

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 864 325**

51 Int. Cl.:

**A61Q 17/04** (2006.01)

**A61K 8/60** (2006.01)

**A61K 8/02** (2006.01)

**A61K 8/06** (2006.01)

**A61K 8/895** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **25.01.2013 PCT/JP2013/051651**

87 Fecha y número de publicación internacional: **12.09.2013 WO13132914**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **25.01.2013 E 13758285 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **17.03.2021 EP 2823807**

54 Título: **Composición de protección solar**

30 Prioridad:

**05.03.2012 JP 2012048258**

**13.07.2012 JP 2012158118**

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

**13.10.2021**

73 Titular/es:

**OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD. (100.0%)  
9, Kanda-Tsukasamachi 2-chome, Chiyoda-ku  
Tokyo, 101-8535, JP**

72 Inventor/es:

**TANAKA, MASAHIKO;  
OGIHARA, MIYOKO y  
KAKO, JUNKO**

74 Agente/Representante:

**BERTRÁN VALLS, Silvia**

**Observaciones:**

**Véase nota informativa (Remarks, Remarques o  
Bemerkungen) en el folleto original publicado por  
la Oficina Europea de Patentes**

ES 2 864 325 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

Composición de protección solar

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a una composición de protección solar que tiene un excelente efecto de protección ultravioleta. Además, la presente invención se refiere a una composición de protección solar que es estable y suave para la piel, y que tiene una excelente resistencia al agua y un alto efecto de protección ultravioleta.

10

**Técnica anterior**

Convencionalmente, los agentes de protección solar se usan a menudo para proteger la piel de la radiación ultravioleta. En los últimos años, tienden a usarse cosméticos de protección solar independientemente de la estación, el sexo y la edad y, en la actualidad, sigue aumentando la demanda de cosméticos de protección solar.

15

El rendimiento de protección ultravioleta de un agente de protección solar puede representarse por el SPF (factor de protección solar), que muestra el índice de protección de UV-B (longitud de onda: de 290 a 320 nm), el PFA (factor de protección de UVA), que muestra el índice de protección de UV-A (longitud de onda: de 320 a 400 nm), o el PA (grado de protección de UVA), que es la indicación de clasificación basada en el PFA. Cuanto mayores sean el valor de SPF y/o el valor de PFA, se supone que mayor será el rendimiento de protección ultravioleta. Los agentes de protección solar con valores de SPF y/o valores de PFA están destinados generalmente para su uso en la vida cotidiana, tal como cuando se permanece en el interior y cuando se sale durante un corto periodo de tiempo. Entre ellos, los agentes de protección solar con altos valores de SPF y/o altos valores de PFA están destinados para su uso en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta, tales como lugares en los que se disfruta de actividades prolongadas al aire libre y deportes al aire libre (por ejemplo, áreas de mar, montaña y esquí).

20

25

Hasta ahora se han notificado muchos agentes de protección solar. Por ejemplo, el documento PTL 1 divulga un agente de protección solar de tipo aceite en agua que tiene un tamaño de partícula emulsionada promedio de 700 nm o menos y que comprende metoxicinamato de octilo, t-butil-metoxidibenzoil-metano y/o 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, un polímero de bloque específico de alquil éter de polioxialquileo-polioxi-etileno y un aceite apolar en proporciones específicas. El agente de protección solar de tipo aceite en agua divulgado en el documento PTL 1 tiene un alto contenido de absorbente de ultravioleta para potenciar de ese modo la capacidad de protección ultravioleta y tiene una excelente estabilidad de emulsión y buena utilizabilidad. Además, el documento PTL 2 divulga una composición de absorción ultravioleta que comprende partículas de látex específicas y un absorbente de ultravioleta, teniendo la composición de absorción ultravioleta un mayor efecto de absorción ultravioleta que una composición que no contiene partículas de látex.

30

35

Una composición denominada "*Super Plus Beblesh Balm*" (XP-002745092), entre otras, comprende un absorbente de UV liposoluble, adenosina y partículas de silicona compuestas de crosopolímero de vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona, así como dióxido de titanio (4,82% en peso) y óxido de zinc (1,95% en peso) como agentes de dispersión de ultravioleta.

40

El documento JP 2007-246521 A se refiere a cosméticos de protección solar de emulsión de tipo agua en aceite. La composición comprende (a) octocrileno, (b) óxido de zinc hidrofobizado como agente de dispersión UV, (c) un tensioactivo catiónico y (d) sílice.

45

El documento JP 2007-269690 A describe una composición cosmética de protección solar que comprende (A) un organopolisiloxano volátil, (B) un óxido de metal particulado seleccionado de óxido de titanio, óxido de zinc y óxido de cerio, (C) un compuesto de siloxano que tiene un resto de organopolisiloxano y un grupo alquilo de cadena larga y (D) etanol. Los óxidos de metal particulados (B) son agentes de dispersión de ultravioleta.

50

En el documento JP 2008/273880 A, se describen una resina de poliimida de protección UV y un cosmético que comprende dicha resina. Según una realización, la composición comprende, entre otros, metoxicinamato de octilo, octocrileno y partículas de silicona, así como óxido de zinc hidrofobizado.

55

El documento JP 2009/524644 A se refiere a composiciones de protección solar que comprenden (A) un elastómero de silicona emulsionante, (B) un emulsionante de silicona sustituida con alquilo y, además, (C) un portador acuoso. Comprende además agentes de dispersión de UV tales como partículas de dióxido de titanio.

60

El documento WO 2010/147238 A1 proporciona un potenciador de la función de permeación de agua en la piel que puede ajustar la TEWL según la condición de la piel para así normalizar la función de permeación de agua en la piel, potenciando de ese modo el efecto de regulación del contenido de agua en la piel. Se ha descubierto que los ácidos nucleicos de purina tienen una acción de ajustar de manera apropiada la TEWL según la condición de la piel y, por tanto, se usan como principio activo de un potenciador de la función de permeación de agua en la piel.

65

Tal como se describió anteriormente, ya se han notificado y vendido muchos agentes de protección solar. Sin embargo, en la actualidad, una cantidad aumentada de radiación ultravioleta alcanza la superficie de la Tierra debido al impacto del agotamiento de la capa de ozono; por consiguiente, sigue aumentando la demanda de agentes de protección solar que tengan un alto efecto de protección ultravioleta. Además, se espera que los agentes de protección solar estables que son suaves para la piel al tiempo que tienen un alto efecto de protección ultravioleta aumenten adicionalmente la sensación de seguridad y la satisfacción de los consumidores.

## Lista de referencias

### Bibliografía de patentes

Documento PTL 1: JP2011-157282A

Documento PTL 2: JPH09-104822A

## Sumario de la invención

### Problema técnico

Desde el punto de vista de potenciar el efecto de protección ultravioleta, se considera importante otorgar un alto efecto de protección ultravioleta a los agentes de protección solar. Además, la reducción del efecto de protección ultravioleta de un agente de protección solar con el tiempo puede evitarse otorgando además una fuerte resistencia al agua contra el sudor y el agua al agente de protección solar. Por consiguiente, un objeto de la presente invención es proporcionar una composición de protección solar que tenga un efecto de protección solar superior. Otro objeto de la presente invención es proporcionar una composición de protección solar que sea estable y suave para la piel y que tenga un alto efecto de protección solar y una excelente resistencia al agua.

### Solución al problema

Como resultado de una investigación extensa para lograr los objetos anteriores, los presentes inventores descubrieron que el valor de SPF de una composición de protección solar puede mejorarse según la composición de protección solar según la reivindicación 1, que contiene dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles y partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos. Además, los presentes inventores descubrieron que esta composición también tiene una excelente resistencia al agua. Además, los presentes inventores descubrieron que, de ese modo, puede obtenerse una composición de protección solar con un alto valor de PFA deseado. Además, los presentes inventores descubrieron que puede obtenerse una composición de protección solar con un valor de PFA mayor usando, en particular, tres o más absorbentes de ultravioleta liposolubles. La presente invención se ha logrado mediante estudios adicionales sobre la estabilidad basándose en estos hallazgos.

Más específicamente, la presente invención proporciona las siguientes invenciones:

Punto 1. Una composición de protección solar que comprende dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles y partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos, y al menos un electrolito que es al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en adenosina fosfato, ácido ascórbico, derivados del ácido ascórbico, sales de los mismos, cloruro de sodio, cloruro de magnesio y cloruro de calcio, en la que la composición de protección solar está libre de un agente de dispersión de ultravioleta, el electrolito está contenido en una cantidad del 0,5% en peso o más en la composición de protección solar, la composición de protección solar está en forma de una emulsión de tipo agua en aceite (W/O) y los derivados del ácido ascórbico se seleccionan del grupo que consiste en ascorbilfosfato de magnesio, ascorbilfosfato de sodio, ascorbilsulfato de disodio, ascorbato de glucósido, ascorbato de glucosamina y ácido deshidroascórbico.

Punto 2. La composición de protección solar según el punto 1, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles son al menos dos miembros seleccionados del grupo que consiste en metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo, absorbentes de ultravioleta a base de polisilicona, homosalato, t-butilmetoxibenzoil-metano, salicilato de etilhexilo, etilhexiltriaza, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina, metilén-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, oxibenzona-3 y drometrisol-trisiloxano.

Punto 3. La composición de protección solar según el punto 1 ó 2, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles son al menos dos miembros seleccionados del grupo que consiste en metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo y polisilicona-15.

Punto 4. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 3, que tiene un valor de SPF de 50 o más como indicador de capacidad de protección UV-B.

Punto 5. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 4, que comprende tres o más absorbentes de ultravioleta liposolubles.

- 5 Punto 6. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 5, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles son benzoato de dietilamino-hidroxi-benzoil-hexilo y al menos dos miembros seleccionados del grupo que consiste en metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, absorbentes de ultravioleta a base de polisilicona, homosalato, t-butil-metoxibenzoil-metano, salicilato de etilhexilo, etilhexiltriazona, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, oxibenzona-3 y drometrisol-trisiloxano.
- 10 Punto 7. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 6, que tiene un valor de PFA de 5 o más como indicador de capacidad de protección UV-A.
- 15 Punto 8. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 7, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles comprenden metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxi-benzoil-hexilo y polisilicona-15.
- 20 Punto 9. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 8, en la que las partículas de silicona compuestas son partículas de silicona compuestas en las que caucho de silicona está recubierto con una resina de silicona.
- 25 Punto 10. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 9, en la que las partículas de silicona compuestas son partículas de silicona compuestas en las que caucho de silicona esférico está recubierto con una resina de silicona.
- 30 Punto 11. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 10, en la que las partículas de silicona compuestas tienen un diámetro de partícula promedio de 2  $\mu\text{m}$  a 10  $\mu\text{m}$ .
- 35 Punto 12. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 11, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles están contenidos en una cantidad total del 10% en peso o más.
- 40 Punto 13. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 12, en la que las partículas de silicona compuestas están contenidas en una cantidad del 4 al 20% en peso.
- 45 Punto 14. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 13, en la que el electrolito es una combinación de al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en cloruro de sodio, magnesio o calcio y al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en adenosina monofosfato, ácido ascórbico, derivados del ácido ascórbico y sales de los mismos.
- 50 Punto 15. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 14, en la que el electrolito comprende adenosina monofosfato o una sal de la misma y al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en cloruro de sodio, magnesio o calcio, y comprende además un aceite esencial.
- 55 Punto 16. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 15, en la que está contenida del 10 al 40% en peso de agua en la composición de protección solar.
- 60 Punto 17. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 16, en la que el electrolito está contenido en una cantidad de 1,5 a 40 partes en peso, basándose en 100 partes en peso de agua.
- 65 Punto 18. La composición de protección solar según uno cualquiera de los puntos 1 a 17, que tiene una viscosidad a 20°C de 100 a 1.000 mPa·s.
- Punto 19. Tal como se mencionó anteriormente, la composición de protección solar de la presente invención está libre de un agente de dispersión de ultravioleta.
- Punto 20. La composición de protección solar según el punto 19, en la que el agente de dispersión de ultravioleta es un óxido de metal.
- Fuera de la invención reivindicada, en el presente documento se describen los siguientes puntos 21 a 26:
- Punto 21. Uso de dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles y partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos para producir una composición de protección solar.
- Punto 22. El uso según el punto 21, en el que la composición de protección solar, los absorbentes de ultravioleta liposolubles y/o la partícula de silicona compuesta que tiene un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos tienen la característica definida en al menos uno cualquiera de los puntos 1 a 21.
- Punto 23. Uso de dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles y partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos para mejorar un efecto de protección ultravioleta de una

composición de protección solar.

