

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 712 734**

51 Int. Cl.:

A61Q 17/04 (2006.01)

A61K 8/41 (2006.01)

A61K 8/86 (2006.01)

A61K 8/45 (2006.01)

A61K 8/81 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **26.04.2010 PCT/US2010/032356**

87 Fecha y número de publicación internacional: **11.11.2010 WO10129215**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **26.04.2010 E 10714834 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **28.11.2018 EP 2424623**

54 Título: **Eficiencia mejorada de composiciones de protección solar**

30 Prioridad:

27.04.2009 US 172916 P

01.12.2009 US 628916

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

14.05.2019

73 Titular/es:

BAYER CONSUMER CARE AG (50.0%)

Peter Merian-Strasse 84

4052 Basel, CH y

AKZO NOBEL CHEMICALS INTERNATIONAL B.V. (50.0%)

72 Inventor/es:

MEYER, THOMAS, A.;

BEASLEY, DONATHAN, G.;

WAGNER, JR., JOHN, H.;

HE, QIWEI;

PHILBIN, MICHAEL, TIMOTHY y

MARTINO, GARY, THEODORE

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 712 734 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

Eficiencia mejorada de composiciones de protección solar

Campo de la invención

5 Esta invención se refiere en general a composiciones aplicadas tópicamente a superficies, por ejemplo piel y cabello, para la protección contra la radiación ultravioleta. La invención en particular se refiere a procedimientos para mejorar la sensación de la piel y la capacidad de protección solar de tales composiciones.

Antecedentes de la invención

10 Las composiciones de protección solar se clasifican típicamente como composiciones acuosas o no acuosas, es decir, anhidras. Las composiciones de protección solar acuosas son típicamente cremas formadas como emulsiones que contienen los compuestos absorbentes de UV activos e ingredientes adicionales, tales como agentes impermeabilizantes, fragancias, emolientes y otros ingredientes para el cuidado de la piel. Las composiciones de protección solar no acuosas son aquellas que son composiciones típicamente basadas en disolventes que pueden formarse como geles para aplicación tópica o pulverizarse, por ejemplo, a partir de una solución basada en alcohol de los ingredientes.

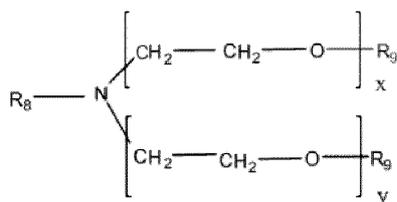
15 Las composiciones de protección solar rociable se han hecho populares en los últimos años como un medio para transportar y aplicar protector solar. Se sabe que los polímeros formadores de película se añaden a las composiciones de filtro solar no acuosas para proporcionar resistencia al agua a estas composiciones después de la aplicación a una superficie como la piel o el cabello. Sin embargo, se ha determinado que la adición de polímeros formadores de película más allá de cierta cantidad puede tener un efecto perjudicial sobre la sensación de la composición sobre la piel, en particular proporcionando una sensación de apelmazamiento. Se han usado agentes neutralizantes en relación con agentes formadores de película contenidos en formulaciones acuosas de emulsión de protección solar. Véase, por ejemplo, el documento WO 2004/071749 (Connetics Australia Pty. Ltd.) discute la limitación de la cantidad de agente neutralizante añadido a las formulaciones acuosas para preservar las propiedades de formación de película.

20 En un esfuerzo por mejorar la sensación de la piel de las composiciones de filtro solar anhidras de aplicación tópica que emplean polímeros formadores de película como agentes impermeabilizantes, los inventores han descubierto que ciertos agentes neutralizantes proporcionan no solo la sensación de piel mejorada deseada, sino que también proporcionan un impulso sustancial inesperado en los valores de SPF. Por lo tanto, serían útiles los procedimientos que emplean tales agentes neutralizantes para proporcionar una protección solar mejorada. Estos y otros objetivos son proporcionados por la invención descrita en el presente documento.

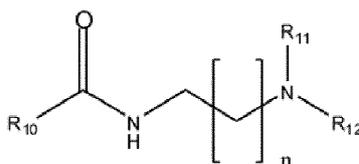
25 Todas las referencias de patentes y no patentes citadas en este documento se incorporan en el presente documento en su totalidad en esta memoria descriptiva por referencia a las mismas. La identificación o discusión de cualquier referencia en esta sección o cualquier parte de esta especificación no debe interpretarse como una admisión de que dicha referencia está disponible como técnica anterior a la presente solicitud.

Sumario de la invención

30 La invención proporciona un procedimiento para aumentar el SPF de una composición anhidra que comprende al menos un agente activo de protección solar y al menos un polímero formador de película, en el que el polímero formador de película comprende una pluralidad de grupos ácidos, el procedimiento comprende añadir un agente neutralizante basado en amina a la composición en una cantidad eficaz para neutralizar al menos una porción de los grupos ácidos en dicho polímero formador de película, en el que el polímero formador de película está presente en una cantidad superior al 1 % en peso de la composición final; y dicho agente neutralizante a base de amina es:



35 en el que R_8 es un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquenilo o aralquinilo de cadena lineal, ramificada o cíclica, de C_2 a aproximadamente C_{36} y R_9 se selecciona entre H o CH_3 , o un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquilo, aralquenilo o aralquinilo de cadena lineal, ramificada o cíclica de C_2 a C_{36} , y en el que x e y son independientemente de 0 a 100; o que tiene la estructura:



en la que R₁₀, R₁₁, y R₁₂ se seleccionan independientemente entre H, CH₃ o un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquilo, aralquenilo o aralquinilo de cadena lineal, ramificada o cíclica de C₂ a aproximadamente C₃₆, y en el que n es de 0 a 100;

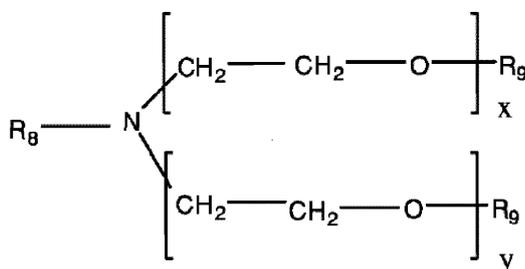
- 5 o se selecciona entre alquilaminas; alquenilaminas; dialquilaminas; dialquenilaminas; dimetilalquilaminas, en el que alquilo es estearilo o cocoilo; metildialquilaminas, en el que el alquilo es estearilo o hexadecilo; y dimetilalquenilaminas, en el que el alquenilo es oleico, linoleico o linolenico;

en el que al menos el 10 % de los grupos ácidos del polímero que forma películas se neutralizan mediante el agente de neutralización basado en amina.

10 **Descripción detallada de la invención**

La invención proporciona un procedimiento para aumentar el SPF para una composición anhidra que comprende al menos un agente activo de protección solar y al menos un polímero formador de película, en el que el polímero formador de película comprende una pluralidad de grupos ácidos, el procedimiento comprende añadir un agente neutralizante basado en amina a la composición en una cantidad eficaz para neutralizar al menos una porción de los grupos ácidos en dicho polímero formador de película, en el que el polímero formador de película está presente en una cantidad superior al 1 % en peso de la composición final; en el que al menos el 10 % de los grupos ácidos del polímero que forma películas se neutralizan mediante el agente de neutralización basado en amina. Si bien hay muchos agentes neutralizantes cosméticamente aceptables disponibles y funcionarán en esta solicitud, los agentes neutralizantes basados en aminas sorprendentemente proporcionan un aumento sinérgico en los niveles de SPF.

