

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



ESPAÑA

19 ES	21	NUMERO	22	10 A1
		461335	FECHA DE PRESENTACION	
			3.8.77	

20 NOV. 1978

Concedido el Registro de acuerdo con las leyes que figuran en la presente memoria y según el contenido de la memoria adjunta.

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:	32 FECHA	33 PAIS
31 NUMERO		
76.23799	4-8-76	Francia

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	A61K	

54 TITULO DE LA INVENCION

"MEJORAS INTRODUCIDAS EN UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE PRODUCTOS BRONCEADORES A BASE DE ESENCIA DE BERGAMOTA NATURAL"

71 SOLICITANTE (ES)

JEAN-JACQUES GOUPIL

DOMICILIO DEL SOLICITANTE

30 Avenue du Président Wilson 94230 CACHAN - Francia

72 INVENTOR (ES)

El solicitante, de nacionalidad francesa.

73 TITULAR (ES)

74 REPRESENTANTE

DON BERNARDO UNGRIA GOIBURU

1 Se sabe que el "bronceado" natural es el resultado de
la acción de los rayos ultravioletas sobre los melanocitos
de la piel humana, siendo estos melanocitos las células espe-
cíficas de la periferia de la dermis que son responsables
5 de la melanogénesis.

Estas células son capaces de acumular gránulos de me-
lanina o melanosomas.

10 Cuando el melanocito es natural, libera los melanoso-
mas en la epidermis donde son captados por otras células,
los queratinocitos, que los acumulan.

La transferencia se realiza mediante ciertos tipos de
prolongaciones celulares, denominadas dendritas.

15 Se obtiene así un filtro solar natural que protege a
la piel y constituye un obstáculo a la acción de los rayos
ultravioletas nocivos.

20 Cuando se extiende sobre la piel una composición con-
veniente que contiene bergamota natural, la acción de la ra-
diación solar se conjuga de alguna manera con la del aceite
esencial de la bergamota natural y se observa un desencade-
namiento y un aumento de la rapidez y de la intensidad de
la melanogénesis. Los productos denominados bronceadores que
contienen esencia de bergamota natural son, por consiguiente,
preciosos porque permiten reducir la duración de exposición
al sol necesaria para obtener mediante el bronceado una bue-
na protección natural de la piel contra el sol.

25 Sin embargo, un exceso en la proporción de esencia de
bergamota natural contenida en los productos bronceadores
es susceptible de producir en ciertos casos, por su conjuga-
ción con los rayos ultravioletas del sol, efectos perjudicia-
les para la piel. Por ello hasta ahora la prudencia ha con-
30

1 ducido a mantenerse por debajo de límites muy bajos en la
composición de los productos bronceadores que contienen
esencia de bergamota natural.

5 Estos límites muy bajos eran observados en la prác-
tica debido a que las composiciones a base de excipientes
hidroalcohólicos se consideraban susceptibles de presentar
peligros para la piel a partir de un contenido en esencia
de bergamota natural pura del orden del 0,60 % del peso del
producto considerado.

10 De hecho, y cualquiera que sea el excipiente utiliza-
do, incluso aunque se trate de un excipiente graso, los pro-
ductos bronceadores hasta ahora fabricados no pasaban jamás
en su composición de 0,60 % como máximo de esencia natural
de bergamota pura.

15 Estas proporciones limitadas, dictadas por una preo-
cupación de prudencia comprensible, estaban justificadas
por el conocimiento del hecho de que el principal producto
activo en cuanto a la acción fotodinamizante contenido en la
esencia natural pura de bergamota es el 5-metoxi-psoraleno,
20 igualmente denominado "bergapteno" y que el contenido de
este producto en esta esencia es variable no solamente se-
gún el suelo, el clima y las condiciones meteorológicas si-
no también, y de forma notable, según la época de la reco-
lección.

25 Por otra parte, se sabe que, por cromatografía en fa-
se gaseosa, es posible medir con precisión suficiente el
contenido en bergapteno de una esencia de bergamota.

30 La aplicación de estos procedimientos de medida cien-
tífica ha permitido a este inventor determinar que es posi-
ble utilizar, en condiciones racionales y sin peligro, pro-

1 porciones más elevadas de esencia natural pura de bergamo-
ta que las empleadas hasta ahora.

5 En primer lugar, para determinar las proporciones de
bergapteno que ha sido posible introducir sin peligro en es-
tas composiciones, se ha procedido a ensayos de bronceado
sistemático sobre grupos de 20 personas que presentaban pie-
les de los tipos I, II, III y IV. Se sabe que los dermatólo-
gos han determinado cuatro tipos de piel: las pieles del ti-
po I que no se broncean y se queman, es decir, están muy ex-
10 puestas a los eritemas solares; las pieles del tipo II que
se broncean difícilmente pero que están expuestas a erite-
mas solares; las pieles del tipo III que se broncean fácil-
mente y están poco expuestas a los eritemas solares y las
pieles del tipo IV que se broncean perfectamente y sin pro-
15 blemas.

