

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **3 004 871**

51 Int. Cl.:

A61K 8/35 (2006.01)
A61K 8/44 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01)
A61K 8/60 (2006.01)
A61Q 17/04 (2006.01)
A61Q 19/04 (2006.01)
A61K 8/895 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **07.11.2018** **PCT/EP2018/080383**
87 Fecha y número de publicación internacional: **16.05.2019** **WO19091992**
96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **07.11.2018** **E 18800089 (7)**
97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **23.10.2024** **EP 3709956**

54 Título: **Composiciones cosméticas o dermatológicas**

30 Prioridad:

13.11.2017 EP 17201411

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
13.03.2025

73 Titular/es:

DSM IP ASSETS B.V. (100.00%)
Wilhelminasingel 39
6221 BE Maastricht, NL

72 Inventor/es:

IMFELD, DOMINIK;
JACKSON, EILEEN;
LAURENT, GUILLAUME BERNARD y
SCHENK, KERSTIN KATHARINA

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 3 004 871 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Composiciones cosméticas o dermatológicas

- 5 La presente invención se refiere a nuevas composiciones cosméticas o dermatológicas que comprenden un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato y al menos un agente autobronceador. Las composiciones son adecuadas para el bronceado artificial/sin sol y/o el oscurecimiento de la piel humana, así como para restaurar y/o mejorar la función de barrera de la piel.
- 10 Por la expresión “agente autobronceador” o “agente bronceador artificial/sin sol” se entienden los agentes que, aplicados tópicamente sobre la piel, en particular sobre la cara, producen un efecto bronceador con un aspecto más o menos similar al que resulta de una exposición prolongada al sol (bronceado natural) o bajo una lámpara UV.
- 15 Hoy en día es importante tener un buen aspecto, y una piel bronceada siempre es signo de buena salud. Sin embargo, el bronceado natural no siempre es deseable, ya que requiere una exposición prolongada a la radiación UV que provoca el oscurecimiento de la piel pero, por otro lado, induce daños en la piel como aumento de arrugas, elastosis, cambios pigmentarios, lesiones cutáneas precancerosas y cancerosas. Por ello, es deseable contar con una alternativa al bronceado natural. Por lo tanto, los ingredientes autobronceadores están ganando cada vez más importancia para diversas aplicaciones en el mercado del cuidado de la piel y del sol.
- 20 La mayoría de los productos cosméticos para el bronceado artificial de la piel (es decir, autobronceadores) contienen como componente activo (es decir, como agente autobronceador) derivados de carbonilo que permiten la formación de compuestos coloreados por interacción con los aminoácidos de la piel. Estos agentes autobronceadores incluyen compuestos mono- o policarbonílicos, tales como, por ejemplo, isatina, aloxano, ninhidrina, gliceraldehído, aldehído mesotartárico, glutaraldehído, eritrola y dihidroxiacetona (DHA).
- 25 Sin embargo, los ingredientes autobronceadores actualmente disponibles, tales como en particular la eritrola o la dihidroxiacetona, tienden a deteriorar la función de barrera de la piel, lo que conduce a un aumento de la pérdida de agua de la piel, que puede medirse por una mayor pérdida de agua transepidérmica (TEWL). Los valores elevados de TEWL, como marcador de una función alterada de la barrera cutánea, se correlacionan además frecuentemente con una baja hidratación del estrato córneo, es decir, una menor humectación de la piel.
- 30 El documento WO2010/020626 describe composiciones que comprenden al menos un dióxido de titanio específico y al menos un agente autobronceador y un vehículo cosméticamente aceptable. Las composiciones son especialmente adecuadas para el bronceado artificial/sin sol y/o el oscurecimiento de la piel humana.
- 35 Además, los ingredientes autobronceadores actuales tienden a penetrar en la piel, especialmente en la piel seca, dejando manchas oscuras que parecen completamente antinaturales.
- 40 Por lo tanto, existe una necesidad constante de autobronceadores eficaces que contrarresten el deterioro de la barrera cutánea causado por los agentes autobronceadores, y que por tanto sean capaces de restaurar o mejorar la función de barrera de la piel para mantener su integridad, salud y aspecto. Además, existe una necesidad de ingredientes que mejoren la eficacia bronceadora de los agentes autobronceadores, permitiendo reducir sus niveles de uso para minimizar sus posibles efectos adversos.
- 45 Ahora se ha descubierto sorprendentemente que la adición de un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato a composiciones cosméticas que comprenden un agente autobronceador supera las deficiencias de la técnica anterior al mejorar significativamente la eficacia bronceadora de la piel del agente autobronceador, al mismo tiempo que restaura la función de barrera de la piel y por lo tanto es útil para mejorar la integridad, la salud y el aspecto de la piel. Por lo tanto, estas composiciones son especialmente adecuadas para el bronceado de la piel seca.
- 50 Así, la invención se refiere a una composición cosmética o dermatológica que comprende una cantidad eficaz de eritrola y una cantidad eficaz de un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato como se define en la reivindicación. Además, la invención se refiere al uso de tales composiciones para el bronceado artificial/sin sol y/o el oscurecimiento de la piel humana, así como para restaurar y/o mejorar la función de barrera de la piel.
- 55 Se entiende bien que, en todas las realizaciones de la presente invención, el filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato se utiliza como un filtro UV distinto y separado y no en forma de un recubrimiento sobre un dióxido de titanio, recubrimiento que se adhiere a la superficie del dióxido de titanio.
- 60 La invención también se refiere a la aplicación tópica de composiciones según la invención para colorear/oscurer la piel para impartir un aspecto similar al bronceado natural de la piel, para mejorar el brillo natural de la piel, para proporcionar un aspecto saludable de la piel y/o para restaurar y/o mejorar la función de barrera de la piel.
- 65

En todas las realizaciones de la presente invención, preferiblemente, las composiciones están libres de (es decir, no contienen) un dióxido de titanio recubierto con un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato tal como en particular polisilicona-15, combinación que conduce a una coloración no deseada de la composición.