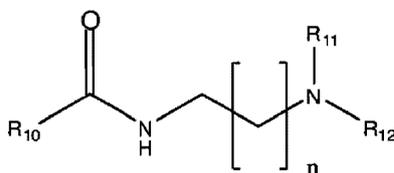
- 20 El agente neutralizante basado en aminas se selecciona de uno o más compuestos de las estructuras II y/o III:



II

en el que R₈ es un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquenilo o aralquinilo de cadena lineal, ramificada o cíclica, de C₂ a aproximadamente C₃₆ y R₉ se selecciona entre H o CH₃, o un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquilo, aralquenilo o aralquinilo de cadena lineal, ramificada o cíclica de C₂ a C₃₆, y en el que x e y son independientemente de 0 a 100; o que tiene la estructura:

- 25



III

en la que R₁₀, R₁₁ y R₁₂ se seleccionan independientemente entre H, CH₃ o un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquilo, aralquenilo o aralquinilo de cadena lineal, ramificada o cíclica de C₂ a aproximadamente C₃₆, y en el que n es de 0 a 100.

- 30 En ciertas realizaciones de ejemplo, como se muestra estructuralmente anteriormente, cada uno de n, x, y y z, son independientemente hasta 90, hasta 80, hasta 70, hasta 60, hasta 50, hasta 40, hasta 30, hasta 20 o hasta 10. En ciertas realizaciones de ejemplo, R₈-R₁₂ comprenderá independientemente restos que tengan hasta 40 átomos de carbono. En ciertas realizaciones de ejemplo, R₈-R₁₂ comprenderá independientemente restos que tengan hasta 30 átomos de carbono. En ciertas realizaciones de ejemplo, R₈-R₁₂ comprenderá independientemente restos que

5 tengan hasta 20 átomos de carbono. Algunos ejemplos no limitantes de agentes neutralizantes de aminas apropiados para esta invención son dimetil alqueniil aminas, en el que el alqueniilo es oleico, linoleico o linolenico, alquilaminas, alqueniilaminas, dialquilaminas, dialqueniilaminas, dimetilalquilaminas, en el que alquilo es estearilo o cocoilo, metildialquilaminas en el que alquilo es estearilo o hexadecilo, y dimetilalqueniilaminas, en el que el alqueniilo es oleico, linoleico y linolenico.

10 En la práctica de la invención, el agente neutralizante de amina actúa para neutralizar al menos una porción de los grupos ácidos, por ejemplo, carboxílico, sulfónico, fosfórico o grupos ácidos similares, en el polímero formador de película. Por lo tanto, el polímero formador de película puede estar neutralizado parcialmente o completamente neutralizado por el agente neutralizante. En ciertas formas de realización de ejemplo, entre aproximadamente el 10 % y aproximadamente el 100 % de los grupos ácidos en el polímero formador de película se neutralizarán. En otras realizaciones de ejemplo hasta aproximadamente el 90 %, hasta aproximadamente el 80 %, hasta aproximadamente el 70 %, hasta aproximadamente el 60 %, hasta aproximadamente el 50 %, hasta aproximadamente el 40 %, hasta aproximadamente el 30 %, hasta aproximadamente el 25 %, hasta aproximadamente el 20 %, hasta aproximadamente el 15 % de los grupos ácidos en el polímero formador de película estarán neutralizados.

15 En la práctica de la invención, la cantidad de agente neutralizante de amina que se añade para obtener el porcentaje deseado de neutralización del agente formador de película polimérica puede determinarse en función de la acidez del polímero y el equivalente de neutralización del agente neutralizante de amina. Por ejemplo, la siguiente ecuación puede usarse para determinar la cantidad precisa de agente neutralizante:

$$\text{Cantidad de agente neutralizante (g)} = \frac{W * A * N * E}{100.000}$$

20 W = peso del polímero formador de película en gramos
 A = acidez del polímero formador de película (mequiv./g)
 N = % de neutralización deseada
 E = neutralización equivalente de amina (g/equiv.)

25 La acidez de agentes formadores de película particulares está fácilmente disponible. Por ejemplo, la acidez del polímero formador de película DERMACRYL® 79 es 2,27 mequiv./g. El equivalente de neutralización (E) para varios agentes neutralizantes de aminas también está fácilmente disponible. En la Tabla 1 a continuación, se muestran ejemplos de algunos agentes neutralizantes de aminas Armeen® y Ethomeen®.

Tabla 1

Nombre del producto	Nombre INCI	Equivalente de neutralización (g/equiv.)
Armeen® M2C	Metildicocamina	398
Armeen® DMSVD	Dimetilsoyamina	306
Armeen® DMCD	Dimetilcocamina	240
Ethomeen® SV12	PEG-2 Soyamina	357
Ethomeen® C12	PEG-2 Cocamina	292
Ethomeen® SV15	PEG-5 Soyamina	474
Ethomeen® C15	PEG-5 Cocamina	413
Ethomeen® SV25	PEG-15 Soyamina	935
Ethomeen® C25A	PEG-15 Cocamina	848

30 En la práctica de la invención, el agente neutralizante de amina puede combinarse con el polímero formador de película para proporcionar un polímero parcial o totalmente neutralizado que se añade más adelante al resto de la composición. Como alternativa, el agente neutralizante de amina puede añadirse con el polímero formador de película como parte de la composición, logrando la neutralización parcial o completa in situ.

35 En una realización de ejemplo de la invención, el polímero formador de película comprende al menos el 5 % en peso de un monómero que contiene ácido. Además de realizaciones de ejemplo, el polímero formador de película comprende al menos el 5 % en peso de un monómero que contiene ácido carboxílico. Ejemplos no limitantes de estos monómeros son ácido acrílico, ácido crotonico, ácido metacrílico, ácido maleico, ácido itacónico y combinaciones y mezclas de los mismos. Pueden usarse polímeros formadores de película adicionales, ya sea sintéticos o naturales, con los polímeros que contienen ácido descritos anteriormente. Los ejemplos no limitantes de estos polímeros formadores de película son: de National Starch and Chemical Company, polímeros AMPHOMER® y AMPHOMER® LV-71 (copolímero de octilacrilamida/acrilatos/metacrilato de butilaminoetilo), polímero AMPHOMER HC® (copolímero de acrilatos/octilacrilamida) BALANCE® 0/55 y polímeros BALANCE CR® (copolímero de acrilatos), polímero BALANCE® 47 (copolímero de octilacrilamida/metacrilato de butilaminoetilo), polímero RESYN® 28-2930 (copolímero de VA/crotonatos/neodecanoato de vinilo), polímero RESYN® 28-1310 (copolímero de