Punto 24. El uso según el punto 28, en el que la composición de protección solar, los absorbentes de ultravioleta liposolubles y/o la partícula de silicona compuesta que tiene un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos tienen la característica definida en al menos uno cualquiera de los puntos 1 a 21.

Punto 25. Un método para mejorar un efecto de protección ultravioleta de una composición de protección solar que comprende absorbentes de ultravioleta liposolubles, usando el método dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles y partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos.

Punto 26. El método según el punto 30, en el que la composición de protección solar, los absorbentes de ultravioleta liposolubles y/o la partícula de silicona compuesta que tiene un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos tienen la característica definida en al menos uno cualquiera de los puntos 1 a 21.

### **Efectos ventajosos de la invención**

La composición de protección solar de la presente invención tiene una mayor capacidad de protección ultravioleta que la de los absorbentes de ultravioleta convencionales. Además, dado que la composición de protección solar de la presente invención se forma en una emulsión de tipo agua en aceite (W/O), la composición de protección solar tiene, en particular, resistencia al agua contra el sudor y el agua. Por consiguiente, la composición de protección solar de la presente invención en forma de una emulsión de tipo agua en aceite tiene efectos excelentes, ya que el efecto de protección ultravioleta deseado puede durar un largo periodo de tiempo y es mucho menos probable que la composición de protección solar se retire de la piel debido al sudor o al agua. Por tanto, la composición de protección solar de la presente invención no sólo es útil para su uso en la vida cotidiana, tal como cuando se permanece en el interior y cuando se sale durante un corto periodo de tiempo, sino que también es útil en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta, tales como lugares en los que se disfruta de actividades prolongadas al aire libre y deportes al aire libre, para los que se requiere incluso un mayor efecto de protección ultravioleta.

A pesar de los efectos excelentes y la alta resistencia al agua y al sudor anteriores, la composición de protección solar de la presente invención tiene además la ventaja de que es menos probable que la piel se blanquee cuando se aplica la composición de protección solar. Además, la composición de protección solar de la presente invención se elimina por lavado fácilmente y tiene una utilizabilidad significativamente mejorada. Además, dado que la composición de protección solar de la presente invención comprende además un electrolito y la composición de protección solar en forma de una emulsión de tipo agua en aceite comprende una cantidad específica del electrolito, se muestran un alto efecto de protección solar y resistencia al agua y la forma de emulsión de tipo agua en aceite puede mantenerse en un estado excelente durante un largo periodo de tiempo. Esto hace que la composición de protección solar de la presente invención sea más excelente en cuanto a estabilidad con el tiempo.

### **Breve descripción de los dibujos**

La figura 1 es una fotografía que muestra los resultados de la evaluación del grado de blanqueamiento.

La figura 2 es un gráfico que muestra los resultados de la evaluación de las propiedades de lavado.

### **Descripción de las realizaciones**

A continuación se describe la composición de protección solar de la presente invención.

La composición de protección solar de la presente invención comprende dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles, partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos y al menos un electrolito.

Los absorbentes de ultravioleta liposolubles no están limitados, siempre que sean solubles en aceite y tengan la capacidad de absorber radiación ultravioleta. Pueden usarse diversos absorbentes de ultravioleta liposolubles, independientemente de si están en forma de un sólido, semisólido o líquido. Los ejemplos de absorbentes de ultravioleta liposolubles incluyen metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo, absorbentes de ultravioleta a base de polisilicona, homosalato, t-butil-metoxibenzoil-metano, salicilato de etilhexilo, etilhexiltriazona, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, oxibenzona-3, etilhexil-dimetil-PABA, drometrizol-trisiloxano. Entre estos absorbentes de ultravioleta liposolubles se prefieren metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo, absorbentes de ultravioleta a base de polisilicona, homosalato, t-butil-metoxibenzoil-metano, salicilato de etilhexilo, etilhexiltriazona, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, oxibenzona-3 y drometrizol-trisiloxano; se prefieren más metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo, absorbentes de ultravioleta a base de polisilicona, homosalato, t-butil-metoxibenzoil-metano, salicilato de etilhexilo, etilhexiltriazona, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina y metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol; y se prefieren aún más metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo y absorbentes de

ultravioleta a base de polisilicona. Los ejemplos de absorbentes de ultravioleta a base de polisilicona incluyen cinamato que se une a polímero silicón, y los ejemplos específicos del mismo incluyen polisilicona-15.

5 Estos absorbentes de ultravioleta liposolubles se usan en combinación de dos o más. En cuanto de adquirir un mayor efecto protector contra UV-B y, además, contra UV-A, es más preferible usar tres o más absorbentes de ultravioleta liposolubles en combinación.

10 Los absorbentes de ultravioleta liposolubles usados en la presente invención se refieren a absorbentes de ultravioleta que pueden disolverse en benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> a 80°C en una cantidad de al menos el 1% en peso o más.

El contenido de los absorbentes de ultravioleta liposolubles no está limitado, siempre que se obtengan los efectos de la presente invención. Por ejemplo, el contenido total de los absorbentes de ultravioleta liposolubles en la composición de protección solar es del 10% en peso o más, y preferiblemente del 10 al 25% en peso.

15 Las partículas de silicón compuestas usadas en la presente invención tienen un diámetro de partícula promedio de 10 µm o menos y una distribución de tamaño de partícula en el intervalo de 1 a 15 µm. Los ejemplos preferidos de las partículas de silicón compuestas incluyen aquellas que tienen una resina de silicón. Los ejemplos más preferidos de las partículas de silicón compuestas incluyen partículas compuestas obtenidas recubriendo caucho de silicón con una resina de silicón, tal como partículas de silicón compuestas de caucho-resina; y se prefieren aún más partículas de silicón compuestas de caucho-resina obtenidas recubriendo caucho de silicón esférico con una resina de silicón. Además, los ejemplos preferidos de partículas de silicón compuestas de caucho-resina incluyen partículas compuestas combinadas con vinil dimeticona, vinil-difenil-dimeticona, silsesquioxano, silsesquioxano de meticona. Las partículas de silicón compuestas de caucho-resina preferidas son partículas de silicón compuestas de caucho-resina que tienen un diámetro de partícula promedio de 10 µm o menos, más preferiblemente de 2 a 10 µm e incluso más preferiblemente de 2 a 8 µm. Los ejemplos específicos de partículas de silicón compuestas de caucho-resina incluyen KSP-100 (diámetro de partícula promedio: 5 µm), KSP-105 (diámetro de partícula promedio: 2 µm), KSP-300 (diámetro de partícula promedio: 5 µm), KMP-600 (diámetro de partícula promedio: 5 µm) y KMP-605 (diámetro de partícula promedio: 2 µm) (todas ellas producidas por Shin-Etsu Chemical). Estas pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más.

30 El contenido de las partículas de silicón compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10 µm o menos no está limitado, siempre que se obtengan los efectos de la presente invención, y el contenido puede determinarse de manera adecuada dependiendo del tipo de partículas. Por ejemplo, el contenido de las partículas de silicón compuestas en la composición de protección solar es del 4 al 20% en peso.

35 En la presente invención, el uso de las partículas de silicón anteriores contribuye al SPF y/o al PA, así como a la sensación de piel resbaladiza y a la viscosidad de la composición de protección solar.

40 Además de los componentes mencionados anteriormente, la composición de protección solar de la presente invención puede contener, si fuese necesario, cualquier otro componente cosmética o farmacológicamente aceptable. Los ejemplos de otros componentes incluyen disolventes, tensioactivos, absorbentes de ultravioleta hidrosolubles, agua, agentes formadores de recubrimiento, hidratantes, agentes emolientes, lubricantes, conservantes, agentes antiinflamatorios, refrigerantes, agentes quelantes, agentes neutralizantes, antioxidantes, agentes aromatizantes, pigmentos, colorantes, lubricantes, estabilizadores de emulsión, agentes desespumantes, agentes protectores, reguladores del pH, agentes acondicionadores de la piel, espesantes, agentes blanqueantes, activadores celulares, azúcares, aminoácidos, vitaminas.

45 A continuación, se muestran además ejemplos de algunos de estos otros componentes, aunque no limitan la presente invención. Específicamente, pueden usarse sales, derivados, aductos, complejos o polímeros de los componentes mostrados a continuación, siempre que no alteren las propiedades.

50 El disolvente usado en la composición de protección solar de la presente invención no está limitado, siempre que pueda disolverse los absorbentes de ultravioleta liposolubles. Los ejemplos del disolvente usados para disolver los absorbentes de ultravioleta liposolubles incluyen ciclopentasiloxano, dimeticona, benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub>, poliisobuteno hidrogenado, neopentanoato de isoestearilo, trietilhexanoato de eritritilo, tetraetilhexanoato de pentaeritritilo, etilhexanoato de cetilo, etilhexanoato de etilhexilo, dineopentanoato de metilpentanodiol, dineopentanoato de dietilpentanodiol, isononanoato de isononilo, tri(ácido caprílico/cáprico)glicerilo, ciclohexasiloxano, ciclotetrasiloxano, octametiltrisiloxano, ciclometicona, caprilil meticona, succinato de dietilhexilo, sebacato de diisopropilo; preferiblemente ciclopentasiloxano, dimeticona, benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub>, caprilil meticona, trietilhexanoato de eritritilo y tetraetilhexanoato de pentaeritritilo. Estos pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más.

60 El contenido del disolvente no está limitado, siempre que se obtengan los efectos de la presente invención. Por ejemplo, el contenido del disolvente en la composición de protección solar es del 10 al 50% en peso, preferiblemente del 20 al 50% en peso y más preferiblemente del 20 al 45% en peso.

Además, los ejemplos de tensioactivos incluyen, pero no se limitan a, tensioactivos no iónicos, tensioactivos de silicona, tensioactivos catiónicos, tensioactivos aniónicos y tensioactivos anfólicos.