Los resultados obtenidos están consignados en la
tabla dada a continuación y demuestran que no se produce
ningún eritema hasta dosis de 20mg de bergapteno por 100 g
de composición en ninguna piel y que la duración de obten-
20 ción de un bronceado óptimo es tanto más breve cuanto mayor
es el contenido en bergapteno de la composición.

25

30

1

Bergapteno en mmg por 100 g de composición solar de excipiente graso

Piel del tipo II, duración de la exposición - (en horas) para obtener un bronceado óptimo.

5

	Con bergapteno	Sin bergapteno	Eritemas, todas las pieles
--	----------------	----------------	----------------------------

10

3 mmg	12 horas	24 h en 6 días	ninguno
5 mmg	10 horas	24 h en 6 días	ninguno
10 mmg	9 horas	24 h en 6 días	ninguno
15 mmg	8 horas	24 h en 6 días	ninguno
20 mmg	7 horas	24 h en 6 días	ninguno
25 mmg	6 horas	24 h en 6 días	1 caso/20, piel del tipo I
30 mmg	5 horas	24 h en 6 días	8 casos/20, piel del tipo I
			4 casos/20, piel del tipo II

15

Los resultados de estos ensayos han permitido al inventor determinar un nuevo límite superior del contenido en bergapteno (es decir del contenido en 5-metoxipsoraleno) de una composición solar con excipiente graso. Este límite superior es del orden de 27,5 mmg de bergapteno por 100 g de composición solar de excipiente graso.

20

El límite inferior es variable en función de la eficacia deseada, pero puede ser fijado en 2,75 mmg de bergapteno por 100 g de composición solar de excipiente graso para obtener ya un efecto "bronceador" mucho más rápido que el conocido hasta la fecha.

25

Las nuevas composiciones que constituyen el objeto de esta invención presentan las características siguientes:

30

La cantidad B de bergapteno a introducir en 100 g de

1 composición solar para obtener un efecto bronceador muy
acelerado, sin riesgo de eritemas solares, está comprendi-
da entre 2,75 y 27,5 mmg.

5 Si se considera que α es el contenido en bergapteno
de la esencia de bergamota natural pura, la proporción E
de esta esencia a introducir en 100 g de composición es
 $E = B/\alpha$ y, por lo tanto, está comprendida entre $2,75/\alpha$
y $27,5/\alpha$ mmg.

10 El contenido en bergapteno de las diferentes esen-
cias de bergamota naturales puras utilizadas ha sido de-
terminado cuidadosamente por cromatografía en fase gaseosa
y puede variar entre 1 por mil y 5 por mil.

15 De estos datos se deduce que la cantidad máxima de
esencia de bergamota natural pura a introducir en 100 g
de composición solar debe variar entre 5,5 g ($B = 27,5$ mmg
y $\alpha = 5 \%$) y 27,5 g ($B = 27,5$ mmg y $\alpha = 1 \%$).

20 En realidad, nunca se introduce tanta esencia de
bergamota natural pura en un producto solar y se puede con-
siderar que la dosis máxima que se alcanza es de 3 g de
esencia de bergamota natural pura en 100 g de producto so-
lar, es decir, una dosis del 3 %.

25 Porqué el perfume óptimo del producto solar se obtie-
ne mediante porcentajes del 2 al 3 % de esencia de berga-
mota por una parte y, por otra parte, una dosis superior al
3 % de esencia natural podría no ser tolerada por ciertas
pieles.

30 En el caso de una esencia de bergamota con un con-
tenido en bergapteno del 4 %, la introducción de un 3 %
de esta esencia en un producto solar corresponde a un aporte
de 12 mmg de bergapteno por cada 100 g de producto so-

1 lar. Si se quiere acelerar las propiedades bronceadoras del
producto y alcanzar el contenido máximo de 27,5 mmg de ber-
gapteno por 100 g de producto, se agrega a la esencia de
5 bergamota natural pura la cantidad complementaria de 5-meto-
xiporsoraleno o bergapteno puro, es decir, en el caso presente,
15,5 mmg.

Los nuevos productos solares de esta invención son no-
tables y nuevos, por una parte por su elevado contenido en
bergapteno: límite máximo de 27,5 mmg de bergapteno para
10 100 g de producto solar en lugar de 2,5 mmg en los produc-
tos anteriores, es decir un límite superior multiplicado por
10 aproximadamente y, por otra parte, por el hecho de que
este elevado contenido en bergapteno se consigue mediante la
introducción de esencia de bergamota natural pura hasta un
15 límite máximo de 3 % y por adición de la cantidad deseada
complementaria de bergapteno puro. Por lo tanto, aquí existe
un doble carácter de novedad.

