es:

SINGLETON, LAURA C.

74 Agente/Representante:

IZQUIERDO BLANCO, María Alicia

ES 2 700 504 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 protección solar

5 **Campo de la invención**

La presente invención se refiere a composiciones tópicas de protección solar que tienen la capacidad de aplicarse con éxito a la piel húmeda.

10 **Antecedentes de la invención**

Los productos de protección solar convencionales generalmente toman la forma de compuestos de filtro UV y/o compuestos de protección UV en partículas (colectivamente, "activos de protección solar") que se solubilizan, emulsionan o dispersan en un vehículo, que se aplica tópicamente a la piel. Los activos de protección solar, generalmente a través de polímeros y otros ingredientes incluidos en el vehículo, forman una capa delgada, protectora y, a menudo, resistente al agua en la piel.

Los solicitantes han reconocido que, desafortunadamente, mientras que los productos de protección solar típicos logran proporcionar una barrera protectora duradera cuando se aplican sobre la piel seca, este no suele ser el resultado cuando se aplica sobre la piel húmeda con sudor o con agua residual sobre la misma. De hecho, cuando se aplica a la piel húmeda, la tendencia de los productos de protección solar convencionales es diluir los principios activos de protección solar, extenderse, formar una película incompleta, a menudo una que se descama o despega de la piel, y/o adquiere un aspecto blanco pálido. Los inventores han descubierto que este blanqueamiento indeseable es particularmente problemático cuando la propia composición incluye agua.

Otros han contemplado una solución para aplicar protector solar a la piel húmeda utilizando un emulsionante de agua en aceite para "autoemulsionarse", presumiblemente en presencia de agua residual presente en la piel. Sin embargo, los solicitantes han reconocido que todavía existen graves problemas estéticos y de rendimiento en los productos de protección solar para "piel húmeda" de la técnica anterior. En consecuencia, los solicitantes ahora han identificado una nueva composición que proporciona una aplicación consistente y agradable a la piel húmeda, así como la capacidad de la película resultante para proteger la piel frente a la radiación ultravioleta dañina.

Sumario de la invención

La presente invención proporciona una composición como se define en la reivindicación 1 adjunta.

Descripción detallada de la invención

Como se usa en el presente documento, "cosméticamente aceptable" significa adecuado para usar en contacto con tejidos (por ejemplo, la piel) sin toxicidad indebida, incompatibilidad, inestabilidad, irritación, respuesta alérgica o similares. Todos los porcentajes en el presente documento son porcentajes en peso basados en la concentración total de la composición, fases de aceite o agua, o partículas minerales, respectivamente.

Las composiciones de la presente invención incluyen una fase oleosa discontinua y una fase acuosa continua. Como entenderá un experto en la materia, por "fase oleosa discontinua", se entiende una agregación físicamente distintiva de compuestos orgánicos e hidrófobos íntimamente mezclados que se estabilizan dentro de una fase acuosa. Los compuestos que pueden incluirse en la fase oleosa incluyen, por ejemplo, compuestos orgánicos, filtros UV, siliconas líquidas, ésteres de ácidos grasos de ácidos policarboxílicos, agentes gelificantes en aceite y ceras, entre otros compuestos hidrófobos. La concentración de la fase oleosa en la composición puede ser de aproximadamente 10 por ciento a aproximadamente 80 por ciento, tal como de aproximadamente 20 por ciento a aproximadamente 70 por ciento, tal como de aproximadamente 30 por ciento a aproximadamente 60 por ciento, tal como de aproximadamente 40 por ciento a aproximadamente 60 por ciento.

Por "fase acuosa continua" se entiende una agregación físicamente distintiva de agua y otros ingredientes opcionales que generalmente son hidrófilos y se mezclan íntimamente con ellos. Los ingredientes adecuados para su uso en la fase acuosa incluyen, por ejemplo, agua, sales disueltas, tales como cloruro de sodio, tensioactivos solubles en agua, conservantes y colorantes solubles en agua, agentes quelantes, agentes de ajuste del pH y tampones (por ejemplo, ácido cítrico, hidróxido de sodio, bicarbonato y similares), compuestos biológicamente activos solubles en agua, glicerina, glicoles y similares. La concentración de la fase acuosa en la composición puede ser de 20 % a aproximadamente 90 %, tal como de aproximadamente 30% a aproximadamente 80%, tal como de aproximadamente el 35% a aproximadamente el 65%, tal como de aproximadamente el 40% a aproximadamente el 65% en peso de la composición. La concentración de la fase acuosa puede ser mayor que la concentración de la fase oleosa.

La fase oleosa discontinua puede dispersarse de manera sustancialmente homogénea en la fase acuosa y puede ser estable en fase. Por "fase estable", se entiende que no hay una separación o sedimentación apreciable de la

fase oleosa de la fase acuosa después de haber estado expuesta a 40 °C durante dos semanas. Puede que no haya una separación o sedimentación apreciable de la fase oleosa de la fase acuosa después de haber estado expuesta a 40 °C durante seis semanas o, en otras realizaciones, después de haber estado expuesta a 40 °C durante tres meses. En tales composiciones estables en fase, la fase oleosa discontinua se puede estabilizar dentro de la fase acuosa continua, de modo que la fase oleosa discreta está presente de forma que la mayoría de las partículas tienen un tamaño de partícula que es de aproximadamente 0,2 micrómetros a aproximadamente 10 micrómetros, más preferiblemente de aproximadamente 0,5 micrómetros a aproximadamente 5 micrómetros, lo más preferiblemente de aproximadamente 0,75 micrómetros a aproximadamente 5 micrómetros. Como alternativa, las composiciones pueden ser tales que la fase oleosa se pueda dispersar dentro de la fase acuosa con agitación ligera a moderada antes de su uso.