5 Los ejemplos específicos de tensioactivos no iónicos incluyen aceite de ricino hidrogenado de PEG, isoestearato de PEG, poliglicerilo de ácido oleico, diisoestearato de PEG, triisoestearato de PEG, hidroxistearato de glicerilo, dipolihidroxistearato de PEG.

10 Los ejemplos de tensioactivos de silicona incluyen polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG, polidimetilsiloxietil dimeticona de PEG, metil éter dimeticona de PEG, butil éter dimeticona de PEG/PPG, dimeticona de PEG, metil éter dimeticona de PEG.

15 Los ejemplos de tensioactivos catiónicos incluyen cloruro de alquiltrimetilamonio, tal como cloruro de esteariltrimetilamonio; cloruro de dialquildimetilamonio, tal como cloruro de diestearildimetilamonio; cloruro de benzalconio.

20 Los ejemplos de tensioactivos aniónicos incluyen sales de ácidos grasos, tales como estearato de potasio y estearato de trietanolamina; sulfatos de alquilo, tales como sulfato de cetilsodio; alquil éter sulfatos de POE, tales como alquil (12,13) éter sulfato-trietanolamina de POE; sales de N-acilmetiltaurina, tales como miristoil-metiltaurina de sodio; fosfatos de alquilo, tales como cetilfosfato de dietanolamina; alquifosfatos de POE, tales como cetil éter fosfato de sodio de POE; sales de N-acilaminoácido, tales como N-estearoil-L-glutamato de sodio, N-estearoil-L-glutamato de potasio, N-estearoil-L-glutamato de trietanolamina.

25 Los ejemplos de tensioactivos anfólicos incluyen betaína de alquil-carboximetil-hidroxi-etil-imidazolinio, tal como betaína de 2-alquil-N-carboximetil-N-hidroxi-etil-imidazolinio; betaína de alquil-amidopropilo, tal como betaína de lauramidopropilo; alquil-hidroxisulfobetaina, tal como lauril-hidroxisulfobetaina.

30 Entre estos, se prefieren tensioactivos no iónicos y tensioactivos de silicona. Los ejemplos específicos de los mismos incluyen dipolihidroxistearato de PEG, polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG. Estos pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más.

El contenido del tensioactivo tampoco está limitado, siempre que se obtengan los efectos de la presente invención. Por ejemplo, el contenido del tensioactivo en la composición de protección solar es del 0,5 al 4% en peso.

35 Además, en algunos casos, la composición de protección solar de la presente invención puede contener un absorbente de ultravioleta hidrosoluble, siempre que se obtengan los efectos de la presente invención. Los ejemplos de absorbentes de ultravioleta hidrosolubles incluyen ácido fenilbencimidazol-sulfónico, ácido tereftalilidindialcanforsulfónico, oxibenzona-4, sales de los mismos; se prefieren ácido fenilbencimidazol-sulfónico, ácido tereftalilidindialcanforsulfónico y sales de los mismos. Estos pueden usarse individualmente o en combinación de dos  
40 o más; sin embargo, cuando se mezclan tres o más absorbentes de ultravioleta liposolubles, es más preferible que la composición de protección solar de la presente invención contenga sólo uno o no contenga ningún absorbente hidrosoluble, para reducir la carga sobre la piel. Además, puesto que la composición de protección solar de la presente invención está en forma de una emulsión de tipo agua en aceite en la que la fase acuosa contiene un electrolito, es deseable usar como máximo un absorbente de ultravioleta hidrosoluble para no afectar a la estabilidad. El absorbente  
45 de ultravioleta hidrosoluble que puede usarse en este caso es, por ejemplo, ácido fenilbencimidazol-sulfónico o una sal del mismo.

50 El contenido del absorbente de ultravioleta hidrosoluble tampoco está limitado, siempre que se obtengan los efectos de la presente invención. Por ejemplo, el contenido del absorbente de ultravioleta hidrosoluble en la composición de protección solar es del 0 al 10% en peso y preferiblemente del 0 al 5% en peso.

Además, cuando la composición de protección solar de la presente invención contiene agua, el agua no está limitada. Por ejemplo, puede usarse agua purificada, agua destilada, agua de intercambio iónico o agua natural.

55 El contenido de agua tampoco está limitado, siempre que se obtengan los efectos de la presente invención. Por ejemplo, el contenido de agua en la composición de protección solar es del 10 al 40% en peso, preferiblemente del 15 al 30% en peso y más preferiblemente del 20 al 30% en peso. La composición de protección solar de la presente invención contiene un electrolito, se requiere la presencia de agua. Un contenido de agua del 10% en peso o menos dificulta que la composición de protección solar contenga de manera estable un electrolito, mientras que un contenido  
60 de agua demasiado alto puede alterar la resistencia al agua de la composición de protección solar.

65 Con el fin de formar la composición de protección solar de la presente invención en una emulsión de tipo agua en aceite estable, la composición de protección solar contiene un electrolito. El electrolito que va a usarse es al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en adenosina fosfato, ácido ascórbico, derivados del ácido ascórbico, sales de los mismos, cloruro de sodio, cloruro de magnesio y cloruro de calcio, en el que los derivados del ácido ascórbico se seleccionan del grupo que consiste en ascorbilfosfato de magnesio, ascorbilfosfato de sodio,

ascorbilsulfato de disodio, ascorbato de glucósido, ascorbato de glucosamina y ácido deshidroascórbico.

5 Las sales de adenosina fosfato y las sales del ácido ascórbico hidrosoluble y los derivados del ácido ascórbico no están particularmente limitados, siempre que sean farmacológica o cosméticamente aceptables. Los ejemplos de los mismos incluyen sales de metal alcalino, tales como sal de sodio y sal de potasio; y sales de metal alcalinotérreo, sales de aminoácido básico, sales de amonio, sales de alcanolamina. Entre estas sales se prefieren las sales de metal alcalino; y se prefieren más las sales de sodio.

10 Entre estos, se prefieren incluso más cloruro inorgánico, y adenosina fosfato, ácido ascórbico, derivados del ácido ascórbico y sales de los mismos; se prefieren aún más cloruro de sodio, magnesio o calcio, y adenosina monofosfato, ácido ascórbico, derivados del ácido ascórbico y sales de los mismos; y se prefieren particularmente cloruro de sodio, cloruro de magnesio, cloruro de calcio, adenosina monofosfato y sales de la misma, y ascorbilfosfato y sales del mismo. En la presente invención, los electrolitos pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más.

15 El contenido del electrolito es del 0,5% en peso o más. Por ejemplo, el contenido del electrolito en la composición de protección solar es del 0,5 al 10% en peso. En particular, para la composición de protección solar en forma de una emulsión de tipo agua en aceite, el contenido del electrolito en la composición de protección solar es preferiblemente del 0,5 al 5% en peso y más preferiblemente del 0,5 al 3% en peso, para mantener de manera estable la forma de emulsión de tipo agua en aceite en un estado excelente durante un largo periodo de tiempo. Además, el contenido del electrolito por 100 partes en peso de agua en la composición de protección solar en forma de una emulsión de tipo agua en aceite es, por ejemplo, de 1,5 a 40 partes en peso, preferiblemente de 2 a 20 partes en peso, más preferiblemente de 2 a 10 partes en peso y de manera particularmente preferible de 2 a 6 partes en peso.

25 La composición de protección solar de la presente invención es una emulsión de tipo agua en aceite (W/O (agua en aceite)). La composición de protección solar de la presente invención está en forma de una emulsión, y es deseable mantener de manera adecuada la forma de emulsión en cuanto de obtener los efectos deseados mencionados anteriormente de la presente invención. La forma de emulsión adecuada indica que están presentes de manera estable en la emulsión gotas de agua de una emulsión de tipo agua en aceite. Más específicamente, por ejemplo, lo siguiente describe un caso de la composición de protección solar de la presente invención en forma de una emulsión de tipo agua en aceite que se separa principalmente en dos fases cuando se deja reposar. La fase superior es una fase de aceite y la fase inferior es una fase en la que se dispersan en aceite gotas de agua tan finas que apenas pueden observarse visualmente. Cuando las gotas de agua tan finas que apenas pueden observarse visualmente se dispersan de manera sustancialmente homogénea en el aceite en la fase inferior, puede decirse que se mantiene la forma de emulsión de tipo agua en aceite adecuada. Este estado de separación reversible se denomina flotación. Por otro lado, cuando las gotas de agua en el aceite en la fase inferior se vuelven tan grandes que pueden observarse visualmente y las gotas de agua se combinan además para formar una fase acuosa, que después se separa, puede considerarse que la forma de emulsión adecuada no puede mantenerse suficientemente. En ese caso, los efectos de protección ultravioleta deseados de la presente invención no pueden adquirirse suficientemente. Desde este punto de vista, en la composición de protección solar de la presente invención en forma de una emulsión de tipo agua en aceite, mantener la forma de emulsión adecuada durante un periodo de tiempo más prolongado es una de las características importantes.

45 Tal como se describió anteriormente, la composición de protección solar de la presente invención que comprende dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles y partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos puede mostrar un SPF mejorado. Además, en la presente invención, el SPF de la composición de protección solar puede establecerse de manera adecuada a un valor deseado, dependiendo del fin, combinando los componentes, tales como los absorbentes de ultravioleta liposolubles con las partículas de silicona compuestas mencionadas anteriormente, y mezclándolos en el intervalo de contenido mencionado anteriormente. Puesto que el valor de SPF de la composición de protección solar de la presente invención puede determinarse de manera adecuada de ese modo, esta composición puede usarse no sólo como una composición de protección solar con un SPF relativamente bajo, que está destinada para su uso en la vida cotidiana, tal como cuando se permanece en el interior y cuando se sale durante un corto periodo de tiempo, sino también como una composición de protección solar con un alto valor de SPF, que es adecuada para su uso en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta. La presente invención es particularmente adecuada para una composición de protección solar con un alto valor de SPF. Cuando el producto objetivo es un cosmético o producto de parafarmacia de protección solar para su uso en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta, el valor de SPF deseado es de 40 o más y preferiblemente de 50 o más. Por ejemplo, es deseable tener un valor de SPF que permita la visualización de SPF50+, que es un indicador de capacidad de protección ultravioleta UV-B en Japón.

60 Además, la composición de protección solar de la presente invención tiene un efecto de protección ultravioleta no sólo contra UV-B, sino también contra UV-A. En particular, al contener tres o más absorbentes de ultravioleta liposolubles, la composición de protección solar de la presente invención tiene un alto efecto protector contra la radiación ultravioleta tanto en la región UV-B como en la región UV-A. Por tanto, tanto el PFA como el SPF de la composición de protección solar de la presente invención pueden establecerse de manera adecuada a valores deseados, dependiendo del fin de uso, combinando los componentes, tales como los absorbentes de ultravioleta liposolubles anteriores con las partículas de silicona compuestas anteriores, y mezclándolos de manera adecuada en el intervalo de contenido

anterior. Aunque el PA se visualiza de diversas maneras en diferentes países, como valores de PFA usados como criterios de evaluación para el PA, tiende a preferirse un valor de PFA de 4 o más para las composiciones de protección solar destinadas para su uso en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta. Por consiguiente, desde el punto de vista de una composición que tiene un alto efecto de protección solar, es deseable que la composición tiene un alto efecto de PA, como con SPF. Por ejemplo, es deseable tener un valor de PFA que permita la visualización de PA+++ , que es un indicador que indica capacidad de protección ultravioleta UV-A en Japón. Es decir, la composición de protección solar de la presente invención puede tener un alto valor de SPF y un alto valor de PFA, preferiblemente un SPF de 40 o más y un PFA de 5 o más y más preferiblemente un SPF de 50 o más (SPF50+) y un PFA de 8 o más (PA+++ o más en Japón).

