

(19)



**Евразийское  
патентное  
ведомство**

(21) **202092522** (13) **A1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ**

(43) Дата публикации заявки  
**2021.02.11**

(22) Дата подачи заявки  
**2019.04.15**

(51) Int. Cl. *A61Q 17/04* (2006.01)  
*A61K 8/34* (2006.01)  
*A61K 8/35* (2006.01)  
*A61K 8/36* (2006.01)  
*A61K 8/40* (2006.01)  
*A61K 8/18* (2006.01)

---

(54) **СОЛНЦЕЗАЩИТНАЯ КОМПОЗИЦИЯ**

---

(31) **18168640.3**

(32) **2018.04.23**

(33) **EP**

(86) **PCT/EP2019/059662**

(87) **WO 2019/206714 2019.10.31**

(71) Заявитель:

**ЮНИЛЕВЕР Н.В. (NL)**

(72) Изобретатель:

**Перумал Раджжумар, Ваидиа Ашиш  
Анант (IN)**

(74) Представитель:

**Фелицына С.Б. (RU)**

---

(57) Настоящее изобретение относится к солнцезащитной композиции. В частности, солнцезащитная композиция относится к обеспечению улучшенного фактора защиты от ультрафиолета А (UVAPF). Композиция включает органическое солнцезащитное вещество UVA, 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилат, соединение, выбранное из резорцина, фенилэтилрезорцина, 4-алкилзамещенного резорцина и их смесей, жирной кислоты и мыла.

**A1**

**202092522**

**202092522**

**A1**

## СОЛНЦЕЗАЩИТНАЯ КОМПОЗИЦИЯ

Область техники, к которой относится изобретение

Настоящее изобретение относится к солнцезащитной композиции. В частности, настоящее изобретение относится к солнцезащитной композиции, которая обеспечивает улучшенный фактор защиты от ультрафиолета (UV) A (UVAPF).

Предшествующий уровень техники

Люди часто стараются заботиться о себе и своих внешних поверхностях, например, коже и коже головы, включая волосы, с желанием вести здоровый образ жизни. Конкретные проблемы, связанные с кожей, которые беспокоят людей, включают здоровую и свободную от инфекций кожу, хороший тон кожи, адекватное увлажнение и защиту от ультрафиолетового излучения, содержащегося в солнечном свете.

Солнечный свет включает инфракрасную область (от 700 нм до 1 мм), видимую область (от 380 до 780 нм) и UV-область (от 100 до 400 нм). UV-диапазон состоит из UVC (от 100 до 280 нм), UVB (от 280 до 315 нм) и UVA (от 315 до 400 нм). В то время как человеческий организм нуждается в некотором UV-излучении для синтеза / поддержания достаточного количества витамина D, вредное воздействие UV обычно перевешивает преимущества. Считается, что чрезмерное воздействие UVB вызывает прямое повреждение ДНК, а также вызывает солнечный ожог; и считается, что чрезмерное воздействие UVA вызывает немедленное потемнение пигмента и замедленный эффект загара. Кроме того, также считается, что UVA вызывает повреждения ДНК в результате реакций окисления, в которых участвуют активные формы кислорода (Zhang et al., 1997, *Free Radical Biology & Medicine*, 23, 980-985).

Именно по этим причинам люди склонны максимально избегать воздействия солнечного света. Однако во многих случаях избежать воздействия солнечного света очень сложно, а иногда; невозможно. По таким неизбежным причинам люди склонны использовать различные композиции для местного применения, например солнцезащитную композицию, которая предлагает по крайней мере некоторую защиту от нежелательных эффектов, вызванных чрезмерным воздействием UV-излучения, содержащегося в солнечном свете. Эти композиции содержат солнцезащитные средства, которые поглощают UV-излучение и предотвращают его попадание на поверхность, например, кожу пользователя, на которую наносится композиция.

Органические солнцезащитные вещества, например 4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметан (BMDM) поглощают UVA-излучение. Способность солнцезащитного вещества обеспечивать защиту за счет поглощения излучения UVA

выражается через коэффициент защиты от UVA (UVAPF). С другой стороны, органические солнцезащитные вещества, например 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилат (OCR) и октилметоксициннамат (MCX) поглощают UVB-излучение. Способность солнцезащитного вещества обеспечивать защиту за счет поглощения излучения UVB выражается в коэффициенте защиты от солнца (SPF).

EP 2431021 (Unilever) раскрывает солнцезащитную композицию с высоким SPF, содержащую менее, чем 8% общих органических солнцезащитных средств, содержащих дибензоилметан или его производное, маслорастворимое органическое солнцезащитное средство UV-B, неионное поверхностно-активное вещество, выбранное из класса этоксилатов жирных спиртов с насыщенной углеродной цепью и имеющий HLB выше, чем 15,5 или из класса этоксилатов жирных спиртов с ненасыщенной углеродной цепью с HLB выше, чем 12, полимер класса сополимер акрилата/R-метакрилата; или сшитый полимер акрилат/R-алкилакрилат и косметически приемлемая основа. Раскрытые в данном документе композиции направлены на обеспечение SPF выше, чем 15 без ущерба для желаемых сенсорных свойств кожи.

WO 03/080009 (Unilever) раскрывает косметические композиции, содержащие органические солнцезащитные вещества вместе с 4-замещенными производными резорцина в косметически приемлемой основе. Композиции демонстрируют улучшенную стабильность при хранении и устойчивость к окислению. WO 03/080009, в частности, раскрывает комбинацию бутилметоксидибензоилметана, октилметоксициннамата, стеариновой кислоты и 4-замещенного резорцина.