VA/Crotonatos), polímeros FLEXAN® (sulfonato de poliestireno sódico), polímero DynamX (poliuretano-14 (y copolímero de acrilatos AMP), polímero RESYN XP® (copolímero de acrilatos/octilacrilamida), STRUCTURE 2001 (copolímero de acrilatos/estearth-20 itaconato) y STRUCTURE® 3001 (copolímeros de acrilatos/ceteth-20 de itaconato); de ISP, OMNIREZ-2000® (copolímero de medio éster etílico de PVM/MA), GANEX P-904® (PVP butilado), GANEX V-216® (copolímero de PVP/hexadeceno) GANEX® V-220 (copolímero de PVP/eicoseno), GANEX® WP-660 (PVP tricontanilo), GANTREZ® A425 (éster butílico de copolímero de PVM/MA), GANTREZ® AN-119 copolímero de PVM/MA, GANTREZ ES 225® (éster etílico de copolímero de PVM/MA), GANTREZ ES425 (éster butílico de PVM/MA), GAFFIX VC-713® (copolímero de vinil caprolactama/PVP/metacrilato de dimetilaminoetilo), GAFQUAT 755® (policuaternio-11), GAFQUAT HS-100® (policuaternio-28) AQUAFLEX XL-30® (Poliimida-1), AQUAFLEX SF-40® (Copolímero de acrilatos de PVP/Vinilcaprolactama/DMAPA), AQUAFLEX FX-64® (Copolímero de Isobutileno/Etilmaleimida/Hidroxietilmaleimida), ALLIANZ LT-120® (Copolímero de Acrilatos/C1-2 Succinatos/Hidroxiacrilatos), STYLEZE CC-10® (Copolímero de acrilatos de PVP/DMAPA), STYLEZE 2000® (Copolímero de VP/Acrilatos/Metacrilato de laurilo), STYLEZE W-20® (Policuaternio-55), Copolymer Series (Copolímero de PVP/Dimetilaminoetilmetacrilato), ADVANTAGE S® y ADVANTAGE LCA® (Copolímero de VinilcaprolactamaNP/Metacrilato de dimetilaminoetilo), ADVANTAGE PLUS (Copolímero de VA/Maleato de butilo/Acrilato de isobornilo); de BASF, LTLTRAHOLD STRONG (ácido acrílico/acrilato de etilo/acrilamida de t-butilo), LUVIMER 100P® (acrilato de t-butilo/acrilato de etilo/ácido metacrílico), LUVIMER 36D (acrilato de etilo/acrilato de t-butilo/ácido metacrílico), LUVIQUAT HM-552® (policuaternio-16), LUVIQUAT HOLD® (policuaternio-16), LUVISKOL K30 (PVP) LUVISKOL K90® (PVP), LUVISKOL VA 64® (copolímero de PVP/VA) LUVISKOL VA73W® (copolímero de PVPNA), LUVISKOL VA®, LUVISET PUR® (Poliuretano-1), LUVISET® Clear (Copolímero de VP/MetacrilamidaNinil Imidazol), LUVIFLEX SOFT® (Copolímero de acrilatos), ULTRAHOLD 8® (Copolímero de Acrilatos/Acrilamida), LUVISKOL® Plus (Polivinilcaprolactama), LUVIFLEX® Silk (Copolímero de PEG/PPG-25/25 Dimeticona/Acrilatos); de Amerchol, AMERHOLD® DR-25 (ácido acrílico/ácido metacrílico/acrilatos/metacrilatos); de Rohm&Haas, ACUDYNE 258® (ácido acrílico/ácido metacrílico/acrilatos/metacrilatos/acrilatos de hidroxí éster; de Mitsubishi y distribuido por Clariant, DIAFORMER Z-301®, DIAFORMER Z-SM®, y DIAFORMER Z-400® (copolímero de metacrililetil betaína/acrilatos), ACUDYNE 180® (Copolímero de Acrilatos/Hidroxiésteres Acrilatos), ACUDYNE SCP® (Copolímero de Etilencarboxiamida/AMPSA/Metacrilatos), y los modificadores reológicos ACCULYN®; de ONDEO Nalco, FIXOMER A-30® y FIXOMER N-28 ® (nombres INCI: copolímero de ácido metacrílico/acrilamidometilpropano sulfonato sódico); de Noveon, FIXATE G-100® (Copolímero de AMP-Acrilatos/Metacrilato de alilo), FIXATE PLUS® (Poliacrilatos-X), CARBOPOL® Ultrez 10 (Carbómero), CARBOPOL Ultrez 20® (Copolímero de Acrilatos/Alquilacrilatos C10-30), AVALURE AC® series (Copolímero de Acrilatos), AVALURE UR® series (Poliuretano-2, Poliuretano-4, Copolímero de PPG-17/IPDI/DMPA); polietilenglicol; acrílicos solubles en agua; poliésteres solubles en agua; poliacrilamidas; poliaminas; aminas policuaternarias; resina de anhídrido maleico estireno (SMA); polietilenamina; y otros polímeros convencionales que son solubles en disolventes polares o que pueden hacerse solubles a través de la neutralización con la base apropiada.

Polímeros formadores de película naturales adicionales son almidón nativo como se usa en el presente documento, también almidones obtenidos de una planta obtenida mediante técnicas de reproducción convencionales que incluyen cruzamiento, translocación, inversión, transformación o cualquier otro procedimiento de ingeniería genética o cromosómica para incluir variaciones de los mismos. Además, el almidón obtenido de una planta cultivada a partir de mutaciones artificiales y variaciones de la composición genérica anterior, que pueden producirse mediante procedimientos convencionales conocidos de reproducción por mutación, también son adecuados en el presente documento. Un experto en la materia reconocería que el polímero formador de película puede comprender una mezcla de dos o más polímeros. En una realización de ejemplo de la invención, puede usarse una mezcla de polímeros, en la que al menos uno de los polímeros contiene un monómero de ácido carboxílico y el nivel de monómero de ácido carboxílico no es inferior al 5 % del polímero total (en peso base seca del polímero formador de película total).

Las composiciones de protección solar se preparan como composiciones no acuosas, basadas en disolventes volátiles. Las expresiones "no acuoso" y "anhidro" se usan de manera intercambiable en este documento y se refieren a composiciones que contienen menos de aproximadamente 10 % en peso de agua. Por lo tanto, las composiciones comprenden una única fase líquida que puede comprender además partículas dispersas. En ciertas realizaciones, las composiciones contendrán menos de aproximadamente el 5 % en peso de agua o menos del 1 % en peso de agua. Ejemplos de disolventes volátiles incluyen uno o más de los alcoholes, tales como metanol, etanol e isopropanol, hidrocarburos volátiles, tales como isooctano, isododecano e isohexadecano, aldehídos y siliconas volátiles que también incluyen cetonas volátiles tales como acetona y metil etil cetona. En una realización el disolvente volátil se elige entre el grupo que consiste en etanol, metanol, isopropanol y acetona. Las composiciones de protección solar que contienen sistemas de disolventes a base de alcohol se caracterizan como soluciones no acuosas. Sin embargo, puede ser deseable tener una pequeña cantidad de agua en la composición, por ejemplo, como ayuda de procesamiento o codisolvente. En ciertas realizaciones de ejemplo, el contenido de agua de las composiciones no será mayor que aproximadamente el 9 % de agua para evitar que la sustancia activa se separe o precipite de la solución. Los expertos en la materia reconocerán que diferentes activos tienen diferentes tolerancias para el agua en solución y ajustarán el contenido de agua en consecuencia. Además, el disolvente puede incluir un aceite tal como aceite mineral o vegetal. El aceite puede ser el único disolvente o puede usarse en cantidades variables como codisolvente o como se describe en el presente documento como "emolientes".