Las composiciones de la presente invención incluyen un filtro UV orgánico. Los filtros UV orgánicos que son útiles en la presente invención son compuestos cosméticamente aceptables que absorben radiación en el rango UV y son generalmente solubles en uno o más disolventes de hidrocarburos orgánicos. El filtro UV orgánico absorbe la radiación en una parte del espectro ultravioleta (290 nm-400 nm) y puede tener un coeficiente de extinción de al menos aproximadamente 1000 mol⁻¹ cm⁻¹, por ejemplo mayor que 10.000 o 100.000 o 1.00000 mol⁻¹ cm⁻¹, para al menos una longitud de onda dentro del espectro ultravioleta definido anteriormente.

Los ejemplos de filtros UV orgánicos incluyen, sin limitación, 3-bencilidenalcanfor, específicamente 3-bencilidennoralcanfor y derivados de los mismos, por ejemplo 3-(4-metilbenciliden)alcanfor; derivados de ácido 4-aminobenzoico, específicamente ésteres de 2-etilhexilo de ácido 4-(dimetilamino)benzoico, ésteres de 2-octilo de ácido 4-(dimetilamino)benzoico y ésteres de amilo de ácido 4-(dimetilamino)benzoico; ésteres de ácido cinnamónico, en particular éster de 2-etilhexilo de ácido 4-metoxicinnamónico, éster de propilo de ácido 4-metoxicinamónico, éster de isoamilo de ácido 4-metoxicinamónico, éster de 2-etilhexilo de ácido 2-ciano-3,3-fenilcinamónico (octocrileno); ésteres de ácido salicílico, es decir éster de 2-etilhexilo de ácido salicílico, éster de 4-isopropilbencilo de ácido salicílico, éster de homomentilo de ácido salicílico; derivados de benzofenonas, en particular 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, 2-hidroxi-4-metoxi-4'-metilbenzofenona, 2,2'-dihidroxi-4-metoxibenzofenona; ésteres de ácido benzalmalónico, en particular éster de di-2-etilhexilo de ácido 4-metoxibenzalmalónico; derivados de triazina, por ejemplo 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etil-1'-hexiloxi)-1,3,5-triazina y octiltriazona; o 4,4'-[[6-[[[(1,1-dimetiletil)amino]carbonil]fenil]amino]-1,3,5-triazin-2,4-diil]diimino]bis-, bis (2-etilhexil)éster de ácido benzoico (UVASORB HEB); propan-1,3-dionas, por ejemplo, 1-(4-terc-butilfenil)-3-(4'-metoxifenil) propan-1,3-diona; derivados de cetotriciclo (5,2,1,0) decano; derivados de benzoilmetano, por ejemplo, 1-(4'-terc-butilfenil)-3-(4'-metoxifenil)propan-1,3-diona, 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano (PARSOL 1789), 1-fenil-3-(4'-isopropilfenil)-propan-1,3-diona, derivados de ácido benzoico éster de hexilo de ácido 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil)-benzoico (UVINUL A+), o ácido 1H-benzimidazol-4,6-disulfónico, 2,2'-(1,4-fenilen)bis-, sal disódica (NEO HELOPAN AP); y benzotriazoles, en particular el derivado de benzotriazol conocido como 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol) [INCI: Bisoctiltriazol], que está disponible comercialmente con el nombre comercial TINOSORB M de CIBA Chemicals. Otro derivado de benzotriazol útil es 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-[2-metil-3-[1,3,3,3-tetrametil-1-(trimetilsilil)oxi]disiloxanil]propil]-fenol (N.º CAS: 155633-54-8), también identificado por el nombre INCI drometrisol trisiloxano y disponible en Chimex con el nombre comercial MEXORYL XL. También son adecuados los derivados de triazina asimétricamente sustituidos, y 2,4-bis - [[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (INCI: anisotriazina) que está disponible comercialmente con el nombre comercial TINOSORB S de CIBA.

El filtro UV orgánico se puede seleccionar del grupo que consiste en octocrileno, un benzotriazol, anisotriazina, un éster de ácido salicílico, un éster de ácido cinámico y un derivado de un benzoilmetano.

El filtro UV orgánico está presente en la composición en una concentración que es de aproximadamente el 10 % o más, tal como de aproximadamente el 10 % a aproximadamente el 40 %, tal como de aproximadamente el 10 % a aproximadamente el 35 %, tal como de aproximadamente el 15 % a aproximadamente el 35 %, por ejemplo, de aproximadamente el 20 % a aproximadamente el 35 % en peso.