WO 11/147738 (Unilever) относится к солнцезащитным композициям, которые обеспечивают SPF (равный или выше, чем 15) и высокий UVAPF (равный или выше, чем 4). В WO 11/147738 раскрыта твердая солнцезащитная композиция, содержащая бутилметоксидибензоилметан, неионогенное поверхностно-активное вещество выбранного класса, полимер выбранного класса в косметически приемлемой основе. WO 11/147738 дополнительно раскрывает нетвердую солнцезащитную композицию, содержащую дибензоилметан или его производное, неионогенное поверхностно-активное вещество выбранного класса, жирную кислоту и косметически приемлемую основу.

WO 16/142129 (Unilever) раскрывает комбинацию жирных кислот C12-C20 с мылом на основе жирных кислот C12-C20, белым пигментом, например, диоксидом титана в косметически приемлемом носителе, в которой молярное отношение мыла к жирной кислоте составляет от 0,23 до 0,5. WO 16/142129 решает проблему обеспечения фотозащиты при сохранении сенсорных свойств композиций, когда пигменты, такие как диоксид титана, добавляют к композициям, содержащим жирные кислоты.

Несмотря на предпринятые до сих пор усилия, композиции, которые обеспечивают улучшенный UVAPF, остаются предметом интереса.

Следовательно, существует необходимость в разработке солнцезащитной композиции, которая обеспечивает улучшенный UVAPF.

В настоящее время обнаружено, что композиция, содержащая соединение, выбранное из резорцина, фенилэтилрезорцина, 4-алкилзамещенного резорцина и их смесей, вместе с органическим солнцезащитным средством UVA, органическим солнцезащитным средством UVB выбранного класса, жирной кислотой и мылом, обеспечивает улучшенный UVAPF.

#### Краткое раскрытие изобретения

В первом аспекте настоящее изобретение относится к солнцезащитной композиции, содержащей:

- a. от 0,1 до 5 мас.% UVA органического солнцезащитного вещества,
- b. от 0,1 до 10 мас.% 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилата,
- c. от 0,1 до 2,5 мас.% соединения, выбранного из резорцина, фенилэтилрезорцина, 4-алкилзамещенного резорцина и их смесей,
- d. от 4 до 25 мас.% жирной кислоты; и
- e. от 0,1 до 10 мас.% мыла.

Во втором аспекте настоящее изобретение относится к способу обеспечения улучшенного UVAPF, причем способ включает нанесение на кожу солнцезащитной композиции первого аспекта и, необязательно, смывание водой.

В третьем аспекте настоящее изобретение относится к применению композиции первого аспекта для обеспечения улучшенного UVAPF.

#### Подробное описание изобретения

Любая особенность одного аспекта настоящего изобретения может быть использована в любом другом аспекте изобретения. Слово «содержащий» предназначено означать «включающий», но не обязательно «состоящий из» или «состоящий из». Другими словами, перечисленные стадии или варианты не должны быть исчерпывающими. За исключением рабочих и сравнительных примеров или там, где явно указано иное, все числа в этом описании, указывающие количества материала или условия реакции, физические свойства материалов и / или использование, следует понимать как измененные словом «примерно». Подразумевается, что числовые диапазоны, выраженные в формате «от x до y», включают x и y. Когда для конкретной особенности несколько предпочтительных диапазонов описываются в формате «от x до y», понятно, что также рассматриваются все диапазоны, объединяющие разные конечные точки.

Если не указано иное, используемые здесь количества выражены в процентах по массе от общей массы композиции и сокращены как «мас.%».

Использование любых и всех примеров или вводного слова перед примером, например, предусмотренного здесь термина «такой как», предназначено просто для лучшего освещения изобретения и никоим образом не ограничивает объем изобретения, заявленного иным образом.

В первом аспекте настоящее изобретение относится к солнцезащитной композиции, содержащей:

- a. от 0,1 до 5 мас.% UVA органического солнцезащитного вещества,
- b. от 0,1 до 10 мас.% 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилата,
- c. от 0,1 до 2,5 мас.% соединения, выбранного из резорцина, фенилэтилрезорцина, 4-алкилзамещенного резорцина и их смесей,
- d. от 4 до 25 мас.% жирной кислоты; и
- e. от 0,1 до 10 мас.% мыла.

#### Органическое солнцезащитное средство UVA

Композиция согласно настоящему изобретению (композиция) содержит органическое солнцезащитное вещество UVA, которое поглощает излучение UVA и предотвращает его попадание на поверхность, например, кожу пользователя.

Примерами солнцезащитных средств, которые могут использоваться в качестве органических солнцезащитных веществ UVA в композиции, являются дибензоилметановое соединение, динатрий бисдисулизол (коммерчески доступный как Neo Heliopan® AP), диэтиламиногидроксибензоилгексилбензоат (коммерчески доступный как Uvinul® A Plus), Ecamsule (коммерчески доступный как Mexoryl SX) и метилантранилат.

Предпочтительно солнцезащитное вещество, которое можно использовать в качестве органического солнцезащитного вещества UVA, выбирают из дибензоилметанового соединения, диэтиламиногидроксибензоилгексилбензоата и их смесей.

Более предпочтительно, солнцезащитное вещество, которое можно использовать в качестве органического солнцезащитного вещества UVA, выбирают из BMDM (коммерчески доступного как Parsol® 1789 или Avobenzon), 2-метилдибензоилметана, 4-изопропилдибензоилметана, 4-трет-бутилдибензоилметана, 2,4-диметилдибензоилметана, 2,5-диметилдибензоилметана, 4,4'-диизопропилдибензоилметана, 2-метил-5-изопропил-4'-метоксидибензоилметана, 2-метил-5-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметана, 2,4-диметил-

4'-метоксидибензоилметана, 2,6-диметил-4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметана и их смесей.