Las proporciones preferidas para la puesta en prác-
tica de la invención son de 5 a 20 mmg de bergapteno por
20 cada 100 g de composición.

Las esencias de bergamota naturales puras preferen-
temente utilizadas para poner en práctica esta invención pre-
sentan unos contenidos de bergapteno del orden del 4 %.

25 Los excipientes utilizados para los nuevos productos
solares de la invención son excipientes grasos, con exclu-
sión de los excipientes acuosos, emulsiones de fase continua
acuosa y sobretudo excipientes hidroalcohólicos. Pueden em-
plearse aceites vegetales o minerales para obtención de
30 productos bronceadores líquidos o lanolinas y otros cuerpos
grasos de origen animal o mineral para la obtención de cre-

1 mas.

5 Por otra parte, la composición debe contener sustancias que desempeñen el papel de filtros ultravioletas B, por ejemplo el para-metoxicinamato de etilhexilo y la trimetilbenciliden-heptanona. Preferiblemente, las proporciones de estas sustancias no deben ser inferiores a 1,5 % de para-metoxicinamato de etilhexilo que forma pantalla para las radiaciones comprendidas entre 2600 Å y 3400 Å y 1 % de trimetilbenciliden-heptanona que forma pantalla para las radiaciones de longitud de onda comprendidas entre 2200 Å y 3150 Å aproximadamente. Las proporciones máximas de cada uno de estos dos filtros son del 4 %. Se sobreentiende que las dos sustancias se han citado a título de ejemplos de filtros ultravioletas B convenientes y pueden ser substituídas por sustancias análogas que produzcan efectos equivalentes.

10 A título de ejemplos ilustrativos de los nuevos productos solares de esta invención podemos citar los siguientes:

20 EJEMPLO 1

Un producto bronceador que contiene, por cada 100 g de composición total:

Bergapteno	0,0075 g
Para-metoxicinamato de etilhexilo	2,0000 g
Trimetilbencilidenheptanona	1,0000 g
Excipiente graso a base de miristato de isopropilo y de aceites vegetales y minerales	cantidad necesaria para 100 g.

30 Naturalmente la composición puede contener, a título complementario, cualquier sustancia adicional beneficiosa

1 para la piel, como diversas vitaminas o cargas que pueden formar pantalla complementaria.

EJEMPLO 2

5 Un producto bronceador que contiene por cada 100 g. de composición total:

Esencia de bergamota natural pura al 4% (equivalente en bergapteno: 0,012 g)	3	g
Bergapteno puro	0,003	g
Para-metoxicinamato de etilhexilo	3	g
Trimetilbencilidenheptanona	1	g

10 En resumen, la Patente de Invención que se solicita deberá recaer sobre las siguientes:

REIVINDICACIONES

15 1. Mejoras introducidas en un procedimiento para la preparación de productos bronceadores a base de esencia de bergamota natural, en el que se introduce la cantidad necesaria de excipiente graso, constituido por un aceite de cacahuete por ejemplo, caracterizadas dichas mejoras porque se incorpora en el orden siguiente y bajo electro-agitación:

20 - 1% de trimetilbencilidenheptona, previamente disuelta aparte en un poco de excipiente graso,
- 1,5% de parametoxicinamato de etilhexilo
25 teniendo estos dos constituyentes los filtros de ultravioletas B, entre 2,75 mmg y 27,50 mmg de 5-metoxi-psoraleno o bergapteno por cada 100 gr. de producto solar, se mantiene la agitación durante media hora para obtener una mezcla y recoger el producto limpio.

30 2. Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas porque la cantidad de bergapteno definida anteriormente procede de la introducción en el producto solar, por

1

5

10

15

20

25

30

una parte de un 3% como máximo de esencia de bergamota natural pura y, por otra parte, la cantidad complementaria deseada de 5-metoxi-psoraleno o bergapteno puro.

3. Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas porque se utilizan, por cada 100 g de producto solar a base de un excipiente graso vitaminado, 0,0075 g de bergapteno, 2 g de para-metoxicinamato de etilhexilo y 1 g de trimetilbencilidenheptano.

4. Mejoras según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizadas por el hecho de utilizar, por cada 100 g de producto solar a base de excipiente graso, 0,012 g de bergapteno en forma de 3 g de esencia de bergamota pura al 4%, 0,03 g de bergapteno puro, 3 g de para-metoxicinamato de etilhexilo y 1 g de trimetilbencilidenheptanona.

5. Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: MEJORAS INTRODUCIDAS EN UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE PRODUCTOS BRONCEADORES A BASE DE ESENCIA DE BERGAMOTA NATURAL.

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente memoria descriptiva que consta de diez páginas mecanografiadas.

Madrid, 3 de Agosto de 1.977
BERNARDO UNGRIA

E. p.