Por tanto, según la presente invención, el SPF y el PA de la composición de protección solar puede establecerse a valores deseados. Cuando se aplica a la piel, esta composición de protección solar muestra un excelente efecto de protección solar.

Además, según la presente invención, la viscosidad de la composición de protección solar tampoco está limitada, y puede determinarse de manera adecuada dependiendo de la forma deseada; sin embargo, es preferible una baja viscosidad en cuando a lograr una sensación de uso más excelente, tal como sensación de piel resbaladiza. Una viscosidad de este tipo está en el intervalo de 100 a 1.000 mPa·s y preferiblemente de 100 a 500 mPa·s, tal como se mide mediante un viscosímetro Brookfield a 20°C.

Además, la composición de protección solar de la presente invención no contiene ningún agente de dispersión de ultravioleta, tal como óxido de metal (por ejemplo, óxido de zinc u óxido de titanio), con el fin de evitar el blanqueamiento de la piel durante su uso y la sensación chirriante cuando se aplica a la piel. Generalmente, se usan ampliamente agentes de dispersión de ultravioleta en muchos agentes de protección solar notificados convencionalmente con un alto SPF. En la presente invención, no es útil la incorporación de un agente de dispersión de ultravioleta para evitar una sensación desagradable, tal como el blanqueamiento de la piel cuando se usa la composición de protección solar.

Los ejemplos de una realización de la composición de protección solar de la presente invención incluyen composiciones de protección solar que comprenden al menos dos absorbentes de ultravioleta liposolubles, partículas de silicona compuestas de caucho-resina que tienen un diámetro de partícula promedio de 10 μm o menos, un electrolito mencionado anteriormente, un disolvente, un tensioactivo y agua, en las que los absorbentes de ultravioleta liposolubles se seleccionan del grupo que consiste en metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo, polisilicona-15, homosalato, t-butil-metoxibenzoil-metano, salicilato de etilhexilo, etilhexiltriazona, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, oxibenzona-3 y drometrisol-trisiloxano. Cuando se otorga un efecto de protección contra UV-A incluso mayor, es preferible usar tres o más absorbentes de ultravioleta liposolubles, uno de los cuales se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo, t-butil-metoxibenzoil-metano, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, oxibenzona-3 y drometrisol-trisiloxano; y de manera particularmente preferible benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo.

La composición de protección solar de la presente invención puede contener además componentes opcionales, tales como, en particular, antioxidantes, conservantes, agentes emolientes, reguladores del pH, agentes quelantes, agentes antiinflamatorios, mencionados anteriormente.

Los ejemplos de antioxidantes o conservantes adecuados para la formulación en la presente invención incluyen tocoferol, dibutil-hidroxitolueno, pentilenglicol, catequinas, ácido benzoico, isopropilmetilfenol, ácido salicílico, parahidroxibenzoato, fenoxietanol.

Los ejemplos de agentes emolientes adecuados para la formulación en la presente invención incluyen dihidrocolesterol, isoestearato de hexildecilo, aceite de jojoba, escualeno, estearato de colesterilo, tetraetilhexanoato de pentaeritritilo, poli(decaisoestearato de glicerilo), etilhexanoato de hexildecilo, lanolina de PEG, neopentanoato de isodecilo, alcohol chimílico, alcohol batílico, estearoil-inulina, poliisobuteno hidrogenado, tri(ácido caprílico/cáprico)glicerilo.

Los ejemplos de reguladores del pH y agentes quelantes adecuados para la formulación en la presente invención incluyen aminometilpropanol, aminometilpropanodiol, trietanolamina, ácido cítrico y otros ácidos orgánicos, EDTA.

Los ejemplos de agentes antiinflamatorios adecuados para la formulación en la presente invención incluyen ácido glicirrízico o sales del mismo, ácido glicirrético o ésteres de ácidos grasos del mismo, ácido tranexámico, bromelaína, extracto de camomila. En la presente invención, es preferible usar un agente antiinflamatorio en combinación con un electrolito mencionado anteriormente, tal como adenosina fosfato, una vitamina hidrosoluble o un derivado de vitamina hidrosoluble o una sal de la misma. Se espera que el uso combinado dé como resultado el efecto de mejorar los trastornos de la piel y el efecto de mejorar las funciones de la piel.

La composición de protección solar de la presente invención puede contener además menta piperita (mentol) y un

agente aromatizante (aceite esencial, perfume sintético), según sea necesario. Por ejemplo, la menta piperita es eficaz para otorgar frescura y aroma a la composición de protección solar. Desde este punto de vista, es preferible mezclar menta piperita en la composición de protección solar. Además, un aceite esencial puede mejorar la sensación de piel resbaladiza debido a su oleosidad y puede usarse como un agente aromatizante que es suave para la piel. Por tanto, es preferible mezclar un aceite esencial en la composición de protección solar. El aceite esencial que va a mezclarse no está particularmente limitado, siempre que sea aceite, y pueden usarse aceites esenciales convencionalmente conocidos. Particularmente cuando se usa en combinación con un compuesto a base de purina, tal como adenosina fosfato, el aceite esencial se selecciona preferiblemente de aceite de anís estrellado, aceite de hoja de cedro, aceite de cedro del Atlas, aceite de *Lavandula hybrida*, aceite de lima, aceite de menta piperita, aceite de *Pinus silvestris*, aceite de romero y aceite de trementina; y se selecciona más preferiblemente de aceite de anís estrellado, aceite de *Pinus silvestris* y aceite de *Lavandula hybrida*.

Desde estos puntos de vista, los ejemplos de otra realización de la composición de protección solar de la presente invención incluyen composiciones de protección solar que comprenden al menos dos absorbentes de ultravioleta liposolubles, partículas de silicona compuestas de caucho-resina que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos, un disolvente, un tensioactivo, un electrolito mencionado anteriormente, un agente antiinflamatorio, un aceite esencial y agua, en las que los absorbentes de ultravioleta liposolubles se seleccionan del grupo que consiste en metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo, polisilicona-15, homosalato, t-butil-metoxibenzoil-metano, salicilato de etilhexilo, etilhexiltriazona, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, oxibenzona-3 y drometrisol-trisiloxano.

La forma de la composición de protección solar de la presente invención puede ser monofásica o multifásica, sin limitación, y pueden emplearse diversas formas convencionalmente conocidas dependiendo del fin. Además, la composición de protección solar de la presente invención puede usarse además como un líquido con un efecto de protección solar, tal como una loción, loción lechosa y esencia; un cosmético de maquillaje, tal como prebase de maquillaje, base de maquillaje y pintalabios; y particularmente un cosmético de maquillaje líquido.

La composición de protección solar de la presente invención tiene una forma de emulsión de tipo agua en aceite en cuanto a potenciar la resistencia al agua.

La composición de protección solar de la presente invención puede producirse mezclando de manera adecuada los componentes, tales como los absorbentes de ultravioleta liposolubles anteriores y las partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos mediante un método convencionalmente conocido, de modo que se obtengan el valor de SPF deseado, el valor de PFA deseado, la viscosidad deseada y/o la forma deseada, dependiendo del fin.

El número de veces de aplicación de la composición de protección solar de la presente invención a la piel no está particularmente limitado. Por ejemplo, el efecto puede obtenerse suficientemente aplicando la composición de protección solar en una cantidad de aproximadamente 2 mg por  $\text{cm}^2$  una vez cada dos horas.

La composición de protección solar de la presente invención muestra un excelente efecto de protección solar cuando se aplica a la piel. En particular, la composición de protección solar de la presente invención puede mostrar un alto efecto tanto contra SPF como contra PA. El efecto de protección solar puede ejercerse suficientemente en un lugar expuesto a altas dosis de radiación ultravioleta. Además, el SPF y el PA de la composición de protección solar de la presente invención puede establecerse de manera adecuada a valores deseados. Esta composición de protección solar puede mostrar un excelente efecto de protección solar tanto contra SPF como contra PA cuando se aplica a la piel.

Puesto que la composición de protección solar de la presente invención se forma en una emulsión de tipo agua en aceite, la composición de protección solar de la presente invención tiene, en particular, resistencia al agua contra el sudor, el agua. Dado que la composición de protección solar de la presente invención se forma en una emulsión de tipo agua en aceite, la composición de protección solar de la presente invención tiene un SPF deseado y un PA deseado, al tiempo que tiene excelentes efectos adicionales de que la composición de protección solar apenas se elimina de la piel debido al sudor, al agua e inhibe o evita la reducción en el efecto de protección ultravioleta con el tiempo. Cuando la composición de protección solar de la presente invención se forma en una emulsión de tipo agua en aceite líquida, la composición de protección solar de la presente invención tiene un excelente efecto adicional en cuando a una mejor sensación de piel resbaladiza. Además, cuando la composición de protección solar de la presente invención contiene una cantidad de electrolito específica, esta composición tiene, en particular, una excelente estabilidad con el tiempo.

Por consiguiente, la composición de protección solar de la presente invención no sólo es útil para su uso en la vida cotidiana, tal como cuando se permanece en el interior y cuando se sale durante un corto periodo de tiempo, sino que también muestra una excelente capacidad de protección ultravioleta y resistencia al agua en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta, tales como lugares en los que se disfruta de actividades al aire libre y deportes al aire libre, para los que se requiere un efecto de protección ultravioleta incluso mayor. Esta composición de protección solar también puede usarse eficazmente como una composición de protección solar que es resistente al agua y al sudor y

que es agradable de usar.

Además, según una realización de la presente invención, puede producirse una composición de protección solar que es menos probable que provoque blanqueamiento de la piel cuando se aplica a la piel. Muchas de las composiciones de protección solar convencionales provocan blanqueamiento artificial de la piel cuando se aplican a la piel, estropeando de ese modo la sensación de uso. Puesto que la composición de protección solar de la presente invención es menos probable que provoque blanqueamiento de la piel cuando se aplica a la piel, también puede mejorarse la sensación de uso en este sentido. Además, según una realización de la presente invención, una composición de protección solar en forma de una emulsión de tipo agua en aceite, que incluso contiene un electrolito, tal como adenosina fosfato, muestra un alto efecto de protección solar, tal como se describió anteriormente, al tiempo que potencia una función derivada del electrolito, tal como normalización de la función de permeabilidad a la humedad de la piel, haciendo de ese modo que la composición de protección solar sea más suave para la piel. Además, puesto que la composición de protección solar de la presente invención puede eliminarse por lavado fácilmente de la piel después de su uso, la composición tiene las ventajas de que no es necesario aplicar una estimulación excesiva (por ejemplo, frotar excesivamente la piel) para eliminar por lavado la composición de protección solar y de que se reducen la inconveniencia con respecto a la dificultad en la eliminación por lavado y el malestar.