Como un experto en la técnica apreciará fácilmente, el término "filtro UV orgánico" no incluye partículas de protección de rayos ultravioleta, ("partículas de protección de UV") se utilizan típicamente al menos en parte para dispersar la radiación ultravioleta. Los ejemplos incluyen óxidos inorgánicos, incluidos dióxido de titanio, óxido de cinc; óxidos de hierro, óxidos de silicón; u otros óxidos de metales (por ejemplo, metales de transición, tales como metales de transición cristalinos). Las partículas de protección de UV son típicamente partículas sólidas que tienen una dimensión (por ejemplo, un diámetro) de aproximadamente 0,1 micrómetros a aproximadamente 10 micrómetros. Las partículas de protección UV pueden incluirse opcionalmente en las composiciones de la presente invención. Alternativamente, pueden ser excluidos. Cuando se incluyen partículas de protección de UV, la concentración de las partículas de protección de UV en la composición puede ser de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 10 %, tal como de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 5 %, tal como de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 2 %.

Las composiciones de la presente invención incluyen una silicona líquida C₂-C₈ insoluble en agua de baja volatilidad, en la que la silicona líquida C₂-C₈ insoluble en agua comprende etilmética. Por "baja volatilidad" se

entiende compuestos que tienen un punto de inflamación superior a aproximadamente 105 °C, tal como superior a aproximadamente 15 0°C, tal como superior a aproximadamente 200 °C. Por silicona líquida, se entiende un compuesto que tiene al menos un siloxano (enlace Si-O-Si) que tiene un punto de fusión por debajo de 25 °C. La silicona líquida es, en ciertas realizaciones, insoluble en agua y, en ciertas realizaciones, soluble en isopropanol. Un ejemplo particularmente adecuado es el compuesto en el que n = 2, disponible como SILWAX D02 (INCI: etilmética) de Siltech de Dacula, Georgia.

La silicona líquida C₂-C₈ insoluble en agua, de baja volatilidad generalmente funciona para proporcionar plasticidad a la película que se crea en la piel y para prevenir el blanqueamiento (por ejemplo, aumentando el índice de refracción de la película resultante) que de otro modo podría producirse cuando la composición entra en contacto con el agua presente en la piel. La concentración de silicona líquida no volátil presente en la composición puede ser de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 10 % o de aproximadamente 1 % a aproximadamente 6 % o de aproximadamente 2 % a aproximadamente 4 %.

Las composiciones de la presente invención incluyen un éster de ácido graso ramificado de un ácido carboxílico poliprótico ("BFEPCA"), en el que el BFEPCA es un poliéster de citrato de octildodecilo. El éster de ácido graso ramificado de un ácido carboxílico poliprótico tiene un punto de fusión inferior a 25 °C, es insoluble en agua y puede ser soluble en isopropanol. El BFEPCA es un producto de reacción de un ácido poliprótico con un ácido graso C₁₀-C₃₀, tal como un ácido graso C₁₂-C₂₂. El ácido graso puede estar ramificado. El ácido poliprótico es ácido cítrico.

Por ejemplo, el BFEPCA puede tener cinco o más grupos éster por molécula. Un ejemplo adecuado de un BFEPCA es un poliéster de citrato de octildodecilo que está disponible comercialmente como COSMOSURF CE-100 de SurfaTechCorporation/Siltech Corporation de Dacula, Georgia.

El BFEPCA ayuda a la capacidad de la composición para excluir el agua durante la formación de la película, pero también sirve para prevenir el desprendimiento de la película y resistir la degradación del agua después de formada la película.

La concentración de BFEPCA presente en la composición puede ser de aproximadamente 2 % a aproximadamente 40 % o de aproximadamente 4 % a aproximadamente 25 % o de aproximadamente 8 % a aproximadamente 18 %. El BFEPCA y la silicona líquida están, en ciertas realizaciones, presentes en una relación entre BFEPCA y la silicona líquida que es de aproximadamente 1,5 a aproximadamente 8, tal como de aproximadamente 2 a aproximadamente 4.

Las composiciones de la presente invención incluyen una partícula mineral recubierta al menos parcialmente con un almidón. Por "partículas" se entiende un sólido finamente dividido que generalmente es insoluble en agua, tal como uno que tiene un tamaño de partícula promedio en un intervalo de aproximadamente 0,1 micrómetros a aproximadamente 20 micrómetros. El material particulado mineral comprende una porción mineral que incluye sílice; y una porción de recubrimiento que se aplica a la superficie del mineral para recubrir al menos parcialmente la porción de mineral. El recubrimiento puede ser continuo y cubrir sustancialmente toda la superficie de la porción mineral o puede ser discontinuo y cubrir una porción sustancial, pero no toda la superficie de la porción mineral. La porción de recubrimiento incluye un almidón.

El almidón puede derivar de plantas tales como maíz, trigo, arroz, tapioca, patata, sagú y similares, incluidas las versiones ceras de tales almidones (que contienen menos del 5 % de amilosa), almidones con alto contenido de amilasa (que contienen más de 40 % de amilosa), aquellos con una longitud de cadena modificada, y/o combinaciones de los mismos. El almidón puede ser almidón de arroz.

La porción mineral puede estar presente en un porcentaje en peso de la partícula mineral que es de aproximadamente 80 % a aproximadamente 98 %, tal como de aproximadamente 80 % a aproximadamente 97 %, tal como de aproximadamente 85 % a aproximadamente 96 %. La porción de recubrimiento puede estar presente en un porcentaje en peso del mineral en partículas que es de aproximadamente 2 % a aproximadamente 20 %, tal como de aproximadamente 3 % a aproximadamente 20 %, tal como de aproximadamente 4 % a aproximadamente 15 %.

