



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 220 984**

51 Int. Cl.:
A61Q 17/04 (2006.01)
A61K 8/06 (2006.01)
A61K 8/27 (2006.01)
A61K 8/29 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA MODIFICADA

T5

96 Número de solicitud europea: **96925256 .8**
96 Fecha de presentación : **07.06.1996**
97 Número de publicación de la solicitud: **0831766**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **01.04.1998**

54 Título: **Composiciones antisolares.**

30 Prioridad: **08.06.1995 US 495734**
07.06.1996 US 660130

45 Fecha de publicación de la mención y de la traducción de patente europea: **16.12.2004**

45 Fecha de la publicación de la mención de la patente europea modificada BOPI: **15.03.2010**

45 Fecha de publicación de la traducción de patente europea modificada: **15.03.2010**

73 Titular/es: **JOHNSON & JOHNSON CONSUMER COMPANIES, Inc.**
Grandview Road
Skillman, New Jersey 08558-9418, US

72 Inventor/es: **Lukenbach, Elvin, R.;**
Naik-Satam, Prakash;
Stutzman, Ralph y
Holland, Jean

74 Agente: **Ungría López, Javier**

ES 2 220 984 T5

ES 2 220 984 T5

DESCRIPCIÓN

Composiciones antisolares.

5 Solicitudes relacionadas

Esta solicitud es una continuación en parte de la EE.UU. N° de Serie 08/495734, presentada el 8 de Junio de 1995 e incorpora aquí como referencia esa solicitud y la materia objeto de la misma.

10 Campo de la invención

Esta invención se relaciona con nuevos y útiles agentes y composiciones de filtro solar para la radiación ultravioleta que exhiben una mayor protección y con métodos de protección de la piel humana frente a los efectos potencialmente perjudiciales de la luz solar.

15 Antecedentes de la invención

Aunque se ha considerado desde hace mucho tiempo que un bronceado es un símbolo de estado indicativo de buena salud y de la capacidad de asegurarse tiempo de ocio suficiente para disfrutar de actividades al aire libre, tales como la natación, el tenis, el golf, el esquí y similares, se ha hecho muy evidente que la excesiva exposición de la piel humana a la luz del sol es perjudicial.

Está bien documentado que la piel humana es sensible a la luz del sol y a la luz artificial que contiene radiación de longitudes de onda de entre aproximadamente 290 nanómetros (nm) y 400 nm. Se sabe que la radiación ultravioleta de longitudes de onda de entre aproximadamente 290 nm y 320 nm (región UV-B) produce rápidamente efectos perjudiciales sobre la piel, incluyendo enrojecimiento o eritema, edema, formación de ampollas u otras erupciones cutáneas en casos más graves. La exposición prolongada o crónica a la radiación de este espectro de longitudes de onda ha sido asociada a condiciones graves de la piel, tales como queratosis actínicas y carcinomas. En los últimos años, también se ha expresado preocupación acerca de la radiación ultravioleta de longitudes de onda por encima de los 320 nm (región UV-A) y de los efectos adversos de dicha radiación sobre la piel humana. La radiación de entre 320 y 400 nm contribuye también al envejecimiento prematuro de la piel. Además, estudios recientes indican que la exposición crónica al sol limita la respuesta inmune de la piel. También hay evidencia de que un bronceado ofrecerá alguna protección frente a las quemaduras, pero es bastante ineficaz frente a otros tipos de lesión solar.

La creciente conciencia del público de que el disfrute de actividades al aire libre debe ir de la mano de una adecuada protección solar ha dado lugar a un crecimiento sin precedentes en el área de los productos de filtros solares. Un producto de filtro solar deseable tendría que tener los siguientes atributos: protección en los espectros de radiación ultravioleta tanto UV-A como UV-B; mantenimiento de una cobertura, es decir, a prueba de agua y a prueba de transpiración; aplicación y conveniencia de uso, es decir, facilidad de aplicación, invisibilidad, que no produzca manchas y que no sea grasiento, y que esté libre de irritación como resultado de sus ingredientes, en particular sus ingredientes de filtro solar activos. De reciente interés en esta área han sido algunas cuestiones sobre los problemas de irritación y sensibilización que pueden producirse en algunos individuos que utilizan productos de filtro solar con altos valores SPF que contienen agentes de filtro solar orgánicos.

La efectividad de un producto de filtro solar viene indicada por su factor de protección solar ("SPF"). El factor de protección solar es la razón de la cantidad de exposición (dosis) requerida para producir una reacción mínima de eritema en la piel protegida con respecto a la cantidad requerida para producir la misma reacción en piel no protegida. La dosis absoluta difiere de una persona a otra y es en gran medida dependiente de la predisposición genética y el origen étnico de la persona. Si una persona necesitaría normalmente una exposición de diez minutos a la luz solar para desarrollar una reacción mínima de eritema, esta persona debería poder tolerar, al usar un producto de filtro solar de SPF 15, hasta 150 minutos de luz solar antes de desarrollar un mínimo eritema. La reciente conciencia del público de los problemas de exposición a la luz solar ha conducido a una demanda de productos de filtro solar con altos valores SPF, es decir, con un SPF 8 o superior.

La facilidad de aplicación y el atractivo cosmético, por otra parte, son importantes en la formulación de composiciones de filtros solares. Estas características se basan en evaluaciones subjetivas, tales como la impresión visual y táctil por parte del usuario. Los estudios de investigación entre los consumidores indican que una formulación de filtro solar debe ser fácilmente aplicada por frotación, dejar la piel sin pegajosidad y, sobre todo, ser invisible sobre la piel tras su aplicación. Se ha visto que las composiciones de filtros solares que contienen agentes de filtro solar orgánicos son, en algunos casos, irritantes para la piel. Por lo tanto, se ha hecho uso de agentes de filtro solar orgánicos, tales como el dióxido de titanio y el óxido de zinc.

Por ejemplo, la Solicitud de Patente Japonesa N° 1981-161.881 describe cosméticos que contienen un 0,1-40% de óxido de titanio dividido ultrafino con un tamaño de partícula de 10-30 nanómetros (nm) a los que se ha hecho hidrofóbicos. Indica que, cuando se mezcla dióxido de titanio tratado hidrofóbicamente con un tamaño de partícula de 10-30 nm en materiales de base cosmética, éste transmite luz visible pero refleja y dispersa los perjudiciales rayos ultravioleta. Se ha visto que cuando se utilizan estas composiciones de dióxido de titanio como agente de filtro solar

ES 2 220 984 T5

en composiciones de filtro solar, esto puede dar lugar a la pérdida de una de las propiedades más deseadas de dichas composiciones, es decir, la invisibilidad.

5 La Patente EE.UU. # 5.028.417, concedida el 2 de Julio de 1991, describe composiciones de filtro solar que contienen dióxido de titanio microfino. Se requiere que el tamaño de partícula del dióxido de titanio sea menor de 10 nm. También dice que se pueden utilizar otros agentes de filtro solar con el dióxido de titanio.

10 La Patente EE.UU. # 5.340.567, concedida el 23/8/94, describe una composición de filtro solar consistente en una combinación sinérgica de dióxido de titanio que tiene un tamaño de partícula de menos de aproximadamente 35 nm y óxido de zinc que tiene un tamaño de partícula de menos de aproximadamente 50 nm, estando presentes el dióxido de titanio y el óxido de zinc en proporciones dadas.

15 La Patente Alemana Nº 3.642.794 (1987) describe una composición cosmética para prevenir las quemaduras solares que contiene un 1-25% de óxido de zinc de un tamaño de partícula de 70-300 micras. También indica que la composición puede también contener dióxido de titanio de un tamaño de partícula de 30-70 micras. Esta composición no es deseable debido a sus características de blancura no estéticas a altos niveles de SPF.

20 La Patente EE.UU. 5.188.831, concedida el 23 de Febrero de 1993, describe composiciones de filtro solar en las que se obtiene el efecto de filtro solar gracias a una mezcla de dióxido de titanio ultrafino dispersable en aceite y dióxido de titanio dispersable en agua. Sin embargo, el nivel de SPF obtenido es sólo de 10 con una concentración total de dióxido de titanio del 5,0% p/p.