Para los fines de la presente invención, un "agente activo de protección solar" o "protector solar activo" incluirá todos esos materiales, individualmente o en combinación, que se consideran aceptables para su uso como ingredientes activos de protección solar en función de su capacidad para absorber la radiación UV. Tales compuestos se describen generalmente como agentes activos UV-A, UV-B o UV-A/UV-B. La aprobación por parte de una agencia reguladora generalmente se requiere para la inclusión de agentes activos en formulaciones destinadas al uso humano. Aquellos agentes activos que han sido o están actualmente aprobados para su uso con protector solar en los Estados Unidos incluyen sustancias orgánicas e inorgánicas, incluyendo, sin limitación, ácido para aminobenzoico, avobenzona, cinoxato, dioxibenzona, homosalato, antranilato de metilo, salicilato de octilo, oxibenzona, padimato O, ácido fenilbenzoimidazolsulfónico, sulisobenzona, salicilato de trolamina, dióxido de titanio, óxido de zinc, metoxicinnamato de dietanolamina, trioleato de digaloilo, etil dihidroxipropil PABA, aminobenzoato de glicerilo, lawsona con dihidroxiacetona, vaselina roja. Ejemplos de activos de protección solar adicionales que aún no han sido aprobados en los EE. UU. pero que están permitidos en formulaciones vendidas fuera de los EE. UU. incluyen etilhexil triazona, dioctil butamido triazona, polisiloxano de malonato de bencilideno, ácido tereftalilidencanforsulfónico, tetrasulfonato de fenil dibenzimidazol disódico, hexil benzoato de dietilamino hidroxibenzoilo, benzoato de bis dietilamino hidroxibenzoilo, bis benzoxazoilfenil etilhexilimino triazina, drometrisol trisiloxano, metilen bis-benzotriazolil tetrametilbutilfenol y bis-etilhexiloxifenol metoxifeniltriazina, 4-metilbencilidenoalcanfor y 4-metoxicinnamato de isopentilo. Sin embargo, como la lista de protectores solares aprobados se está ampliando, los expertos en la materia reconocerán que la invención no está limitada a los agentes activos de protección solar actualmente aprobados para uso humano, sino que es fácilmente aplicable a aquellos que puedan permitirse en el futuro.

En una realización de la invención, el agente activo de protección solar comprende una cantidad eficaz de fotoprotección de partículas de al menos un pigmento o nanopigmento inorgánico, ejemplos no limitativos de los cuales incluyen dióxido de titanio, óxido de zinc, óxido de hierro, óxido de circonio, óxido de cerio o mezcla de los mismos.

Las composiciones se pueden aplicar a la piel como un roce líquido, pero se aplican más comúnmente como un pulverizador. Sin embargo, las composiciones no se limitan a aquellas composiciones aplicadas a la piel principalmente como un agente de protección solar. Las composiciones también incorporan aquellas formulaciones en las que el agente activo de protección solar es un ingrediente en otra composición de aplicación tópica. Algunos ejemplos no limitativos son el lápiz labial, el maquillaje, el bálsamo labial, la sombra de ojos, los tintes para el cabello y los acondicionadores, o cualquier aplicación en la que la protección solar pueda considerarse beneficiosa.

En ciertas realizaciones, las composiciones pueden almacenarse en recipientes a presión mediante combinación con un propelente. Las composiciones así almacenadas pueden aplicarse abriendo una válvula en el contenedor que libera el propelente y la composición, típicamente en una pulverización o neblina. El propulsor usado en la composición puede ser cualquier gas adecuado, o una combinación de gases, que puedan comprimirse o licuarse dentro de un bote de rociado dispensador, que se expanda o volatilice en forma de vapor o gas tras la exposición a la temperatura ambiente y las condiciones de presión para entregar la composición. en forma de aerosol. Los propulsores adecuados incluyen hidrocarburos que tienen de 1 a 5 átomos de carbono, que incluyen pero sin limitación metano, etano, propano, isopropano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarbonos (HFC), clorofluorocarbonos (CFC), nitrógeno, éteres que incluyen dimetil éter, y cualquiera de sus mezclas. Los expertos en la materia reconocen que en un recipiente cerrado, como una lata de aluminio o una botella de vidrio, propulsores como el dimetil éter se condensan al estado líquido a temperatura ambiente. Por lo tanto, la composición en el recipiente de aerosol es una formulación líquida que puede contener propelente disuelto, propelente líquido no disuelto y propelente gaseoso. Todo esto está bajo presión debido a la presión de vapor del propelente. En la práctica de este aspecto de la presente invención, el propelente puede estar presente en una cantidad de hasta aproximadamente 90 por ciento en peso, preferentemente de aproximadamente 2 por ciento en peso a aproximadamente 50 por ciento en peso, y más preferentemente de aproximadamente 5 por ciento en peso a aproximadamente 40 por ciento en peso, más preferentemente a aproximadamente el 30 por ciento en peso, basado en el peso total de la composición de aerosol.

Las composiciones pueden contener una amplia gama de componentes opcionales adicionales a los que se hace referencia en el presente documento como "componentes cosméticos", pero que también pueden incluir componentes generalmente conocidos como agentes farmacéuticamente activos. El CTFA Cosmetic Ingredient Handbook, Séptima edición, 1997 y la Octava edición, 2000, que se incorpora en el presente documento como referencia en su totalidad, describe una amplia variedad de ingredientes cosméticos y farmacéuticos comúnmente utilizados en composiciones para el cuidado de la piel, que son adecuados para uso en las composiciones de la presente invención. Ejemplos de estas clases funcionales desveladas en esta referencia incluyen: absorbentes, abrasivos, agentes antiaglomerantes, agentes antiespumantes, antioxidantes, aglutinantes, aditivos biológicos, agentes tamponantes, agentes de carga, agentes quelantes, aditivos químicos, colorantes, astringentes cosméticos, biocidas cosméticos, desnaturalizantes, fármacos astringentes, analgésicos externos, formadores de película, componentes de fragancia, humectantes, agentes opacificantes, ajustantes de pH, plastificantes, agentes reductores, agentes blanqueadores de la piel, agentes acondicionadores de la piel (emolientes, humectantes, misceláneo y oclusivo), protectores de la piel, disolventes, refuerzos de espuma, hidrotropos, agentes solubilizantes, agentes de suspensión (no tensioactivo), agentes de protección solar, absorbentes de luz ultravioleta, refuerzos de SPF, agentes impermeabilizantes y agentes que aumentan la viscosidad (acuosos y no acuosos).