El material particulado mineral puede tener una capacidad de absorción de aceite mineral de aproximadamente 20 ml/100 g o más, tal como de aproximadamente 100 ml/100 g o más, tal como de aproximadamente 200 ml/100 g o más. La capacidad de absorción de aceite mineral se determina colocando 3-5 gramos de la muestra de ensayo en una placa de vidrio y añadiendo aceite mineral gota a gota y mezclando con una espátula. El punto final viene indicado cuando la muestra produce una pasta muy rígida que no se rompe ni se separa. La pasta debe poder enrollarse con la espátula sin separación. La prueba se realiza por triplicado.

El material particulado mineral puede prepararse por cualquiera de los diversos medios conocidos por los expertos en la técnica. Los métodos adecuados incluyen recubrir partículas minerales con un almidón rociando el almidón sobre las partículas minerales y posteriormente secando.

- En un proceso de ejemplo, el agua y el almidón de arroz se mezclan y se calientan durante un tiempo suficiente para gelatinizar el almidón. Esta mezcla de almidón gelatinizado se rocía a alta presión sobre partículas de sílice esféricas porosas que tienen un diámetro en el intervalo de aproximadamente 1 micrómetro a aproximadamente 10 micrómetros. Durante el proceso de rociado, la sílice se mezcla en un mezclador de alta intensidad y alta velocidad para garantizar un recubrimiento homogéneo. La mezcla de sílice y almidón gelatinizado se seca después al vacío durante un período de tiempo suficiente para eliminar el agua. Las proporciones relativas de sílice y almidón recubierto sobre ella se seleccionan para lograr una relación en peso entre sílice y almidón de aproximadamente 95:5.
- 10 Dado que el material particulado mineral es insoluble en la fase oleosa o en la fase acuosa, el material particulado generalmente existe en la composición como una fase dispersa discreta, es decir, no es parte de la fase oleosa o de la fase acuosa.
- 15 La cantidad de partículas minerales en la composición es del 2 % al 10 % o del 4 % al 8 %.
- 20 Las composiciones de la presente invención pueden incluir un agente gelificante en aceite. Por "agente gelificante en aceite" se entiende un compuesto que es capaz de formar un gel con aceite mineral o dimeticona. En particular, cuando el agente gelificante en aceite se mezcla con aceite mineral o dimeticona a una concentración de agente gelificante en aceite que está entre aproximadamente 0,25 % y 2,0 % en peso, la mezcla resultante tiene un rendimiento de al menos aproximadamente 5 Pascales (Pa), tal como al menos aproximadamente 10 Pa, tal como de aproximadamente 10 Pa a aproximadamente 1100 Pa.
- 25 Los agentes gelificantes en aceite adecuados incluyen ésteres de glicerol de diversos ácidos grasos, por ejemplo ésteres de glicerol de ácidos grasos que tienen una longitud de cadena de carbono de al menos C₁₆. Un ejemplo adecuado es una mezcla de monoglicéridos, diglicéridos y triglicéridos de ácido behénico (C₂₂) vendida bajo el nombre comercial COMPRITOL 888 de Gattefosse of France.
- 30 Otros agentes gelificantes en aceite adecuados incluyen copolímeros de siloxanos y monómeros que incluyen restos hidrófilos, tales como copolímeros de siloxanos y monómeros que tienen restos alcoxi. Los ejemplos adecuados incluyen materiales a veces clasificados como emulsionantes de agua en silicona. Un ejemplo adecuado es la PEG/PPG-19/19 dimeticona, que se vende en disolvente de ciclopentasiloxano como Dow Corning BY-11030 disponible en Dow Corning de Midland, Michigan.
- 35 Otros agentes gelificantes en aceite adecuados incluyen copolímeros de monómeros tales como etileno, propileno, butileno y/o estireno, por ejemplo, terpolímeros de etileno, propileno y estireno y terpolímeros de butileno, etileno y estireno. Dichos terpolímeros se venden con el nombre comercial VERSAGEL F-1000 de Penreco of Los Ángeles, California.
- 40 Otros agentes gelificantes en aceite particularmente adecuados incluyen etilcelulosa, un éter de etilo de celulosa que comprende un polímero de cadena larga que consiste en unidades de anhidroglucosa unidas entre sí por enlaces acetal. Una forma adecuada de etilcelulosa está disponible como una mezcla con monoésteres y diésteres de cocoato de butilenglicol y alcohol isoestearílico (alcohol graso). Esta mezcla se vende como "EMULFREE CBG disponible en Gattefosse of Paris, Francia.
- 45 Las composiciones de la presente invención pueden incluir un polímero formador de película para mejorar la formación de película y proporcionar cierta resistencia al agua. Por "polímero formador de película" se entiende un polímero que cuando se disuelve en la composición, permite que se forme una película continua o semicontinua cuando la composición se extiende sobre, por ejemplo, vidrio liso, y se permite que el vehículo líquido se evapore. Como tal, el polímero debe secarse sobre el vidrio de manera tal que sobre el área que se extiende debe ser predominantemente continua, en lugar de formar una pluralidad de estructuras discretas de tipo isla. En general, las películas formadas mediante la aplicación de composiciones sobre la piel de acuerdo con las realizaciones de la invención descritas en el presente documento tienen menos de, de promedio, aproximadamente 100 micrómetros de espesor, tal como menos de aproximadamente 50 micrómetros.
- 50
- 55 Los polímeros formadores de película adecuados incluyen polímeros naturales, tales como polisacáridos o proteínas y polímeros sintéticos, tales como poliésteres, poliacrílicos, poliuretanos, polímeros de vinilo, polisulfonatos, poliureas, polioxazolinas y similares. Los ejemplos específicos de polímeros formadores de película incluyen, por ejemplo, homopolímeros o copolímeros acrílicos con grupos hidrófobos, tales como copolímeros de acrilato/ocilacrilamida, incluyendo DERMACRYL 79, disponible en Akzo Chemical de Bridgewater, Nueva Jersey; copolímero de dimeticona/acrilato dimeticona disponible como X-22-8247D de Shin-Etsu de Japón; copolímero de dimer dilinoleilo hidrogenado/dimetilcarbonato del dimer disponible en Cognis Corporation de Ambler, Pennsylvania como COSMEDIA DC; copolímero de vinilpirrolidona y una a-olefina de cadena larga, tal como los disponibles comercialmente en ISP Specialty Chemicals de Wayne, Nueva Jersey como GANEX V220; copolímeros de vinilpirrolidona/tricontanilo disponibles como GANEX WP660 también de ISP; poliésteres dispersables en agua, incluidos los sulfopoliésteres, tales como los comercializados por Eastman Chemical como EASTMAN AQ 38S. El
- 65

