



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 279 779**

51 Int. Cl.:
A61Q 17/04 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01)
A61K 8/37 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **01104074 .8**
86 Fecha de presentación : **21.02.2001**
87 Número de publicación de la solicitud: **1127568**
87 Fecha de publicación de la solicitud: **29.08.2001**

54 Título: **Formulaciones fotoprotectoras cosméticas y dermatológicas que contienen derivados de benzotriazol y naltalatos de alquilo.**

30 Prioridad: **25.02.2000 DE 100 08 896**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.09.2007

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.09.2007

73 Titular/es: **Beiersdorf AG.**
Unnastrasse 48
20253 Hamburg, DE

72 Inventor/es: **Gers-Barlag, Heinrich;**
Wendel, Volker y
Grundt, Wiebke

74 Agente: **Isern Jara, Jorge**

ES 2 279 779 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).

ES 2 279 779 T3

DESCRIPCIÓN

Formulaciones fotoprotectoras cosméticas y dermatológicas que contienen derivados de benzotriazol y naftalatos de alquilo.

La presente invención se refiere a preparados fotoprotectores cosméticos y dermatológicos, concretamente a preparados fotoprotectores cosméticos y dermatológicos para el cuidado de la piel.

Es generalmente conocido el efecto perjudicial que la porción ultravioleta de la radiación solar ejerce sobre la piel. En función de su respectiva longitud de onda las radiaciones tienen diferentes efectos sobre la piel como órgano: la llamada radiación UV-C, cuya longitud de onda es inferior a 290 nm, es absorbida por la capa de ozono de la atmósfera terrestre y por lo tanto no tiene ninguna importancia fisiológica. En cambio la radiación en el intervalo entre 290 nm y 320 nm, conocida como gama UVB, produce eritemas y quemaduras solares leves, o de mayor o menor intensidad. Se indica una zona estrecha alrededor de los 308 nm como la fracción de luz solar con mayor efecto eritematoso.

Para la protección contra los rayos UV-B se conocen numerosos compuestos, por ejemplo derivados del 3-benciliden-alcanfor, del ácido 4-aminobenzoico, del ácido cinámico, del ácido salicílico, de la benzofenona, del 2-fenilbenzimidazol y también de la s-triazina.

Durante mucho tiempo se ha supuesto falsamente que la radiación UV-A de onda larga, comprendida entre 320 nm y 400 nm, tenía un efecto biológico inapreciable. Entretanto no obstante, numerosos estudios demuestran que la radiación UV-A es mucho más peligrosa que la UV-B, en cuanto a la capacidad de desencadenar reacciones fotodinámicas, concretamente fototóxicas, y alteraciones crónicas de la piel.

El efecto perjudicial de la radiación UV-B también puede intensificarse mediante la radiación UV-A.

Está demostrado, entre otras cosas, que en condiciones diarias perfectamente normales, la radiación UV-A es suficiente para dañar en poco tiempo las fibras de colágeno y elastina, que son de importancia fundamental para la estructura y consistencia de la piel. De este modo se producen alteraciones cutáneas crónicas causadas por la luz, que provocan el "envejecimiento" prematuro de la piel. Al cuadro clínico de la piel envejecida por la luz pertenecen por ejemplo las arrugas y grietas, así como un relieve irregular con surcos. Además, las partes afectadas por el envejecimiento de la piel debido a la luz pueden presentar una pigmentación irregular. Igualmente pueden formarse manchas marrones, queratosis e incluso carcinomas o melanomas malignos. Asimismo, una piel envejecida prematuramente por la acción diaria del UV se distingue por una menor actividad de las células de Langerhans y una ligera inflamación crónica.

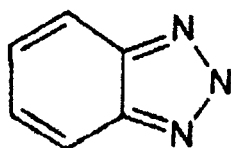
Aproximadamente el 90% de la radiación ultravioleta que llega a la tierra está formada por rayos UV-A. Así como la radiación UV-B varía mucho en función de diversos factores (p.ej. la estación del año y la hora del día, o la latitud), la radiación UV-A permanece relativamente constante día tras día, con independencia de los factores estacionales y diurnos o geográficos. Mientras que la mayor parte de la radiación UV-A penetra en la epidermis viva, aproximadamente el 70% de los rayos UV-B es retenido por el estrato córneo.

Por lo tanto es de importancia fundamental que los preparados cosméticos y dermatológicos ofrezcan una protección suficiente, tanto contra la radiación UV-B, como contra la radiación UV-A.

En general, el mecanismo de absorción de la luz por las sustancias filtrantes fotoprotectoras es bien conocido y está muy documentado, pues en la mayoría de los países industriales existen listas positivas para el uso de tales sustancias, que fijan unas normas de documentación muy estrictas.

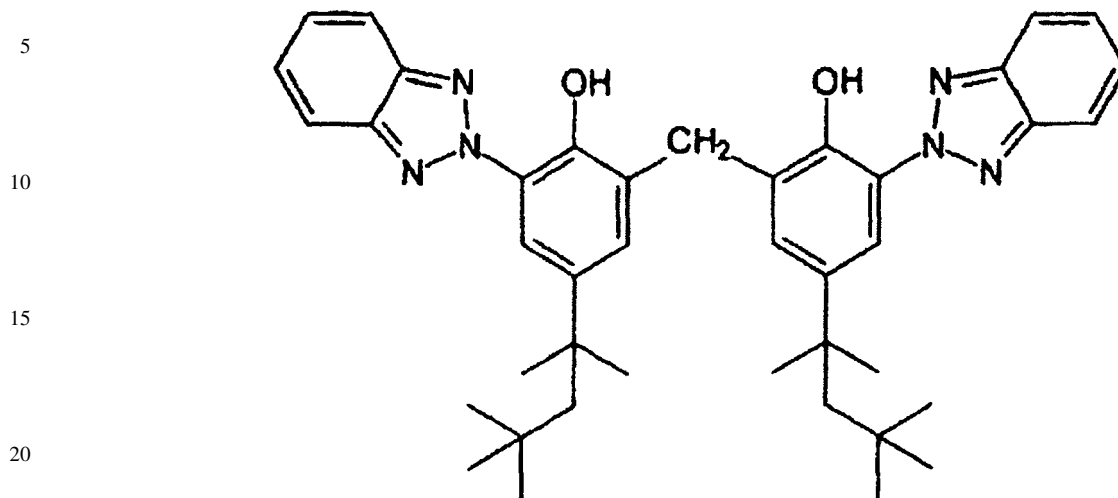
De todas maneras, la concentración de empleo de las sustancias filtrantes fotoprotectoras conocidas está frecuentemente limitada por la combinación con otras sustancias presentes en forma sólida. Por tanto la consecución de factores más altos de protección a la luz o de rendimiento protector contra el UV-A plantea ciertas dificultades técnicas de formulación.

Como filtros fotoprotectores son ventajosos los que se caracterizan por el patrón estructural del benzotriazol



ES 2 279 779 T3

Un derivado de benzotriazol ventajoso es el 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-fenol), el cual se caracteriza por la fórmula química estructural



25 (INCI: bisoctiltriazol). Puede adquirirse de CIBA-Chemikalien GmbH bajo la marca comercial Tinosorb® M y se distingue por tener muy buenas propiedades absorbentes del UV. El inconveniente de esta sustancia es la peculiaridad de formar imperceptiblemente películas delgadas sobre la piel, que producen molestias táctiles.