En todas las realizaciones de la presente invención, las composiciones incluso más preferiblemente no contienen un dióxido de titanio que está sustancialmente libre de cualquier recubrimiento de aluminio. En una realización aún más preferida, las composiciones según la presente invención están completamente libres de (es decir, no contienen) ningún dióxido de titanio (recubierto o no recubierto) ya que la combinación de los mismos conduce a una coloración no deseada de la composición.

Según ciertas realizaciones, restaurar y/o mejorar la función de barrera de la piel comprende al menos uno de restaurar, mantener o reducir la tasa de deshidratación de la piel, y restaurar, mantener o promover el valor de hidratación de la piel.

Según otras realizaciones, las composiciones cosméticas o dermatológicas según la presente invención son eficaces en al menos uno de los siguientes: mejorar la salud de la piel, la integridad de la piel, la firmeza de la piel, la extensibilidad de la piel, la elasticidad de la piel, el embellecimiento del aspecto general de la piel y cualquier combinación de los mismos. Cada posibilidad representa una realización separada de la presente invención.

La presente invención también se refiere a un método para broncear o dar color artificialmente la piel así como para hidratarla, comprendiendo dicho método la aplicación tópica de una cantidad eficaz de una composición según la invención.

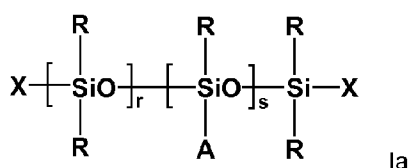
Además, la invención se refiere al uso de un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato para restaurar y/o mejorar la función de barrera de la piel tratada con una eritrusosa, tal como en particular para restaurar, respectivamente reducir, la tasa de deshidratación de la piel, y restaurar, respectivamente mejorar, el valor de hidratación de la piel, en comparación con el tratamiento con el agente autobronceador solo.

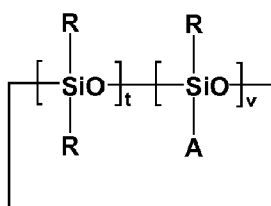
En otra realización, la invención se refiere al uso de un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato para mejorar la eficacia del bronceado de un agente autobronceador, tal como en particular la eritrusosa, y opcionalmente apreciar el efecto. La mejora del bronceado de la piel mediante las composiciones inventivas se puede evaluar midiendo la luminosidad (valor L) de la piel con un cromómetro.

En otra realización, la invención se refiere al uso de un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato, tal como en particular polisilicona-15, en combinación con un agente autobronceador, tal como en particular eritrusosa, en una composición cosmética o dermatológica para reducir (sinérgicamente) la luminosidad (valor L) de la piel tratada con la composición inventiva y opcionalmente apreciar el efecto. En particular, la luminosidad se reduce en al menos 0,5, más preferiblemente en al menos 1. La luminosidad se mide después de 24 h utilizando un cromómetro, y se compara con la composición respectiva que comprende únicamente el tipo benzalmalonato, tal como en particular la polisilicona-15, o el agente autobronceador, tal como en particular la eritrusosa.

La expresión "cantidad efectiva", como se utiliza aquí, se refiere a una cantidad necesaria para obtener un efecto fisiológico. El efecto fisiológico puede conseguirse con una dosis única o con dosis repetidas. La dosis administrada puede, por supuesto, variar dependiendo de factores conocidos, tales como las características fisiológicas de la composición particular y su modo y vía de administración; la edad, la salud y el peso del receptor; la naturaleza y grado de los síntomas; el tipo de tratamiento concurrente; la frecuencia del tratamiento; y el efecto deseado, y se puede ajustar por una persona experta en la técnica.

Los filtros UV basados en polisiloxano preferidos según la presente invención son compuestos de polisiloxano lineales o cíclicos según la fórmula Ia o Ib:



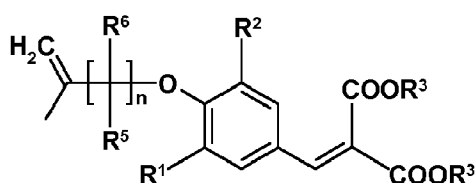


Ib,

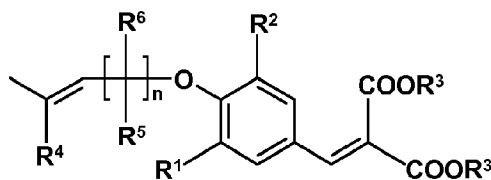
en las que

5 X es R o A;

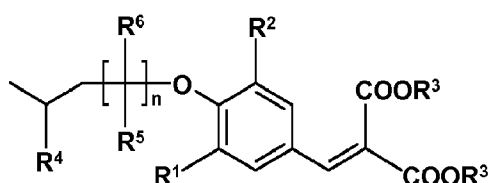
A se selecciona de la fórmula IIa y/o IIb o IIc:



IIa



IIb



IIc;

15 R es hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o fenilo;

R¹ y R² son cada uno independientemente hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₆ o alcoxi C₁₋₆;

20 R³ es alquilo C₁₋₆;

R⁴ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

25 r es de 0 a 250;

s es de 0 a 20;

r + s es al menos 3;

30 t es de 0 a 10;

v es de 0 a 10;

35 v + t es al menos 3; y

n es de 1 a 6;

con la condición de que cuando s es 0, al menos un X es A.