Наиболее предпочтительным солнцезащитным веществом, которое можно использовать в качестве органического солнцезащитного вещества UVA, является BMDM.

Композиция содержит от 0,1 до 5 мас.%, предпочтительно от 0,5 до 4,5 мас.%, более предпочтительно от 1 до 4 мас.%, еще более предпочтительно от 1 до 3,5 мас.%, еще более предпочтительно от 1 до 3 мас.%, еще более предпочтительно от 1 до 2,5 мас.% одного или нескольких органических солнцезащитных веществ UVA.

#### 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилат (OCR)

Композиция содержит OCR (коммерчески доступный как Octocrylene<sup>TM</sup>), который поглощает UVB излучение и предотвращает его попадание на поверхность, например кожу.

Композиция содержит от 0,1 до 10 мас.%, предпочтительно от 0,5 до 9 мас.%, более предпочтительно от 1 до 8 мас.%, еще более предпочтительно от 1,5 до 7 мас.%, еще более предпочтительно от 2 до 6 мас.%, еще более предпочтительно от 2,5 до 5 мас.%, и наиболее предпочтительно от 3 до 4 мас.% OCR.

#### Резорцин, фенилэтилрезорцин (PER), 4-алкилзамещенный резорцин

Композиция включает соединение, выбранное из резорцина, PER, 4-алкилзамещенного резорцина и их смесей. Известно, что такие соединения обеспечивают эффект осветления кожи.

Предпочтительно, выбранное соединение представляет собой 4-алкилзамещенный резорцин. Алкильная группа в 4-алкилзамещенном резорцине может быть алкилом с прямой или разветвленной цепью. Например, алкильная группа может быть алкилом с прямой цепью, как в случае 4-пропилрезорцином, или может быть алкилом с разветвленной цепью, как в случае 4-изопропилрезорцина (IPR).

Примеры 4-алкилзамещенного резорцина включают 4-метилрезорцин, 4-этилрезорцин (ER), 4-пропилрезорцин, IPR, 4-бутилрезорцин (BR), 4-пентилрезорцин, 4-гексилрезорцин (HR), 4-гептилрезорцин, 4-октилрезорцин и их смеси.

Предпочтительными 4-алкилзамещенными резорцинами являются ER, BR, HR и их смеси. Более предпочтительными 4-алкилзамещенными резорцинами являются ER, HR и их смеси.

Будет понятно, что композиция может включать комбинацию одного или нескольких соединений, выбранных из резорцина, PER и 4-алкилзамещенного резорцина. Например, композиция может содержать один или несколько 4-алкилзамещенных резорцинов в присутствии или в отсутствие резорцина. Предпочтительно композиция

содержит одно соединение, выбранное из резорцина, PER, 4-алкилзамещенного резорцина.

Композиция содержит от 0,1 до 2,5 мас.%, предпочтительно от 0,1 до 2,25 мас.%, более предпочтительно от 0,25 до 2 мас.%, еще более предпочтительно от 0,25 до 1,5 мас.%, еще более предпочтительно от 0,25 до 1 мас.%, еще более предпочтительно от 0,25 до 0,75 мас.% и наиболее предпочтительно от 0,25 до 0,5 мас.% резорцина, PER, 4-алкилзамещенного резорцина и их смесей.

#### Жирная кислота

В состав входит жирная кислота. Жирные кислоты, когда они присутствуют в композиции вместе с мылом, обеспечивают так называемый эффект исчезающего крема, то есть композиция, при нанесении на кожу человека, исчезает на коже, не оставляя заметных полосок композиции.

Композиция включает жирные кислоты, содержащие атомы углерода, предпочтительно от 10 до 22, более предпочтительно от 12 до 22, еще более предпочтительно от 14 до 22, еще более предпочтительно от 16 до 22, еще более предпочтительно от 18 до 22. Обнаружено, что жирные кислоты с увеличением длины цепи обеспечивает увеличение UVAPF и/или увеличение SPF.

Примеры жирных кислот, которые можно использовать в композиции, включают лауриновую, миристиновую, пальмитиновую, стеариновую, изостеариновую, олеиновую, линолевую, арахидиновую, бегеновую, эруковую кислоты и их смеси.

Альтернативно, жирная кислота, которая может быть предпочтительно использована, представляет собой стеариновую кислоту или пальмитиновую кислоту или их смесь. Жирная кислота в настоящем изобретении предпочтительно представляет собой хистриновую кислоту, которая по существу (обычно примерно от 90 до 95%) представляет собой смесь стеариновой кислоты и пальмитиновой кислоты в соотношении от 55:45 до 45:55.

Композиция содержит от 4 до 25 мас.%, предпочтительно от 6 до 22 мас.%, более предпочтительно от 8 до 20 мас.%, еще более предпочтительно от 10 до 19 мас.% и еще более предпочтительно от 12 до 18 мас.% жирной кислоты.

#### Мыло

Композиция содержит мыло. Мыло, когда оно присутствует в комбинации в сочетании с жирной кислотой, обеспечивает так называемый исчезающий эффект.

Мыло по настоящему изобретению обычно получают нейтрализацией *in situ* жирной кислоты, присутствующей в композиции. Таким образом, предпочтительно, чтобы мыло имело длину углеродной цепи, которая соответствует длине цепи жирной

кислоты в композиции. Мыло образуется из жирной кислоты за счет использования гидроксидов щелочных металлов, например гидроксид натрия или гидроксид калия. Из двух более предпочтительным является гидроксид калия. Таким образом, мыло предпочтительно представляет собой калиевое мыло (калиевая соль жирной кислоты).