30 Otro inconveniente es que tales derivados de benzotriazol son insolubles, o insuficientemente solubles, en los ingredientes oleosos usuales. En los disolventes conocidos, estos compuestos solo se pueden disolver hasta un máximo del 15% en peso, lo cual corresponde por regla general a una concentración aproximada de 1 hasta 1,5% en peso de sustancia filtrante (= activa) en todo el preparado cosmético o dermatológico.

35 Por tanto una desventaja del estado técnico es que con estas sustancias solo se han podido conseguir, por regla general, factores de protección solar comparativamente bajos, porque su solubilidad o dispersabilidad en las formulaciones es demasiado baja, es decir, no se pueden incorporar de modo satisfactorio, o solo con dificultad, a estas formulaciones.

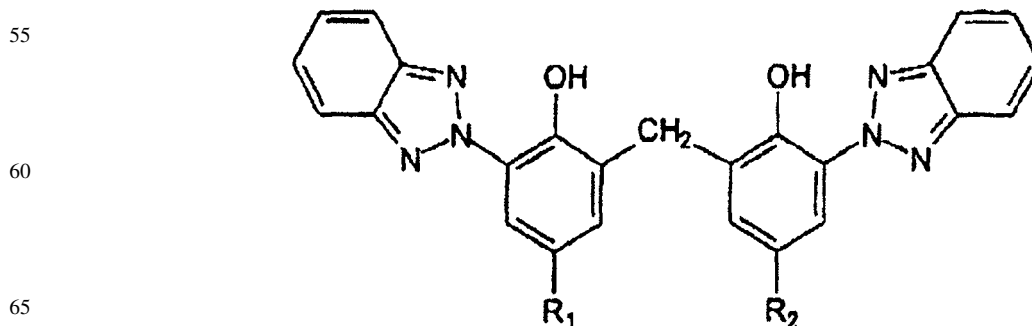
Aun cuando básicamente - a pesar de la solubilidad limitada - puede alcanzarse cierta protección al UV, a menudo surge otro problema, la recristalización.

40 En particular las sustancias difícilmente solubles recristalizan de modo bastante rápido, lo cual puede ser provocado por oscilaciones de temperatura o por otros factores. La recristalización incontrolada de un ingrediente esencial del preparado, como un filtro de UV, tiene consecuencias muy adversas en las propiedades del preparado en cuestión y no menos graves en la protección requerida contra la luz.

45 El objeto de la presente invención era proporcionar de manera sencilla preparados caracterizados por un contenido elevado de ciertos derivados de benzotriazol y por un factor de fotoprotección correspondientemente alto.

50 Por lo tanto, fue sorprendente e imprevisible para el especialista que formulaciones cosméticas de acción fotoprotectora, caracterizadas por llevar

- (a) una o más sustancias filtrantes de UV escogidas del grupo de los derivados de benzotriazol, caracterizados por la estructura

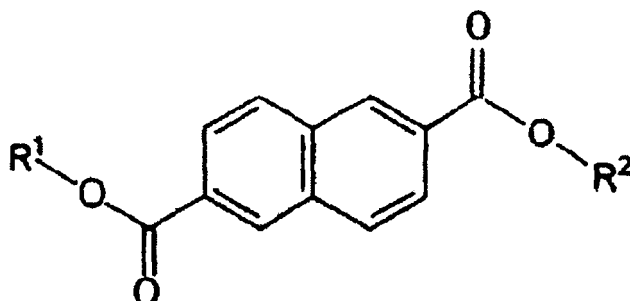


ES 2 279 779 T3

donde R_1 y R_2 , independientemente entre sí, se escogen del grupo de los radicales alquilo C_1 - C_{18} ramificados o lineales,

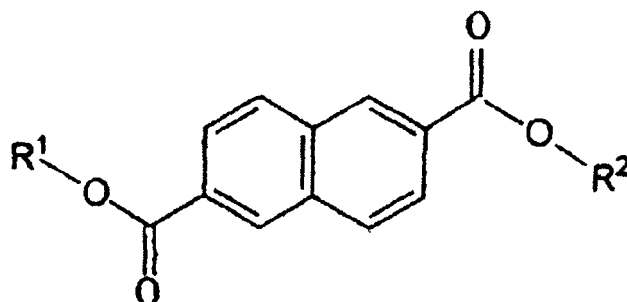
y

(b) uno o varios naftalatos de dialquilo con la fórmula estructural



donde R^1 y R^2 , independientemente entre sí, se escogen del grupo de radicales alquilo ramificados y lineales de 6 a 24 átomos de carbono, remediaran las desventajas del estado técnico.

En una forma de ejecución especialmente ventajosa, la presente invención se refiere al uso de uno o más naftalatos de dialquilo, caracterizados por la fórmula estructural



donde R^1 y R^2 , independientemente entre sí, se escogen del grupo de radicales alquilo ramificados y lineales, de 6 hasta 24 átomos de carbono, para mejorar la incorporación de los derivados de benzotriazol en

- (a) un componente orgánico aislado o
- (b) en, al menos, una fase orgánica de un sistema disperso de dos o más fases, que además puede contener una o más fases acuosas.

En el caso particular de derivados de benzotriazol difícilmente solubles, se supone que el o los naftalatos de dialquilo ponen de manifiesto la facultad de distribuir tales derivados de benzotriazol de modo finamente disperso en

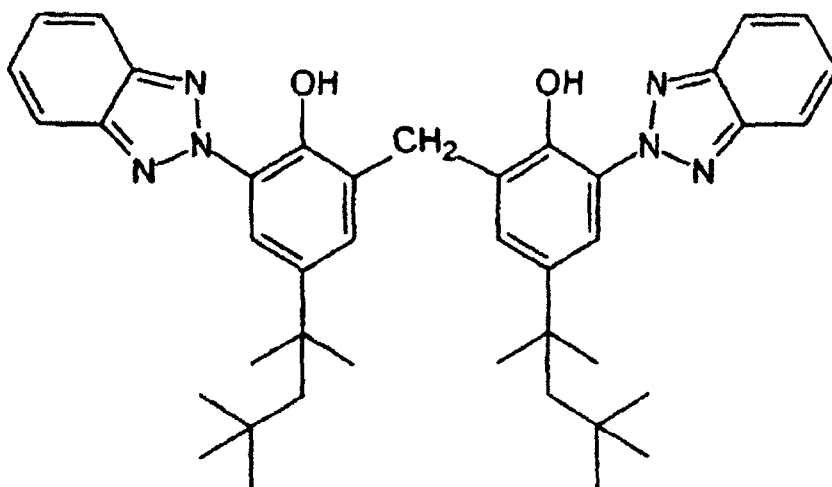
- (a) un componente orgánico aislado o
- (b) en, al menos, una fase orgánica de un sistema disperso de dos o más fases, que además puede contener una o más fases acuosas,

mejor de lo que podían o apuntaban los componentes del estado técnico.

Según la presente invención, es preferible que los sistemas dispersos de dos o más fases que puedan contener una o más fases acuosas junto a una o más fases orgánicas tengan la forma de emulsiones cosméticas o dermatológicas, por ejemplo del tipo W/O, O/W, W/O/W o O/W/O. También puede tratarse preferentemente de una microemulsión, de una emulsión Pickering o de una emulsión pulverizable. Pero también puede ser ventajoso que los preparados de la presente invención tengan forma de solución, de hidrodispersión, de aerosol, de espuma o incluso de barra.