40

La expresión "alquilo C₁₋₆" se refiere a grupos tales como metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, sec. butilo, isobutilo, pentilo y neopentilo. La expresión "alcoxi C₁₋₆" se refiere a los grupos alcoxi correspondientes.

En todas las realizaciones de la presente invención, R es preferiblemente metilo.

Los restos R¹ y R² son preferiblemente hidrógeno, metoxi o etoxi, más preferiblemente hidrógeno, o uno de R¹ y R² es hidrógeno y el otro es metilo, metoxi o etoxi.

Los restos R³ son preferiblemente metilo o etilo, más preferiblemente etilo.

Preferiblemente, R⁴ es hidrógeno o metilo, R⁵ y R⁶ son hidrógeno, y n es 1.

Los compuestos de polisiloxano que tienen un grupo A de fórmula general IIa y IIb, y su preparación, se describen en la solicitud de patente europea EP-A0538431. Estos compuestos de polisiloxano son los más preferidos.

Los compuestos de polisiloxano que tienen un grupo A de fórmula general IIc, y su preparación, se describen en la solicitud de patente europea EP-A 0358 584.

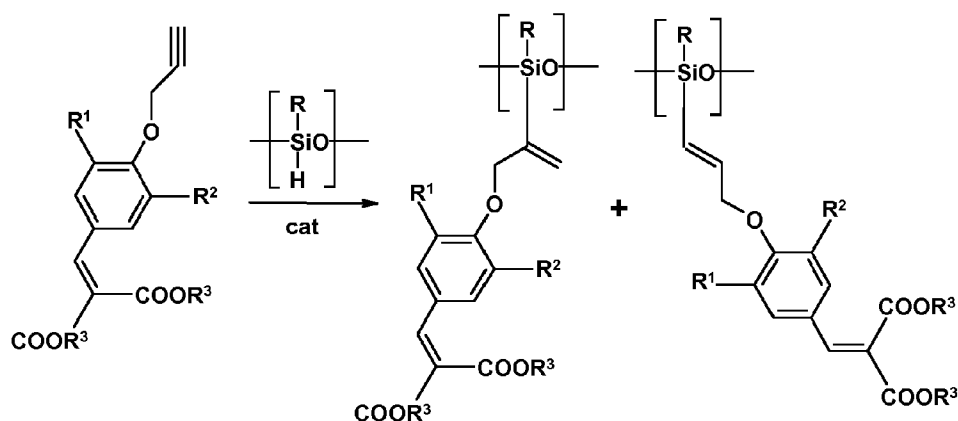
En los compuestos de polisiloxano lineales según la fórmula Ia, el resto portador del cromóforo A puede estar conectado a los grupos del extremo del polisiloxano (X=A), o puede estar distribuido estadísticamente a lo largo del polímero.

Se prefieren los compuestos de polisiloxano lineales en los que el resto A que porta el cromóforo está distribuido estadísticamente. Dichos compuestos de polisiloxano preferidos tienen al menos una unidad que porta el resto cromóforo (s = 1), preferiblemente s tiene un valor de aproximadamente 2 a aproximadamente 10, más preferiblemente una media estadística de aproximadamente 4. El número de r de las otras unidades de silicona presentes en los compuestos de polisiloxano es preferiblemente de aproximadamente 5 a aproximadamente 150, más preferiblemente una media estadística de aproximadamente 60.

Los compuestos de polisiloxano en los que el 20% o menos, preferiblemente menos del 10%, de las unidades totales de siloxano son unidades que portan un resto cromóforo son preferidos con respecto a las propiedades cosméticas.

La relación de unidades de polisiloxano que tienen un resto cromóforo A de la fórmula IIa con respecto a aquellas que tienen un resto cromóforo A de la fórmula IIb no es crítica. Dicha relación puede ser aproximadamente 1:1 a aproximadamente 19:1, preferiblemente aproximadamente 2:1 a aproximadamente 9:1, de forma más preferible aproximadamente 4:1.

Los compuestos de polisiloxano Ia o Ib en los que A es un resto de fórmula IIa o IIb se pueden preparar como se describe en el documento EP-B0538431 mediante siliación de los benzalmalonatos correspondientes según el siguiente esquema de reacción:



en el que R¹, R² y R³ son como se definen anteriormente.

La siliación del éster dietílico de 4-(2-propinilo)fenilmetileno se puede llevar a cabo empleando procedimientos conocidos para la adición de átomos de hidrógeno enlazados a silicio a grupos que contienen insaturación alifática. Estas reacciones generalmente son catalizadas por un metal del grupo del platino o un complejo de dicho metal. Ejemplos de catalizadores que pueden emplearse son platino sobre carbono, ácido cloroplatínico, acetilacetato de platino, complejos de compuestos de platino con compuestos insaturados, por ejemplo olefinas y divinildisiloxanos, complejos de compuestos de rodio y paladio y complejos de compuestos de platino soportados sobre sustratos

inorgánicos. La reacción de adición puede realizarse a presión reducida, atmosférica o aumentada. Se puede utilizar un disolvente, por ejemplo tolueno o xileno, en la mezcla de reacción, aunque la presencia del disolvente no es esencial. También se prefiere llevar a cabo la reacción a temperaturas de reacción elevadas, por ejemplo de aproximadamente 50 °C a aproximadamente 150 °C.