Композиция содержит от 0,1 до 10 мас.%, предпочтительно от 1 до 8 мас.%, более предпочтительно от 2 до 7 мас.%, еще более предпочтительно от 2 до 6 мас.%, еще более предпочтительно от 2 до 5 мас.% и наиболее предпочтительно от 2 до 4 мас.% мыла.

Предпочтительно композиция дополнительно включает неионогенное поверхностно-активное вещество, имеющее значение HLB в диапазоне от 9 до 20, предпочтительно от 10 до 19, более предпочтительно от 12 до 18, еще более предпочтительно от 13 до 17 и еще более предпочтительно от 15 до 17.

HLB рассчитывается с использованием метода Гриффина, где  $HLB = 20 \times M_h / M$ , где  $M_h$  - молекулярная масса гидрофильной части молекулы, а  $M$  представляет молекулярную массу всей молекулы, давая результат по произвольной шкале от 0 до 20. Типичные значения для различных поверхностно-активных веществ приведены ниже:

Значение <10: жирорастворимый (не растворим в воде)

Значение > 10: растворим в воде.

Значение от 4 до 8 указывает на противопенный агент.

Значение от 7 до 11 указывает на эмульгатор W / O (вода в масле).

Значение от 12 до 16 указывает на эмульгатор масло в воде.

Значение от 11 до 14 указывает на смачивающий агент.

Значение от 12 до 15 характерно для моющих средств (детергентов).

Значение от 16 до 20 указывает на солюбилизатор или гидротроп.

Предпочтительно неионогенное поверхностно-активное вещество, имеющее значение HLB в диапазоне от 9 до 20, выбирают из этоксилатов жирных спиртов, этоксилатов алкилфенола, сложных алкиловых эфиров полиоксиэтиленсорбитана и их смесей. Предпочтительно неионогенные поверхностно-активные вещества содержат по меньшей мере 9 алкиленоксидных групп, предпочтительно по меньшей мере 9 этиленоксидных групп.

Примеры этоксилатов жирных спиртов, которые могут использоваться в качестве неионных поверхностно-активных веществ в композиции, включают полиоксиэтиленлауриловый простой эфир (HLB = 16,9; коммерчески доступен как Brij® 35), полиоксиэтилен (20) цетиловый простой эфир (HLB = 16; коммерчески доступен как Brij® 58). , октадециловый простой эфир полиэтиленгликоля (HLB = 18,8; коммерчески

доступен как Brij® 700) и Laureth - 9 (C12EO9; HLB = 14,3; коммерчески доступен как Brij® L9).

Примеры этоксилатов алкилфенола, которые можно использовать в качестве неионогенного поверхностно-активного вещества в композиции, включают этоксилат октилфенола (HLB = 15,5; коммерчески доступен как Triton™ X165), этоксилат октилфенола (HLB = 17,6; коммерчески доступен как Triton™ X405) и октилфенолэтоксилат (HLB = 18; коммерчески доступен как Triton™ X705).

Примеры сложных алкиловых эфиров полиоксиэтиленсорбитана, которые могут быть использованы в качестве неионогенного поверхностно-активного вещества в композиции, включают монолаурат полиоксиэтиленсорбитана (HLB = 13,3; коммерчески доступный как Tween® 21), монолаурат полиоксиэтиленсорбитана (HLB = 16,7; коммерчески доступный как Tween® 20), монопальмитат полиоксиэтиленсорбитана (HLB = 15,6; коммерчески доступен как Tween® 40) и моностеарат полиоксиэтиленсорбитана (HLB = 14,9; коммерчески доступен как Tween® 60).

Более предпочтительно, неионогенное поверхностно-активное вещество, имеющее значение HLB в диапазоне от 9 до 20, которое может присутствовать в композиции, представляет собой этоксилат жирного спирта с насыщенной углеродной цепью, имеющий HLB выше 15,5.

Предпочтительно композиция содержит от 0,5 до 5 мас.%, более предпочтительно от 1 до 4 мас.%, еще более предпочтительно от 2 до 3 мас.% неионогенного поверхностно-активного вещества, имеющего HLB в диапазоне от 9 до 20.

Предпочтительно композиция дополнительно содержит полимер. Полимер действует как загуститель в композиции и улучшает сенсорные свойства композиции.

Полимер предпочтительно выбирают из следующих классов:

- сополимер акрилат/R-метакрилата, например сополимер акрилатов/ стеарета-20 метакрилата (коммерчески доступный как Aculyн™ 22) и сополимер акрилатов/ бегенет-25 метакрилата (коммерчески доступный как Aculyн™ 28),
- кросс-полимер акрилата/R-метакрилата, например кросс-полимер акрилатов/ стеарет-20 метакрилата (коммерчески доступен как Aculyн™ 88),
- сополимер акрилатов (коммерчески доступен как Aculyн™ 33),
- кросс-полимер акрилата/R-алкилакрилата, например кросс-полимер акрилата/ C10-C30 алкилакрилата (коммерчески доступный как Pemulen™ TR-2),
- сополимер акрилоилдиметилтаурата аммония с винилпирролидоном (коммерчески доступен как Aristoflex® AVC),

- сополимер акрилоилдиметилтаурата натрия с винилпирролидоном (коммерчески доступен как Aristoflex® AVS); и

- кросс-полимер акрилоилдиметилтаурата с R-алкилакрилатом и метиакрилатом, например, сшитый полимер акрилоилдиметилтаурата аммония/ бегенет-25 метакрилата (коммерчески доступный как Aristoflex® HMB и Aristoflex® BLV); и их смеси.