Por consiguiente, puede decirse que la presente invención proporciona el uso de dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles y partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos y al menos un electrolito mencionado anteriormente para mejorar el efecto de protección ultravioleta de la composición de protección solar, en cuando al valor de SPF, la resistencia al agua, el valor de PAF y/o la estabilidad con el tiempo. Además, debido al uso de dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles y partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos y al menos un electrolito mencionado anteriormente, puede decirse que la presente invención proporciona un método para mejorar el efecto de protección ultravioleta de la composición de protección solar que comprende los absorbentes de ultravioleta liposolubles, en cuanto al valor de SPF, la resistencia al agua, el valor de PAF y/o la estabilidad con el tiempo.

### Ejemplos

A continuación, la presente invención se describe con referencia a los ejemplos; sin embargo, la presente invención no se limita a estos ejemplos.

#### Ejemplo de prueba 1

##### 1. Producción de la composición de protección solar

Se mezclaron los componentes mostrados en la tabla 1 a continuación en cada razón de mezclado, preparándose de ese modo composiciones de protección solar de tipo agua en aceite similares a una emulsión (ejemplos 1 a 3). Obsérvese que la unidad de cada razón de mezclado en la tabla es % en peso.

Tabla 1

	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3	Ej. comp. 1
Metoxicinamato de etilhexilo *1	7	7	7	7
Octocrileno *2	3	3	3	3
Benzoato de dietilamino-hidroxi-benzoil-hexilo *3	4	4	4	4
Polisilicona-15 *4	3,5	3,5	3,5	3,5
Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 $\mu\text{m}$ ) *5	4	4	4	0
Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 12 $\mu\text{m}$ ) *6	0	0	0	4
Dimeticona *7	0	0,2	0	0
Dimeticona *8	1	0,8	1	3
Caprilil meticona *9	2,5	2,5	2,5	0
Difenilsiloxifenil trimeticona *10	0,3	0,3	0,3	0,5
Benzoato de alquilo C <sub>12-15</sub> *11	5	5	5	3
Ciclopentasiloxano *12	14	14	14	16

ES 2 864 325 T3

Ciclopentasiloxano/dimeticonol *13	0	0	0,5	0
Ciclopentasiloxano/trimetilsiloxisilicato *14	0,5	0,5	0,5	0,5
Ciclopentasiloxano/polimetilsilsesquioxano *15	0	0	0	1
Polimetilsilsesquioxano (diámetro de partícula promedio: 6 µm) *16	3	3	3	4
Polimetilsilsesquioxano *17	2	2	2	0
Ácido fenilbencimidazol-sulfónico *18	1,5	1,5	1,5	1,5
Polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9 *19	2,4	2,4	2,4	2,5
Dipolihidroxiestearato de PEG-30 *20	0,2	0,2	0,2	0,2
Etanol	7,5	7,5	7,5	7,5
Adenosina 5'-monofosfato	0,5	0,5	0,5	0,5
Antioxidante, conservante	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada
Agente quelante, regulador del pH, agente emoliente, agente aromatizante	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada
Hidratante, agente antiinflamatorio	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada
Agua	25-30	25-30	25-30	25-30
Total	100	100	100	100

\*1: nombre comercial "Uvinul MC80N" (producido por BASF)

\*2: nombre comercial "Eusolex OCR" (producido por Merck)

5 \*3: "Uvinul A Plus Granular" (producido por BASF)

\*4: nombre comercial "Parsol SLX" (producido por DSM)

\*5: nombre comercial "KSP-100" (producido por Shin-Etsu Chemical)

10 \*6: nombre comercial "KSP-101" (producido por Shin-Etsu Chemical)

\*7: nombre comercial "KF-96A-6CS" (producido por Shin-Etsu Chemical)

15 \*8: nombre comercial "KF-96A-50000CS" (producido por Shin-Etsu Chemical)

\*9: nombre comercial "SS-3408" (producido por Dow Corning Toray)

\*10: nombre comercial "KF-56A" (producido por Shin-Etsu Chemical)

20 \*11: nombre comercial "Crodamol AB" (producido por Croda)

\*12: nombre comercial "SH245 Fluid" (producido por Dow Corning Toray)

25 \*13: nombre comercial "1501 Fluid" (producido por Dow Corning Toray)

\*14: nombre comercial "KF-7312J" (producido por Shin-Etsu Chemical)

30 \*15: nombre comercial "SilForm Flexible Fluid" (producido por Momentive)

\*16: nombre comercial "Tospearl 2000B" (producido por Momentive)

\*17: nombre comercial "KMP-590" (producido por Shin-Etsu Chemical)

35 \*18: nombre comercial "Parsol HS" (producido por DSM)

\*19: nombre comercial "KF-6038" (producido por Shin-Etsu Chemical)

\*20: nombre comercial "Cithrol DPHS AP" (producido por Croda)

Como ejemplo comparativo, se produjo una composición de protección solar de la misma manera usando un crosopolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) que tiene un diámetro de partícula promedio de 12 µm (ejemplo comparativo 1), en lugar del crosopolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) que tiene un diámetro de partícula promedio de 5 µm mostrado en la tabla 1.

## 2. Medición del SPF

Se midieron los valores de SPF de las composiciones de protección solar producidas en los ejemplos 1 a 3 y el ejemplo comparativo 1 en un sistema *in vitro*.

Específicamente, se colocaron cada una de las composiciones de protección solar de los ejemplos 1 a 3 y el ejemplo comparativo 1 sobre la totalidad de la superficie de diferentes placas (Helioplate (marca registrada) HD6, producida por HerioScreen Lab.) en forma de una pequeña mancha usando una pipeta. La cantidad de cada composición de protección solar fue de 28,7 ± 0,3 mg por placa. A continuación, se extendió rápidamente la composición de protección solar a lo largo de la totalidad de la placa con una fuerza ligera y, a continuación, se aplicó de manera uniforme a la totalidad de la placa. Después de dejar reposar la placa a temperatura ambiente en un lugar oscuro durante 15 minutos, se midieron los valores de SPF de la placa usando un dispositivo UV-2000S (producido por Labsphere) y se obtuvo su valor promedio.

Tabla 2

	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3	Ej. comp. 1
Valor de SPF	85	94	77	39

## 3. Resultados

Tal como resulta evidente a partir de la tabla 2, las composiciones de protección solar de los ejemplos 1 a 3 mostraron un SPF que era significativamente superior a la composición de protección solar del ejemplo comparativo 1. Esto demostró que las composiciones de protección solar de los ejemplos 1 a 3 pueden potenciar adicionalmente el efecto de los absorbentes de ultravioleta. Aunque puede haber un hueco entre los valores de SPF medidos en el sistema *in vitro* y los valores de SPF evaluados en humanos, dependiendo de la situación de medición, a partir de los valores anteriores obtenidos en los ejemplos 1 a 3 se reconoce que se obtendrá un valor de SPF de al menos 40 o más en humanos. Además, dado que se usaron absorbentes de ultravioleta liposolubles que tienen un efecto protector contra UVA en combinación en los ejemplos 1 a 3, también se reconoce que se obtendrá un alto PA, como con SPF.

Además, las composiciones de protección solar de los ejemplos 1 a 3, que estaban en forma de emulsiones de tipo agua en aceite, tienen resistencia al agua contra el sudor, el agua. Esto reveló lo siguiente: las composiciones de protección solar de los ejemplos 1 a 3 tienen además el efecto de que apenas se eliminan de la piel; no sólo son útiles para su uso en la vida cotidiana, tal como cuando se permanece en el interior y cuando se sale durante un corto periodo de tiempo, sino que también son útiles en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta, para los que se requiere un efecto de protección ultravioleta incluso mayor, en cuanto a su excelente capacidad de protección ultravioleta y resistencia al agua; y pueden usarse eficazmente como composiciones de protección solar resistentes al agua y al sudor.

Además, aunque no se muestran los resultados, las composiciones de protección solar de los ejemplos 1 a 3, que no contienen polvo de metal, tal como óxido de titanio, no provocaron un blanqueamiento artificial de la piel cuando se aplicaron a la piel, que era típico en composiciones de protección solar con un alto SPF. Por tanto, estas composiciones de protección solar fueron satisfactorias. Además, la viscosidad de las composiciones de protección solar estaba en el intervalo de baja viscosidad deseado. La sensación de piel resbaladiza de las composiciones de protección solar cumplió las expectativas, a diferencia de las preparaciones de protección solar que tienen una alta viscosidad.

### Ejemplo de prueba 2

### Ejemplos 4 a 6

#### Producción de las composición de protección solar

Se mezclaron los componentes mostrados en la tabla 3 a continuación en cada razón de mezclado, preparándose de ese modo composiciones de protección solar de tipo agua en aceite (ejemplos 4 a 6). Obsérvese que la unidad de cada razón de mezclado en la tabla es % en peso. La viscosidad de las composiciones de los ejemplos 1 a 3 fue de 150 a 250 mPa·s tal como se mide mediante un viscosímetro Brookfield a 20°C.

Tabla 3

Nombre de visualización	Ej. 4	Ej. 5	Ej. 6
Metoxicinamato de etilhexilo *1	7	7	7
Octocrileno *2	3	2,5	3,5
Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo *3	3	3	3
Polisilicona-15 *4	3	3	3
Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) *5	4	4	4
Polimetilsilsesquioxano *6	3	3	3
Ácido fenilbencimidazol-sulfónico *7	0	1	0
Glicirretinato de dipotasio	0,05	0,05	0,05
Glicirretinato de estearilo	0,05	0,05	0,05
Hialuronato de sodio	0,001	0,001	0,001
Cloruro de sodio, adenosina 5'-monofosfato	0,5-1	0,5-1	0,5-1
Disolvente, agente emoliente	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada
Tensioactivo, antioxidante, conservante	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada
Agente quelante, regulador del pH, refrigerante, agente aromatizante	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada
Agua	24-28	24-28	24-28
Total	100	100	100

\*1: nombre comercial "Uvinul MC80N" (producido por BASF)

\*2: nombre comercial "Eusolex OCR" (producido por Merck)

5 \*3: "Uvinul A Plus Granular" (producido por BASF)

\*4: nombre comercial "Parsol SLX" (producido por DSM)

10 \*5: nombre comercial "KSP-100" (producido por Shin-Etsu Chemical)

\*6: nombre comercial "Tospearl 2000B" (producido por Momentive), nombre comercial "KMP-590" (producido por Shin-Etsu Chemical)

15 \*7: nombre comercial "Parsol HS" (producido por DSM)

#### Ejemplo de prueba 2-1

#### Evaluación del SPF de la composición de protección solar del ejemplo 4

20 Se midió el valor de SPF de la composición de protección solar del ejemplo 4 producida tal como se describió anteriormente según la norma internacional ISO 24444. Específicamente, se midió el valor de SPF de la siguiente manera.