Se prefieren especialmente los compuestos de la fórmula general Ia, en la que

X significa metilo,

A significa el grupo de la fórmula IIa o IIb,

R significa metilo,

R¹ y R² significa hidrógeno, metoxi o etoxi, o uno de R¹ y R² es hidrógeno y el otro es metilo, metoxi o etoxi,

R³ significa metilo o etilo,

R⁴ significa hidrógeno o metilo,

R⁵ y R⁶ significa hidrógeno,

r es aproximadamente 5 a 150,

s es aproximadamente 2 a aproximadamente 10, y

n tiene un valor de 1.

Los más preferidos son los polisiloxanos lineales de fórmula general Ia, en la que

X significa metilo,

A significa un grupo de la fórmula IIa o IIb,

R significa metilo,

R¹ y R² significa hidrógeno,

R³ significa etilo,

R⁴ significa hidrógeno,

R⁵ y R⁶ significa hidrógeno,

r es una media estadística de aproximadamente 60,

s es una media estadística de aproximadamente 4, y

n tiene un valor de 1.

El filtro UV basado en polisiloxano más preferido en todas las realizaciones de la presente invención es polisilicona-15 (INCI), que está disponible comercialmente con el nombre comercial PARSOL® SLX en DSM Nutritional Products Ltd.

El agente autobronceador se selecciona generalmente entre derivados de mono- o policarbonilo como se describe en Preferiblemente, DHA y/o eritrosa (en forma D o L o como racemato), particularmente eritrosa.

El agente autobronceador puede utilizarse en combinación con al menos un colorante directo sintético o natural y/o al menos un derivado indólico, tales como los descritos en los documentos EP-425.324 y EP-456.545.

Estos agentes autobronceadores también se pueden utilizar en combinación con otros agentes sintéticos o naturales para colorear la piel.

Por la expresión "agente para colorear la piel" se entiende cualquier compuesto que tenga una afinidad específica por la piel y que le confiera una coloración duradera y que no la cubra (es decir, que no tenga tendencia a opacificar la piel), que no se elimine ni con agua ni con la ayuda de un disolvente, y que resista tanto el frotamiento como el lavado

con una disolución que contenga tensioactivos. Una coloración tan duradera se distingue entonces de la coloración superficial y de corta duración aportada, por ejemplo, por un pigmento de maquillaje.

Los agentes colorantes adicionales pueden seleccionarse también, por ejemplo, entre extractos de plantas, tales como, por ejemplo, extractos de secuoyas "insolubles" del género *Pterocarpus* y del género *Baphia*, tales como *Pterocarpus santalinus*, *Pterocarpus osun*, *Pterocarpus soyauxii*, *Pterocarpus erinaceus*, *Pterocarpus indicus* o *Baphia nitida*, tales como los descritos en el documento EP-971.683.

Los agentes colorantes también pueden ser nanopigmentos de óxido de hierro cuyo tamaño medio de partículas individuales es menor que 100 nm, tales como los descritos en el documento EP-966.953.

El término eritrusulosa se refiere a la eritrusulosa en forma D o L o como racemato. Preferiblemente en todas las realizaciones según la presente invención se utiliza L-(+)-Eritrusulosa [533-50-6]. La eritrusulosa está disponible comercialmente, por ejemplo como ERITRULOSA en DSM Nutritional Products Ltd, Kaiseraugst (al menos 50% de eritrusulosa en agua). Aún más preferiblemente, en todas las realizaciones de la presente invención, la eritrusulosa se utiliza como único agente autobronceador o en combinación con DHA (es decir, como combinación de eritrusulosa y DHA como único agente autobronceador).

La cantidad del filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato, tal como preferiblemente polisilicona-15, en las composiciones según la presente invención, se selecciona preferiblemente en el intervalo de 0,1 a 15% en peso, tal como en el intervalo de 0,5 a 10% en peso, tal como lo más preferible en el intervalo de 1 a 5% en peso, basado en el peso total de la composición.

La cantidad del al menos un agente autobronceador en las composiciones según la presente invención se selecciona preferiblemente en el intervalo de 0,1 a 20% en peso, preferiblemente de 0,2 a 10% en peso, lo más preferible en el intervalo de 1 a 5% en peso, basado en el peso total de la composición.

La cantidad de eritrusulosa (basada en el principio activo) en las composiciones según la presente invención se selecciona preferiblemente en el intervalo de 0,1 a 5% en peso, más preferiblemente en el intervalo de 0,5 a 4% en peso, lo más preferible en el intervalo de 1 a 3% en peso, basado en el peso total de la composición.

La cantidad de dihidroxiacetona en las composiciones según la presente invención se selecciona preferiblemente en el intervalo de 0,1 a 15% en peso, más preferiblemente en el intervalo de 0,5 a 12% en peso, lo más preferible en el intervalo de 1 a 10% en peso, basado en el peso total de la composición.

Si se utiliza eritrusulosa en combinación con DHA, la composición cosmética o dermatológica comprende de manera preferible aproximadamente 1 a 5% en peso de eritrusulosa y aproximadamente 1 a 15% en peso de DHA, tal como de manera ventajosa aproximadamente 1,5% en peso de eritrusulosa y 3,5% en peso de DHA, basado en el peso total de la composición.

Todos los porcentajes y relaciones mencionados en esta memoria descriptiva son en peso a menos que se indique nada más o sea evidente.