ES 2 700 504 T3

polímero formador de película puede ser insoluble en agua, pero puede volverse soluble tras la exposición a alcalinidad para facilitar la eliminación de la piel al lavarse con jabón.

5 La cantidad de polímero formador de película presente en la composición puede ser de aproximadamente 0,25 % a aproximadamente 15 %, o de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 10 %, o de aproximadamente 1 % a aproximadamente 3 %.

10 La composición puede incluir una cera. Por cera se entiende uno o más compuestos hidrófobos que tienen un punto de fusión que está en el intervalo de 30 °C a 120 °C, tal como en el intervalo de 45 °C a 100 °C. El componente de cera puede incluir un compuesto de cera que tenga un punto de fusión de aproximadamente 75 °C a 100 °C.

15 Por "compuesto hidrofóbico adicional" se entiende un compuesto que incluye un resto hidrofóbico que cumple uno o más de los siguientes tres criterios: (a) tiene una cadena de carbono de al menos seis carbonos en la que ninguno de los seis carbonos es un carbono carbonilo o tiene un resto hidrófilo (definido a continuación) unido directamente a él; (b) tiene dos o más grupos alquilsoxi; o (c) tiene dos o más grupos oxipropileno en secuencia. El resto hidrófobo puede incluir grupos lineales, cíclicos, aromáticos, saturados o insaturados. El compuesto hidrófobo no es anfifílico y, por lo tanto, no incluye restos hidrófilos, tal como un grupo aniónico, catiónico, zwitteriónico o no iónico, que es polar, incluyendo sulfato, sulfonato, carboxilato, fosfato, fosfonatos, amonio, incluidas las especies de mono- di- y trialquilamonio, piridinio, imidazolinio, amidinio, poli(etileniminio), amonio-alquilsulfonato, amonio-alquilcarboxilato, amfoacetato y restos de poli (etilenoxi)sulfonilo. El compuesto hidrófobo puede no incluir restos hidroxilo.

25 Las ceras adecuadas incluyen cualquiera de los diversos hidrocarburos (alcanos o alquenos de cadena lineal o ramificada, cetona, dicetona, alcoholes primarios o secundarios, aldehídos, ésteres de esteroles, ácidos alcanóicos, turpenos, monoésteres), tales como los que tienen una longitud de cadena de carbono que varía de C₁₂-C₃₈. También son adecuados LOS diésteres u otros ésteres ramificados. El compuesto puede ser un éster de un alcohol (glicerol u otro que no sea glicerol) y un ácido graso de C₁₈ o mayor.

30 Los ejemplos no limitativos incluyen cualquiera de varias ceras naturales, incluida la cera de loto (por ejemplo, la Cera floral Nelumbo Nucifera disponible en Deveraux Specialties, Silmar, California); cera de abejas (por ejemplo, cera de abeja blanca SP-422P disponible en Strahl y Pitsch de

35 West Babylon, Nueva York), ceras de insectos, aceite de esperma de ballena, lanolina, ceras vegetales como cera de carnauba, aceite de jojoba, cera de candelilla; ceras minerales, tales como cera de parafina; y ceras sintéticas, tales como palmitato de cetilo, palmitato de laurilo, estearato de cetosteárido y cera de polietileno (por ejemplo, PERFORMALENE 400, que tiene un peso molecular de 450 y un punto de fusión de 84 °C, disponible en New Phase Technologies de Sugar Land, Texas); y ceras de silicona tales como alquilmética C₃₀₋₄₅ y olefina C₃₀₋₄₅ (por ejemplo, Dow Corning AMS-C30, con un punto de fusión de 70 °C, disponible en Dow Corning de Midland, Michigan). El componente de cera puede incluir un éster de glicerol de alto punto de fusión, tal como monoestearato de glicerol.

40 La cantidad de cera puede estar presente en la composición de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 5 % o de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 2 % o de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 1 %.