Las composiciones también pueden incluir materiales que también aumentan el SPF de la composición final mediante mecanismos tales como dispersión y dispersión de la radiación UV. Tales materiales se denominan en el presente documento "agentes dispersantes de radiación UV" y comprenden materiales que exhiben actividad absorbente de UV o que no muestran actividad absorbente de UV. Un ejemplo de tales agentes dispersadores de radiación UV incluyen materiales poliméricos, como el producto conocido como Sun Spheres™ (Rohm and Haas; Filadelfia, PA), que se describen por su fabricante como esferas de copolímero de estireno/acrilato huecas fabricadas mediante polimerización en emulsión. Se dice que las esferas de polímero elevan los valores de SPF a través de la región UVA y UVB dispersando y/o dispersando la radiación UV incidente a lo largo de la película de protector solar presente en una superficie, como la piel humana. Se entiende que las esferas causan que la radiación UV penetre en la piel redirigiendo la radiación hacia los activos de pantalla solar absorbentes de luz UV en la formulación de la pantalla solar, donde la radiación reacciona con las moléculas activas de la pantalla solar y la energía se disipa en forma de calor. Como se usa en el presente documento, los términos "esferas" o "agentes dispersantes" no están limitados por la composición o la forma química, sino que comprenden cualquier agente que produzca el efecto de alargar la trayectoria de la radiación UV incidente, aumentando la probabilidad estadística de que la radiación se ponga en contacto con una molécula activa de filtro solar, es decir, un agente activo absorbente de UV. Estos materiales también pueden incluir materiales absorbentes de UV que también exhiben propiedades de dispersión tales como ZnO (los ejemplos incluyen productos Z-Cote™ disponibles en BASF), TiO₂ (los ejemplos incluyen los productos de Sola veil™ disponibles de Uniqema (New Castle, DE, Estados Unidos)), compuestos, tales como metilén bis-benzotriazolil tetrametilbutilfenol, ("Tinosorb™ M" disponible de Ciba Specialty Chemicals, Inc. (Basilea, Suiza)). Los agentes dispersantes de la radiación UV están típicamente presentes en la formulación en cantidades de hasta aproximadamente el 25 % en peso. Ciertas formas de realización de ejemplo pueden comprender hasta aproximadamente el 10 % en peso, preferentemente en intervalos de aproximadamente el 0,5 % a aproximadamente el 7,0 % en peso, en intervalos particularmente preferidos del 3 % a aproximadamente el 5 % en peso.

Como se usa en el presente documento, las expresiones "agente de bronceado sin sol" o "composiciones de autobronceado" se refieren a composiciones que, cuando se aplican a la piel humana, le confieren un aspecto similar al que se obtiene al exponer la piel a la luz solar natural o artificial. Ejemplos de agentes activos de bronceado sin sol se describen en las patentes de EE. UU. n.º 6.482.397, 6.261.541 y 6.231.837. Tales composiciones de bronceado sin sol comprenden típicamente, además de una cantidad efectiva de bronceado artificial de un agente de auto bronceado, cantidades efectivas de un agente colorante de composición y un vehículo cosméticamente aceptable adaptado para aplicación tópica a la piel humana. Los agentes de autobronceado también pueden incluir aquellas composiciones generalmente aceptadas en la técnica para aplicación a la piel humana, y que, cuando se aplican, reaccionan con aminoácidos para formar productos pigmentados. Tales reacciones dan a la piel un aspecto marrón similar al color obtenido al exponerla a la luz solar durante períodos de tiempo suficientes para broncear la piel. Agentes de autobronceado adecuados incluyen, sin limitación, alfa-hidroxi aldehídos y cetonas, gliceraldehído y alcoholes aldehídos relacionados, diversos indoles, imidazoles y derivados de los mismos, y diversos agentes de pigmentación aprobados. Actualmente se prefieren en el presente documento como agentes de autobronceado los alfa-hidroxi aldehídos y cetonas. Lo más preferentemente, el agente de autobronceado es dihidroxiacetona ("DHA"). Otros agentes adecuados de autobronceado incluyen, sin limitación, metil glioxal, glicerol aldehído, eritrolosa, alloxan, 2,3-dihidroxisuccindialdehído, 2,3-dimetoxisuccindialdehído, 2-amino-3-hidroxi-succindialdehído y 2-bencilamino-3-hidroxisuccindialdehído.

Un emoliente es una sustancia oleaginosa o aceitosa que ayuda a suavizar y suavizar la piel, y también puede reducir su rugosidad, agrietamiento o irritación. Los emolientes adecuados típicos incluyen aceite mineral que tiene una viscosidad en el intervalo de 50 a 500 centipoises (cps), aceite de lanolina, aceite de coco, manteca de cacao, aceite de oliva, aceite de almendra, aceite de nuez de macadamia, extractos de aloe como la lipoquinona aloe vera, aceites de jojoba sintéticos, aceites naturales de sonora jojoba, aceite de cártamo, aceite de maíz, lanolina líquida, aceite de semilla de algodón, aceite de semilla de uva, aceite de almendras dulces y aceite de cacahuete. Preferentemente, el emoliente es un cocoglicérido, que es una mezcla de mono, di y triglicéridos de aceite de cacao, que se vende bajo el nombre comercial de Myritol 331 de Henkel KGaA, o éter de dicaprililo disponible bajo el nombre comercial Cetiol OE de Henkel KGaA o benzoato de alquilo C₁₂-C₁₅ se vende con el nombre comercial Finsolv TN de Finetex. Pueden estar presentes uno o más emolientes que varían en cantidades desde aproximadamente 1 por ciento a aproximadamente 10 por ciento en peso, de manera preferente de aproximadamente el 5 por ciento en peso. Otro emoliente adecuado es DC 200 Fluid 350, un fluido de silicona, disponible de Dow Corning Corp.

Otros emolientes adecuados incluyen escualano, aceite de ricino, polibuteno, aceite de almendra dulce, aceite de aguacate, aceite de calófilo, aceite de ricino, acetato de vitamina E, aceite de oliva, aceites de silicona tales como dimetilopolisiloxano y ciclometicona, alcohol linolénico, alcohol oleílico, el aceite de germen de cereales como el aceite de germen de trigo, palmitato de isopropilo, palmitato de octilo, miristato de isopropilo, estearato de hexadecilo, estearato de butilo, oleato de decilo, acetil glicéridos, los octanoatos y benzoatos de los alcoholes (C₁₂ - C₁₅), los octanoatos y decanoatos de alcoholes y polialcoholes como los de glicol y glicerilo, ésteres de ricinoleatos, tales como adipato de isopropilo, hexil laurato y dodecanoato de octilo, maleato de dicaprililo, aceite vegetal hidrogenado, feniltrimeticona, aceite de jojoba y extracto de aloe vera.

Pueden usarse otros emolientes adecuados que son sólidos o semisólidos a temperatura ambiente. Tales emolientes cosméticos sólidos o semisólidos incluyen dilaurato de glicerilo, lanolina hidrogenada, lanolina hidroxilada, lanolina acetilada, vaselina, lanolato de isopropilo, miristato de butilo, miristato de cetilo, miristato de miristilo, lactato de miristilo, alcohol cetílico, alcohol de isostearilo y lanolato de isocetilo. Uno o más emolientes pueden incluirse opcionalmente en la formulación.