Более предпочтительно, полимер выбран из сополимера акрилата / R-метакрилата, сополимера акрилатов и их смесей.

Предпочтительно композиция содержит от 0,1 до 5 мас.%, более предпочтительно от 0,5 до 4,5 мас.%, еще более предпочтительно от 1 до 4 мас.%, еще более предпочтительно от 1,5 до 3,5 мас.%, еще более предпочтительно от 2 до 3 мас.% полимера.

Предпочтительно композиция содержит косметически приемлемый носитель, который включает воду и может присутствовать в композиции в количестве от 5 до 99,9 мас.%, предпочтительно от 10 до 95 мас.%, более предпочтительно от 15 до 90 мас.%, еще более предпочтительно от 20 до 80 мас.%, еще более предпочтительно от 25 до 75 мас.% и еще более предпочтительно от 30 до 70 мас.%.

Предпочтительно, композиция дополнительно содержит один или несколько агентов для осветления кожи. Эти один или несколько осветляющих кожу агентов могут быть выбраны из ниацинамида, витамина B6, витамина C, витамина A, предшественников глутатиона, галардина, адапалена, экстракта алоэ, лактата аммония, арбутина, азелаиновой кислоты, бутилгидроксианизола, бутилгидрокситолуола, сложных эфиров цитрата, дезоксиарбутина, производных 1,3-дифенилпропана, 2,5-дигидроксibenзойной кислоты и ее производных, 2-(4-ацетоксифенил)-1,3-дифенила, 2-(4-гидроксифенил)-1,3-дифенила, эллаговой кислоты, глюкопиранозил-1-аскорбата, глюконовой кислоты, гликолевой кислоты, экстракта зеленого чая, 4-гидрокси-5-метил-3 [2H]-фуранона, 4-гидроксианизола и его производных, производных 4-гидроксibenзойной кислоты, гидроксикаприловой кислоты, аскорбата инозита, молочной кислоты, экстракта лимона, линолевой кислоты, аскорбилфосфата магния, 5-октаноил салициловой кислоты, салициловой кислоты, производных 3,4,5-тригидроксibenзила, ацетилглюкозамина, экстракта питеры, симвайта (symwhite), пантотената кальция (меланоблок), сепивайта (sepiwhite/sepiwhite), экстракта соевых бобов (ингибитор Баумена-Бирка/ bowman birk inhibition), 12-гидроксистеариновой кислоты и их смесей. 12-гидроксистеариновая кислота, когда используется в композиции, используется в качестве осветляющего кожу агента, а не в качестве жирной кислоты.

Предпочтительно осветляющие кожу агенты, которые можно использовать в композиции, представляют собой ниацинамид, витамин В6, 12-гидроксистеариновую кислоту, предшественники глутатиона, галардин и их смеси.

Агент для осветления кожи, когда используется в композиции, может быть добавлен в композицию в количестве от 0,001 до 15 мас.%, предпочтительно от 0,01 до 10 мас.%, более предпочтительно от 0,1 до 5 мас.%, еще более предпочтительно от 0,5 до 3 мас.%.

Предпочтительно композиция дополнительно содержит смягчающие вещества. Примеры смягчающих средств, которые могут быть использованы в композиции, включают стеариловый спирт, глицерилмонорицинолеат, норковое масло, цетиловый спирт, изопропилизостеарат, изобутилпальмитат, изоцетилстеарат, олеиловый спирт, изопропиллаурат, гексиллаурат, децилолеат, октадекан-2-ол, изоцетиловый спирт, эйкозаниловый спирт, бегениловый спирт, цетилпальмитат, силиконовые масла, такие как диметилполисилоксан, ди-н-бутилсебацинат, изопропилмирилат, изопропилпальмитат, изопропилстеарат, бутилстеарат, полиэтиленгликоль, триэтиленгликоль, ланолин, масло какао, кукурузное масло, масло семян хлопка, оливковое масло, пальмоядровое масло, масло семян рапса, масло семян сафлора, масло примулы вечерней, соевое масло, масло семян подсолнечника, масло авокадо, масло семян кунжута, кокосовое масло, масло арахиса, касторовое масло, ацелированные ланолиновые спирты, нефтяной вазелин, минеральное масло, бутилмирилат, изопропиллинолеат, лауриллактат, миристиллактат, децилолеат, миристилмирилат и их смеси.

Предпочтительно композиция дополнительно содержит растворители. Примеры растворителей, которые можно использовать в композиции, включают этиловый спирт, изопропанол, ацетон, моноэтиловый простой эфир этиленгликоля, монобутиловый простой эфир диэтиленгликоля, моноэтиловый простой эфир диэтиленгликоля и их смеси.

Предпочтительно композиция дополнительно включает порошки. Примеры порошков, которые можно использовать в композиции, включают мел, тальк, фуллерову землю, каолин, крахмал, камеди, коллоидный кремнезем, полиакрилат натрия, тетраалкил и/или триалкилариламмоний смектиты, химически модифицированный алюмосиликат магния, органически модифицированную монтмориллонитовую глину, гидратированный силикат алюминия, коллоидальный диоксид кремния, карбоксивиниловый полимер, карбоксиметилцеллюлозу натрия, моностеарат этиленгликоля и их смеси.