45 Las composiciones de la presente invención incluyen un polímero de silicona modificado con alquilo. El polímero de silicona modificado con alquilo dispersado puede ser insoluble en isopropanol, así como insoluble en agua. El polímero de silicona modificado con alquilo incluye un grupo alquilo C₁₂-C₂₂.

50 La silicona modificada con alquilo generalmente sirve para reducir la tensión superficial, mejorar la exclusión del agua y reducir el blanqueamiento. Un ejemplo de un polímero de silicona modificada con alquilo adecuado que se dispersa bien en disolventes, tales como isopropanol incluye copolímeros de cetil dimeticona y bis-vinil dimeticona, tal como SILWAX CR-5016, disponible comercialmente en SilTech de Dacula, Georgia. Cuando el polímero de silicona modificada con alquilo es insoluble en la fase oleosa o en la fase acuosa, el polímero de silicona modificada con alquilo puede existir en la composición como una fase dispersa discreta, es decir, que no forma parte de la fase oleosa o de la fase acuosa.

55 La cantidad de polímero de silicona modificado con alquilo dispersado que puede estar presente en la composición puede ser de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 1 % o de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 0,5 % o de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 0,25 %.

60 Cualquiera de varios otros ingredientes cosméticamente aceptables puede incluirse en la composición en cantidades que no contrarresten los efectos de los otros ingredientes. Por ejemplo, ingredientes tales como aceites (incluidos ésteres emolientes y triglicéridos) de origen vegetal, animal o mineral, fragancias, tintes, conservantes, agentes beneficiosos para la piel, fotoestabilizantes, antioxidantes, agentes gelificantes en fase acuosa (tal como diesterato de glicerilo o polímeros acrílicos modificados hidrofóbicamente u otros polímeros espesantes), agentes neutralizantes (tales como trietanolamina, hidróxido de sodio y similares).

65

ES 2 700 504 T3

Los otros ingredientes pueden incluirse, por ejemplo, en concentraciones totales que son inferiores a aproximadamente el 10 %, tales como menos de aproximadamente el 5 %, tales como menos de aproximadamente el 2 %, por ejemplo, menos de aproximadamente el 1 %.

5 **Ejemplos**

Los siguientes ejemplos no limitantes ilustran adicionalmente la invención reivindicada:

Ejemplo I: Preparación de ejemplos de la invención

10

Se prepararon las siguientes composiciones de la invención:

Nombre comercial	Nombre CTFA	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3	Ej. 4	Ej. 5
Agua	Agua	45,25	47,48	43,46	55,22	51,50
PEMULEN TR-2	Crospolímero de acrilatos/acrilato de alquilo C ₁₀₋₃₀	0,25	0,25	0,25	0,25	0,3
	EDTA disódico	0,2	0,1	0,1	0,2	0,2
	Glicirricato de dipotasio	0,1	0,1	0,1	0,1	0,1
	0,2	0,2	0,2	0,2	0,2	0,2
	Fenoxietanol	0,5			0,5	0,5
Uvinul M40 (BASF)	Oxibenzona; Benzofenona -3 /	6,00	5,00	5,00	5,00	5,00
Octisalato	Salicilato de octilo	5,00	5,00	5,00	5,00	5,00
Una vobenzona	Neo Heliopan 357 (Symrise)	3,00	3,00	3,00	3,00	3,00
Neo Heliopan 303 (Symrise)	Octocrileno	10	10	10	4	4
	Homosalato	7,0	4,0	7,0	4,0	4,0
CorapanTQ (CP Hall)	2,6-Naftalato de dietilhexilo	0,1	0,10	0,10	0,10	0,1
Cera de loto (Deveraux)		0,5	0,50	0,50	0,50	0,50
Cera de abeja		2,0	2,0	2,0	2,0	0,3
X-22 -8247D (ShinEtsu)	Dimeticona (y) copolímero de acrilatos/dimeticona	1,5	1,50	1,50	1,50	1,75
Sensiva	Etilhexilglicerina	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0
Lexguard O (Inolex)	Caprililglicol	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
Arlacel 165 VEG	Estearato de glicerilo/estearato de PEG-100	1,9	1,9	1,9	1,9	1,9
Anfisol k	Cetil fosfato de potasio	0,9	1,0	1,0	1,0	
Compritol 888 (Gattefosse)	(mono, di, tri)behenato de glicerilo					1,0
Crospolímero de citrato de octildodecilo (y) etilmeticona (y) crospolímero de etildimeticona/bis vinildimeticona ¹	Mezcla	5,0	3,5	5,0	3,0	3,0
	BHT	0,7	0,7	0,7	0,7	0,7
Sunspheres	Copolímero de estireno/acrilato,	2,0	1,0			
Agua (Neutralización)		1,5	1,5	1,5	1,5	6,5
Trietanolamina		0,3	0,25	0,27	0,16	0,45
Agua			2,4	2,4		
Cosmocil CQ	Guanida de propilamidopropilo		0,4	0,4		
Reosol AVH	Estearato de etilhexilo; trideceth-6	0,1	0,1	0,5	0,15	
	Alcohol bencílico	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0
Fragancia		0,13	0,15	0,15	0,15	0,3

Nombre comercial	Nombre CTFA	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3	Ej. 4	Ej. 5
Partícula mineral	Sílice, recubierta de almidón de arroz	4,0	6,0	6,0	8,0	8,0
TOTAL		100	100	100	100	100

¹ Una mezcla de 79,8 % de poliéster de octildodecitrato (COSMOSURF CE-100), 20 % de etilmeticona (SILWAX D02) y 0,2 % de un copolímero de cetildimeticona y bis-vinildimeticona (SILWAX CR-5016), cada uno disponible en SilTech.