25 La Solicitud de Patente Mundial WO 90/06103, publicada el 14 de Junio de 1990, describe filtros solares de dióxido de titanio donde las partículas de dióxido de titanio microfino están revestidas con un fosfolípido, ya sea a través del uso de un molino de polvo o a través de la preparación de una dispersión en una fase oleosa que contenga el fosfolípido con una mezcladora de alto corte. El dióxido de titanio revestido de fosfolípido es entonces incorporado a composiciones de filtro solar. Se reivindica una elevada eficiencia: los datos presentados muestran valores de SPF de hasta 11 para una concentración de dióxido de titanio del 3,75% y de hasta 25 para una concentración de dióxido de titanio del 7,5%. El uso de una mezcladora de alto corte o de un molino de polvo es un proceso complicado e intensivo
30 en cuanto a energía.

EP 535972 A1, publicada el 07/04/93, describe un método de preparación de filtros solares en el que se forma una dispersión de partículas de óxido de zinc y/o de dióxido de titanio en un aceite por molienda.

35 EP 619999 A2, publicada el 19/10/94, describe una dispersión acuosa de óxido metálico particulado de un tamaño de partícula menor de 200 nm mezclado con un emulsor y una fase oleosa y también un filtro solar hidrofóbico orgánico para formar una emulsión de ac/ag. La composición de protección solar resultante tiene un SPF mayor que lo que se esperaría si sólo hubiera un efecto aditivo. Sin embargo, el dióxido de titanio solo a un 4% dio un SPF de sólo 7 a aproximadamente 11.
40

EP 628303, publicada el 19/10/94, describe un procedimiento para preparar una composición de filtro solar. Consiste en mezclar partículas de filtro solar de óxido metálico de menos de 200 nm dispersas en un aceite con uno o más emulsores y/o filtros solares orgánicos. Se reivindica que la composición de filtro solar resultante tiene un valor de SPF considerablemente mayor que el esperado. El alto SPF es sólo obtenido cuando se mezcla un óxido metálico con un filtro solar orgánico. Ciertamente, cuando no se usa ningún filtro solar orgánico, el valor de SPF es sólo de aproximadamente 7.
45

WO 93/11742 describe composiciones de filtro solar consistentes en dióxido de titanio y óxido de hierro de un tamaño de partícula menor de 200 nm, preferiblemente revestidos con un fosfolípido.
50

Un artículo publicado en DCI en Septiembre de 1992 por Tioxide Specialties Ltd. describe varias formas de incorporar dispersiones en aceite o en agua de dióxido de titanio en emulsiones. Sin embargo, no se da ningún dato sobre los valores SPF resultantes.

55 Un artículo publicado en Cosmetics and Toiletries, Vol. 107, Octubre de 1992, describe varias formas de formular con un bloque solar físico. La discusión se centra en el uso de dióxido de titanio en una dispersión o en el uso de un emulsor que es también un agente dispersante efectivo para el dióxido de titanio. Dice que se pueden conseguir SPF muy por encima de 20. Sin embargo, no se dan ejemplos ni se hace mención en el artículo de los componentes de filtro solar específicos o de sus composiciones.
60

Un folleto publicado por la Tioxide Company el 15 de Marzo de 1994 describe filtros solares inorgánicos de altos valores SPF obtenidos sin la adición de ningún filtro solar orgánico. Cuando se midió, el SPF de las composiciones de filtro solar era ciertamente el descrito. Sin embargo, cuando se midió la concentración de dióxido de titanio, ésta era al menos el doble de la reivindicada.
65

La Patente EE.UU. 5.498.406 describe composiciones de filtro solar en una emulsión de aceite-en-agua que contiene filtros solares tanto orgánicos como inorgánicos y que incluye alcoholes de cadena larga (C₂₅₋₄₅) para la estabilización de la emulsión. Esta composición se basa predominantemente en principios activos de filtro solar orgánicos.

ES 2 220 984 T5

Aunque los autores mencionan el uso de ácido esteárico como parte de la composición de aceite en agua, están en contra del uso del ácido esteárico en la estabilización del dióxido de titanio sin alcoholes C₂₂₋₄₅.

5 Se comercializó un filtro solar a finales de los 80 bajo la marca SUNDOWN[®], que contenía ingredientes de filtro solar tanto orgánicos como inorgánicos. Además, contenía Velsan D8P3 y ácido esteárico. Sin embargo, no era un filtro solar eficiente, a pesar de la adición de ingredientes de filtro solar tanto orgánicos como inorgánicos.

10 La Solicitud de Patente Mundial WO 90/11067, publicada el 4 de Octubre de 1990, describe composiciones de filtro solar que consisten en una mezcla de diferentes tamaños de partícula de dióxido de titanio. Las composiciones de filtro solar son descritas como substancialmente transparentes sobre la piel, ofreciendo no obstante una adecuada protección UV-A y UV-B.

15 La Patente EE.UU. 5.207.998 describe composiciones para el cuidado solar que contienen entre un 0,1% y un 25% de dióxido de titanio junto con octocrileno (un absorbente de UV) y un vehículo tópico.

20 La Solicitud de Patente Mundial WO 94/04131, publicada el 3 de Marzo de 1994, describe composiciones de filtro solar con mejor fotoestabilidad, la cual se consigue combinando un filtro solar de dibenzoilmetano (absorbente de UV-A) con un filtro solar de bencilidenal-canfor (absorbente de UV-B). Se describe que, en algunas realizaciones, las composiciones pueden contener de aproximadamente un 0,1% a aproximadamente un 25% de un bloque solar físico inorgánico, tal como dióxido de titanio.

Objetos de la invención

25 Es, por lo tanto, un objeto de la presente invención aportar agentes y composiciones de filtro solar mejorados.

Es otro objeto de la presente invención aportar composiciones de filtro solar que contienen agentes de filtro solar que superan los inconvenientes de los materiales hasta ahora disponibles y proporcionar una protección adecuada y segura para la piel humana.

30 Es un objeto más de esta invención proporcionar métodos de protección de la piel humana frente a los efectos perjudiciales de la luz solar.

Estos y otros objetos y características de la invención resultarán fácilmente evidentes para un experto en la técnica gracias a la descripción detallada que se da a continuación.

Resumen de la invención

40 Los anteriores objetos y otras características y ventajas de la presente invención son conseguidos mediante composiciones de filtro solar que contienen agentes de filtro solar inorgánicos como ingredientes activos. Más concretamente, la presente invención se relaciona con composiciones de filtro solar que contienen dióxido de titanio y, eventualmente, óxido de zinc de rangos de tamaño de partícula preferidos, y en cantidades y proporciones preferidas, como agentes de filtro solar.

45 Estas composiciones específicas permiten el uso de cantidades mucho menores de los ingredientes activos de filtro solar que lo que se podía alcanzar previamente, consiguiendo aun así los altos valores SPF deseados para las composiciones y sin la desagradable blancura que aparece en las composiciones de filtro solar anteriores a concentraciones por encima de aproximadamente el 5%. En las composiciones de filtro solar de esta invención, se pueden usar concentraciones considerablemente mayores de dióxido de titanio sin incurrir en un efecto blanqueante, por ejemplo de incluso hasta un 15%, con un aspecto aceptable, o posiblemente mayores.

50 Más aún, nuestra invención no se basa en el uso de preparaciones hidrofílicas de dióxido de titanio como se requería en la patente antes citada, ni se trata de procesos intensivos en cuanto a energía, tales como la molienda de polvo, ni se requieren agentes activos de filtro solar orgánicos para la elevada eficacia.

55 Las composiciones de esta invención son emulsiones de aceite-en-agua que contienen al menos los siguientes componentes:

(a) un agente de filtro solar inorgánico, tal como dióxido de titanio u óxido de zinc o una mezcla de éstos;

60 (b) un emulsor aniónico seleccionado entre el grupo siguiente: sales de ácidos grasos saturados, sales de ácidos grasos de cadena lineal, sulfosuccinatos de alquilo, fosfatos de alquilo y mezclas de los mismos; y

(c) un componente oleoso que contiene un aceite vehiculizante y al menos un emoliente, como se definen en la reivindicación 1.

65 Las composiciones de esta invención proporcionan formulaciones de filtro solar que tienen un SPF de al menos 10 con un nivel de concentración de dióxido de titanio de aproximadamente el 4%. Las composiciones de esta invención exhiben usos extremadamente eficaces de componentes de filtros solares, particularmente dióxido de titanio. Las

ES 2 220 984 T5

composiciones de esta invención pueden ser, por lo tanto, formuladas, para contener cantidades de dióxido de titanio relativamente inferiores a las usadas hasta la fecha a un nivel dado de SPF.

5 Esencialmente, las composiciones de esta invención son fácilmente preparadas simplemente mezclando y proporcionan una excelente dispersión del agente de filtro solar inorgánico por toda la composición, asegurando así una cobertura uniforme de la piel. Son substancialmente invisibles tras su aplicación a la piel.