Según la presente invención resultan ventajosos los naftalatos de dialquilo, en que R^1 y/o R^2 representan grupos alquilo ramificados de 6 hasta 10 átomos de carbono. Se prefiere especialmente el naftalato de dietilhexilo.

El derivado preferido de benzotriazol es el 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-fenol), el cual se caracteriza por la fórmula química estructural



La cantidad total de uno o más derivados de benzotriazol, sobre todo de 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-fenol), en los preparados cosméticos o dermatológicos finales se elige ventajosamente en el intervalo de 0,1 hasta 15,0% en peso, preferiblemente de 0,5 hasta 10,0% en peso, referido al peso total de los preparados.

Las formulaciones fotoprotectoras cosméticas o dermatológicas de la presente invención pueden tener la composición usual y servir para la protección cosmética o dermatológica contra la luz, también para tratar, cuidar y limpiar la piel y/o el cabello, y también como producto de maquillaje en la cosmética decorativa.

Para su empleo, los preparados cosméticos y dermatológicos se aplican sobre la piel y/o el cabello en cantidad suficiente, según es habitual en cosmética.

Los preparados cosméticos y dermatológicos según la presente invención pueden contener los aditivos habituales en tales preparados, p.ej. conservantes, bactericidas, perfumes, antiespumantes, colorantes, pigmentos, espesantes, sustancias humectantes y/o hidratantes, grasas, aceites, ceras u otros ingredientes usuales en una formulación cosmética o dermatológica, como alcoholes, polioles, polímeros, estabilizadores de la espuma, electrolitos, disolventes orgánicos o derivados de silicona.

En general también es preferible que lleven antioxidantes. Según la presente invención pueden emplearse todos aquellos antioxidantes que son corrientes o apropiados para las aplicaciones cosméticas y/o dermatológicas.

De manera conveniente, los antioxidantes se eligen del grupo formado por aminoácidos (p.ej. glicina, histidina, tirosina, triptófano) y sus derivados, imidazoles (p.ej. el ácido urocánico) y sus derivados, péptidos como D,L-carnosina, D-carnosina, L-carnosina y sus derivados (p.ej. anserina), carotenoides, carotenos (p.ej. α -caroteno, β -caroteno, licopina) y sus derivados, ácido clorogénico y sus derivados, ácido lipónico y sus derivados, (p.ej. ácido dihidrolipónico), aurotioglucosa, propiltiouracilo y otros tioles (p.ej. tioredoxina, glutatión, cisteína, cistina, cistamina y sus ésteres de glicosilo, N-acetilo, metilo, etilo, propilo, amilo, butilo y laurilo, palmitoilo, oleilo, γ -linoleilo, colesterilo y glicerilo) así como sus sales, tioldipropionato de dilaurilo, tioldipropionato de diestearilo, ácido tioldipropiónico y sus derivados (ésteres, éteres, péptidos, lípidos, nucleótidos, nucleósidos y sales) así como compuestos de sulfoximina (p.ej. butioninsulfoximina, homocisteínsulfoximina, butioninsulfonas, penta-, hexa- y heptationinsulfoximina) en dosis compatibles muy reducidas (p.ej. pmol hasta μ mol/kg), también quelantes (de metales) (p.ej. ácidos grasos α -hidroxilados, ácido palmítico, ácido fitínico, lactoferrina), ácidos α -hidroxilados (p.ej. ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico), ácido húmico, ácido biliar, extractos biliares, bilirrubina, biliverdina, EDTA, EGTA y sus derivados, ácidos grasos insaturados y sus derivados (p.ej. ácido γ -linoléico, ácido linólico, ácido oleico), ácido fólico y sus derivados, ubiquinona y ubiquinol y sus derivados, vitamina C y derivados (p.ej. palmitato de ascorbilo, fosfato de ascorbil-Mg, acetato de ascorbilo), tocoferoles y derivados (p.ej. acetato de vitamina E), vitamina A y derivados (p.ej. palmitato de vitamina A) así como benzoato de coniferilo del benjuí, ácido rutínico y sus derivados, α -glicosilrutina, ácido ferúlico, furfurilidenglucitol, carnosina, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, ácido nordihidroguayacónico, ácido nordihidroguayarético, trihidroxibutirofenona, ácido úrico y sus derivados, manosa y sus derivados, cinc y sus derivados (p.ej. ZnO, ZnSO₄), selenio y sus derivados (p.ej. selenometionina), estilbeno y sus derivados (p.ej. óxido de estilbeno, óxido de trans-estilbeno) y los derivados apropiados según la presente invención (sales, ésteres, éteres, azúcares, nucleótidos, nucleósidos, péptidos y lípidos) de dichos principios activos.

ES 2 279 779 T3

La fase orgánica de las formulaciones que contienen la combinación de sustancias según la presente invención se escoge ventajosamente del grupo de los aceites polares, por ejemplo del grupo de las lecitinas y de los triglicéridos de ácido graso, sobre todo de los triglicerinésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales con una longitud de cadena de 8 hasta 24, sobre todo 12 hasta 18 átomos de C. Los triglicéridos de ácido graso se pueden escoger ventajosamente, por ejemplo, del grupo de los aceites sintéticos, semisintéticos y naturales, como p.ej. triglicérido caprílico/cáprico, glicérido de coco, aceites de oliva, girasol, soja, cacahuete, colza, de almendras, palma, coco, ricino, germen de trigo, pepita de uva, cardo, onagra, macadamia y otros similares.

Como componentes ventajosos conforme a la presente invención también pueden escogerse otros aceites polares, del grupo de los ésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales, con una longitud de cadena de 3 hasta 30 átomos de C, y alcoholes saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales, con una longitud de cadena de 3 hasta 30 átomos de C; del grupo de los ésteres de ácidos carboxílicos aromáticos y alcoholes saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales, con una longitud de cadena de 3 hasta 30 átomos de C. Luego estos aceites estéricos pueden elegirse ventajosamente del grupo formado por palmitato de octilo, cocoato de octilo, isoestearato de octilo, miristato de octildodecilo, isononanoato de cetearilo, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, estearato de isopropilo, oleato de isopropilo, estearato de n-butilo, laurato de n-hexilo, oleato de n-decilo, estearato de isoocitilo, estearato de isononilo, isononanoato de isononilo, palmitato de 2-etil-hexilo, laurato de 2-etil-hexilo, estearato de 2-hexildecilo, palmitato de 2-octildodecilo, heptanoato de estearilo, oleato de oleílo, erucato de oleílo, oleato de erucilo, erucato de erucilo, estearato de tridecilo, trimelitato de tridecilo, así como mezclas sintéticas, semisintéticas y naturales de tales ésteres, como p.ej. el aceite de jojoba.

La fase orgánica también puede escogerse ventajosamente del grupo formado por los dialquiléteres, como p.ej. el dicapriléter.

También es preferible escoger el o los componentes oleosos del grupo constituido por isoeicosano, diheptanoato de neopentilglicol, dicaprilato/dicaprato de propilenglicol, diglicerilsuccinato caprílico/cáprico, caprilato/caprato de butilenglicol, lactato de alquilo C₁₂₋₁₃, tartrato de dialquilo C₁₂₋₁₃, triisoestearina, hexacaprilato/hexacaprato de dipentaeritritilo, monoisoestearato de propilenglicol, tricaprilinea, dimetilisorbida. Resulta especialmente ventajoso que la fase orgánica de las formulaciones según la presente invención contenga benzoato de alquilo-C₁₂₋₁₅ o esté completamente formada por el mismo.