Se prepararon ejemplos preparando primero una mezcla preliminar de fase acuosa cargando un recipiente con agua, PEMULEN TR-2, EDTA disódico, glicirrizato dipotásico y clorfenesina, calentando la mezcla a 80 °C y mezclando hasta que sea homogénea. Luego se añadió fenoxietanol (agente gelificante) en el caso de los Ejemplos 1, 4 y 5 y la mezcla se mezcló nuevamente hasta que fue homogénea. En un recipiente secundario, se preparó una mezcla de fase oleosa mezclando los filtros UV orgánicos y los otros ingredientes enumerados en la Tabla 1, hasta e incluyendo Sunspheres. La mezcla de fase acuosa y la mezcla de fase oleosa se mezclaron durante 5 minutos y luego se homogeneizaron durante 3 minutos para formar una emulsión preliminar. La emulsión preliminar se neutralizó después enfriando a 65 °C, añadiendo agua y trietanolamina y, a continuación, mezclando hasta que esté uniforme. La emulsión neutralizada se dejó enfriar a 40 °C y se añadieron alcohol bencílico y fragancia. Las partículas minerales se añadieron luego lentamente mezclando hasta que se enfrió a 30 °C-32 °C. Esto se homogeneizó durante 1 minuto adicional y se añadió el resto de cualquier agua. En el caso del Ejemplo 5, el 6,5 % del agua total presente en la formulación se retuvo desde la carga inicial del recipiente y se añadió después de la emulsificación.

Los ejemplos se evaluaron para determinar la estabilidad a 40 °C y el blanqueamiento adverso sobre la piel. La estabilidad, una medida acelerada de la vida útil pronosticada, se evaluó colocando las composiciones a 40 °C y luego observando cualquier sinéresis apreciable, por ejemplo, una cantidad apreciable de fase oleosa (líquido) visible en la parte superior de la composición emulsionada. La estabilidad de tres meses a 40 °C es equivalente en general a 3 años de vida útil del producto, mientras que dos meses a 40 °C es equivalente en general a 2 años de vida útil.

El blanqueamiento sobre la piel se evaluó sumergiendo el brazo de un sujeto humano en agua durante aproximadamente 1- 2 minutos, luego aplicando las composiciones de la invención al área húmeda del brazo y frotando las composiciones en la piel. Las composiciones se aplicaron en cantidades generalmente efectivas para proporcionar una película continua al área de la piel, es decir, aproximadamente 4 gramos para todo el brazo masculino o aproximadamente 3 gramos para todo el brazo femenino, típicamente aproximadamente 0,5 g/15 cm²sobre el mismo brazo.

El Ejemplo 1 mostró solo una cantidad mínima aceptable de blanqueamiento cuando se aplicó a la piel y fue estable en fase estable durante 3 meses a 40 °C. El ejemplo 5 no mostró ningún blanqueamiento perceptible en la piel y fue estable durante 3 meses a 40 °C. Los ejemplos 2 y 4 mostraron un blanqueamiento mínimo, pero aceptable, en la piel y se mantuvieron estables durante 2 semanas a 40 °C. El ejemplo 3 no mostró ningún blanqueamiento perceptible en la piel.

Los resultados anteriores sugieren que las composiciones según la invención son sorprendentemente capaces de proporcionar poco o ningún blanqueamiento cuando se aplican sobre la piel húmeda. Los resultados anteriores también sugieren que se pueden lograr diversos grados de estabilidad, dependiendo de la formulación particular, por ejemplo, (a) incluyendo un agente gelificante de aceite (como COMPRITOL), o (b) añadiendo al menos un 5% (como un porcentaje de la composición total) del agua después de la emulsificación, pero antes de la partícula mineral. Para niveles altos de partículas minerales, al menos parcialmente recubiertas con almidón, incluyendo el agente gelificante en aceite, incluyendo niveles más altos de agua, y/o siguiendo la etapa del proceso de retener al menos 5 % de agua hasta después de la emulsificación, pero antes de las partículas minerales, se mejora la estabilidad. Una vez que tenga el beneficio de la divulgación en el presente documento, un experto en la técnica apreciará fácilmente diversos factores y etapas para ajustar la estabilidad de tales composiciones.

Ejemplo 2: SPF

Los ejemplos 1 y 5 se probaron para el factor de protección solar (SPF) utilizando un método de prueba de SPF estático *in vivo* convencional de acuerdo con el documento "Sunscreen Drug Products for Over-The-Counter Human Use; Final Monograph" presentada por la Food and Drug Administration, 21 de mayo de 1999, Federal Register Volumen 64, Número 98, 27666-27693. Véase pág. 2-3. La prueba incluyó la medición de SPF en piel seca antes y después de la inmersión de la piel en agua durante un total de 80 minutos. El ejemplo 1 mostró valores de SPF en la piel seca de 92,5 antes de la inmersión y 91,85 después de la inmersión. El ejemplo 5 mostró valores de SPF en la piel seca de 55,2 antes de la inmersión y 55,0 después de la inmersión.