Descripción detallada de la invención

10 Las composiciones de filtro solar de esta invención dan capacidades de bloqueo ultravioleta (UV) altamente efectivas, es decir, que se obtiene un nivel de protección con una concentración significativamente inferior de dióxido de titanio que el previamente obtenido usando dióxidos de titanio en polvo comerciales. No requieren los métodos de procesamiento inusuales previamente necesarios para dispersar el dióxido de titanio en un aceite, tales como la preparación de bases de molienda para sublotos, la mezcla o la molienda de alto corte o la aplicación de dichos procedimientos de molienda a la formulación del producto final. Las composiciones de filtro solar de dióxido de titanio 15 típicas de SPF 15 requieren niveles de dióxido de titanio que imparten un efecto blanqueante significativo a la piel; las composiciones de esta invención minimizan este inconveniente.

20 Las composiciones de esta invención son emulsiones de aceite-en-agua cosméticamente superiores a las preparaciones convencionales de filtro solar inorgánico, incluyendo las formulaciones de agua-en-aceite de dióxido de titanio solamente, a valores de SPF equivalentes, debido a los bajos niveles de dióxido de titanio necesarios en el sistema de la invención. Las composiciones de esta invención pueden ser usadas para la protección solar en el uso diario o para productos faciales, así como para situaciones recreacionales. Debido a la eficiencia del sistema, las formulaciones de la invención tienen un coste significativamente menor que otros sistemas de filtro solar.

25 Existen varios ingredientes que contribuyen a la inesperadamente alta eficacia del bloqueo de las composiciones de la radiación UV. Estos elementos incluyen los siguientes materiales:

30 Las composiciones de esta invención deben incluir uno o más de un grupo selecto de emulsores aniónicos según lo definido antes. En particular, son útiles las sales de determinados ácidos grasos en las formulaciones de esta invención, preferiblemente las sales de ácidos grasos saturados y/o las sales de ácidos grasos de cadena lineal. Las sales de metales alcalinos, las sales de metales alcalinotérreos y las sales de aminas son más preferibles para uso en las composiciones de esta invención. Por ejemplo, el ácido esteárico y sus sales son útiles como emulsores en las composiciones de esta invención, mientras que el uso de sales isoestearato tiende a producir una composición que no es muy eficiente 35 en el uso de filtros solares. De igual modo, las sales oleato no son útiles, ya que son insaturadas y no dan lugar a composiciones de filtro solar eficientes.

40 Más concretamente, los siguientes emulsores aniónicos son útiles en las composiciones de esta invención: estearato de sodio, fosfato de DEA-cetilo, dioctilsulfosuccinato de sodio y similares. Más preferiblemente, el emulsor debe ser estearato de sodio. Aunque no se entiende por completo por qué algunas sales de ácidos grasos dan lugar a una composición de la invención, se tiene la teoría de que se prefieren las sales de ácidos grasos de cadena lineal (cuyos ácidos grasos tienen un punto de fusión relativamente alto, por encima de 70°C o superior) debido a su estructura. Por ejemplo, las sales de ácidos grasos ramificados o insaturados no son aceptables para uso en las composiciones de esta invención.

45 Los emulsores aniónicos deben estar presentes en las composiciones de esta invención en una cantidad de aproximadamente un 0,01 a aproximadamente un 10%, más preferiblemente de un 0,1 a aproximadamente un 7% y más preferiblemente de aproximadamente un 0,5 a aproximadamente un 5%. Puede haber emulsores adicionales presentes en las composiciones de esta invención, tales como emulsores no iónicos conocidos para quienes tienen conocimientos ordinarios en la técnica, tales como ésteres de sorbitán y ésteres de sorbitán etoxilados, ácidos grasos etoxilados, alcoholes grasos y alcoholes grasos etoxilados, ésteres de glicéridos grasos y ésteres de glicéridos grasos etoxilados y similares. Sin embargo, debe haber al menos un emulsor aniónico presente para conseguir los productos de esta invención. Los emulsores de sales de ácidos grasos pueden ser añadidos a la composición como sal o se puede formar 50 la sal *in situ*.

55 Está presente en las composiciones de esta invención un aceite vehiculizante. Puede ser seleccionado entre el grupo de ésteres de ácidos grasos interrumpidos con poliéteres.

60 Más preferiblemente, el aceite vehiculizante debe ser un éster polietilenoxi(eventualmente polipropilenoxi)carboxilato de alquilo graso C₈ a C₂₂, cuyo éster tiene un grupo alquilo que tiene de uno a veintidós átomos de carbono, eventualmente lineal o ramificado, o puede contener un grupo fenilo. Más preferiblemente, el aceite vehiculizante debe ser un PPG-2 isodeceth-7 carboxilato de isopropilo, tal como Velsan D8P3 u otros materiales comerciales vendidos por Clariant bajo la denominación comercial Velsan. Otras estructuras similares incluyen Hetester PHA de Bernel.

65 Preferiblemente, el aceite vehiculizante debe estar presente en la composición en una cantidad de entre aproximadamente el 0,1% y aproximadamente el 10%. Más preferiblemente, debe estar presente en una cantidad de entre aproximadamente el 1% y aproximadamente el 5%. Más preferiblemente, debe estar presente en una cantidad de entre aproximadamente un 2% y aproximadamente un 3%.

ES 2 220 984 T5

La fase oleosa contiene al menos dos materiales, el aceite vehiculizante y un emoliente seleccionado entre aceites minerales, aceites ésteres, aceites vegetales, siliconas, emolientes sintéticos tales como ésteres de ácidos grasos y similares. Este emoliente está presente en la formulación en una proporción con respecto a la concentración del vehículo de 1:1 a 3:1, más preferiblemente de aproximadamente 2:1. El aceite vehiculizante y el emoliente deben componer entre aproximadamente un 2% y aproximadamente un 20% de la composición en peso.

El tercer elemento que debe estar presente en las composiciones de esta invención es un compuesto de filtro solar inorgánico, tal como dióxido de titanio, óxido de zinc o sus combinaciones. Preferiblemente, se ha de usar dióxido de titanio que tenga un tamaño de partícula primaria de menos de aproximadamente 300 nm de diámetro. Debe estar presente en la composición en una cantidad de aproximadamente un 2% a aproximadamente un 25%. Más preferiblemente, debe estar presente en una cantidad de aproximadamente un 2% a aproximadamente un 15%. Más preferiblemente, debe estar presente en una cantidad de aproximadamente un 3% a aproximadamente un 10%. El compuesto de filtro solar inorgánico debe ser dispersable en agua y puede estar presente con o sin revestimiento de superficie.

La razón de dióxido de titanio con respecto al peso del aceite vehiculizante y el emoliente combinados debe ser de aproximadamente 0,3:1 a aproximadamente 1:1. Más preferiblemente, la razón debe ser de entre aproximadamente 0,5:1 y 2:3. Por ejemplo, una composición que contenga un 15% de dióxido de titanio, un 8,33% de Velsan D8P3, un 12,5% de Miglyol 812 y el resto de la composición idéntico al de la del Ejemplo 1 que se dará más adelante, da lugar a una composición de filtro solar que tiene un SPF de 43. El valor de blancura de esta composición es aceptable y es sólo ligeramente blanqueante sobre la piel.

En caso de usar sales de ácidos grasos, se ha de tener cuidado en mantener el pH de las composiciones de esta invención a un nivel superior a aproximadamente 5, más preferiblemente superior a aproximadamente 5,5. El mantenimiento del pH a este nivel asegurará que estos emulsores aniónicos permanecen en la forma salina, lo que es importante para conservar la estabilidad y la eficacia de la composición. Cuando se usan los otros emulsores aniónicos citados, la estabilidad y la eficacia de la composición no resultan afectadas por debajo de dichas limitaciones de pH.

Adicionalmente, los elementos usuales de un sistema en emulsión de filtro solar moderno, tales como un espesante/estabilizante polimérico, uno o más aceites emolientes adicionales, conservantes microbianos, agentes de estanqueidad al agua, antioxidantes, fragancias, humectantes y, por supuesto, el vehículo acuoso, son utilizados sin selección o restricción conocidas.