Un humectante es un agente humectante que promueve la retención de agua debido a sus propiedades higroscópicas. Los humectantes adecuados incluyen glicerina, glicoles poliméricos tales como polietilenglicol y polipropilenglicol, manitol y sorbitol. Preferentemente, el humectante es sorbitol, USP al 70 % o polietilenglicol 400, NF. Uno o más humectantes pueden incluirse opcionalmente en la formulación en cantidades de aproximadamente el 1 por ciento a aproximadamente el 10 por ciento en peso, de manera preferente aproximadamente el 5 por ciento en peso.

Un modificador de sensación de sequedad es un agente que, cuando se agrega a una emulsión, imparte una "sensación de sequedad" a la piel cuando se seca la emulsión. Los modificadores del tacto seco pueden incluir talco, caolín, tiza, óxido de zinc, fluidos de silicona, sales inorgánicas como sulfato de bario, sílice tratada en la superficie, sílice precipitada, sílice ahumada tal como un Aerosil disponible en Degussa Inc. de Nueva York, N.Y. Estados Unidos. Otro modificador de la sensación de sequedad es un almidón de glicerilo reticulado con epíclorhidrina del tipo que se describe en la patente de EE.UU. n.º 6.488.916.

Puede ser ventajoso incorporar agentes espesantes adicionales, tal como, por ejemplo, diversos carbopoles disponibles de Noveon Co. Son particularmente preferidos aquellos agentes que no alterarían la estructura laminar en la formulación del producto final, tales como agentes espesantes no iónicos. La selección de agentes espesantes adicionales está bien dentro de la habilidad de un experto en la materia.

También pueden añadirse sustancias naturales o sintéticas adicionales a las composiciones para proteger o retrasar su deterioro debido a la acción del oxígeno en el aire (oxidación). También pueden reducir las reacciones de oxidación en el tejido de la piel. Tales sustancias evitan el deterioro oxidativo que puede conducir a la generación de productos de reacción de pardeamiento rancio y no enzimático. Las sustancias adecuadas típicas incluyen propilo, ésteres oclílicos y dodecilílicos del ácido gálico, hidroxianisol butilado (BHA, generalmente adquirido como una mezcla de orto y meta isómeros), hidroxitolueno butilado (BHT), extracto de té verde, ácido úrico, cisteína, piruvato, ácido nordihidroguaiarético, Vitamina A, Vitamina E y Vitamina C y sus derivados. Una o más de tales sustancias pueden incluirse opcionalmente en la composición en una cantidad que oscila entre aproximadamente 0,001 y aproximadamente 5 por ciento en peso, de manera preferente de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 0,5 por ciento. Los agentes quelantes son sustancias que se usan para quelar o unir iones metálicos, como en el caso de una estructura de anillo heterocíclico, de modo que el ion se mantiene mediante enlaces químicos de cada uno de los anillos participantes. Los agentes quelantes adecuados incluyen ácido etileno diaminotetraacético (EDTA), EDTA disódico, edetato cálcico disódico, EDTA trisódico, albúmina, transferina, desferoxamina, desferal, mesilato de desferoxamina, EDTA tetrasódico y EDTA dipotásico o combinaciones de cualquiera de estos.

Las fragancias son sustancias aromáticas que pueden impartir un aroma estéticamente agradable a la composición de protección solar. Las fragancias típicas incluyen materiales aromáticos extraídos de fuentes botánicas (es decir, pétalos de rosa, flores de gardenia, flores de jazmín, etc.) que se pueden usar solas o en cualquier combinación para crear aceites esenciales. Como alternativa, los extractos alcohólicos pueden prepararse para fragancias de composición. Sin embargo, debido a los costos relativamente altos de obtener fragancias a partir de sustancias naturales, la tendencia moderna es usar fragancias preparadas sintéticamente, particularmente en productos de alto volumen. Una o más fragancias pueden incluirse opcionalmente en la composición de filtro solar en una cantidad que varía de aproximadamente el 0,001 a aproximadamente el 5 por ciento en peso, de manera preferente de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 0,5 por ciento en peso. También pueden usarse conservantes adicionales si se desea e incluyen composiciones conservantes bien conocidas tales como alcohol bencílico, alcohol feniletílico y ácido benzoico, diazolidinilo, urea, clorfenesina, yodopropinilo y carbamato de butilo, entre otros. Las composiciones pueden comprender además agentes activos protectores de la piel. Los ejemplos adecuados incluyen (con intervalos de porcentaje en peso preferidos), Alantoína (0,5 a 2 por ciento); Gel de hidróxido de aluminio (0,15 a 5 por ciento); Calamina (1 a 25 por ciento); Manteca de cacao (más de 50); Aceite de hígado de bacalao (5 a 14 por ciento); Avena coloidal; Dimeticona (1 a 30 por ciento); Glicerina (20 a 45 por ciento); Grasa dura (más de 50); Caolina (4 a 20 por ciento); Lanolina (12.5 a 50 por ciento); Aceite mineral (superior al 50 por ciento); Vaselina (más del 30 por ciento); Bicarbonato sódico; Almidón tóxico (10 a 98 por ciento); Vaselina blanca (más del 30 por ciento); Acetato de zinc (0.1 a 2 por ciento); Carbonato de zinc (0.2 a 2 por ciento); y óxido de zinc (1 a 25 por ciento).

Las composiciones pueden incluir además componentes repelentes de insectos. El agente activo repelente de insectos más utilizado para productos de cuidado personal es N,N-dietil-m-toluamida, con frecuencia llamado "DEET" y disponible en forma de un concentrado que contiene al menos aproximadamente el 95 por ciento de DEET. Otros repelentes químicos sintéticos incluyen etilbutilacetilaminopropionato (también conocido como IR 3535), ftalato de dimetilo, etil hexanodiol, indalona, di-n-propilisocincoronato, biciclohepteno, dicarboximida y tetrahidrofuraldehído. Ciertos materiales derivados de plantas también tienen actividad repelente de insectos, incluido el aceite de citronela y otras fuentes de citronela (incluido el aceite de hierba de limón), limoneno, aceite de romero y aceite de eucalipto.

La elección de un repelente de insectos para su incorporación a la emulsión de protección solar será frecuentemente influenciada por el olor del repelente. La cantidad de agente repelente usado dependerá de la elección del agente; DEET es útil en altas concentraciones, tal como hasta aproximadamente el 15 por ciento o más, mientras que algunas de las sustancias derivadas de las plantas se usan típicamente en cantidades mucho más bajas, tal como el 0,1 por ciento o menos. La aplicación tópica de las composiciones descritas en el presente documento al cabello o la piel de un ser humano proporcionará una protección mejorada contra los efectos perjudiciales de la radiación ultravioleta (UVR). Por lo tanto, el sujeto proporciona además un procedimiento para proteger la piel y/o el cabello humano contra los efectos nocivos de la radiación solar, más particularmente UVR, procedimiento que comprende aplicar tópicamente una cantidad eficaz de las composiciones como se describe en el presente documento. Un resultado estéticamente beneficioso de la exposición de la piel a UVR (es decir, longitudes de onda de radiación de luz de 280 nm a 400 nm) es la promoción del bronceado de la epidermis humana. Otro beneficio de la exposición al sol proviene de la producción de vitamina D dentro de la piel. La UVR se divide típicamente en regiones UV-A (longitudes de onda de luz de 320 a 400 nm) y UV-B (longitudes de onda que van de 280 a 320 nm). En general, se considera que la sobreexposición a la radiación UV-B conduce a quemaduras de la piel y eritema. Además, la sobreexposición a la radiación UV-A puede causar una pérdida de elasticidad de la piel y la aparición de arrugas, lo que promueve el envejecimiento prematuro de la piel. Tal irradiación promueve la activación de la reacción eritemática o amplifica esta reacción en ciertos individuos e incluso puede ser la fuente de reacciones fototóxicas o fotoalérgicas. Se cree cada vez más que la sobreexposición a los rayos UV-A también puede conducir a un melanoma. Por lo tanto, la aplicación de las composiciones a la piel y/o el cabello de un individuo proporcionará una fotoprotección UVR mejorada (UV-A y/o UV-B) de la piel y/o el cabello del individuo.