La misma composición se probó utilizando el mismo método, excepto que las composiciones se aplicaron a la piel húmeda después de la inmersión. Las composiciones mostraron valores de SPF de 86,66 y 47,8 respectivamente, cuando se aplicaron a la piel húmeda después de la inmersión en agua. Estos resultados muestran sorprendentemente que las composiciones de la invención perdieron solo una pequeña fracción de sus valores de SPF cuando se aplicaron a la piel húmeda en comparación con cuando se aplicaron a la piel seca.

Por lo tanto, la divulgación proporciona, entre otros:

(i) Una composición, que comprende:

- a. una fase acuosa continua,
- b. una fase oleosa discontinua dispersada en dicha fase acuosa continua,
- c. aproximadamente un 10 por ciento o más en peso de un filtro de UV orgánico,
- d. una silicona líquida C₂-C₈ insoluble en agua,
- e. un éster de ácido graso ramificado de un ácido carboxílico poliprótico; y
- f. aproximadamente el 2 por ciento o más en peso de una partícula mineral que comprende un recubrimiento de almidón aplicado a la superficie del mismo.

(ii) La composición de (i), en la que dicha partícula mineral comprende sílice.

(iii) La composición de (i), en la que dicha partícula mineral comprende de aproximadamente 80 por ciento a aproximadamente 98 por ciento en peso de dicho mineral y de aproximadamente 2 por ciento a aproximadamente 20 por ciento en peso de dicho recubrimiento de almidón.

(iv) La composición de (i) que comprende de aproximadamente 4 por ciento a aproximadamente 10 por ciento en peso de dicha partícula mineral.

(v) La composición de (i), en la que dicho éster de ácido graso ramificado de un ácido carboxílico poliprótico comprende un poliéster de octildodecil citrato.

(vi) La composición de (i), en la que dicha silicona líquida C₂-C₈ insoluble en agua comprende etilmética.

(vii) La composición de (i), en la que dicha partícula mineral tiene una capacidad de absorción de aceite mineral de aproximadamente 20 ml/100 g o más.

(viii) La composición de (i), en la que dicho filtro UV orgánico se selecciona del grupo que consiste en octocrileno, un benzotriazol, anisotriazina, un éster de ácido salicílico, un éster de ácido cinámico y un derivado de un benzoilmetano.

(ix) La composición de (iv) en la que dicha partícula mineral comprende una sílice que tiene un almidón de arroz aplicado a su recubrimiento y en la que dicha composición comprende además un agente gelificante.

(x) La composición de (ix) que tiene una estabilidad de 3 meses a 40 °C.

(xi) La composición de (i) que tiene una estabilidad de 2 semanas a 40 °C.

REIVINDICACIONES

1. Una composición, que comprende:

5 una fase acuosa continua,
 una fase oleosa discontinua dispersada en dicha fase acuosa continua,
 aproximadamente el 10 por ciento o más en peso de un filtro UV orgánico,
 una silicona líquida C₂-C₈ insoluble en agua,
 un éster de ácido graso ramificado de un ácido carboxílico poliprótico;

10 de 2 al 10 por ciento en peso de una partícula mineral que comprende un recubrimiento de almidón aplicado a la superficie de la misma, comprendiendo dicha partícula mineral una porción mineral que incluye sílice; y

15 un polímero de silicona modificado con alquilo dispersado que incluye un grupo alquilo C₁₂-C₂₂;
 en el que el éster de ácido graso ramificado de un ácido carboxílico poliprótico es un poliéster de citrato de octildodecilo;
 en el que la silicona líquida C₂-C₈ insoluble en agua comprende etilmética.

20 2. La composición de la reivindicación 1, en la que dicha partícula mineral comprende del 80 por ciento al 98 por ciento en peso de dicho mineral y del 2 por ciento al 20 por ciento en peso de dicho recubrimiento de almidón.

3. La composición de cualquier reivindicación precedente, que comprende de 4 por ciento a 10 por ciento en peso de dicha partícula mineral.

25 4. La composición de cualquier reivindicación precedente, en la que dicha partícula mineral tiene una capacidad de absorción en aceite mineral de 20 ml/100 g o mayor.

5. La composición de cualquier reivindicación precedente, en la que el polímero de silicona modificado con alquilo que incluye un grupo alquilo C₁₂-C₂₂ es un copolímero de cetildimeticona y bis-vinilmética.

30 6. La composición de cualquier reivindicación precedente, en la que el polímero de silicona modificado con alquilo que incluye un grupo alquilo C₁₂-C₂₂ está presente en una cantidad de 0,1 a 1 por ciento en peso, opcionalmente de 0,1 a 0,5 por ciento en peso, opcionalmente de 0,1 a 0,25 por ciento en peso.

35 7. La composición de cualquier reivindicación precedente, en la que dicho filtro UV orgánico se selecciona del grupo que consiste en octocrileno, un benzotriazol, anisotriazina, un éster de ácido salicílico, un éster de ácido cinámico y un derivado de un benzoilmetano seleccionado de 1-(4'-terc-butilfenil)-3- (4'-metoxifenil)propano-1,3-diona, 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano o 1-fenil-3- (4'-isopropilfenil)-propano-1,3-diona.

40 8. La composición de cualquier reivindicación precedente, en la que dicha partícula mineral comprende una sílice que tiene un almidón de arroz aplicado a su recubrimiento y en la que dicha composición comprende además un agente gelificante.

45

50

55

60

65