La formulación básica de las composiciones de esta invención puede ser también usada como composiciones vehiculizantes para agentes tópicos activos que tienen efectos dermatológicos, incluyendo agentes de despigmentación, ingredientes antienvjecimiento, agentes antifúngicos, agentes antimicrobianos, repelentes de insectos y similares. Por ejemplo, los agentes de despigmentación pueden incluir ascorbilfosfato de magnesio o hidroquinona. Los agentes antienvjecimiento pueden incluir compuestos retinoides y alfa-hidroxiácidos. Los agentes antifúngicos que pueden ser incluidos en las composiciones de esta invención incluyen compuestos azol, incluyendo ketoconazol y similares. Los agentes antimicrobianos pueden incluir triclosán. Se pueden incluir fragancias repelentes de insectos en las composiciones de esta invención. Se pueden administrar a la piel otros productos conocidos para quienes tienen conocimientos ordinarios en la técnica usando las composiciones de esta invención. Las composiciones de esta invención deberían tener entonces capacidad de doble acción, ya que contendrían tanto agentes de filtro solar como otros agentes activos para proteger y/o tratar la piel.

Las composiciones de esta invención pueden ser incorporadas en diversos productos cosméticos y para el cuidado personal, tales como lociones para las manos y para el cuerpo, aceites, ungüentos, productos de bálsamo para los labios, cosméticos faciales y similares.

Las composiciones de filtro solar de esta invención pueden ser preparadas usando uno de al menos dos métodos: un método de dos recipientes, en donde se preparan individualmente las fases oleosa y acuosa, y un método de un recipiente, al que se añaden todos los ingredientes en un orden específico seleccionado. Cualquiera de estos procedimientos producirá una emulsión lisa y uniforme de color blanco a marfil claro.

Según el procedimiento de dos recipientes, se prepara una fase acuosa midiendo agua desionizada en un vaso de precipitados y mezclando. Se deben añadir los elementos de la fase acuosa, incluyendo emulsores y humectantes, quelantes, espesantes, agentes de estanqueidad al agua, agentes neutralizantes y antioxidantes, y se debe calentar la solución. Se puede poner el emulsor aniónico en la fase acuosa o en la fase oleosa, dependiendo de la naturaleza del emulsor. Se prepara la fase oleosa por separado en otro recipiente, incluyendo el emulsor aniónico, el aceite vehiculizante, el emoliente y el agente de filtro solar inorgánico. Se mantienen entonces las dos fases a una temperatura relativamente alta y se mezclan.

Más concretamente, en el procedimiento de dos recipientes se prepara la fase acuosa midiendo agua desionizada en un vaso de precipitados y mezclando. A continuación, se debe añadir Carbopol 940 (de B.F. Goodrich de Cincinnati, Ohio) y mezclar la composición hasta quedar apropiadamente hidratada. Se deben añadir entonces propilenglicol y EDTA y se debe mezclar la composición hasta conseguir una solución homogénea. Se debe calentar entonces la solución a 70-80°C para la separación de fases.

ES 2 220 984 T5

Se prepara entonces la fase oleosa añadiendo los siguientes ingredientes a un vaso de precipitados: BHT, Velsan D8P3 (de Clariant Corporation, Charlotte, North Carolina), ácido esteárico, alcohol cetílico y Mi-glyol 812 (de Huls Company de Piscataway, New Jersey). Se debe poner el vaso de precipitados en un baño de agua sobre una placa caliente eléctrica. Se han de calentar los ingredientes a aproximadamente 80°C o hasta que se fundan. Se debe añadir el dióxido de titanio lentamente y agitar la composición a alta velocidad hasta quedar homogénea. Se debe mantener la mezcla a aproximadamente 80°C hasta la formación de fases.

Se pueden formar entonces las fases de la composición añadiendo la fase oleosa a la fase acuosa y mezclando, manteniendo la temperatura a aproximadamente 80°C durante 5 minutos. Se debe añadir luego hidróxido de sodio (como solución al 10%) y mezclar la composición durante 5 minutos a alta velocidad. A continuación, se ha de reducir la velocidad de mezcla e iniciar el enfriamiento. Cuando la temperatura del lote alcanza los 40-45°C, se añade Dowicil 200 (una solución al 33% de Quaternium 15 de Dow Chemical Company, Dearborn, MI) y, eventualmente, fragancia. Se debe comprobar el pH y ajustarlo a un valor por encima de pH 5,0 con una solución al 10% de hidróxido de sodio, caso de ser necesario. Se puede añadir agua desionizada según sea necesario para llevar el lote al peso final. Cuando la temperatura del lote alcanza los 28-32°C, se puede interrumpir la mezcla y el enfriamiento.

En el procedimiento de un recipiente, se pueden preparar las fases acuosa y oleosa en el mismo recipiente, siempre que se añadan los componentes en un orden apropiado. Por ejemplo, se ha de crear primeramente la fase acuosa, añadiendo agua y eventualmente ciertos emulsores que sean compatibles con la fase acuosa al recipiente. Se debe calentar el recipiente a una temperatura de aproximadamente 85°C a aproximadamente 95°C. Una vez la temperatura ha alcanzado este nivel, se pueden añadir los componentes de la fase oleosa, incluyendo, eventualmente, el emulsor aniónico si es compatible con la fase oleosa y el aceite vehiculizante, así como cualesquiera emulsores de fase oleosa, antioxidantes y emolientes adicionales que se puedan desear. Se ha de mantener la temperatura a este nivel durante aproximadamente 15 minutos y añadir el agente de filtro solar inorgánico lentamente, y mezclar la composición durante un período de tiempo de al menos aproximadamente 30 minutos. Después de enfriar, el pH puede ser entonces comprobado y ajustado caso de ser necesario y se puede añadir Dowicil, un conservante, así como fragancia eventual.

Más concretamente, se puede añadir agua desionizada a un vaso de precipitados al que se añade lentamente Carbopol 940. A continuación, se añade EDTA y se mezcla la composición a alta velocidad durante 15-20 minutos o hasta que el Carbopol se haya hidratado apropiadamente. Se debe iniciar el calentamiento de la mezcla a 92-95°C y añadir la cantidad requerida de propilenglicol durante este tiempo. Cuando la temperatura ha alcanzado 92-95°C, se añaden BHT, Velsan D8P3, ácido esteárico, alcohol cetílico y Miglyol 812. Se debe mantener la temperatura de la mezcla a aproximadamente 92-95°C durante aproximadamente 15 minutos. Se debe añadir entonces dióxido de titanio y mezclar la composición durante 30 minutos. Se debe añadir hidróxido de sodio (como solución al 10%) y mezclar la composición durante 30 minutos a 88-92°C. Se debe enfriar la composición y añadir Dowicil 200 a 40°C, así como una fragancia eventual. Se debe ajustar el pH a un pH superior a 5,0 con hidróxido de sodio. Finalmente, se debe añadir agua suficiente para llevar el lote al peso pretendido.

Los siguientes ejemplos sirven como ilustraciones de las composiciones de esta invención; sin embargo, no limitan el alcance de la invención aquí descrita.

Ejemplo 1

Se añadieron 743,07 ml de agua desionizada a un vaso de precipitados. Se añadieron entonces lentamente 2,5 gramos de Carbopol 940 (de B.F. Goodrich de Cincinnati, Ohio) al vaso de precipitados. Se añadió luego 1,0 gramo de EDTA disódico y se mezcló la composición a alta velocidad durante 15-20 minutos o hasta que el Carbopol se hubiera hidratado apropiadamente. Se calentó la mezcla a 92-95°C y se añadieron 30 gramos de propilenglicol. Cuando la temperatura alcanzó los 92-95°C, se añadieron 0,5 g de BHT, 25 gramos de Velsan D8P3 (de Clariant Corporation, Charlotte, NC), 50 gramos de ácido esteárico, 10 gramos de alcohol cetílico y 37,5 gramos de Miglyol 812 (de Huls Company de Piscataway, New Jersey). Se añadieron entonces 45 gramos de dióxido de titanio MT-100T (un dióxido de titanio microfino revestido de estearato de aluminio de Tri-K Industries, Emerson, NJ) al recipiente y se mezcló la composición durante 30 minutos a 88-92°C. Se inició el enfriamiento y, cuando la composición alcanzó los 40°C, se añadieron 3 gramos de Dowicil 200 (una solución al 33% de Quaternium 15), así como 2,5 gramos de fragancia. Se ajustó el pH a 8-8,5 con 49,93 gramos de una solución al 10% de hidróxido de sodio (el pH deseado es de 8,25). Finalmente, se añadió suficiente agua desionizada para llevar el lote al peso deseado.