25 Se aplicó la composición de protección solar del ejemplo 4 a 10 sujetos, y la porción de prueba era un sitio entre el omóplato y la cintura. El área de aplicación de cada sujeto era de 5 cm x 7 cm y se extendieron 70 mg de la composición de protección solar con las yemas de los dedos a lo largo de la totalidad del sitio durante aproximadamente 30 segundos. Se inició la irradiación ultravioleta sobre la porción de prueba 15 minutos después de la aplicación. La fuente de luz de la irradiación ultravioleta usada fue un simulador solar de arco de xenón (Ushio Optical Maodulex, producido por Ushio Inc.) equipado con un sistema de filtro con los filtros Schott WG320 y UG11 de  
30 1 mm de grosor, y se irradió la porción de prueba con luz de radiación, incluyendo UVB (longitud de onda: de 290 a 320 nm). El número de campos de radiación fue de 6 y el área de cada campo fue de 0,5 cm<sup>2</sup>. Se amplificó el nivel de radiación en una misma tasa de 1,10. Se calculó el valor de SPF de cada sujeto como la razón de MED de la porción aplicada/MED de la porción sin aplicar en cada sujeto. Se determinó la MED (dosis eritematogena mínima) observando  
35 visualmente la respuesta de la piel 24 ± 4 horas después de la irradiación. Obsérvese que la MED indica la dosis mínima de radiación ultravioleta (tiempo) en la que se observa un ligero eritema en la piel. Se determinó el SPF de la composición de protección solar como el promedio de los valores de SPF obtenidos de esta manera. Basándose en el valor de SPF determinado de ese modo, se determina la visualización de SPF según la clasificación específica de

cada país. La tabla 2 muestra los resultados.

Tabla 4

	Promedio (n=10)
Valor de SPF	55,3

5 Tal como resulta evidente a partir de la tabla 4, el valor promedio de los valores de SPF de la composición de protección solar del ejemplo 4 fue de 55,3. Los resultados de esta prueba mostraron que la composición de protección solar del ejemplo 4 tenía un SPF de 50 o más.

10 Además, puesto que la composición de protección solar del ejemplo 4 está en forma de una forma de emulsión de tipo agua en aceite líquida, esta composición también tiene resistencia al agua contra el sudor, el agua y apenas se elimina de la piel durante su uso. Esto reveló que esta composición de protección solar no sólo es útil para su uso en la vida cotidiana, tal como cuando se permanece en el interior y cuando se sale durante un corto periodo de tiempo, sino que también es útil en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta, para los que se requiere un efecto de protección ultravioleta incluso mayor, en cuanto a su excelente capacidad de protección ultravioleta y resistencia al agua; y que esta composición de protección solar también puede usarse eficazmente como una composición de protección solar resistente al agua y al sudor. Además, se espera que la composición de protección solar del ejemplo 4, que contiene adenosina fosfato, contribuya al mantenimiento y a la mejora de la función de permeabilidad a la humedad de la piel.

20 Ejemplo de prueba 2-2

Evaluación del SPF y del PA de la composición de protección solar del ejemplo 5

25 Se midió el valor de SPF de la composición del ejemplo 5 producida tal como se describió anteriormente de la misma manera que en el ejemplo de prueba 2-1 y se evaluó el valor de PFA de la composición según las directrices convencionales de medición de la Asociación de la Industria Cosmética de Japón.

30 Se aplicó la composición de protección solar del ejemplo 5 a 10 sujetos, y la porción de prueba era un sitio entre el omóplato y la cintura. El área de aplicación de cada sujeto era de 4 cm x 6 cm y se extendieron 48 mg de la composición de protección solar con las yemas de los dedos a lo largo de la totalidad del sitio durante aproximadamente 30 segundos. Se inició la irradiación ultravioleta sobre la porción de prueba 15 minutos después de la aplicación. La fuente de luz de la irradiación ultravioleta usada fue un simulador solar de arco de xenón (Ushio Optical Maodulex, producido por Ushio Inc.) equipado con un sistema de filtro con los filtros Schott WG320 y UG11 de 35 1 mm de grosor, y se irradió la porción de prueba con luz de radiación, incluyendo UVA (longitud de onda: de 320 a 400 nm). El número de campos de radiación fue de 6 y el área de cada campo fue de 0,5 cm<sup>2</sup>. Se amplificó el nivel de radiación en una misma tasa de 1,10. Se calculó el valor de PFA de cada sujeto como la razón de MPPD de la porción aplicada/MPPD de la porción sin aplicar en cada sujeto. Se determinó la MPPD (dosis de oscurecimiento persistente de pigmentos mínima) de 2 a 4 horas después de la finalización de la irradiación. Obsérvese que la MPPD indica la dosis mínima de radiación ultravioleta en la que se observa un ligero oscurecimiento de la piel en casi la totalidad del campo de radiación de 2 a 4 horas después de la finalización de la irradiación. Se determinó el valor de PFA de la composición de protección solar como el promedio de los valores de PFA obtenidos de esta manera. Basándose en el valor de PFA determinado de ese modo, se determina la visualización de PA según la clasificación específica de 45 cada país. La tabla 3 muestra los resultados.

Tabla 5

	Promedio (n=10)
Valor de SPF	54,0
Valor de PFA	8,3

50 Tal como resulta evidente a partir de la tabla 5, el valor promedio de los valores de SPF de la composición de protección solar del ejemplo 5 fue de 54,0. Los resultados de esta prueba mostraron que la composición de protección solar del ejemplo 5 también tenía un SPF de 50 o más. Además, los resultados mostraron que el valor de PFA de la composición de protección solar del ejemplo 5 también fue de 8 o más. Por tanto, se reveló que esta composición de protección solar tenía un efecto protector notablemente alto tanto contra UVA como contra UVB.

55 Además, puesto que la composición de protección solar del ejemplo 5 también está en forma de una emulsión de tipo agua en aceite líquida, esta composición tiene resistencia al agua contra el sudor, el agua y apenas se elimina de la piel durante su uso, como con el ejemplo 4. Esto reveló que esta composición de protección solar no sólo es útil para su uso en la vida cotidiana, tal como cuando se permanece en el interior y cuando se sale durante un corto periodo de

tiempo, sino que también es notablemente útil en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta, para los que se requiere un efecto de protección ultravioleta incluso mayor, en cuanto a su excelente capacidad de protección ultravioleta y resistencia al agua, tal como se describió anteriormente; y que esta composición de protección solar puede usarse eficazmente como una composición de protección solar resistente al agua y al sudor. Además, se espera que la composición de protección solar del ejemplo 5, que también contiene adenosina fosfato, contribuya al mantenimiento y a la mejora de la función de permeabilidad a la humedad de la piel.

Ejemplo de prueba 2-3

10 Evaluación del SPF y del PA de la composición de protección solar del ejemplo 6

Se evaluaron el valor de SPF y el valor de PFA de la composición del ejemplo 6 producida tal como se describió anteriormente de la misma manera que en el ejemplo de prueba 2-2. La tabla 4 muestra los resultados.

15 Tabla 6

	Promedio (n=10)
Valor de SPF	53,3
Valor de PFA	8,1

20 Tal como resulta evidente a partir de la tabla 6, el valor promedio de los valores de SPF de la composición de protección solar del ejemplo 6 fue de 53,3. Los resultados de esta prueba mostraron que la composición de protección solar del ejemplo 6 también tenía un SPF de 50 o más. Además, los resultados mostraron que el valor de PFA de la composición de protección solar del ejemplo 6 también fue de 8 o más. Por tanto, se reveló que esta composición de protección solar también tenía un efecto protector notablemente alto tanto contra UVA como contra UVB.

25 Además, puesto que la composición de protección solar del ejemplo 6 también está en forma de una emulsión de tipo agua en aceite líquida, esta composición tiene resistencia al agua contra el sudor, el agua y apenas se elimina de la piel durante su uso, como con los ejemplos 4 y 5. Esto reveló que esta composición de protección solar no sólo es útil para su uso en la vida cotidiana, tal como cuando se permanece en el interior y cuando se sale durante un corto periodo de tiempo, sino que también es notablemente útil en lugares expuestos a altas dosis de radiación ultravioleta, para los que se requiere un efecto de protección ultravioleta incluso mayor, en cuanto a su excelente capacidad de protección ultravioleta y resistencia al agua, tal como se describió anteriormente; y que esta composición de protección solar también puede usarse eficazmente como una composición de protección solar resistente al agua y al sudor. Además, se espera que la composición de protección solar del ejemplo 6, que también contiene adenosina fosfato, contribuya al mantenimiento y a la mejora de la función de permeabilidad a la humedad de la piel.

35 Ejemplo de prueba 3

Evaluación del blanqueamiento mediante la aplicación de la composición de protección solar del ejemplo 6 y confirmación de las propiedades de lavado

40 A continuación, se sometió a prueba el blanqueamiento de la piel mediante la aplicación de la composición de protección solar del ejemplo 6 por comparación. Se realizó la evaluación del blanqueamiento usando la composición de protección solar del ejemplo 6 y cuatro agentes de protección solar disponibles comercialmente (ejemplos comparativos 2 a 5), descritos más adelante, comparando sus grados de blanqueamiento. Específicamente, se realizó la evaluación del blanqueamiento por aplicación usando elastómero de uretano que tiene un tacto y una elasticidad próximas a los de la piel humana (Bio Skin, producido por Beaulax). Con el fin de confirmar el grado de blanqueamiento por aplicación, se tomaron cada una de la composición de protección solar del ejemplo 6 y los agentes de protección solar de los ejemplos comparativos 2 a 5 en una cantidad de aproximadamente 30 mg y se aplicaron y extendieron sobre el elastómero de uretano para formar un círculo de aproximadamente 2,5 cm de diámetro. Se confirmó visualmente el grado de blanqueamiento. La figura 1 muestra los resultados.

50 A continuación, se describen los cuatro agentes de protección solar disponibles comercialmente (ejemplos comparativos 2 a 5). Todos estos agentes de protección solar contienen sólo un absorbente de ultravioleta liposoluble (metoxicinamato de etilhexilo). Más específicamente, el agente de protección solar del ejemplo comparativo 2 contiene metoxicinamato de etilhexilo, ácido fenilbencimidazol-sulfónico, polimetilsilsesquioxano, óxido de zinc, un agente aromatizante, mentol, extracto de hoja de *Mentha piperita*. El agente de protección solar del ejemplo comparativo 3 contiene metoxicinamato de etilhexilo, polimetilsilsesquioxano, óxido de zinc, talco, sílice, un agente aromatizante, acetilhialuronato de sodio. El agente de protección solar del ejemplo comparativo 4 contiene para-metoxicinamato de etilhexilo, óxido de zinc, óxido de titanio, ácido silícico, sericita, hidroxapatita, un agente aromatizante, mentol, extracto de salvia, extracto de algas. El agente de protección solar del ejemplo comparativo 5 contiene metoxicinamato de octilo, poli(metacrilato de metilo), óxido de zinc, óxido de titanio, hidróxido de aluminio, sílice, mentol, aceite de menta piperita.