Предпочтительно композиция дополнительно содержит консерванты для защиты от роста потенциально вредных микроорганизмов. Примеры ингредиентов, которые могут быть использованы в качестве консервантов в композиции, включают сложные алкиловые

эферы пара-гидроксibenзойной кислоты, производные гидантоина, соли пропионата и различные соединения четвертичного аммония. Более предпочтительно, ингредиенты, которые могут быть использованы в качестве консерванта в композиции, представляют собой бензоат натрия, йодопропинилбутилкарбамат, метилизотиазолинон, йодопропинилбутилкарбамат, феноксиэтанол, метилпарабен, пропилпарабен, имидазолидинилмочевину, дегидроацетат натрия, этилгексилглицерин, бензиловый спирт, алкандиолы и их смеси. Алкандиолы, которые подходят для использования в качестве консервантов, представляют собой алканы C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>, которые вицинально замещены гидроксигруппами. Иллюстративные примеры включают 1,2-октандиол (каприлилгликоль), 2,3-октандиол, 1,2-нонандиол, 1,2-декандиол, 1,2-гександиол, 3,4-октандиол и их смеси или тому подобное, где каприлилгликоль обычно является наиболее предпочтительным.

Когда консерванты присутствуют в композиции, они добавляются предпочтительно в количестве от 0,001 до 5 мас.%, более предпочтительно от 0,01 до 3 мас.% и наиболее предпочтительно от 0,02 до 2 мас.%.

Композиция может дополнительно содержать ряд других необязательных ингредиентов, которые включают антиоксиданты, связующие, биологические добавки, буферные агенты, красители, вяжущие вещества, ароматизатор, придающие непрозрачность агенты, кондиционеры, отшелушивающие агенты, регуляторы pH, успокаивающие кожу агенты и агенты заживления кожи.

Композиция предпочтительно составляется в форме порошка, хлопьев, лосьона, крема, геля или мусса. Более предпочтительно композиция составлена в форме крема или лосьона и наиболее предпочтительно в форме крема. Композиция может быть несмываемой или смываемая водой. Композиция предпочтительно представляет собой композицию несмываемого типа. Упаковка для композиции по настоящему изобретению может представлять собой пластырь, флакон, тубу, аппликатор с роликовым шариком, аэрозольное устройство с пропеллентом, сжимаемый контейнер или сосуд с крышкой.

Обнаружено, что резорцин, фенилэтилрезорцин, 4-алкилзамещенный резорцин и их смеси улучшают UVAPF, когда они присутствуют в композиции согласно первому аспекту. Также обнаружено, что такой улучшенный UVAPF получается только при использовании OCR в присутствии органического солнцезащитного вещества UVA. Улучшенный UVAPF не был получен, когда другое UVB органическое солнцезащитное вещество, например MCX, было использовано вместо OCR. Известно, что OCR стабилизирует дибензоилметановое соединение, например BMDM. Обнаружено, что улучшение UVAPF, полученное в присутствии соединения, выбранного из резорцина,

фенилэтилрезорцина, 4-алкилзамещенного резорцина и их смесей, превышает и выше UVAPF, полученного при использовании OCR вместо MCX в той же композиции. Таким образом, удивительно, что замена одного солнцезащитного крема UVB, то есть MCX, другим солнцезащитным средством UVB, то есть OCR, неожиданно привела к улучшенному UVAPF, где доставка UVAPF является функцией солнцезащитного средства UVA.

Предпочтительно солнцезащитная композиция представляет собой композицию, содержащую:

- a. от 0,1 до 5 мас.% дибензоилметанового соединения,
- b. от 0,1 до 10 мас.% 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилата,
- c. от 0,1 до 2,5 мас.% соединения, выбранного из BR, ER, HR и их смесей,
- d. от 4 до 25 мас.% жирной кислоты; и
- e. от 0,1 до 10 мас.% мыла.

Более предпочтительно солнцезащитная композиция представляет собой композицию, содержащую:

- a. от 0,1 до 5 мас.% 4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметана,
- b. от 0,1 до 10 мас.% 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилата,
- c. от 0,1 до 2,5 мас.% соединения, выбранного из ER, HR и их смесей,
- d. от 4 до 25 мас.% жирной кислоты; и
- e. от 0,1 до 10 мас.% мыла.

Во втором аспекте настоящее изобретение дополнительно относится к способу обеспечения улучшенного UVAPF, в котором способ включает стадии:

- a. нанесение на кожу солнцезащитной композиции первого аспекта; и
- b. необязательно, смывание водой.

Настоящее изобретение также обеспечивает способ обеспечения улучшенного UVAPF, включающий стадии нанесения композиции первого аспекта на поверхность, например, кожу, в случае несмываемого состава. Этот способ необязательно включает дополнительную стадию по меньшей мере частичного удаления композиции с поверхности, если она находится в форме смываемой композиции. Предпочтительно, чтобы метод был нетерапевтическим или косметическим. Когда композицию наносят на кожу, получают улучшенный UVAPF.

В третьем аспекте настоящее изобретение относится к применению композиции первого аспекта для улучшенного UVAPF.

Настоящее изобретение теперь будет продемонстрировано посредством следующих неограничивающих примеров.

Примеры

Протоколы

Приготовление композиции

Вкратце, композицию согласно настоящему изобретению готовили следующим образом. Деминерализованную воду и гидроксид калия загружали в химический стакан (основной стакан), установленный на магнитной мешалке и нагревателе. Водную фазу нагревали до 75 °С и поддерживали при той же температуре. В боковом резервуаре жирную кислоту, упомянутую в примерах ниже, нагревали до 75 °С для плавления и добавляли в основной химический стакан, поддерживаемый при 75 °С. Систему перемешивали в течение 5 минут при 75 °С. Солнцезащитные средства, упомянутые в примерах, другие маслорастворимые ингредиенты и неионогенное поверхностно-активное вещество помещали в отдельный стакан и нагревали до 65-70 °С для плавления. Их хорошо перемешали и добавили в основной стакан. Перемешивание продолжали еще 5 минут при 75 °С. Мешалку и нагреватель выключили, и перемешивание производили вручную до тех пор, пока температура не достигла комнатной (25 °С).