Se midió el SPF (factor de protección solar) *in vitro* de esta composición usando el sistema descrito por Cole y VanFossen [Cole, C., VanFossen, R. (1990), *In-vitro* model for UVB and UVA protection. En: Sunscreens: Development, Evaluation and Regulatory Aspects, N. Shaath y N. Lowe Eds., Marcel Dekker Pub., New York, N.Y.]. Resumiendo, este sistema consiste en la medición de la transmisión de radiación UV de simulación solar a través de la composición (2,0 mg/cm²) aplicada al sustrato, cinta Transpose™ en este caso. El sistema consiste en un sensor óptico que es sólo sensible a la radiación que produce quemaduras solares y tiene un espectro de sensibilidad similar al espectro de sensibilidad del eritema humano. El SPF es la razón de la señal óptica a través del sustrato sin filtro solar dividida por la señal óptica a través del sustrato revestido con el filtro solar.

El sistema es calibrado frente a una serie de filtros solares de SPF conocido (4 a 36) determinado *in-vivo* usando el método de la monografía de la FDA (Registro Federal, 25 de Agosto de 1978, Sunscreen drug products for over-

ES 2 220 984 T5

the-counter human drugs, pp. 38206-38269). El SPF resultante de la composición del Ejemplo 1 anterior es 16,9 y la composición es estéticamente satisfactoria y estable.

Ejemplo 2-13

En la siguiente serie de ejemplos, se investigó el uso de dióxidos de titanio de diferentes orígenes y/o tipos de revestimiento a la misma concentración del 4,5%. Se prepararon todas las composiciones según el método expuesto en el Ejemplo 1, con los mismos componentes en las mismas concentraciones, salvo para el componente variado. En la Tabla I se dan los resultados.

TABLA I

Efecto del revestimiento de TiO₂ sobre el SPF (4,5% TiO₂)		
Fuente de TiO₂	Tratamiento superficial	SPF
(2) MT-100T (Tri-K Industries, Inc.)	Al, ácido esteárico	16,9
(3) MT-500B (Tri-K Industries, Inc.)	Ninguno	13,6 9,9
(4) SMT-100SAS (Tri-K Industries, Inc.)	Metilhidrogenopolisiloxano	5,0
(5) UV Titan M262 (Presperse, Inc.)	Alúmina, dimeticona	18,0 12,0
(6) UV Titan M212 (Presperse, Inc.)	Alúmina, glicerina	8,5
(7) P25 (Degussa)	Ninguno	9,1
(8) STT65C-S (Kobo)	Ninguno	12,1
(9) DM140 KSI (Kobo)	STT65C-S tratado en superficie con silicona	11,5
(10) STT-30D-S (Kobo)	Al, Si, silicona	3,8
(11) STT-30S-L (Kobo)	Al, ácido esteárico	7,3
(12) TiO ₂ (hidrofóbico) (Creativa Polymers)	Meticona, dimeticona	12,0
(13) TiO ₂ (hidrofóbico) (Creativa Polymers)	Dimeticona copoliol	7,7

Ejemplos 14-17

En esta serie de ejemplos, se varió la concentración de dióxido de titanio y se midió el SPF resultante. Se preparan las fórmulas según el método expuesto en el Ejemplo 1 y difieren en concentración sólo en cuanto a la cantidad de dióxido de titanio. Se compensó la diferencia con agua desionizada.

Concentración de dióxido de titanio		SPF
MT-100T		
(14)	4,5%	17,1
(15)	6,0%	25,3
(16)	7,5%	20,4
(17)	15,0%	43,1

ES 2 220 984 T5

Ejemplos 18-38

Los siguientes ejemplos pretenden mostrar qué emulsores aniónicos dan lugar a un alto SPF. Las composiciones eran idénticas a la del Ejemplo 1, excepto por el hecho de que se varió el emulsor aniónico según la información expuesta en la siguiente Tabla II. Por los datos presentados en la Tabla II, puede verse que el dioc-tilsulfosuccinato de sodio, el fosfato de DEA-cetilo (Am-phisol) en las circunstancias correctas, el laurilsulfato de sodio y el estearato de sodio son todos efectivos en dar un SPF mayor de 10.

TABLA II

Efecto de emulsores aniónicos sobre el SPF	
	SPF
(18) Estearato de sodio (NaOH Neut.)-Ácido esteárico más hidróxido de sodio	11,6
(19) Estearato de sodio en fase acuosa	15,7
(20) Ácido isoesteárico al 5,0% sin Brij 721, sin ácido esteárico con Miglyol 812 y Velsan D8P3	4,5
(21) Ácido isoesteárico al 5,0% (añadido a H ₂ O+NaOH) con un 3,0% de Brij 721	8,6
(22) Ácido oleico al 5,0%, sin ácido esteárico, pH ajustado	6,1, 5,2
(23) Ácido láurico al 5,0%, sin ácido esteárico	6,4
(24) Amphisol al 2,0% con un 3,0% de Brij 721 y ácido esteárico, sin ajuste de pH	12,3
(25) Amphisol al 2,0% con Brij 721 y sin ácido esteárico	8,1
(26) Amphisol al 2,0% con Brij 721 y cera de abejas, sin ácido esteárico, sin ajuste de pH	15,1
(27) Laurilsulfato de sodio al 0,5% con ácido esteárico, 3,0% de Brij 721, sin ajuste de pH	15,0
(28) Avanel S150 (2,5%), Miglyol 812 (3,75%), ácido esteárico (5,0%), sin ajuste de pH	5,1 (2,3)
(29) Avanel S150 (2,0%), ácido esteárico (0%), Velsan D8P3 (2,5%), Miglyol 812 (3,75%), Brij 721 (3%)	3,2 (2,0)
(30) Avanel S150 (5,74%), Velsan D8P3 (0%), Miglyol 812 (0%)	7,0 (2,6)
(31) Brij 721 al 2,7%, Brij 72 al 0,3% y Rewo-derm S1333 al 0,5%, sin ácido esteárico, pH=7	4,1
(32) Tween 60 al 2,7%, Span 60 al 0,3% y Rewo-derm S1333 al 0,5%, sin ácido esteárico, pH=7	4,2

ES 2 220 984 T5

5	(33) Diestearato de Glucam E-20 al 3,0% y Rewoderm S1333 al 0,5%, sin ácido esteárico, pH=7	3,8
10	(34) Glucam SSE-20 al 3,0%, Rewoderm S1333 al 0,5%, sin ácido esteárico, pH=7	3,5
15	(35) Lecitina al 1,0%, sin ácido esteárico, Brij 721 al 3,0%, sin ajuste de pH	3,0
20	(36) Aerosol OT-75 con ácido esteárico, Brij 721, sin ajuste de pH	11,2
25	(37) Aerosol OT-75 con ácido esteárico, Brij 721, estearato de sodio al 0,5%, sin ajuste de pH	16,2
	(38) Hamposyl C-30, sin ácido esteárico	5,9

Los nombres de marcas expuestos anteriormente se refieren a los siguientes compuestos:

Brij 721: Surfactante no iónico: polioxietilén 21 estearil éter.

Miglyol 812: Triglicérido cáprico/caprílico.

Velsan D8P3: PPG-2 isodeceth-7 carboxilato.

Rewoderm S-1333: Ricinoleamido-MEA-sulfosuccinato disódico.

Amphisol: Fosfato de DEA-cetilo.

Aerosol OT-75: Sulfosuccinato de dioctilsodio.

Hamposyl es un cocoilsarcosinato de sodio, un emulsor aniónico.

ES 2 220 984 T5

Ejemplos 39-46

Los siguientes ejemplos 39-46 demuestran que los emulsores no iónicos no dan lugar por sí mismos a un alto SPF. Las composiciones expuestas a continuación son idénticas a la del Ejemplo 1, excepto por las variaciones indicadas en la siguiente Tabla III.

TABLA III

Efecto de emulsores no iónicos sobre el SPF	
	SPF
(39) Alcohol cetílico al 6,0%, sin ácido esteárico, Brij 721 al 3,0% y sin ajuste de pH	2,7
(40) Monoestearato de glicerilo al 5,0%, Tween 60 al 2,0%, Arlacel 60 al 1,0%, sin ácido esteárico, pH=7	2,9
(41) Monoestearato de glicerilo al 5,0%, Brij 721 al 3,0%, sin ácido esteárico	5,1
(42) Brij 721 al 2,7%/Brij 72 al 0,3%, sin ácido esteárico, pH=7	2,5
(43) Tween 60 al 2,7%, Span 60 al 0,3%, sin ácido esteárico, pH=7	3,6
(44) Diestearato de Glucam E-20 al 3,0%, sin ácido esteárico	2,9
(45) Glucam SSE-20 al 3,0%, sin ácido esteárico	3,3
(46) Glucam P-20 al 5,0%, sin ácido esteárico	2,5

El Tween 60 es un monoestearato de polioxietilen(20)sorbitán.