Preferiblemente, en todas las realizaciones según la presente invención, la relación (p/p) del al menos un agente autobronceador al filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato se selecciona ventajosamente en el intervalo de 0,1:1 a 1:0,1, preferiblemente en el intervalo de 0,2:1 a 1:0,2, más preferiblemente en el intervalo de 0,5:1 a 1:0,5, lo más preferible en el intervalo de aproximadamente 1:1.

Así, la invención se refiere también a composiciones que comprenden un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato, tal como preferiblemente polisilicona-15, en combinación con eritrusulosa y/o DHA como agente autobronceador, en las que la relación (p/p) del agente autobronceador a polisilicona-15 se selecciona en el intervalo de 0,2:1 a 1:0,2, preferiblemente en el intervalo de 0,5:1 a 1:0,5, tal como en particular en el intervalo de aproximadamente 1:1.

Las composiciones cosméticas o dermatológicas según la presente invención pueden prepararse según el estado de la técnica. Las composiciones según la invención comprenden además un vehículo, portador o diluyente cosmética o dermatológicamente aceptable.

La expresión vehículo cosméticamente o dermatológicamente aceptable se refiere a todos los vehículos y/o excipientes y/o diluyentes utilizados convencionalmente en composiciones cosméticas.

Las composiciones tópicas según la presente invención se preparan generalmente mezclando el agente autobronceador y el filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato en las cantidades indicadas aquí con un vehículo adecuado.

Se prefieren las composiciones cosméticas o dermatológicas para el bronceado artificial/sin sol y/o el oscurecimiento de la piel humana. Preferiblemente, las composiciones que imparten un efecto autobronceador a la piel son composiciones para bronceado artificial/sin sol y/o oscurecimiento, composiciones de protección solar o humectantes.

5 Las composiciones autobronceadoras según la invención pueden presentarse en forma de cremas, leches, geles, geles crema, emulsiones de aceite en agua, dispersiones vesiculares, lociones fluidas, en particular lociones fluidas vaporizables, o cualquier otra forma generalmente utilizada en cosmética, en particular aquellas habitualmente adecuadas para las composiciones cosméticas autobronceadoras.

10 Las composiciones según la presente invención pueden comprender adicionalmente aditivos y adyuvantes cosméticos convencionales seleccionados, en particular, entre sustancias grasas, disolventes orgánicos, espesantes iónicos o no iónicos, suavizantes, antioxidantes, agentes para combatir los radicales libres, opacificantes, estabilizantes, emolientes, siliconas, alfa-hidroxiácidos, antiespumantes, agentes hidratantes, vitaminas, repelentes de insectos, antagonistas de la sustancia P, antiinflamatorios, fragancias, conservantes, tensioactivos, cargas, polímeros, propelentes, agentes basificantes o acidificantes, colorantes o cualquier otro ingrediente habitualmente utilizado en el campo cosmético y/o dermatológico, en particular para la producción de composiciones autobronceadoras en forma de emulsiones.

20 Las sustancias grasas pueden ser un aceite o una cera, o una mezcla de ellos. Por el término "aceite" se entiende un compuesto que es líquido a temperatura ambiente. Por el término "cera" se entiende un compuesto sólido o sustancialmente sólido a temperatura ambiente y cuyo punto de fusión es generalmente mayor que 35 °C.

25 Los aceites ejemplares son aceites minerales (parafina líquida); aceites vegetales (aceite de almendras dulces, de macadamia, de grosella negra o de jojoba); aceites sintéticos, tales como perhidroescualeno, alcoholes grasos, ácidos o ésteres (tales como el benzoato de alquilo C.sub.12-C.sub.15 comercializado con la marca comercial "Finsolv TN" por Finetex, palmitato de octilo, lanolato de isopropilo o triglicéridos, incluidos los de ácidos cáprico/caprílico), o ésteres y éteres grasos oxietilenados u oxipropilenados; aceites de silicona (ciclometicona, polidimetilsiloxanos o PDMS); aceites fluorados; polialquilenos y sus mezclas.

30 Algunos ejemplos de compuestos cerosos son la cera de parafina, la cera de carnauba, la cera de abejas o el aceite de ricino hidrogenado.

Y los disolventes orgánicos ejemplares incluyen los alcoholes inferiores y los polioles que tienen como máximo 8 átomos de carbono.

35 Los espesantes se seleccionan ventajosamente entre los ácidos poliacrílicos reticulados o las gomas guar y celulosas modificadas o no modificadas, tales como la goma guar hidroxipropilada, la metilhidroxietilcelulosa y la hidroxipropilmetilcelulosa.

40 Las composiciones según la presente invención pueden comprender adicionalmente otros agentes de filtrado de luz orgánicos o inorgánicos que son activos en las regiones UV-A y/o UV-B (absorbentes), siendo tales agentes de filtrado de luz solubles en agua, solubles en grasa o insolubles en disolventes cosméticos comúnmente utilizados.