Según la presente invención también se puede usar ventajosamente cualquier mezcla de dichos componentes oleosos y ceros.

La fase orgánica también puede contener ventajosamente aceites apolares, como, por ejemplo, los escogidos del grupo de los hidrocarburos y ceras, ramificados y lineales, concretamente aceite mineral, vaselina (petrolato), aceite de parafina, escualano y escualeno, poliolefinas, poliisobutenos hidrogenados e isohehexadecano. Las sustancias preferidas entre las poliolefinas son los polidecenos.

La fase orgánica también puede contener ventajosamente aceites de silicona cíclicos o lineales o estar totalmente formada por dichos aceites, aunque, aparte del aceite o aceites de silicona, se prefiere tener un contenido adicional de otros componentes en la fase orgánica.

Como aceite de silicona utilizable en la presente invención se usa ventajosamente la ciclometicona (octametilciclotetrasiloxano). Pero, conforme a la presente invención, también es ventajoso el empleo de otros aceites de silicona, por ejemplo cetildimeticona, hexametilciclotrisiloxano, polidimetilsiloxano, poli(metilfenilsiloxano).

Según la presente invención también son ventajosas p.ej. las ceras de origen animal y vegetal, como por ejemplo la cera de abejas, la cera china, la cera de abejorros y otras ceras de insectos, así como la manteca de shea.

La fase acuosa de los preparados según la siguiente invención puede contener ventajosamente aditivos habituales en cosmética, como por ejemplo alcoholes, sobre todo de bajo número de C, preferentemente etanol y/o isopropanol, dioles o polioles de bajo número de C y también sus éteres, preferentemente propilenglicol, glicerina, etilenglicol, etilenglicolmonoetil- o monobutiléter, propilenglicolmonometil-, monoetil- o monobutiléter, dietilenglicolmonometil- o monoetil-éter y productos análogos, polímeros, estabilizadores de la espuma, electrolitos y, sobre todo, uno o más espesantes, que pueden escogerse ventajosamente del grupo formado por dióxido de silicio, silicatos de aluminio, polisacáridos y sus derivados, p.ej. ácido hialurónico, goma xantano, hidroxipropilmetilcelulosa, y, de modo especialmente ventajoso, del grupo constituido por los poli-acrilatos, con preferencia un poli-acrilato del grupo de los llamados Carbopoles, por ejemplo Carbopoles de los tipos 980, 981, 1382, 2984, 5984, ya sea solos o en combinación. También pueden emplearse preferentemente hidratantes.

Se designan como hidratantes aquellas sustancias o mezclas de sustancias que confieren a los preparados cosméticos o dermatológicos la propiedad de disminuir la cesión de humedad a través del estrato córneo (también llamada pérdida de agua transepidérmica (TEWL)) y/o de favorecer su hidratación, después de aplicarlos o repartirlos sobre la superficie de la piel.

Como hidratantes ventajosos para la presente invención cabe citar, por ejemplo, la glicerina, el ácido láctico, el ácido pirrolidoncarboxílico y la urea. Asimismo es ventajoso el uso de hidratantes poliméricos del grupo de los

ES 2 279 779 T3

polisacáridos solubles y/o hinchables y/o gelificables con agua. Resultan especialmente ventajosos, por ejemplo, el ácido hialurónico, el quitosano y/o un polisacárido rico en fucosa que está clasificado en el Chemical Abstracts bajo el número de registro 178463-23-5 y que puede adquirirse p.ej. a la firma SOLABIA, S.A. con la marca Fucogel® 1000.

5 Según su constitución, las composiciones cosméticas o dermatológicas de uso tópico conforme a la presente invención pueden utilizarse, por ejemplo, como crema protectora de la piel, leche limpiadora, crema diurna o crema nocturna. En caso necesario, las composiciones según la presente invención también pueden emplearse ventajosamente como base de formulaciones farmacéuticas.

10 También son ventajosos los preparados cosméticos y dermatológicos presentados en forma de protector solar. De manera preferente, además de las combinaciones de principios activos según la presente invención, contienen al menos una sustancia filtrante del UV-A y/o al menos una sustancia filtrante del UV-B. Aunque no es necesario, estas formulaciones también pueden contener uno o varios pigmentos inorgánicos, como sustancias filtrantes de UV.

15 Se prefieren los pigmentos inorgánicos basados en óxidos metálicos y/o en otros compuestos metálicos poco solubles o insolubles en agua, sobre todo en los óxidos del titanio (TiO₂), cinc (ZnO), hierro (p.ej. Fe₂O₃), circonio (ZrO₂), silicio (SiO₂), manganeso (p.ej. MnO), aluminio (Al₂O₃), cerio (p.ej. Ce₂O₃), óxidos mixtos de los metales correspondientes y también mezclas de dichos óxidos.

20 Evidentemente también puede ser ventajoso un contenido adicional de partículas estabilizadoras de dióxido de titanio y/o de óxido de cinc, aunque no es necesario según la presente invención.

Según la presente invención también es ventajosa la elaboración de preparados cosméticos y dermatológicos, cuya finalidad principal no es la protección contra la luz solar, pero que igualmente contienen sustancias protectoras del UV. Así p.ej., en las cremas diurnas suelen incorporarse sustancias filtrantes del UV-A o del UV-B.

Las sustancias protectoras del UV, al igual que los antioxidantes y, si se desea, los conservantes, también protegen eficazmente los preparados de la podredumbre.

30 Los preparados según la presente invención llevan ventajosamente sustancias que absorben la radiación UV en la región UV-A y/o UV-B, siendo la cantidad total de sustancias filtrantes p.ej. de 0,1% en peso hasta 30% en peso, preferiblemente 0,5 hasta 20% en peso, sobre todo 1,0 hasta 15,0% en peso, respecto al peso total de los preparados, para disponer de preparados cosméticos que protejan el cabello y la piel contra toda la gama de la radiación ultravioleta. Asimismo pueden servir como protectores solares para el cabello o para la piel.

35 Si las emulsiones de la presente invención llevan sustancias filtrantes del UV-B, éstas pueden ser liposolubles o hidrosolubles. Sustancias filtrantes del UV-B liposolubles, ventajosas para la presente invención, son p.ej.:

- 40 - derivados del 3-bencilidenalcanfor, preferiblemente 3-(4-metilbenciliden)alcanfor, 3-bencilidenalcanfor;
- derivados del ácido 4-aminobenzoico, preferiblemente 4-(dimetilamino)-benzoato de 2-etilhexilo, 4-(dime-
- 45 tilamino)-benzoato de amilo;
- ésteres del ácido cinámico, preferiblemente 4-metoxicinamato de 2-etilhexilo, 4-metoxicinamato de iso-
- pentilo;
- ésteres del ácido salicílico, preferiblemente salicilato de 2-etilhexilo, salicilato de 4-isopropilbencilo, sali-
- 50 cilato de homomentilo;
- derivados de la benzofenona, preferiblemente 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, 2-hidroxi-4-metoxi-4'-me-
- tilbenzofenona, 2,2'-dihidroxi-4-metoxibenzofenona;
- ésteres del ácido benzalmalónico, preferiblemente 4-metoxibenzalmalonato de di(2-etilhexilo);
- 55 - derivados de triazina simétricos respecto al eje C₃ del núcleo básico de la triazina, preferiblemente 4,4',4''-
- (1,3,5-triazin-2,4,6-triiltriimino)-tris-benzoato de tris(2-etilhexilo) [INCI: Octyl triazone], que vende la fir-
- ma BASF Sociedad Anónima con la denominación comercial UVINUL® T 150;
- así como filtros UV unidos a polímeros.