El Arlacel 60 es un monoestearato de sorbitán.

El Arlacel 165 es un monoestearato de glicerol y estearato de polioxietileno.

El Span 60 es un monoestearato de sorbitán.

El diestearato de Glucam E-20 es un diestearato de metilgluceth 20.

El Glucam SSE-20 es un sesquiestearato de metilglucósido etoxilado (20).

ES 2 220 984 T5

Ejemplo 47-90

Los siguientes Ejemplos 47-90 muestran la importancia de usar aceites vehiculizantes en los productos de esta invención junto con aceites emolientes conocidos para quienes tienen conocimientos ordinarios en la técnica y de disponibilidad comercial. Son similares al Ejemplo 1, variando sólo el componente oleoso, según se indica a continuación. Las composiciones comprenden un emoliente, junto con Velsan D8P3, Velsan P83 o Hetester PHA, de acuerdo con la invención. Se incluyen otras composiciones para realizar comparaciones.

TABLA IV

Efecto de aceites simples y de mezclas de aceites	
	SPF ^{1,2}
(47) Finsolv TN (6,25%)	7,0
(48) Finsolv TN (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	15,8
(49) Finsolv TN (3,75%)/Velsan D8P3 (2,5%)	16,4 (4,1), 18,4 (4,4)
(50) Finsolv TN (3,125%)/Aceite mineral NF (3,125%)	9,1 (3,2)
(51) Finsolv TN (3,125%)/Cetiol 868 (3,125%)	8,2 (2,9)
(52) Miglyol 812 (6,25%)	8,9 (3,2)
(53) Velsan D8P3 (6,25%)	10,0 (3,3)
(54) Procetyl AWS (6,25%)	9,9 (3,4)
(55) Procetyl AWS (3,75%)/Velsan D8P3 (3,25%)	16,8 (4,2)
(56) Procetyl AWS (3,75%)/Miglyol 812 (2,5%)	10,6 (3,3)
(57) Procetyl AWS (3,125%)/Aceite mineral NF (3,125%)	10,7 (3,2)
(58) Procetyl AWS (3,125%)/Citmol 316 (3,125%)	11,6 (3,5)
(59) Miristato de isopropilo (6,25%)	8,7 (2,8), 5,3 (2,4)
(60) Miristato de isopropilo (3,75%)/Velsan D8P3 (2,5%)	13,0 (3,4)

ES 2 220 984 T5

5	(61) Cetiol 868 (7,25%)	8,7 (3,0)
	(62) Cetiol 868 (3,75%)/Velsan D8P3 (2,5%)	14,2 (3,7)
	(63) Aceite mineral, NF (6,25%)	6,7 (2,8)
10	(64) Aceite mineral, NF (3,75%)/Velsan D8P3 (2,5%)	15,2 (3,8)
	(65) Aceite mineral, NF (3,125%)/Citmol 316 (3,125%)	4,3 (2,4)
15	(66) Aceite mineral, NF (3,125%)/Minno 21 (3,125%)	4,6 (2,1)
	(67) Drakeol-7 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	6,9 (2,9)
20	(68) Klearol (5,0%)	11,0 (3,4)
25	(69) Klearol (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	6,6 (2,9), 5,4 (2,6), 7,0 (3,2), 7,7 (2,5)
30	(70) Arlamol E (6,25%)	5,3 (2,2)
	(71) Arlamol E (3,75%)/Velsan D8P3 (2,5%)	14,3 (3,4)
	(72) Dimeticona (6,25%)	7,3 (3,0)
35	(73) Dimeticona (3,75%)/Velsan D8P3 (2,74%)	14,1 (3,7)
	(74) Dimeticona (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	3,5 (2,0)
	(75) Miglyol 812 (3,0%)/Velsan D8P3 (2,5%)	15,1 (3,5)
40	(75A) Eumulgin L (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	11,8 (2,8)
	(76) Eumulgin L (6,25%)/Miglyol 812 (3,75%)	11,2 (3,6)
	(77) Crodamol ML (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	10,4 (3,0)
45	(78) Hetester PHA (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	13,1 (3,4)
50	(79) Procetyl 10 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	9,5 (3,0)
	(80) Marlox FK86 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	11,0 (3,0)
55	(81) Ucon 50 HB-660 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	9,4 (2,8)
	(82) Eumulgin B-2 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	12,5 (3,2)
60	(83) Eumulgin B-2 (6,25%)	9,3 (3,0)
	(84) Sandoxylate 424 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	13,0 (3,4)
65		

ES 2 220 984 T5

5	(85) Sandoxylate 418 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	12,8 (3,1)
10	(86) Sandoxylate 412 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	16,0 (3,3)
15	(87) Sandoxylate 408 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	15,1 (3,3)
20	(88) UCON 50 HB-660 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	9,4 (2,8)
25	(89) Velsan P83 (2,5%)/Miglyol 812 (3,75%)	11,0 (3,0)
30	(90) Miglyol 812 (3,0%)/Velsan D8P3 (2,5%)	15,1 (3,5)

¹ Los valores entre paréntesis indican factores de protección en la región UVA del espectro.

² Datos múltiples indican múltiples pruebas de formulación independientes.

Los nombres de las marcas mostrados anteriormente se refieren a los siguientes compuestos comerciales:

Eumulgin L: PPG-1-PEG-9 lauril glicol éter.

Hetester PHA: Isoceteth-3-acetato de PG.

Sandoxylates: PPG-2 isodeceth (4 a 12).

Eumulgin B2: Cetareth-20.

Procetyl AWS: PPG-2 ceteth-20.

Cetiol 868: Estearato de octilo.

Citmol 316: Citrato de triisocetilo.

Minno 21: Dioctanoato de neopentilglicol (y) neopentilglicol.

Drakeol-7: Aceite mineral.

Klearol: Aceite mineral.

Arlamol E: PPG-15 estearil éter.

Crodamol ML: Lactato de miristilo.

Procetyl 10: PPG-10 cetil éter.

Marlox FK86: PPG-8 deceth-6.

Ucon 50 HB-660: PPG-12 buteth-16.

Avanel S150: Pareth-15 C₁₂₋₁₅ sulfonato de sodio.

Velsan P8-3: Pareth-9 C₁₂₋₁₅ carboxilato de isopropilo.

ES 2 220 984 T5

Ejemplos 91-94

En los siguientes ejemplos 91-94, se varió el tipo de material Velsan. Por lo demás, las composiciones son idénticas a la del Ejemplo 1.

TABLA V

Efecto del tipo de Velsan* sobre el SPF (con Miglyol 812 constante a 3,75%)	
	SPF ^{1,2}
(91) Velsan D8P3	15,3 (3,3) 21,0 (4,2)
(92) Velsan D8P16 (pasta)	12,6 (3,0)
(93) Velsan D8P16 (líquido)	14,0 (3,4)
(94) Velsan P8-3 (líquido)	14,0 (3,3)

* El nivel de Velsan era del 2,5%.

¹ Los valores entre paréntesis indican factores de protección en la región UVA del espectro.

² Datos múltiples indican múltiples pruebas de formulación independientes.

Los nombres de las marcas mostrados anteriormente se refieren a los siguientes compuestos comerciales:

Velsan D8P16: PPG-2 isodeceth-7 carboxilato de cetilo.

Velsan P8-3: Pareth-9 C₁₂₋₁₅ carboxilato de isopropilo.

Ejemplo 95

Se preparó una composición para uso como filtro solar que tenía componentes idénticos a los del Ejemplo 1, pero se añadió a la fase oleosa un 3% de metoxicinamato de octilo y se redujo el agua hasta ajustarla a un 3%. La composición resultante tenía un SPF de 23,3. Así, puede verse que las composiciones de esta invención pueden incluir agentes de filtro solar orgánicos, así como inorgánicos.

Ejemplo 96

Se preparó una composición para uso como filtro solar que tenía componentes idénticos a los del Ejemplo 1 y se añadieron un 5% de óxido de zinc y un 3% de Brij 721. La composición resultante tenía un SPF de 20,4 con respecto al UVB. Se ajustó el pH de la composición a 7. Esta composición tiene un valor de protección en el UVB significativamente mayor.