45 Ejemplos de agentes de protección UV-B o de amplio espectro, es decir, sustancias que tienen máximos de absorción entre aproximadamente 290 nm y 340 nm, pueden ser compuestos orgánicos o inorgánicos. Los agentes de protección orgánicos UV-B o de banda ancha son, por ejemplo, acrilatos tales como 2-ciano-3,3-difenilacrilato de 2-etilhexilo (octocrileno, PARSOL® 340), 2-ciano-3,3-difenilacrilato de etilo, y similares; derivados de alcanfor tales como 4-metilbencilidenalcanfor (PARSOL® 5000), 3-bencilidenalcanfor, metosulfato de canfobenzalconio, poliacrilamidometilbencilidenalcanfor, sulfobencilidenalcanfor, sulfometilbencilidenalcanfor, ácido tereftalidendicanfosulfónico, y similares; derivados de cinamato, tales como metoxycinamato de etilhexilo (PARSOL® MCX), metoxycinamato de etoxietilo, metoxycinamato de dietanolamina (PARSOL® Hydro), metoxycinamato de isoamilo, y similares, así como derivados del ácido cinámico enlazados a siloxanos; derivados del ácido p-aminobenzoico, tales como ácido p-aminobenzoico, p-dimetilaminobenzoato de 2-etilhexilo, p-aminobenzoato de etilo N-oxipropilenado, p-aminobenzoato de glicerilo; benzofenonas tales como benzofenona-3, benzofenona-4, 2,2',4,4'-tetrahidroxi-benzofenona, 2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetoxibenzofenona, y similares; ésteres del ácido benzalmalónico tales como 4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo); ésteres del ácido 2-(4-etoxi-anilino)metileno)propandioico tal como el éster dietílico del ácido 2-(4-etoxi-anilino)metileno)propandioico como se describe en la publicación de patente europea EP 0895 776F; drometrizol trisiloxano (Mexoryl XL); derivados de imidazol tales como, por ejemplo, el ácido 2-fenilbencilimidazolsulfónico y sus sales (PARSOL® HS). Las sales del ácido 2-fenilbencilimidazolsulfónico son, por ejemplo, sales alcalinas tales como sales de sodio o potasio, sales de amonio, sales de morfina, sales de aminas primarias, secundarias y terciarias, como sales de monoetanolamina, sales de dietanolamina y similares; derivados de salicilato tales como salicilato de isopropilbencilo, salicilato de bencilo, salicilato de butilo, salicilato de etilhexilo (PARSOL® EHS, Neo Heliopan OS), salicilato de isoocitilo o salicilato de homomentilo (homosalato, PARSOL® HMS, Neo Heliopan HMS), y similares; derivados de triazina tal como etilhexil triazona (Uvinul T-150), dietilhexilbutamidotriazona (Uvasorb HEB), y similares. Filtros UV encapsulados, tales como metoxycinamato de

etilhexilo encapsulado (perlas Eusolex UV) o microcápsulas cargadas con filtros UV, como se describe, por ejemplo, en el documento EP 1471995 y similares;

Ejemplos de agentes de protección de amplio espectro o UV A, es decir, sustancias que tienen máximos de absorción entre aproximadamente 320 nm y 400 nm, pueden ser compuestos orgánicos o inorgánicos, por ejemplo derivados de dibenzoilmetano tales como 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoil-metano (PARSOL® 1789), dimetoxidibenzoilmetano, isopropildibenzoilmetano, y similares; derivados de benzotriazol tales como 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3,-tetrametilbutil)-fenol (PARSOL® MAX) y similares; bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina (PARSOL® SHIELD), y similares; ácidos fenilen-1,4-bis-bencimidazolsulfónicos o sales, tales como ácido 2,2-(1,4-fenilen)bis-(1H-bencimidazol-4,6-disulfónico) (Neoheliopan AP); hidroxibenzofenonas amino sustituidas, tales como éster hexílico del ácido 2-(4-dietilamino-2-hidroxi-benzoil)-benzoico (Uvinul A plus) como se describe en la publicación de patente europea EP 1046391; filtros UV-A iónicos como se describe en la publicación de patente internacional WO2005080341 A1; pigmentos tales como ZnO microparticulado, y similares. El término "microparticulado" se refiere a un tamaño de partículas de aproximadamente 5 nm a aproximadamente 200 nm, particularmente de aproximadamente 15 nm a aproximadamente 100 nm. Las partículas también pueden estar recubiertas por otros óxidos metálicos, tales como por ejemplo óxidos de aluminio o de circonio, o por recubrimientos orgánicos, tales como por ejemplo polioles, meticona, estearato de aluminio, alquilsilano. Tales recubrimientos se conocen bien en la técnica.

Como los derivados del dibenzoilmetano tienen una fotoestabilidad limitada, puede ser deseable fotoestabilizar estos agentes de protección UV-A. Por tanto, la expresión "agente de protección UV-A convencional" se refiere también a derivados de dibenzoilmetano tales como, por ejemplo, PARSOL® 1789 estabilizado, por ejemplo, mediante derivados de 3,3-difenilacrilato como se describe en las publicaciones de patentes europeas EP 0 514 491 B1 y EP 0 780 119 A1; derivados de bencilidenalcanfor como se describe en la patente de EE. UU. n.º 5.605.680; organosiloxanos que contienen grupos benzmalonato como se describe en las publicaciones de patentes europeas EP 0358584 B1, EP 0538431 B1 y EP 0709080 A1.

Los agentes de filtrado de luz están generalmente presentes en las composiciones según la invención en proporciones que oscilan de 0,1 a 20% en peso con respecto al peso total de la composición, y preferiblemente que oscilan de 0,2 a 15% en peso con respecto al peso total.

Por supuesto, un experto en la técnica tendrá cuidado de seleccionar el compuesto o compuestos adicionales opcionales mencionados anteriormente y/o sus cantidades de manera que las propiedades ventajosas asociadas intrínsecamente con la combinación según la invención no se vean afectadas negativamente, o no se vean sustancialmente afectadas, por la adición o adiciones previstas.