Además, se usaron la composición de protección solar del ejemplo 6 y los cuatro agentes de protección solar disponibles comercialmente (ejemplos comparativos 2 a 5) para evaluar las propiedades de lavado (facilidad de eliminación por lavado de la piel). Específicamente, se tomaron cada uno de la composición de protección solar del ejemplo 6 y los agentes de protección solar de los ejemplos comparativos 2 a 5 en una cantidad de aproximadamente 0,25 g y se aplicaron a una toalla de algodón cortada en un cuadrado de 3 cm x 3 cm. Se sumergió la toalla de algodón después de la aplicación en una disolución diluida al 10% de un jabón corporal disponible comercialmente (nombre comercial: UL-OS Skin Wash, producido por Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd.) en agua corriente (dureza: 40 ppm) y se dejó en un baño caliente a 50°C durante 1,5 horas, seguido por lavado con agua y secado. Después del secado, se evaluó la cantidad de la composición de protección solar o del agente de protección solar restante en cada toalla de algodón mediante el peso.

La figura 2 muestra los resultados. Se expresaron las propiedades de lavado como una tasa de lavado (%) determinada mediante la siguiente ecuación:  $((\text{cantidad de aplicación a la toalla de algodón} - \text{cantidad restante en la toalla de algodón}) / \text{cantidad de aplicación a la toalla de algodón}) \times 100$  (n = 3, valor promedio). La figura 2 reveló que la composición de protección solar del ejemplo 6 tenía una tasa de lavado mucho mayor y que se eliminó por lavado de la piel muy fácilmente, en comparación con los agentes de protección solar de los ejemplos comparativos 2 a 5.

Tal como resulta evidente a partir de los resultados anteriores, a pesar de su alto SPF y su alto PA, la composición de protección solar del ejemplo 6 no provocó blanqueamiento artificial de la piel cuando se aplicó a la piel, que fue típico en agentes de protección solar convencionales con un alto SPF. Por tanto, esta composición de protección solar fue muy satisfactoria. Además, no se observó el problema de la dificultad de eliminación por lavado, que fue típico en agentes de protección solar convencionales con un alto SPF. Esta composición de protección solar también fue muy satisfactoria en este sentido. En las composiciones de protección solar de los ejemplos 4 y 5 también se obtienen los mismos efectos que los de la composición de protección solar del ejemplo 6. Además, la viscosidad de las composiciones de protección solar estaba en el intervalo de baja viscosidad deseado y la sensación de piel resbaladiza cumplió las expectativas, a diferencia de las preparaciones de protección solar que tienen una alta viscosidad.

#### Ejemplo de prueba 4

##### 1. Producción de la composición de protección solar

Se mezclaron los componentes mostrados en la tabla 7 a continuación en cada una de las razones de mezclado mostradas en la tabla 8, preparándose de ese modo composiciones de protección solar en forma de emulsiones de tipo agua en aceite. Obsérvese que la unidad de cada razón de mezclado en la tabla es % en peso. Específicamente, se mezclaron los componentes 1 a 9 en la tabla 7 y se dispersaron y disolvieron de manera uniforme a 60°C, preparándose de ese modo una fase de aceite A. Por separado, se mezclaron los componentes 10 a 15 en la tabla 7 y se disolvieron de manera uniforme, y se usó el componente 14 para ajustar el pH a 7, preparándose de ese modo una fase acuosa B. Se calentaron la fase de aceite A y la fase acuosa B hasta 60°C y se añadió la fase acuosa B a la fase de aceite A mientras se agitaba la fase de aceite A a 1.400 rpm usando una mezcladora (T.K. ROBO MICS, producida por Tokushu Kika Kogyo). Después de la agitación, se añadió el componente 16 y se emulsionó la mezcla agitando de nuevo a 1.400 rpm, obteniéndose de ese modo las composiciones de protección solar de los ejemplos 7 a 17 mostradas en la tabla 8.

Tabla 7

Nombre de componente	
1	Ciclopentasiloxano (nombre comercial: "SH245 Fluid" (producido por Dow Corning Toray))
2	Poliisobuteno hidrogenado
3	Metoxicinamato de etilhexilo (nombre comercial: "Uvinul MC80N" (producido por BASF))
4	Octocrileno (nombre comercial: "Eusolex OCR" (producido por Merck))
5	Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo (nombre comercial: "Uvinul A Plus Granular" (producido por BASF))
6	Polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9 (nombre comercial "KF-6038" (producido por Shin-Etsu Chemical))

7	Benzoato de alquilo C <sub>12-15</sub> (nombre comercial "Crodamol AB" (producido por Croda))
8	Polimetilsilsesquioxano (nombre comercial "Tospearl 2000B" (producido por Momentive))
9	Crosopolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm) (nombre comercial "KSP-100" (producido por Shin-Etsu Chemical))
10	Glicerol (nombre comercial: "Concentrated Glycerin" (producido por Kao Corporation))
11	Cloruro de sodio
12	Adenosina 5'-monofosfato
13	Ascorbilfosfato de magnesio (producido por Wako Pure Chemical Industries)
14	Aminometilpropanodiol (producido por GOO Chemical)
15	Agua
16	Etanol

## 2. Prueba de estabilidad

Se colocaron aproximadamente 15 g de cada muestra en un tubo de ensayo y se cubrió el tubo de ensayo con una tapa. Después de la incubación en un baño de agua a temperatura constante de 60°C durante de 4 a 7 días, se observó el estado de cada composición de protección solar. Específicamente, las composiciones de protección solar anteriores estaban en forma de emulsiones de tipo agua en aceite, que se separaron principalmente en dos fases cuando se dejaron reposar después de su producción. La fase superior era una fase de aceite y la fase inferior era una fase de emulsión en la que se dispersaron en el aceite gotas de agua tan finas que apenas podrían observarse visualmente. El estado era estable. A continuación, después de la incubación en el baño de agua a temperatura constante de 60°C anteriores durante de 4 a 7 días, se observó visualmente el estado de cada composición de protección solar.

## 3. Resultados

Las composiciones de protección solar de los ejemplos 7 a 17 mostraron un estado estable cuando se dejaron reposar después de la producción de las mismas tal como se describió anteriormente. Por tanto, se obtuvieron las composiciones de protección solar deseadas. Basándose en los resultados de los ejemplos de prueba 1 a 3, puede entenderse fácilmente que las composiciones de protección solar producidas en el ejemplo de prueba 4 también muestran los valores de SPF y valores de PFA deseados y que estas composiciones también tienen una excelente resistencia al agua debido a su forma de emulsión de tipo agua en aceite. Por tanto, según la presente invención, se reveló que pueden obtenerse composiciones de protección solar con un excelente efecto de protección ultravioleta.

Las composiciones de protección solar obtenidas en este ejemplo de prueba están en forma de emulsiones de tipo agua en aceite monofásicas excelentes, que se separan en dos fases cuando se dejan reposar. El estado de separación reversible de una emulsión que parece tener dos fases separadas a primera vista, pero que vuelve fácilmente a una forma de emulsión monofásica homogénea mediante agitación, se denomina flotación. En este ejemplo de prueba, si una composición de protección solar vuelve a una forma de emulsión monofásica homogénea mediante agitación, la estabilidad de la composición de protección solar después del almacenamiento se evalúa como buena "+". Por el contrario, los ejemplos de emulsiones de tipo agua en aceite con una estabilidad insuficiente incluyen aquellas que experimentan una separación irreversible, mediante lo cual no vuelven a una forma de emulsión homogénea ni siquiera mediante agitación. Por ejemplo, una porción de las gotas de agua se combina para formar agua, que se excluye de la fase de emulsión. En este ejemplo de prueba, si se confirma la separación irreversible en una composición de protección solar después del almacenamiento, la estabilidad de la composición de protección solar se evalúa como insuficiente "-".

Tal como se muestra en la tabla 8, se observó tal separación irreversible en los ejemplos 7 a 10 después de la incubación durante 4 días. También se observó la misma tendencia incluso después de la incubación durante 7 días y también se confirmó la separación irreversible en los ejemplos 7 a 10. En cambio, las composiciones de protección solar de los ejemplos 11 a 17 mantuvieron suficientemente la forma de emulsión adecuada incluso después de la incubación.

Estos resultados demostraron que cuando se mezcló el 0,5% en peso o más de electrolito en la composición de protección solar de la presente invención, la composición de protección solar resultante tenía el valor de SPF, el valor de PFA y una resistencia al agua deseados, así como una estabilidad con el tiempo notablemente excelente.

5

Tabla 8

Componente	Ej. 7	Ej. 8	Ej. 9	Ej. 10	Ej. 11	Ej. 12	Ej. 13	Ej. 14	Ej. 15	Ej. 16	Ej. 17
1	24	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada
2	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10
3	7,5	7,5	7,5	7,5	7,5	7,5	7,5	7,5	7,5	7,5	7,5
4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
5	2	2	2	2	2	2	2	2	2	2	2
6	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5	2,5
7	7	7	7	7	7	7	7	7	7	7	7
8	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
9	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
10	2	2	2	2	2	2	2	2	2	2	2
11	0	0	0,2	0	0,4	0,4	0,5	0,9	0,7	2,9	4,9
12	0	0,1	0,1	0,3	0,1	0	0	0,1	0,3	0,1	0,1
13	0	0	0	0	0	0,1	0	0	0	0	0
14	0	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada	Cantidad adecuada
15	25	25	25	25	25	25	25	25	25	25	25
16	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
Concentración de electrolito	0	0,1	0,3	0,3	0,5	0,5	0,5	1	1	3	5
Antes de la incubación	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+
60°C, 4 días	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	+
60°C, 7 días	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	+

Ejemplos de formulación

5 Basándose en los resultados obtenidos en los ejemplos de prueba 1 a 4, se prepararon las composiciones de protección solar de la siguiente manera. La unidad en cada ejemplo de formulación es % en peso. Todas las combinaciones siguientes muestran altos valores de SPF y altos valores de PFA; por tanto, puede determinarse que puede obtenerse el efecto deseado.