Las composiciones que contienen protector solar están destinadas a proporcionar una calificación de factor de protección solar (SPF) de al menos 2, con realizaciones preferibles adicionales que tienen un factor de protección solar de al menos 5, en otra realización al menos 10, en otra realización al menos 15, en otra realización al menos 20, en otra realización al menos 25, en otra realización al menos 30, en otra realización al menos 35, en otra realización al menos 40, en otra realización al menos 45, en otra realización al menos 50, en otra realización al menos 55, en otra realización al menos 60, en otra realización al menos 65, en otra realización al menos 70, en otra realización al menos 75, en otra realización al menos 80, en otra realización al menos 85, en otra realización al menos 90, otra realización al menos 95 y en otra realización al menos 100. Las composiciones que contienen protector solar también están destinadas a proporcionar "clasificaciones de estrellas" de la FDA-UV de los EE. UU. de al menos una estrella, al menos dos estrellas, al menos tres estrellas y hasta cuatro estrellas. Como se demuestra en el presente documento, al neutralizar los grupos ácidos del polímero formador de película, se puede obtener un aumento de SPF mientras se mantiene la cantidad de carga de agente activo de protección solar en la composición. Por lo tanto, en una realización de ejemplo, para dos composiciones que contienen cantidades iguales de agentes activos de protección solar, el SPF para la composición que contiene el agente formador de película parcial o totalmente neutralizado puede ser mayor que 125 por ciento de la composición que contiene agentes formadores de película no neutralizados. En realizaciones de ejemplo alternativas, el SPF para la composición que contiene el agente formador de película parcial o totalmente neutralizado puede ser mayor que el 150 por ciento de la formulación no neutralizada, mayor que el 200 por ciento de la formulación no neutralizada, o mayor que el 300 por ciento de la formulación no neutralizada. De forma alternativa, un SPF mayor que el 125 por ciento de SPF no neutralizado es equivalente a decir que el SPF para una composición que contiene el polímero parcial o totalmente neutralizado es mayor que 1,25 veces el que se lograría usando una formulación no neutralizada.

La invención se describirá adicionalmente por medio de los siguientes ejemplos, que no pretenden limitar la invención, como se define en las reivindicaciones adjuntas, de ninguna manera.

Ejemplo 1 - Composición de protección solar

Se preparó una composición de protector solar que contenía agentes neutralizantes de amina y polímero formador de película de la siguiente manera. A un vaso de precipitados de 250 ml se le añadieron 3,0 g de Avobenzona, 5,0 g de Octisalato, 6,0 g de Oxibenzona, 15,0 g de Homosalato y 1,0 g de Glicerina a una solución en agitación que contenía 0,51 g de Dimetilstearylamina y 3,0 g de Dermacril 79 (un copolímero de acrilato que contiene ácido acrílico al 14 %, disponible de National Starch and Chemical Co. Bridgeagua, Nueva Jersey) en 66,49 g de Etanol. La composición se agitó hasta que todos los componentes se disolvieron. Se pueden calentar ligeramente composiciones similares para ayudar en la disolución.

Ejemplo 2 - Evaluación del efecto de la neutralización en SPF de formulaciones de protección solar

Las composiciones de protector solar se prepararon como se ha descrito anteriormente con niveles y tipos variables de agentes neutralizantes de amina. Todas las composiciones en este ejemplo contenían Avobenzona (3,0 g), Salicilato de octilo (5,0 g), Oxibenzona (6,0 g), Homosalato (15,0 g), glicerina (1,0 g) y Dermacril 79 (3,0 g) más etanol para llevar el peso a 100 gramos.

Todas las mediciones de SPF se realizaron usando placas de poli(metacrilato de metilo) (PMMA) (Schonberg GMBH & Co KG., 22457 Hamburgo-Schnelsen, Alemania) como sustrato al que se aplicaron las fórmulas de protector solar. Las formulaciones de prueba se aplicaron a los sustratos a 1 mg/cm² y se dejaron secar durante 20 minutos. Una placa de PMMA tratada con glicerina a 1 mg/cm² sirvió como referencia y blanco. El SPF *in vitro* de cada fórmula se

determinó usando un analizador Optometrics SPF 290S (Optometrics LLC, Ayer, MA; EE. UU.) equipado con una etapa de muestreo X-Y controlada por ordenador y funcionando de acuerdo con las instrucciones del fabricante. Se obtuvieron un total de 12 valores de SPF *in vitro* para cada fórmula utilizando una posición diferente, no superpuesta, en cada sustrato montado. Todos los valores de SPF indicados son el promedio de 12 valores medidos para cada formulación.

5

Los resultados se muestran en la Tabla 2.

Tabla 2

SPF en función de la neutralización.					
Muestra	EtOH al 25 % / KOH (gramos)	Trietanol amina (gramos)	Dimetil etearil amina (gramos)	Porcentaje de neutralización de grupos ácido carboxílico	SPF <i>in vitro</i>
1	0	0	0	0	31
2	0,38			10	27
3	0,95			25	33
4	1,90			50	28
5		0,10		10	37
6		0,25		25	14
7		0,50		50	21
8			0,20	10	51
9			0,51	25	56
10			1,01	50	141

Los resultados en la Tabla 2 muestran la mejora significativa en el SPF *in vitro* medido con tan solo un 10 por ciento de neutralización del polímero formador de película (muestra 8) y que es posible alcanzar niveles más altos de protecciones con una mayor neutralización (muestra 9 y 10). No se encuentran resultados similares con otros agentes neutralizantes comunes que no poseen los grupos de cadena larga.

10

Ejemplo 3 - Diversas aminas usadas para refuerzo de SPF

Los protectores solares se prepararon como se describe en el ejemplo 2 y se neutralizaron con la amina indicada para neutralizar el 25 por ciento de los grupos de ácido carboxílico en el Dermacril 79. Las formulaciones de prueba se aplicaron al sustrato de PMMA a 2 mg/cm². Los resultados se muestran en la Tabla 3

15

Tabla 3

Muestra n.º	Amina	SPF
11	Propilamina	45
12	Butilamina	53
13	Hexilamina	82
14	Octilamina	102
15	Decilamina	93
16	Dodecilamina	76
17	Dietilamina	63
18	Dihexilamina	81
19	Trietilamina	54
20	Tributilamina	25
21	Dimetilaminopropilcocamida	69
22	Cocamina	83
23	Dimetilcocamina	52
24	Dimetilstearylamina	65
25	Soyamina	64
26	Dimetilsoyamina	63
27	Dimetilerucilamina	83
28	Dimetilbehenilamina	62

29	PEG-15 Cocamina	56
30	PEG-15 Soyamina	63
31	PEG-2 Behenilamina	71
32	Jeffamina M-1000	57
33	Jeffamina M-2070	34
34	Control sin neutralizador	39

La muestra 34 representa el control sin neutralización. Estos experimentos muestran que, aunque las composiciones que contienen ciertas aminas no demuestran un aumento sustancial de SPF, las composiciones que contienen ejemplos de una amplia variedad de aminas proporcionan un gran aumento de SPF sobre el control.