Las composiciones según la invención pueden formularse según técnicas bien conocidas en la técnica, en particular aquellas adecuadas para la preparación de emulsiones de tipo de aceite en agua o de agua en aceite.

Estas composiciones pueden presentarse en forma de emulsión simple o compleja (O/W, W/O, O/W/O o W/O/W), tal como una crema o una leche, o en forma de gel o de gel crema, o en forma de loción, de polvo o de tubo sólido, y opcionalmente pueden envasarse en aerosol y presentarse en forma de espuma o de spray.

Las composiciones según la invención se formulan preferiblemente como geles acuosos, una emulsión de aceite en agua o de agua en aceite.

En una realización ventajosa, las composiciones según la presente invención comprenden aproximadamente 50% a aproximadamente 99%, de forma preferible aproximadamente 60% a aproximadamente 98%, de forma más preferible aproximadamente 70% a aproximadamente 98%, tal como en particular de aproximadamente 80% a aproximadamente 95% de un vehículo, basado en el peso total de la composición cosmética.

En una realización ventajosa particular, el vehículo consiste además en al menos 40% en peso, más preferiblemente en al menos 50% en peso, lo más preferible en al menos 55% en peso de agua, tal como en particular aproximadamente 55 a aproximadamente 90% en peso de agua, o incluso 75 a 90% en peso de agua.

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

Las composiciones cosméticas y/o dermatológicas según la presente invención comprenden ventajosamente otros conservantes o potenciador del conservante. Preferentemente, el conservante adicional o potenciador del conservante se selecciona del grupo que consiste en fenoxietanol, etilhexilglicerina, hidroxiacetofenona, caprilato de glicerilo, caprililglicol, 1,2-hexanodiol, propanodiol, propilenglicol, así como mezclas de los mismos.

Preferiblemente, en las composiciones según la presente invención está presente un conservante/potenciador del conservante. Lo más preferible, dicho conservantes/potenciador del conservante es fenoxietanol y/o etilhexilglicerina, lo más preferible una mezcla de los mismos.

Quando está presente, el conservante o potenciador del conservante se utiliza preferiblemente en una cantidad de 0,01 a 2% en peso, más preferiblemente en una cantidad de 0,05 a 1,5% en peso, lo más preferible en una cantidad de 0,1 a 1,25% en peso, o incluso 0,5 a 1% en peso, basado en el peso total de la composición. Se prefiere especialmente que las composiciones cosméticas según la invención no contengan ningún otro conservante adicional tales como, por ejemplo, parabenos y/o metilisotiazolidina.

La invención también se refiere a un método para broncear y/u oscurecer artificialmente la piel, que comprende aplicar tópicamente una cantidad eficaz de una composición cosmética como se describe anteriormente sobre la piel durante el período de tiempo necesario para obtener el efecto de bronceado artificial/sin sol deseado.

En una realización preferida, la invención se refiere a composiciones cosméticas o dermatológicas que comprenden adicionalmente un hidrocoloide seleccionado de goma de celulosa, goma xantana, polímero cruzado de decadieno PVM/MA, o hidroxietilcelulosa.

Las composiciones cosméticas y/o dermatológicas según la invención se aplican preferiblemente al menos una vez al día, pero también pueden aplicarse varias veces al día, por ejemplo dos o tres veces al día.

La cantidad de composición cosmética y/o dermatológica que se debe aplicar sobre la piel depende de la concentración de los ingredientes activos en las composiciones y del efecto cosmético o farmacéutico deseado. Por ejemplo, la aplicación puede ser tal que se aplica una crema sobre la piel. Generalmente se aplica una crema en una cantidad de aproximadamente 1 a 2 mg de crema/cm² de piel. Sin embargo, la cantidad de la composición que se aplica sobre la piel no es crítica, y si con una cierta cantidad de composición aplicada no se puede lograr el efecto deseado, se puede utilizar una mayor concentración de los ingredientes activos, por ejemplo aplicando más composición o aplicando composiciones que contengan más ingrediente activo.

Para ilustrar mejor la presente invención y sus ventajas, se da el siguiente ejemplo específico, entendiéndose que el mismo tiene carácter únicamente ilustrativo y de ningún modo limitativo.

Ejemplo 1: Medida de la reactividad del bronceado en la piel humana

Se han preparado las siguientes formulaciones:

1. Que contiene 5% de ERITRULOSA de DSM Nutritional Products (~4 % de ingrediente activo)
2. Que contiene 2% de PARSOL® SLX (INCI: polisilicona-15)
3. Que contiene 5% de ERITRULOSA de DSM Nutritional Products (~4% de ingrediente activo) y 2% de PARSOL® SLX

Formulación	1	2	3
Nombre INCI	% en peso	% en peso	% en peso
AGUA	Hasta 100	Hasta 100	Hasta 100
PROPILENGLICOL	3	3	3
FENOXIETANOL; ETILHEXILGLICERINA	1	1	1
ERITRULOSA; AGUA (~80% en agua)	5	0	5
DIMETICONA	5	5	5
POLISILICONA-15	0	2	2
POLICUATERNIUM-37; TRIDECETH-6; DICAPRILATO/DICAPRATO DE PROPILENGLICOL	1,5	1,5	1,5

Cinco sujetos humanos diferentes aplicaron las formulaciones de prueba en su antebrazo interno en un área circular con un diámetro de 5 cm. Para una aplicación se esparcieron 50 ul de formulación de manera uniforme moviendo la yema del dedo sobre el área de prueba circular hasta que se sintió que la crema se absorbía. Se definieron cuatro áreas de prueba en los antebrazos (2 de ellas a cada lado), una sin tratar, una para 5% de eritrusosa (~ 4% de ingrediente activo), una para la combinación 5% de eritrusosa (~ 4% de ingrediente activo) y 2% de PARSOL® SLX y una para 2% de PARSOL® SLX solamente.