Ejemplo de formulación 1

- 10 Ciclopentasiloxano: 20  
Poliisobuteno hidrogenado: 5
- 15 Benzoato de alquilo: 7  
Caprilil meticona: 3
- 20 Metoxicinamato de etilhexilo: 7,5  
Octocrileno: 3  
Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 3
- 25 Polisilicona-15: 3,5  
Polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9: 2,5
- 30 Cospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 5  
Polimetilsilsesquioxano: 5  
Etanol: 7,5
- 35 Antioxidante: cantidad adecuada  
Fenoxietanol: 0,2  
1,2-Pentanodiol: 3
- 40 Adenosina monofosfato de disodio: 0,5  
Glicirrizato de dipotasio: 0,1
- 45 Cloruro de sodio: 0,5  
Ácido cítrico: cantidad adecuada  
Agua: 23
- 50 Total: 100

Ejemplo de formulación 2

- 55 Ciclopentasiloxano: 25  
Benzoato de alquilo: 5
- 60 Tetraetilhexanoato de pentaeritrito: 3  
Metoxicinamato de etilhexilo: 7,5  
Octocrileno: 3
- 65 Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 3

## ES 2 864 325 T3

	Polisilicona-15: 3,5
	Ácido fenilbencimidazol-sulfónico: 1
5	Dimeticona de PEG-10: 3
	Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 4,5
10	Polimetilsilsesquioxano: 4
	Trimetilsiloxisilicato: 1
	Etanol: 6
15	Antioxidante: cantidad adecuada
	Fenoxietanol: 0,2
20	1,2-Pentanodiol: 2
	Adenosina monofosfato: 0,5
	Glicirretinato de estearilo: 0,05
25	Trietanolamina: cantidad adecuada
	Agua: 27
30	Total: 100
	<u>Ejemplo de formulación 3</u>
	Ciclopentasiloxano: 12
35	Poliisobuteno hidrogenado: 15
	Benzoato de alquilo: 4
40	Trietilhexanoato de eritritilo: 4
	Metoxicinamato de etilhexilo: 7,5
	Octocrileno: 5
45	Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 2
	Bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina: 1
50	Estearoil-inulina: 0,5
	Polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9: 1,7
	Dipolihidroxiestearato de PEG-30: 0,5
55	Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 4,5
	Polimetilsilsesquioxano: 5
60	Trimetilsiloxisilicato: 1
	Etanol: 7
	Antioxidante: cantidad adecuada
65	Fenoxietanol: 0,2

1,2-Pentanodiol: 2

Adenosina monofosfato: 0,1

5 Cloruro de sodio: 0,5

Glicirrizato de dipotasio: 0,03

Glicirretinato de estearilo: 0,03

10 Aminometilpropanodiol: cantidad adecuada

Agua: 26

15 Total: 100

Ejemplo de formulación 4

Ciclopentasiloxano: 20

20 Poliisobuteno hidrogenado: 5

Benzoato de alquilo: 8

25 Caprilil meticona: 3

Metoxicinamato de etilhexilo: 7,5

Octocrileno: 3

30 Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 3

Polisilicona-15: 3,5

35 Poldimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9: 2,5

Dipolihidroxiestearato de PEG-30: 0,3

Crosopolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 5

40 Polimetilsilsesquioxano: 5

Etanol: 7,5

45 Antioxidante: cantidad adecuada

Fenoxietanol: 0,2

1,2-Pentanodiol: 3

50 Adenosina monofosfato: 0,5

Cloruro de sodio: 0,5

55 Aminometilpropanodiol: cantidad adecuada

Agua: 27

Total: 100

60 Ejemplo de formulación 5

Ciclopentasiloxano: 25

65 Benzoato de alquilo: 5

	Tetraetilhexanoato de pentaeritrito: 3
	Metoxicinamato de etilhexilo: 7,5
5	Octocrileno: 3
	Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 3
	Polisilicona-15: 3,5
10	Ácido fenilbencimidazol-sulfónico: 1
	Polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9: 2
15	Dipolihidroxiestearato de PEG-30: 0,5
	Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 4,5
	Polimetilsilsesquioxano: 4
20	Trimetoxisilicato: 1
	Etanol: 7,5
25	Antioxidante: cantidad adecuada
	Fenoxietanol: 0,2
	1,2-Pentanodiol: 2
30	Adenosina monofosfato: 0,5
	Trietanolamina: cantidad adecuada
35	Agua: 27
	Total: 100
	<u>Ejemplo de formulación (fuera la invención)</u>
40	Ciclopentasiloxano: 25
	Caprilil meticona: 3
45	Benzoato de alquilo: 5
	Metoxicinamato de etilhexilo: 10
	Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 3
50	Óxido de titanio particulado hidrofobizado: 3
	Óxido de zinc particulado hidrofobizado: 3
55	Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 4
	Polidimetilsiloxietil dimeticona de PEG-9: 3
	Trimetilsiloxisilicato: 1
60	Glicerol: 2
	Etanol: 8
65	Fenoxietanol: 0,2

1,2-Pentanodiol: 1

Glicerol: 1

5 Cloruro de sodio: 0,5

Antioxidante: cantidad adecuada

Agua: 27

10

Total: 100

Ejemplo de formulación 7

15 Ciclopentasiloxano: 10

Poliisobuteno hidrogenado: 15

Benzoato de alquilo: 5

20

Trietilhexanoato de eritritilo: 4

Metoxicinamato de etilhexilo: 7

25 Octocrileno: 4

Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 3

Polisilicona-15: 3

30

Estearoil-inulina: 0,5

Dimeticona altamente polimerizada: 0,2

35 Poldimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9: 1,7

Dipolihiidroxiestearato de PEG-30: 0,5

Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 4,5

40

Polimetilsilsesquioxano: 3

Trimetoxisilicato: 1

45 Etanol: 7

Antioxidante: cantidad adecuada

Fenoxietanol: 0,2

50

1,2-Pentanodiol: 2

Adenosina monofosfato: 0,1

55 Ascorbilfosfato de magnesio: 1

Aminometilpropanodiol: cantidad adecuada

Agua: 26

60

Total: 100

Ejemplo de formulación 8

65 Ciclopentasiloxano: 20

## ES 2 864 325 T3

	Dimeticona: 5
	Benzoato de alquilo: 5
5	Trietilhexanoato de eritritilo: 4
	Metoxicinamato de etilhexilo: 7,5
10	Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 3
	Polisilicona-15: 5
	Polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9: 1,7
15	Dipolihidroxiestearato de PEG-30: 0,4
	Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 4,5
20	Polimetilsilsesquioxano: 3
	Etanol: 6
	Antioxidante: cantidad adecuada
25	Fenoxietanol: 0,1
	1,2-Pentanodiol: 1
30	Glicerol: 2
	Mentol: 0,2
	Aceite esencial: 0,1
35	(aceite de anís estrellado, aceite de <i>Pinus silvestris</i> , aceite de <i>Lavandula hybrida</i> )
	Adenosina monofosfato: 1
40	Aminometilpropanodiol: cantidad adecuada
	Agua: 30
	Total: 100
45	<u>Ejemplo de formulación 9</u>
	Ciclopentasiloxano: 15
50	Poliisobuteno hidrogenado: 15
	Etanol: 8
	Metoxicinamato de etilhexilo: 8
55	Benzoato de alquilo C <sub>12-15</sub> : 6
	Polimetilsilsesquioxano: 5
60	Crospolímero de (vinil dimeticona/silsesquioxano de meticona) (diámetro de partícula promedio: 5 µm): 5
	Benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo: 3
	Polisilicona-15: 3
65	Glicerol: 3

## ES 2 864 325 T3

	Polidimetilsiloxietil dimeticona de lauril-PEG-9: 2,5
	Cloruro de sodio: 1
5	Adenosina monofosfato: 0,5
	Extracto de <i>Artemisia capillaris</i> : cantidad adecuada
	Extracto de trébol: cantidad adecuada
10	Aminometilpropanodiol: cantidad adecuada
	1,3-Butilenglicol: cantidad adecuada
15	Éster de ácido graso de glicerol: cantidad adecuada
	Antioxidante: cantidad adecuada
	Agua: 23
20	Total: 100

**REIVINDICACIONES**

- 5 1. Composición de protección solar que comprende dos o más absorbentes de ultravioleta liposolubles, partículas de silicona compuestas que tienen un diámetro de partícula promedio de 10  $\mu\text{m}$  o menos y al menos un electrolito, que es al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en adenosina fosfato, ácido ascórbico, derivados del ácido ascórbico, sales de los mismos, cloruro de sodio, cloruro de magnesio y cloruro de calcio, en la que la composición de protección solar está libre de un agente de dispersión de ultravioleta, el electrolito está contenido en una cantidad del 0,5% en peso o más en la composición de protección solar, la composición de protección solar está en forma de una emulsión de tipo agua en aceite (W/O) y los derivados del ácido ascórbico se seleccionan del grupo que consiste en ascorbilfosfato de magnesio, ascorbilfosfato de sodio, ascorbilsulfato de disodio, ascorbato de glucósido, ascorbato de glucosamina y ácido deshidroascórbico.
- 15 2. Composición de protección solar según la reivindicación 1, en la que el electrolito es al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en adenosina monofosfato y sales de la misma.
3. Composición de protección solar según la reivindicación 1 ó 2, en la que está contenida del 10 al 40% en peso de agua en la composición de protección solar.
- 20 4. Composición de protección solar según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles son al menos dos miembros seleccionados del grupo que consiste en metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo, absorbentes de ultravioleta a base de polisilicona, homosalato, t-butil-metoxibenzoil-metano, salicilato de etilhexilo, etilhexiltriazona, bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, oxibenzona-3 y drometrisol-trisiloxano.
- 25 5. Composición de protección solar según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles son al menos dos miembros seleccionados del grupo que consiste en metoxicinamato de etilhexilo, octocrileno, benzoato de dietilamino-hidroxibenzoil-hexilo y polisilicona-15.
- 30 6. Composición de protección solar según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en la que las partículas de silicona compuestas son partículas de silicona compuestas en las que caucho de silicona está recubierto con una resina de silicona.
- 35 7. Composición de protección solar según la reivindicación 6, en la que las partículas de silicona compuestas son partículas de silicona compuestas en las que caucho de silicona esférico está recubierto con una resina de silicona.
- 40 8. Composición de protección solar según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles están contenidos en una cantidad total del 10% en peso o más.
- 45 9. Composición de protección solar según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en la que los absorbentes de ultravioleta liposolubles están contenidos en una cantidad total del 10 al 25% en peso, las partículas de silicona compuestas están contenidas en una cantidad del 4 al 20% en peso y el electrolito está contenido en una cantidad del 0,5 al 10% en peso.

Fig. 1

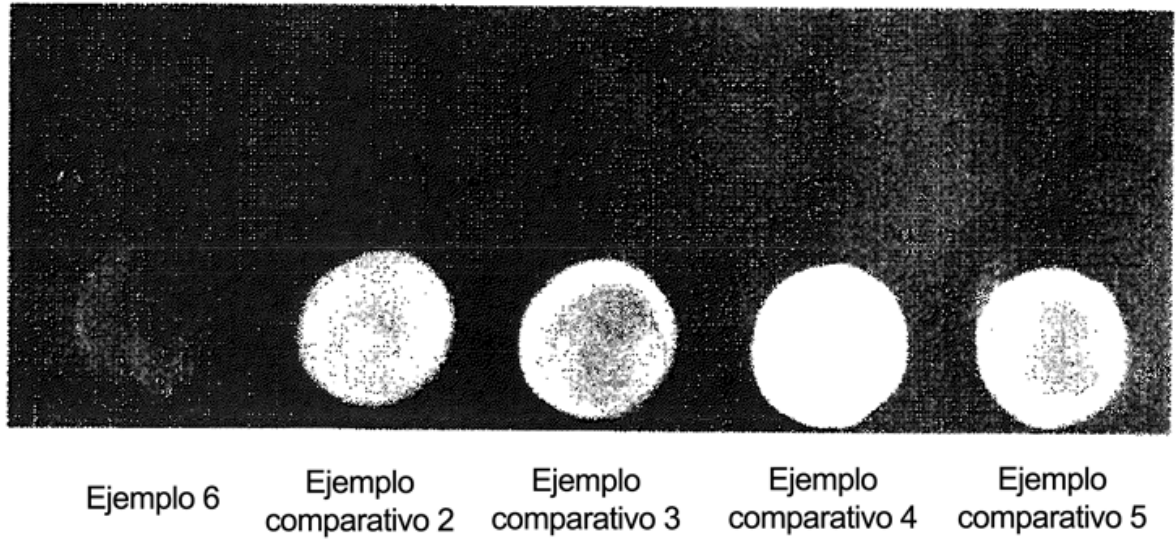


Fig. 2