Измерение SPF / UVA-PF in vitro

Измерения пропускания тонких пленок проводили с помощью измерителя SPF-290S SPF (Optometrics Corporation). В этом исследовании использовалась пластина из ПММА размером 70 x 70 мм с шероховатостью 6 мкм от Schönberg GmbH & Co. Процент пропускания различных композиций измеряли следующим образом. 2 мг/см<sup>2</sup> исследуемого образца наносили на пластину из ПММА, равномерно распределяли с помощью шприца и распределяли равномерно. Время сушки пластин из ПММА составляло 30 минут. По истечении времени сушки пластины с образцами подвергали воздействию UV-света и регистрировали изображение пропускания. Это изображение дает коэффициент пропускания как функцию длины волны (от 290 до 400 нм) для данного образца. Для одной пластины сканировали от шести до восьми различных пятен. То же было повторено для 3 пластин. Таким образом, представленные данные представляют собой в среднем более 18 показаний. Контрольное изображение пропускания было получено с использованием пустой пластины, без образца на пластинах из ПММА с нанесенным на нее глицерином. Значения пропускания использовались для получения значений SPF с использованием программного обеспечения Win SPF, поставляемого с прибором. Значения пропускания использовали для расчета значений UVAPF для каждой композиции.

In-vivo SPF / UVAPF

Композиции, представленные в примерах, приведенных в таблице 1, были протестированы в рандомизированном исследовании на людях-добровольцах, проведенном с соответствующими контролями. Вкратце, минимальная эритемная доза (MED) и минимальная доза стойкого потемнения пигмента (MPPDD) для каждого добровольца оценивалась перед нанесением образца (композиции в таблице 1). Тестовые образцы были неразличимы (were blinded) со стандартными образцами, для которых известен SPF / UVAPF. Необходимое количество пробы (2 мг/см<sup>2</sup>) наносили на кожу спины добровольцев. Образцы равномерно распределяли с помощью шприца и равномерно наносили с помощью резинового напальчника в течение периода от 20 до 50 секунд, который зависит от легкости нанесения композиции. Для каждого образца используется новый резиновый напальчник. После нанесения образца субъекты подвергались воздействию ультрафиолета, дозировка которого рассчитывается на основе MED и MPPDD (специфичных для каждого добровольца) и ожидаемых или целевых SPF / UVAPF. После воздействия, добровольцев оценивали на предмет эритемы и MPPDD. Оценка SPF проводилась с использованием стандарта ISO 24444: 2010. Оценка UVAPF проводилась с использованием ISO 24442: 2011. Приведенные здесь данные относятся в среднем к 5 добровольцам.

Таблица 1

Ингредиенты	1	2	A	B	C
Мыло (образованное in-situ)	2,62	2,62	2,62	2,62	2,62
Hystric acid (смесь стеариновой и пальмитиновой кислот)	17	17	17	17	17
Неионогенное поверхностно-активное вещество (Brij 35)	2	2	2	2	2
UVA солнцезащитное средство (BMDM)	1,2	1,2	1,2	1,2	1,2
2-этилгексил 2-циано-3,3-дифенилакрилат (OCR)	3	3	3	-	-
MCX	-	-	-	2,4	2,4
HR	0,5	0,25	-	-	0,5
Полимер (Aculyн 22)	1	1	1	1	1
Полимер (Aculyн A33)	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
In-vivo UVAPF	14	17	13	7	7

Данные в таблице 1 показывают, что улучшенный UVAPF получается с использованием композиций согласно настоящему изобретению (примеры 1 и 2), которые

содержат HR вместе с BMDM, OCR, жирной кислотой и мылом, по сравнению со сравнительными примерами (примеры А и В; не соответствующие настоящему изобретению), которые не содержат HR.

Кроме того, данные также показывают, что улучшенный UVAPF достигается только тогда, когда выбранное солнцезащитное вещество UVB, то есть OCR (пример 1), используется вместо MCX (пример С), несмотря на то, что обе эти композиции содержат одинаковое количество, то есть 0,5 мас.% HR. Таким образом, HR обеспечивает улучшенный UVAPF при использовании в сочетании с органическим солнцезащитным веществом UVA, 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилатом, жирной кислотой и мылом. Этот улучшенный UVAPF не был получен, когда MCX присутствовал вместо OCR.

Данные в таблице 1 также показывают, что отсутствие или присутствие HR в композициях примеров В и С не влияет на UVAPF.

Неожиданно было обнаружено, что улучшение UVAPF не зависело от используемой дозы HR. Как видно из примера 2 (0,25 мас.% HR), было получено UVAPF, равное 17, тогда как пример 1 (0,5 мас.% HR) показал UVAPF, равное 14. Считается, что такой эффект обусловлен эффективностью гашения супероксида, которая, как было обнаружено, возрастает с увеличением концентрации HR до концентрации (2 мМ). После этого эффективность гашения супероксидом снижалась, несмотря на увеличение концентрации HR в условиях равномерного освещения.

#### Влияние количества мыла в композиции на UVAPF и SPF

Композиции, представленные в таблице 2, демонстрируют эффект присутствия мыла в композиции по сравнению с контролем (без мыла).