24 horas después se midió el tono de la piel en las áreas de prueba utilizando un cromómetro (Minolta). El parámetro medido fue la luminosidad (valor L) que refleja el brillo de la piel (un valor L más bajo ilustra una piel más oscura). Se tomaron tres medidas consecutivas en cada área de prueba y se calculó el valor promedio por área de prueba. Los resultados se presentan en las tablas 1 y 2.

Tabla 1: Valores de luminosidad L medidos con el cromómetro después de 24 h

#	Referencia 1 Piel sin tratar	Referencia 2 Formulación 1	Referencia 3 Formulación 2	Formulación 3 de la invención
Sujeto 1	63,66	61,44	62,64	58,52
Sujeto 2	68,34	66,56	67,61	65,58
Sujeto 3	62,91	63,91	64,81	62,65
Sujeto 4	60,90	62,21	60,48	60,36
Sujeto 5	65,22	64,32	64,07	63,70
Promedio	64,21	63,69	63,92	62,16
Diferencia con no tratado	-	-0,52	-0,28	-2,04

Sorprendentemente, la aplicación de la combinación de 5% de eritrolosa y 2% de PARSOL® SLX produjo un bronceado de la piel significativamente mejorado (es decir, más oscuro) en comparación con el efecto resultante de la eritrolosa sola.

Ejemplo 2: Pérdida de agua transepidérmica (TEWL) en la piel humana

Para estas medidas se utilizó la misma configuración de prueba que en el ejemplo 1.

La TEWL es el flujo estable de agua líquida que se difunde a través del estrato córneo. La TEWL es una medida de la estabilidad e integridad de la barrera cutánea. Un valor de TEWL reducido indica una barrera cutánea mejorada que conduce a una mejor hidratación de la piel.

La medida de la TEWL se realizó 24 horas después de la aplicación utilizando el dispositivo Aquaflux Biox Systems Ltd según las instrucciones del fabricante.

Tabla 3: Valores de TEWL (mg/m²h) después de 24 h

#	Referencia 1 Piel sin tratar	Referencia 2 Formulación 1	Referencia 3 Formulación 3	Formulación 2 de la invención
Sujeto 1	8,88	10,80	10,40	10,48
Sujeto 2	9,14	11,24	9,93	11,34
Sujeto 3	5,85	7,97	7,45	7,03
Sujeto 4	11,25	12,06	12,03	10,23
Sujeto 5	7,02	8,21	8,56	7,41
Promedio de todos	8,43	10,06	9,67	9,30
Diferencia con no tratado	-	1,63	1,25	0,87

Sorprendentemente, la combinación de 5% (~4% de ingrediente activo) de eritrolosa y 2% de PARSOL® SLX mostró un valor de TEWL significativamente menor en comparación con el uso de eritrolosa, respectivamente PARSOL® SLX, sola, lo que ilustra la restauración de la función de barrera de la piel en comparación con el tratamiento con los ingredientes individuales.

REIVINDICACIONES

- 5 1. Una composición cosmética o dermatológica que comprende eritrusosa y un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato, caracterizada por que el filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato se utiliza como un filtro UV distinto y separado y no en forma de un recubrimiento sobre un dióxido de titanio, recubrimiento que está adherido a la superficie del dióxido de titanio y es polisilicona-15.
- 10 2. La composición cosmética o dermatológica según la reivindicación 1, en la que la cantidad del filtro UV a base de polisiloxano se selecciona en el intervalo de 0,1 a 15% en peso, preferiblemente en el intervalo de 0,5 a 10% en peso, lo más preferible en el intervalo de 1 a 5% en peso, basado en el peso total de la composición.
- 15 3. La composición cosmética o dermatológica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en la que la cantidad de eritrusosa se selecciona en el intervalo de 0,1 a 20% en peso, preferiblemente en el intervalo de 0,2 a 10% en peso, lo más preferible en el intervalo de 1 a 5% en peso, basado en el peso total de la composición.
- 20 4. La composición cosmética o dermatológica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, que comprende además al menos un agente de filtrado de luz adicional.
- 25 5. Uso no terapéutico de una composición como en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 para bronceado artificial/sin sol, oscurecimiento de la piel humana, y/o restauración y/o mejora de la función de barrera de la piel.
6. Uso no terapéutico según la reivindicación 5, en el que la restauración y/o mejora de la función de barrera de la piel comprende al menos uno de restaurar, mantener o reducir la tasa de deshidratación de la piel, y restaurar, mantener o promover el valor de hidratación de la piel.
- 30 7. Uso no terapéutico de una composición como en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, para mejorar el brillo natural de la piel.
8. La composición cosmética o dermatológica como en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, para uso en la protección de la piel humana contra la radiación UV.
- 35 9. Uso no terapéutico de un filtro UV a base de polisiloxano que tiene un resto cromóforo del tipo benzalmalonato como se define en la reivindicación 1, para uso en la restauración y/o mejora de la función de barrera de la piel tratada con eritrusosa, tal como en particular para restaurar, respectivamente reducir, la tasa de deshidratación de la piel, y restaurar, respectivamente mejorar, el valor de hidratación de la piel, en comparación con el tratamiento con el agente autobronceador solo.