ES 2 220 984 T5

Ejemplo 97

Se preparó una composición para uso como filtro solar con propiedades antienvjecimiento como sigue. La formulación de este Ejemplo 97 contiene los siguientes ingredientes:

Fórmula base con retinol

	FASE ACUOSA	p/p %
10	Agua desionizada	74,50
	Carbopol 940	0,25
15	Propilenglicol	3,00
	Ácido cítrico	0,10
	Estearato de sodio	0,50
20	Dowicil 200	0,10
	FASE OLEOSA	
25	BHT	0,05
	Velsan D8P3	2,50
	Ácido esteárico	5,00
30	Alcohol cetílico	1,00
	Miglyol 812	3,75
	Retinol (10% en aceite de soja)	1,65
35	Acetato de tocoferol	0,10
	Dióxido de titanio	4,50
40	Brij 721	3,00

Se preparó la formulación de este Ejemplo como sigue. Se preparó la fase acuosa midiendo el peso de agua de la fórmula en un recipiente adecuado. Se introdujo Carbopol 940 lentamente mezclando al mismo tiempo para permitir que el Carbopol 940 se hidratara. Se añadió entonces propilenglicol, seguido del estearato de sodio y del ácido cítrico y se mezcló la fase durante 30 minutos. Se calentó entonces la mezcla a 90°C. Se combinaron luego los ingredientes de la fase oleosa por separado, a excepción del retinol, y se mezclaron bien y se calentaron después a 90°C. Bajo luz amarilla, se añadió luego retinol a la fase oleosa, que se añadió entonces a la fase acuosa, y se enfrió el sistema mientras se mezclaba. Se añadió luego Dowicil 200 cuando el producto alcanzó los 40°C. Se homogeneizó entonces la totalidad de la mezcla en un homogeneizador rotor-estator durante tres minutos. Se ajustó entonces el pH con hidróxido de sodio a pH 6,42. Se introdujo luego el producto resultante en tubos de aluminio y se purgó con gas argón. El producto pudo ser entonces almacenado.

55

60

65

ES 2 220 984 T5

Ejemplo 98

Ejemplo comparativo

5 La siguiente composición 98A contenía agentes de filtro solar tanto inorgánicos como orgánicos. Se preparó la composición 98B usando la misma formulación, pero se eliminaron los ingredientes de filtro solar orgánicos. Las formulaciones eran las siguientes:

10	<u>Componente</u>	98A	98B
		<u>% P/P</u>	<u>% P/P</u>
	Agua desionizada	57,89	60,15
15	Carbopol 940	0,40	0,40
	Propilenglicol	3,00	3,00
	EDTA disódico	0,10	0,10
20	Carboset XL-19-X2	7,50	7,50
	Solución amoniacal (7,5%)	2,60	2,60
	Aerosol OT (75%)	0,01	--
25	Acetato de vitamina E	0,10	0,10
	Isoestearato de isopropilo	2,50	2,50
	Hidroxitolueno butilado	0,05	0,05
30	Finsolv TN	5,00	5,00
	Velsan D8P3	2,50	2,50
35	Dimeticona	0,50	0,50
	Ácido isoesteárico	2,00	2,00
	Alcohol cetílico	1,00	1,00
40	Amphisol	2,00	2,00
	Oxibenzona	2,75	--
	Parsol MCX	6,50	--
45	Hombifine S-35 (TiO ₂)	1,00	3,96
	Salicilato de octilo	1,00	--
	Lexamul GDL	1,00	1,00
50	Dowicil 200 (solución al 33%)	0,30	0,30
	Fragancia	0,30	0,30
	Aceite mineral	--	2,52
55	Miristato de isopropilo	--	2,52
	SPF	20,2	2,4

60 Como demuestran los anteriores valores de SPF, la Formulación 98B, que no contenía ningún agente de filtro solar orgánico, tenía un factor de protección solar extremadamente bajo y era bastante ineficaz en su utilización del dióxido de titanio. Así, la mera eliminación de los agentes de filtro solar orgánicos de la Formulación 98A no dio valores de SPF comparables.

65

ES 2 220 984 T5

Ejemplo 99

Ejemplo comparativo

5 En este ejemplo, la Formulación 99A contenía ácido isoesteárico, un emulsor aniónico de cadena ramificada. La Formulación 99B contenía ácido esteárico, un emulsor aniónico de cadena lineal según los productos de esta invención. Las formulaciones eran las siguientes:

<u>Componente</u>	99A % P/P	99B % P/P
10 Agua desionizada	80,95	80,95
15 Carbopol 940	0,40	0,40
Propilenglicol	3,00	3,00
EDTA disódico	0,10	0,10
20 Acetato de vitamina E	0,10	0,10
Hidroxitolueno butilado	0,05	0,05
Velsan D8P3	2,50	2,50
25 Ácido isoesteárico	5,00	--
Ácido esteárico	--	5,00
Alcohol cetílico	1,00	1,00
30 Micro TiO ₂ SA-20	4,00	4,00
Dowicil 200 (solución al 33%)	0,30	0,30
Fragancia	0,30	0,30
35 Rojo D&C #33 (solución al 0,1%)	0,90	0,90
Hidróxido de sodio (solución 40 al 50%)	1,40	1,40
SPF	7,1	21,2

45 Puede verse que la Formulación 99B, que contenía ácido esteárico, un emulsor aniónico de cadena lineal según esta invención, dio un SPF considerablemente superior al de la Formulación 99A, que contenía ácido isoesteárico, un emulsor aniónico de cadena ramificada.

50 Ejemplo 100

Se preparó una composición de filtro solar adecuada para uso como formulación vehiculizante de doble acción que contenía los siguientes materiales:

<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
55 Agua desionizada	78,15
Glicerina 99%	3,00
60 Carbopol 940	0,25
Edetato de sodio	0,10
Acetamida AMEA	2,50
65 Velsan D8P3	2,50

ES 2 220 984 T5

	Ácido esteárico	4,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Dióxido de titanio	4,50
5	Alcohol cetearílico, cetearil- sulfato de sodio y sulfato de sodio	1,00
10	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

15 Se puede preparar la formulación de este Ejemplo 100 como sigue. Se preparó la fase acuosa midiendo el peso de agua de la fórmula en un recipiente adecuado. Se introdujo Carbómero lentamente mezclando al mismo tiempo para permitir que el Carbómero se hidratara. Se añadió entonces el EDTA y se mezcló la fase durante 30 minutos. A los 30 minutos, se calentó la mezcla a 90°C. Se añadieron entonces glicerina y AMEA a la fase. Se añadieron después 20 el BHT, el Velsan D8P3, el ácido esteárico, el alcohol cetearílico y el triglicérido caprílico/cáprico y el bisabolol. Se mantuvo la temperatura a 90°C durante quince minutos. Se añadió lentamente el dióxido de titanio y se mezcló la composición durante 30 minutos. Se añadió el hidróxido de sodio en forma de solución para ajustar el pH a un valor de entre 7 y 7,5. Se mezcló entonces la solución durante 30 minutos a 88-92°C, formándose la emulsión. Se enfrió entonces la composición a 35°C y se volvió a ajustar el pH. Se añadió luego agua desionizada para substituir la pérdida 25 por evaporación y se homogeneizó el lote durante 5 minutos.

Se pueden preparar formulaciones adicionales según el procedimiento mostrado en este Ejemplo 100 para crear composiciones según esta invención que contienen uno o más ingredientes activos además del filtro solar. La base de soporte de esta invención da una composición extensible y cosméticamente elegante en la que aplicar los agentes de 30 filtro solar y los materiales activos tópicos adicionales, según se muestra a continuación.