Таблица 2

Ингредиенты	D	3	4	5
Мыло (образованное in-situ)	0	2,62	5	7,5
Hustring acid	17	17	17	17
Неионогенное поверхностно-активное вещество (Brij 35)	2	2	2	2
UVA солнцезащитное средство BMDM	1,2	1,2	1,2	1,2
OCR	3,0	3,0	3,0	3,0
MCX	-	-	-	-
HR	0,25	0,25	0,25	0,25
Полимер (Aculyn 22)	1	1	1	1

Полимер (Aculyн 33)	0,5	0,5	0,5	0,5
In-vitro SPF	9,52 ± 0,78	22,04 ± 3,04	16,96 ± 1,58	15,75 ± 0,95
In-vitro UVAPF	6,87 ± 0,37	10,63 ± 0,83	9,28 ± 0,57	9,03 ± 0,40

Данные в таблице 2 показывают, что мыло, когда оно присутствует в композиции согласно настоящему изобретению, повышает SPF, а также UVAPF.

Кроме того, дополнительные композиции, как показано в таблице 3 ниже, были приготовлены, как описано ранее, и UVAPF и SPF были измерены, как описано ранее. Полученные результаты представлены в таблице 3 ниже.

Таблица 3

Ингредиенты	6	7	8	9
Мыло (образованное in-situ)	2,5	2,75	2,62	2,62
Полимер (Aculyн 33)	0,5	0,5	0,5	0,5
Неионогенное поверхностно-активное вещество (Brij 35)	2	2	2	2
OCR	3	3	3	3
Пальмитиновая кислота	17	-	-	-
Стеариновая кислота	-	17	-	-
Hystric Acid	-	-	17	17
BMDM	1,2	1,2	1,2	1,2
HR	0,25	0,25	-	-
BR	-	-	0,25	-
ER	-	-	-	0,25
UVAPF (in-vitro)	14,7 ± 0,8	17,98 ± 0,81	13,84 ± 0,31	13,5 ± 0,89
SPF (in-vitro)	22,47 ± 0,8	27,09 ± 1,93	27,44 ± 0,97	25,4 ± 1,09

Данные в таблице 3 показывают, что улучшенный UVAPF получается, когда пальмитиновая кислота, как показано в примере 6; или стеариновая кислота, как показано в примере 7, были использованы в композиции.

Данные в таблице 3 также показывают, что улучшенный UVAPF получается, когда BR, как показано в примере 8; или ER, как показано в примере 9, были использованы в композиции.

В заключение, солнцезащитные композиции согласно настоящему изобретению обеспечивают улучшенный UVAPF.

## ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Солнцезащитная композиция, содержащая:
  - a. от 0,1 до 5 мас.% UVA органического солнцезащитного вещества,
  - b. от 0,1 до 10 мас.% 2-этилгексил-2-циано-3,3-дифенилакрилата,
  - c. от 0,1 до 2,5 мас.% соединения, выбранного из резорцина, фенилэтилрезорцина, 4-алкилзамещенного резорцина и их смесей,
  - d. от 4 до 25 мас.% жирной кислоты; и
  - e. от 0,1 до 10 мас.% мыла.
2. Солнцезащитная композиция по п.1, дополнительно содержащая неионогенное поверхностно-активное вещество, имеющее значение гидрофильно-липофильного баланса (HLB) в диапазоне от 9 до 20.
3. Солнцезащитная композиция по п.1 или 2, в которой неионогенное поверхностно-активное вещество представляет собой этоксилат жирного спирта с насыщенной углеродной цепью, имеющий HLB в диапазоне от 15,5 до 20.
4. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-3, дополнительно содержащая от 0,1 до 5 мас.% полимера.
5. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-4, содержащая от 0,1 до 3 мас.% мыла.
6. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-5, содержащая от 8 до 20 мас.% жирной кислоты.
7. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-6, где 4-алкилзамещенный резорцин выбран из 4-метилрезорцина, 4-этилрезорцина, 4-пропилрезорцина, 4-изопропилрезорцина, 4-бутилрезорцина, 4-пентилрезорцин, 4-гексилрезорцин, 4-гептилрезорцин, 4-октилрезорцин и их смеси.
8. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-7, в которой 4-алкилзамещенный резорцин выбран из 4-этилрезорцина, 4-гексилрезорцина и их смесей.
9. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-8, дополнительно содержащая от 0,001 до 15 мас.% осветляющего кожу агента.
10. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-9, в которой солнцезащитное вещество UVA выбрано из 4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметана, 2-метилдибензоилметана, 4-изопропилдибензоилметана, 4-трет-бутилдибензоилметана, 2,4-диметилдибензоилметана, 2,5-диметилдибензоилметана, 4,4'-диизопропилдибензоилметана, 2-метил-5-изопропил-4'-метоксидибензоилметана, 2-метил-5-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметана, 2,4-диметил-4'-метоксидибензоилметана или 2,6-диметил-4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметана.

11. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-10, в которой солнцезащитное вещество UVA представляет собой 4-трет-бутил-4'-метоксидибензоилметан.

12. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-11, где композиция представляет собой несмываемую композицию.

13. Солнцезащитная композиция по любому из пп.1-11, где композиция представляет собой смываемую композицию.

14. Способ обеспечения улучшенного UVAPF, где способ включает следующие стадии:

- a. нанесение на кожу солнцезащитной композиции по любому из пп. 1-13; и
- b. необязательно, ополаскивание водой.

15. Применение композиции по любому из пп.1-13 для улучшенного фактора защиты от ультрафиолета A.