5 Ejemplo 4 - Ensayos *in Vivo* de SPF y muy resistentes al agua

Se prepararon tres formulaciones de protección solar y se probaron su eficacia en un ensayo SPF humano y en un ensayo muy resistente al agua (FDA Final Monograph Protocol 7.22). Las tres formulaciones son las Muestras 1, 9 y 10 de la Tabla 2 anterior. Las tres formulaciones eran composiciones a base de etanol que contenían, Avobenzona al 3 %, Salicilato de octilo al 5 %, Oxibenzona al 6 %, Homosalato al 15 %, glicerina al 1,0 %, Dermacril 79 al 3 % (todos los porcentajes en peso de formulación final). Las tres formulaciones diferían con respecto al porcentaje de neutralización de los grupos de ácido carboxílico del agente formador de película. La muestra 1 tuvo una neutralización del 0 %, la muestra 9 tuvo una neutralización del 25 % y la muestra 10 tuvo una neutralización del 50 %. El agente neutralizante de amina usado para las muestras 9 y 10 fue dimetilestearilamina, que se añadió en una cantidad para lograr el nivel de neutralización deseado.

La prueba de SPF en cada muestra se realizó (de acuerdo con el Protocolo 7.22) midiendo primero el SPF promedio antes de la inmersión (estática), realizando el procedimiento de inmersión, y después una segunda medición de inmersión para calcular el SPF promedio muy resistente al agua. Se evaluaron cinco sujetos para cada muestra. Los resultados se muestran en la tabla 4.

Tabla 4

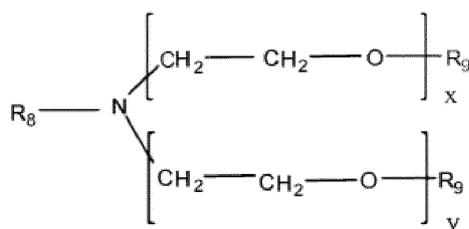
Muestra	Avg SPF preinmersión	Avg SPF posinmersión
1	31,8	29,2
9	56,5	55,8
10	78,3	78,3*

* N = 4 para Muestra 10 posinmersión. Uno de los cinco sujetos mostró eritema en todos los subsitios a los que se aplicó la composición de prueba después de la inmersión en agua. De acuerdo con los procedimientos convencionales, este tema no se usó para calcular el valor promedio de SPF posterior a la inmersión para la muestra 10.

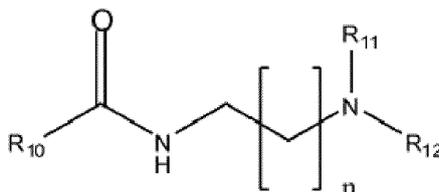
Los datos en la Tabla 4 prueban que las composiciones proporcionan un SPF *in vivo* sustancialmente aumentado en base a la presencia del agente formador de película neutralizado con amina y las formulaciones soportadas en las pruebas de ensayo de resistencia al agua. La muestra 9 (que comprendía un 25 % de neutralización) mostró un SPF de 178 % (preinmersión) y 191 % (posinmersión) del SPF de la muestra 1. La muestra 10 (que comprendía un 50 % de neutralización) mostró un SPF de 246 % (preinmersión) y un SPF de 268 % (posinmersión) del SPF de la muestra 1. Los datos demuestran que las composiciones de la invención son composiciones de pantalla solar muy resistentes al agua basadas en las diferencias insignificantes entre los valores de SPF antes y después de la inmersión.

REIVINDICACIONES

1. Un procedimiento para aumentar el SPF para una composición anhidra que comprende al menos un agente activo de protección solar y al menos un polímero formador de película, en el que el polímero formador de película comprende una pluralidad de grupos ácidos, el procedimiento comprende añadir un agente neutralizante basado en amina a la composición en una cantidad eficaz para neutralizar al menos una porción de los grupos ácidos en dicho polímero formador de película, en el que el polímero formador de película está presente en una cantidad superior al 1 % en peso de la composición final;
- 5 y dicho agente neutralizante a base de amina es:



- 10 en el que R_8 es un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralqueno o aralquino de cadena lineal, ramificada o cíclica, de C_2 a aproximadamente C_{36} y R_9 se selecciona entre H o CH_3 , o un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquilo, aralqueno o aralquino de cadena lineal, ramificada o cíclica de C_2 a C_{36} , y en el que x e y son independientemente de 0 a 100; o que tiene la estructura:



- 15 en la que R_{10} , R_{11} , y R_{12} se seleccionan independientemente entre H, CH_3 o un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquilo, aralqueno o aralquino de cadena lineal, ramificada o cíclica de C_2 a aproximadamente C_{36} , y en el que n es de 0 a 100;
- 20 o se selecciona entre alquilaminas; alquenilaminas; dialquilaminas; dialquenilaminas; dimetilalquilaminas, en el que alquilo es estearilo o cocoilo; metildialquilaminas, en el que el alquilo es estearilo o hexadecilo; y dimetilalquenilaminas, en el que el alquenilo es oleico, linoleico o linolenico;
- en el que al menos el 10 % de los grupos ácidos del polímero que forma películas se neutralizan mediante el agente de neutralización basado en amina.

2. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que el polímero formador de película está presente en una cantidad de más del 1 % al 10 % en peso de la composición final.
- 25 3. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que el polímero formador de película está presente en una cantidad de más del 1 % al 5 % en peso de la composición final.
4. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que el polímero formador de película está presente en una cantidad de más del 1 % al 3 % en peso de la composición final.
5. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que al menos el 25 % de los grupos ácidos del polímero que forma películas se neutralizan mediante el agente de neutralización basado en amina.
- 30 6. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que al menos el 50 % de los grupos ácidos del polímero que forma películas se neutralizan mediante el agente de neutralización basado en amina.
7. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que dichos grupos ácidos en el polímero formador de película comprenden grupos de ácido carboxílico, grupos de ácido sulfónico, grupos de ácido fosfórico o una combinación de los mismos.
- 35 8. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que el agente neutralizante a base de amina es dimetilestearilamina.
9. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que el agente neutralizante basado en amina se selecciona entre: metil dicocamina, dimetil soyamina, dimetil cocamina, PEG-2 soyamina, PEG-2 cocamina, PEG-5 soyamina, PEG-5 cocamina, PEG-15 soyamina y PEG-15 cocamina.
- 40 10. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que el polímero formador de película es un copolímero de acrilatos/octilacrilamida.