Se pueden producir las siguientes formulaciones según el procedimiento antes mostrado en el Ejemplo 100 entendiéndose que el procedimiento puede ser ajustado para adecuarse a los materiales específicos. Los materiales pueden incluir, aunque sin limitación, el pH del producto final, el orden de adición de las materias primas y/o las temperaturas de procesamiento según sea necesario. 35

Ejemplo 100A

Composición que contiene dihidroxiacetona (bronceado sin sol)

	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
40	Agua desionizada	74,15
	Glicerina 99%	3,00
45	Carbopol 940	0,25
	Edetato de sodio	0,10
	Acetamida AMEA	2,50
50	Velsan D8P3	2,50
	Ácido esteárico	4,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
55	Dihidroxiacetona	4,00
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
	Alcohol cetearílico, cetearil- sulfato de sodio y sulfato de sodio	1,00
60	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
65	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

ES 2 220 984 T5

Ejemplo 100B

Composición que contiene un agente blanqueante de la piel, ascorbilfosfato de magnesio

5	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
	Agua desionizada	75,15
	Glicerina 99%	3,00
10	Carbopol 940	0,25
	Edetato de sodio	0,10
	Ascorbilfosfato de	3,00
15	magnesio	
	Acetamida AMEA	2,50
	Velsan D8P3	2,50
20	Ácido esteárico	4,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
25	Alcohol cetearílico, cetearil-	1,00
	sulfato de sodio y sulfato de	
	sodio	
	Bisabolol	0,20
30	Hidroxitolueno butilado	0,05
	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

35 Ejemplo 100C

Composición que contiene un agente blanqueante de la piel, hidroquinona

40	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
	Agua desionizada	76,15
	Glicerina 99%	3,00
45	Carbopol 940	0,25
	Edetato de sodio	0,10
	Hidroquinona	2,00
50	Acetamida AMEA	2,50
	Velsan D8P3	2,50
	Ácido esteárico	4,00
55	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
	Alcohol cetearílico, cetearil-	1,00
60	sulfato de sodio y sulfato de	
	sodio	
	Bisabolol	0,20
65	Hidroxitolueno butilado	0,05
	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

ES 2 220 984 T5

Ejemplo 100D

Composición que contiene ácido retinoico soluble en aceite

5	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
	Agua desionizada	78,14
	Glicerina 99%	3,00
10	Carbopol 940	0,25
	Edetato de sodio	0,10
	Acetamida AMEA	2,50
15	Velsan D8P3	2,50
	Ácido esteárico	4,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
20	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
	Alcohol cetearílico, cetearil-	1,00
25	sulfato de sodio y sulfato de sodio	
	Ácido retinoico	0,01
30	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

35

Ejemplo 100E

Composición que contiene retinaldehído soluble en aceite

40	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
	Agua desionizada	78,07
	Glicerina 99%	3,00
45	Carbopol 940	0,25
	Edetato de sodio	0,10
	Acetamida AMEA	2,50
50	Velsan D8P3	2,50
	Ácido esteárico	4,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
55	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
	Alcohol cetearílico, cetearil-	1,00
60	sulfato de sodio y sulfato de sodio	
	Retinaldehído	0,08
	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
65	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

ES 2 220 984 T5

Ejemplo 100F

Composición que contiene retinol soluble en aceite

5	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
	Agua desionizada	78,07
10	Glicerina 99%	3,00
	Carbopol 940	0,25
	Edetato de sodio	0,10
15	Acetamida AMEA	2,50
	Velsan D8P3	2,50
	Ácido esteárico	4,00
20	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
	Alcohol cetearílico, cetearil-	1,00
25	sulfato de sodio y sulfato de sodio	
	Retinol	0,08
30	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
35	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

Ejemplo 100G

40 *Composición que contiene palmitato de retinilo*

45	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
	Agua desionizada	77,35
	Glicerina 99%	3,00
	Carbopol 940	0,25
50	Edetato de sodio	0,10
	Acetamida AMEA	2,50
	Velsan D8P3	2,50
55	Ácido esteárico	4,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
60	Alcohol cetearílico, cetearil-	1,00
	sulfato de sodio y sulfato de sodio	
65	Palmitato de retinilo	0,80

ES 2 220 984 T5

	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
5	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

Ejemplo 100H

10 *Composición que contiene un agente anti-fúngico*

	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
15	Agua desionizada	76,15
	Glicerina 99%	3,00
	Carbopol 940	0,25
20	Edetato de sodio	0,10
	Acetamida AMEA	2,50
	Velsan D8P3	2,50
25	Ácido esteárico	4,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
30	Alcohol cetearílico, cetearil- sulfato de sodio y sulfato de sodio	1,00
35	Ketoconazol	2,00
	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
40	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

Ejemplo 100J

45 *Composición que contiene un agente antimicrobiano*

	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
50	Agua desionizada	77,65
	Glicerina 99%	3,00
	Carbopol 940	0,25
55	Edetato de sodio	0,10
	Acetamida AMEA	2,50
	Velsan D8P3	2,50
60	Ácido esteárico	4,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
65	Alcohol cetearílico, cetearil-	1,00

ES 2 220 984 T5

sulfato de sodio y sulfato de sodio

5	Triclosán	0,50
	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
10	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

Ejemplo 100K

15 *Composición que contiene una fragancia "repelente de insectos"*

	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
	Agua desionizada	72,15
20	Glicerina 99%	3,00
	Carbopol 940	0,25
	Edetato de sodio	0,10
25	Acetamida AMEA	2,50
	Velsan D8P3	2,50
	Ácido esteárico	4,00
30	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
35	Alcohol cetearílico, cetearil-sulfato de sodio y sulfato de sodio	1,00
	Fragancia repelente de insectos	6,00
	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
45	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

Ejemplo 100L

50 *Composición que contiene óxidos de hierro*

	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
	Agua desionizada	76,49
55	Glicerina 99%	3,00
	Veegum	0,60
	Edetato de sodio	0,10
60	Acetamida AMEA	2,50
	Velsan D8P3	2,50
	Ácido esteárico	4,00
65	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75

ES 2 220 984 T5

	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
	Óxido de hierro	1,66
5	Alcohol cetearílico, cetearil- sulfato de sodio y sulfato de sodio	1,00
10	Keltrol	0,40
	Bisabolol	0,20
	Hidroxitolueno butilado	0,05
15	Hidróxido de sodio	Ajustar pH a 7,5

Ejemplo 100M

Composición que contiene un alfa-hidroxiácido

	<u>Nombre CTFA del componente</u>	<u>% p/p</u>
25	Agua desionizada	55,95
	Carbopol 940	0,25
	Edetato de sodio	0,10
30	Estearato de sodio	5,00
	Propilenglicol	3,00
	Hidroxitolueno butilado	0,05
35	Valsan D8P3	2,50
	BRIJ 721	3,00
40	Alcohol cetearílico, cetearil- sulfato de sodio y sulfato de sodio	1,00
45	Triglicérido caprílico/cáprico	3,75
	Ácido esteárico	5,00
	Dióxido de titanio MT 100T	4,50
50	Ácido glicólico (solución al 70%)	7,14
	Hidróxido de sodio (solución al 20%)	8,66
55	Dowicil 200	0,10

El pH de este producto ha de ser ajustado a aproximadamente 5,15.

60

65

ES 2 220 984 T5

REIVINDICACIONES

1. Una composición de filtro solar consistente en:

5 (a) un agente de filtro solar inorgánico,

(b) un emulsor aniónico seleccionado entre el grupo consistente en sales de ácidos grasos saturados, sales de ácidos grasos de cadena lineal, sulfosuccinatos de alquilo, fosfatos de alquilo y sus mezclas y

10 (c) un componente oleoso consistente en un aceite vehiculizante y al menos un emoliente.

15 Donde dicho aceite vehiculizante es seleccionado entre el grupo consistente ésteres de ácidos grasos interrumpidos con poliéteres, dicho emoliente es seleccionado entre el grupo consistente en aceites minerales, aceites ésteres, aceites vegetales, siliconas y emolientes sintéticos y la razón de emoliente a aceite vehiculizante es de 1:1 a 3:1.

2. Una composición de filtro solar según la reivindicación 1, donde dicho agente de filtro solar inorgánico es seleccionado entre el grupo consistente en dióxido de titanio, óxido de zinc y sus mezclas.

20 3. Una composición de filtro solar según la reivindicación 2, donde dicho agente de filtro solar inorgánico es dióxido de titanio.

4. Una composición de filtro solar según la reivindicación 3, dicho dióxido de titanio tiene un tamaño de partícula primaria de menos de aproximadamente 30 nanómetros.

25 5. Una composición de filtro solar según la reivindicación 1, donde dicho emulsor aniónico es una sal de un ácido graso.

30 6. Una composición de filtro solar según la reivindicación 1, donde dicho emulsor aniónico es seleccionado entre el grupo de estearato de sodio, laurilsulfato de sodio, fosfato de DEA-cetilo y dioctilsulfosuccinato de sodio.

35 7. Una composición de filtro solar según la reivindicación 1, donde dicho éster de ácido graso interrumpido con poliéter es un éster polietilenoxi(eventualmente polipropilenoxi)carboxilato de alquilo graso C₈ a C₂₂, cuyo éster tiene un grupo alquilo de uno a veintidós átomos de carbono, eventualmente lineal o ramificado.