60 Como sustancias hidrosolubles filtrantes del UV-B pueden usarse ventajosamente p.ej.:

- 65 - sales del ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfónico, como las de sodio, potasio o trietanolamonio, y el propio
- ácido sulfónico;
- derivados de ácido sulfónico de la benzofenona, preferiblemente ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona-5-
- sulfónico y sus sales;

ES 2 279 779 T3

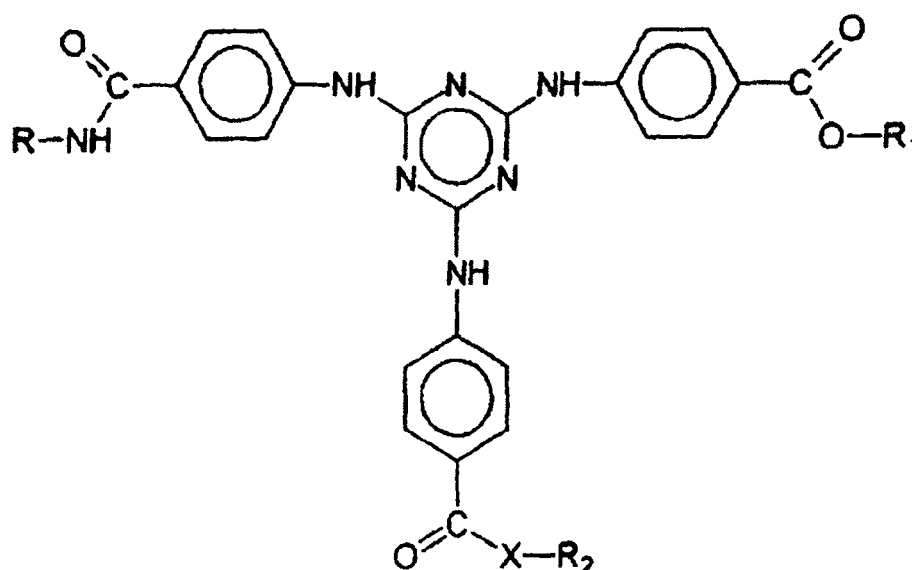
- derivados de ácido sulfónico del 3-bencilidenalcanfor, como p.ej. ácido 4-(2-oxo-3-bornilidenmetil)benzenosulfónico, ácido 2-metil-5-(2-oxo-3-bornilidenmetil)sulfónico y sus sales.

Evidentemente la lista de los citados filtros UV-B que pueden usarse en los preparados de la presente invención no debe ser limitativa.

También son sustancias filtrantes del UV ventajosas para la presente invención los denominados filtros de banda ancha, es decir sustancias filtrantes que absorben tanto la radiación UV-A como la radiación UV-B.

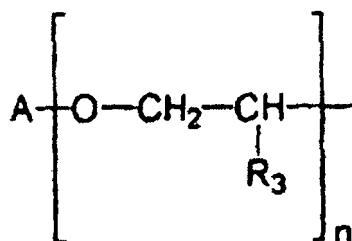
También puede ser ventajoso usar en los preparados de la presente invención filtros UV-A que hasta ahora solían llevar los preparados cosméticos. En tal caso se trata preferentemente de derivados del dibenzoflmetano, sobre todo de la 1-(4'-terc.-butilfenil)-3-(4'-metoxifenil)propano-1,3-diona y de la 1-fenil-3-(4'-isopropilfenil)propano-1,3-diona.

También puede resultar ventajoso agregar a los componentes básicos de la presente invención otros derivados de s-triazina, sustituidos asimétricamente, por ejemplo aquellos que se describen en la patente EP-A-570 838, cuya estructura química está representada por la fórmula genérica



donde

- R significa un radical alquilo C₁-C₁₈ ramificado o lineal, un radical cicloalquilo C₅-C₁₂ eventualmente sustituido con uno o varios grupos alquilo C₁-C₄,
- X un átomo de oxígeno o un grupo NH,
- R₁ un radical alquilo C₁-C₁₈ ramificado o lineal, un radical cicloalquilo C₅-C₁₂ eventualmente sustituido con uno o varios grupos alquilo C₁-C₄, o un átomo de hidrógeno, un átomo de metal alcalino, un grupo amonio o un grupo de la fórmula



en que

ES 2 279 779 T3

A significa un radical alquilo C₁-C₁₈ ramificado o lineal, un radical cicloalquilo C₅-C₁₂ o arilo eventualmente sustituido con uno o varios grupos alquilo C₁-C₄,

R₃ un átomo de hidrógeno o un grupo metilo,

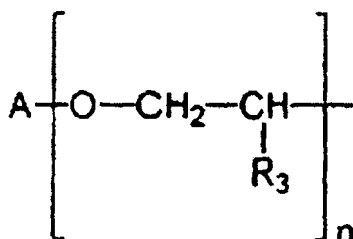
5

n un número de 1 hasta 10,

R₂ un radical alquilo C₁-C₁₈ ramificado o lineal, un radical cicloalquilo C₅-C₁₂ eventualmente sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₄, cuando X representa el grupo NH, y un radical alquilo C₁-C₁₈ ramificado o lineal, un radical cicloalquilo C₅-C₁₂ eventualmente sustituido con uno o varios grupos alquilo C₁-C₄, o un átomo de hidrógeno, un átomo de metal alcalino, un grupo amonio o un grupo de la fórmula

10

15



20

en que

25

A significa un radical alquilo C₁-C₁₈ ramificado o lineal, un radical cicloalquilo C₅-C₁₂ o arilo eventualmente sustituido con uno o varios grupos alquilo C₁-C₄,

R₃ un átomo de hidrógeno o un grupo metilo,

30

n un número de 1 hasta 10, cuando X representa un átomo de oxígeno.

Sobre todo son ventajosas las s-triazinas asimétricamente sustituidas, escogidas del grupo de sustancias que se describen en la patente EP-A-775 698:

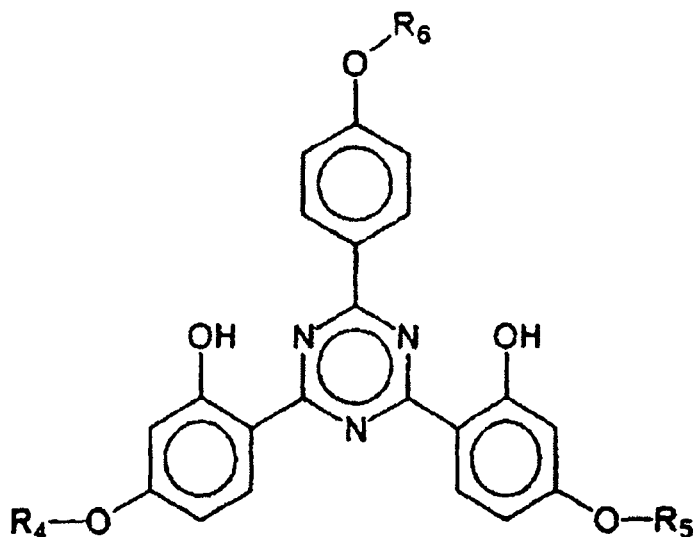
35

40

45

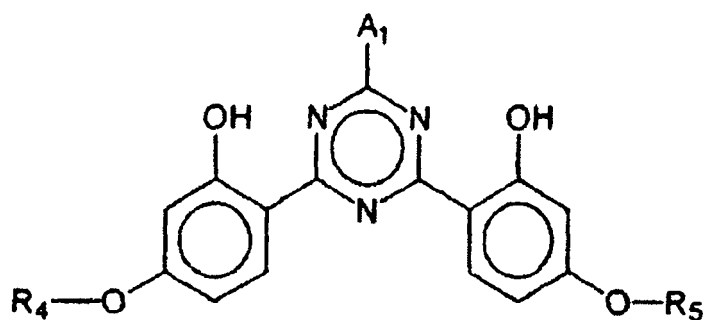
50

55



60 y/o

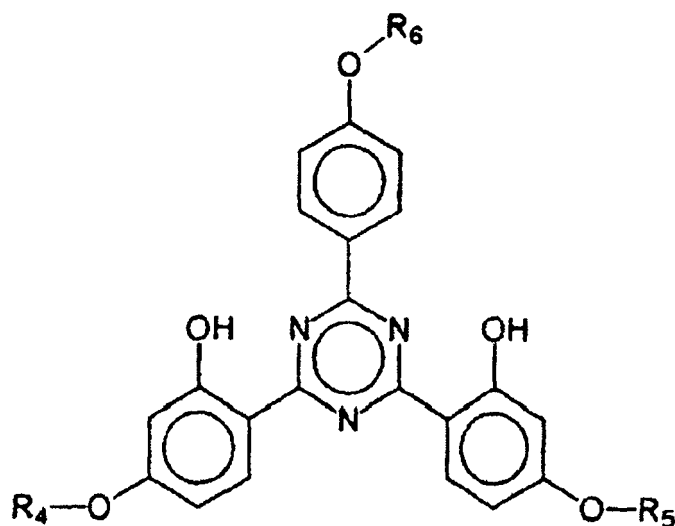
65



20 Todas las bis-resorcil triazinas citadas en dicho documento - ya sea reveladas mediante fórmulas genéricas o concretas - resultan ventajosas para la presente invención. De manera especialmente ventajosa R_4 y R_5 se eligen del grupo de los radicales alquilo ramificados y lineales de 1 hasta 18 átomos de carbono. A su vez, los grupos alquilo pueden estar sustituidos ventajosamente con grupos sililoxi.

25 A_1 representa ventajosamente un anillo aromático de cinco o seis miembros, homocíclico o heterocíclico, que lleva sustituyentes.

30 Son particularmente ventajosos los siguientes compuestos:



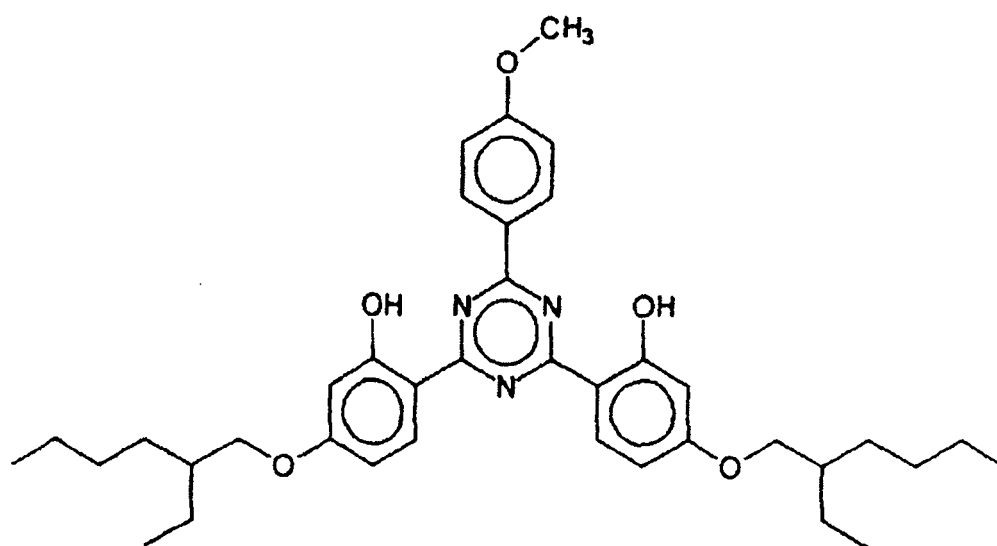
50 donde R_6 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo ramificado o lineal de 1 hasta 10 átomos de carbono, sobre todo la 2,4-bis-{{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (INCI: Aniso triazine), que vende la CIBA-Chemikalien GmbH con la marca comercial Tinosorb® S y se caracteriza por la siguiente estructura

5

10

15

20



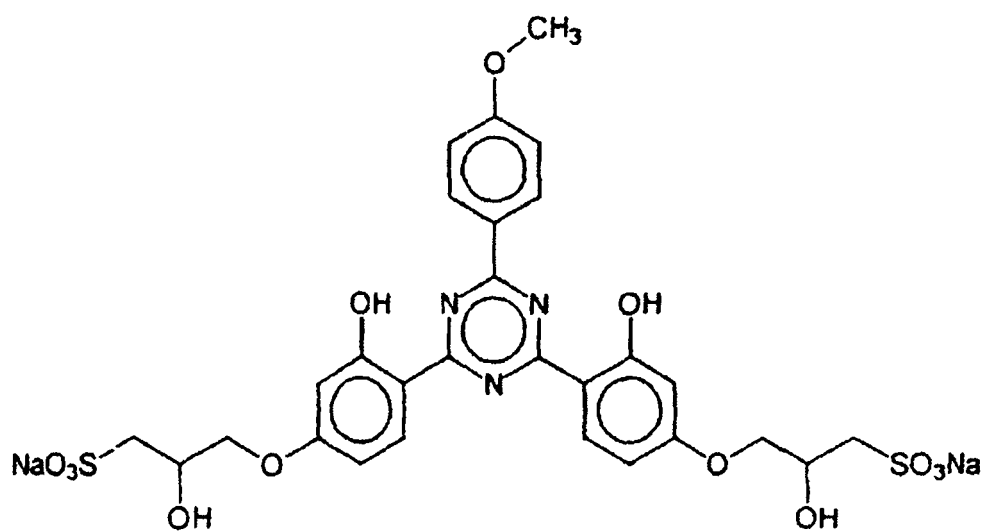
En caso necesario también es ventajoso que los preparados de la presente invención contengan la sal sódica de la 2,4-bis-{[4-(3-sulfonato)-2-hidroxi-propiloxi]-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, la cual se caracteriza por la siguiente estructura:

30

35

40

45



50

En caso necesario también es ventajoso que los preparados según la presente invención contengan 2,4-bis-{[4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxi-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, la cual se caracteriza por la siguiente estructura:

55

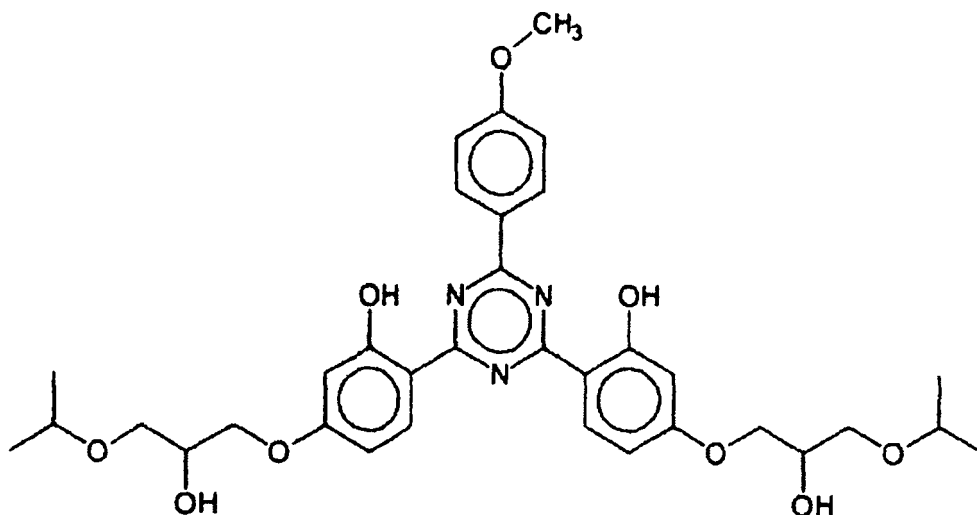
60

65

5

10

15



20

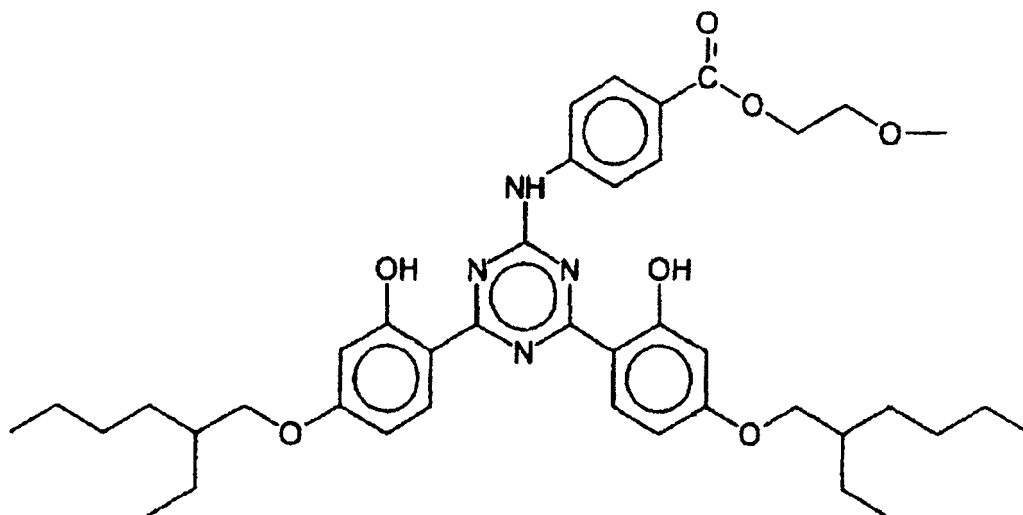
En caso necesario también es ventajoso que los preparados de la presente invención lleven 2,4-bis-{[4-(2-ethylhexyloxy)-2-hidroxi]-fenil}-6-[4-(2-metoxietil-carboxil)-fenilamino]-1,3,5-triazina, caracterizada por la siguiente estructura:

25

30

35

40



45

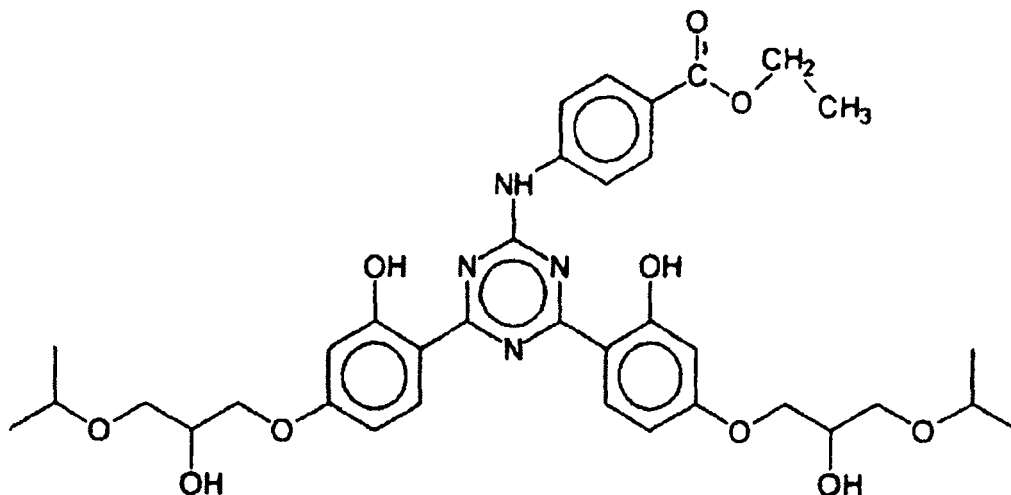
En caso necesario también es ventajoso que los preparados de la presente invención contengan 2,4-bis-{[4-(3-(2-propyloxy)-2-hidroxi-propyloxy)-2-hidroxi]-fenil}-6-[4-(etil-carboxil)-fenilamino]-1,3,5-triazina, la cual se caracteriza por la siguiente estructura:

50

55

60

65



ES 2 279 779 T3

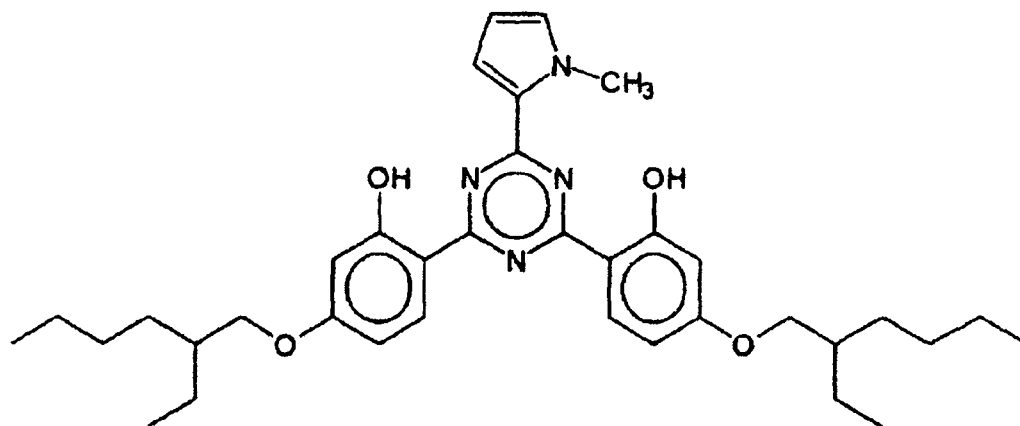
En caso necesario también es ventajoso que los preparados de la presente invención lleven 2,4-bis-[[4-(2-etilhexiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(1-metil-pirrol-2-il)-1,3,5-triazina, caracterizada por la siguiente estructura:

5

10

15

20



25

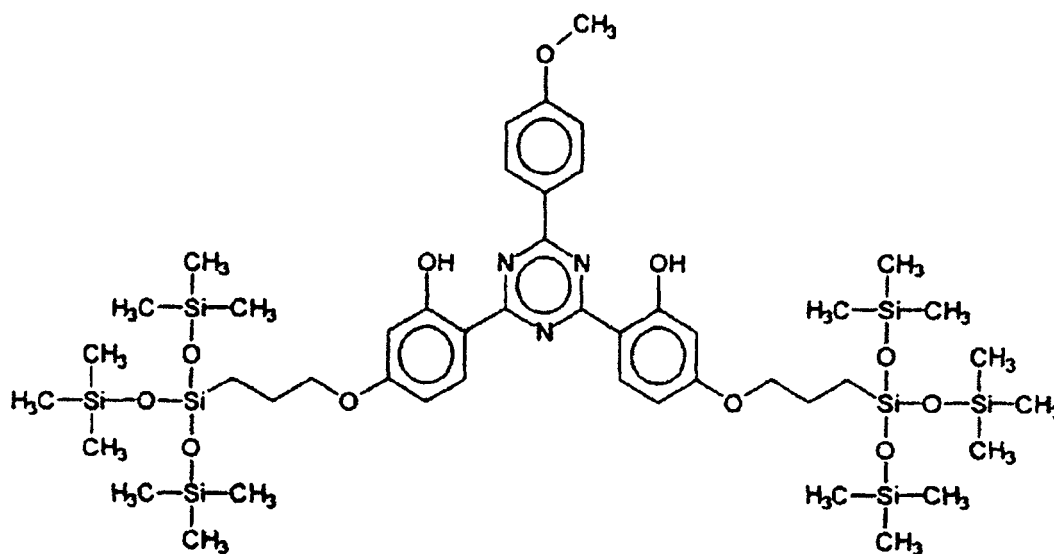
En caso necesario también es ventajoso que los preparados de la presente invención contengan 2,4-bis-[[4-tris(trimetil-siloxi-sililpropiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, caracterizada por la siguiente estructura:

30

35

40

45



50

En caso necesario también es ventajoso que los preparados según la presente invención contengan 2,4-bis-[[4-(2-metilpropeniloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, caracterizada por la siguiente estructura:

55

60

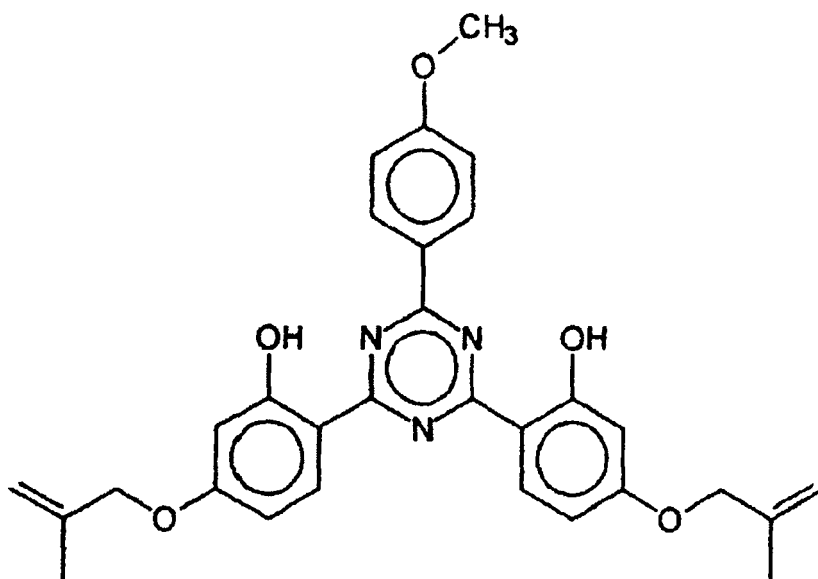
65

5

10

15

20



25

En caso necesario también es ventajoso que los preparados según la presente invención contengan 2,4-bis-{{[4-(1',1',1',3',5',5',5'-heptamethylsiloxy-2-metil-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, la cual se caracteriza por la siguiente estructura:

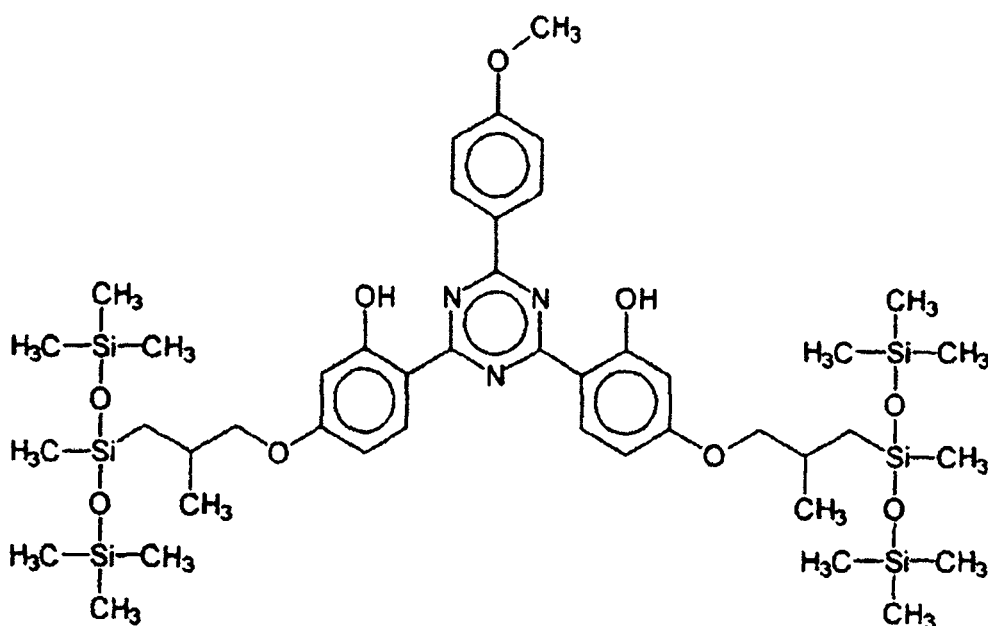
30

35

40

45

50



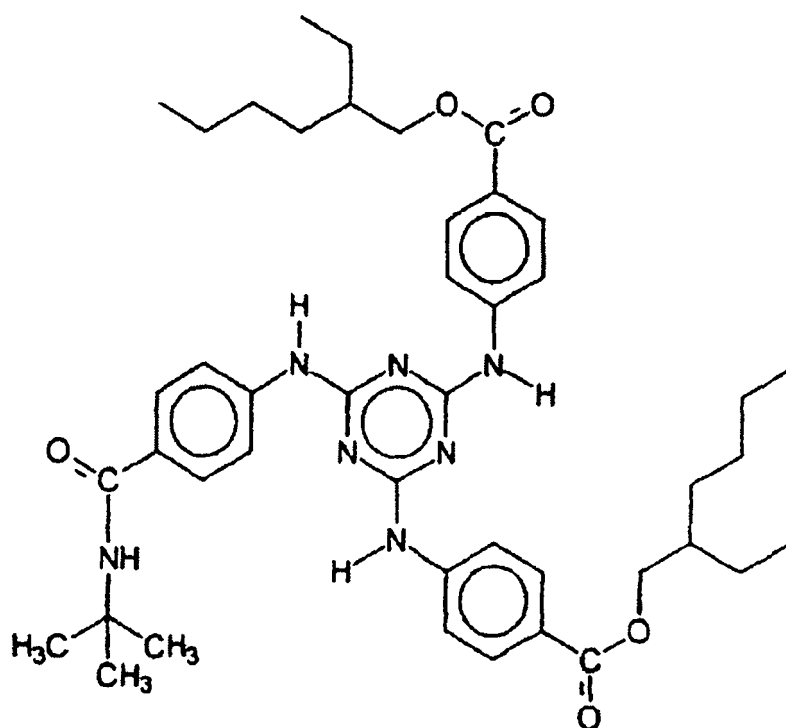
55

En caso necesario también es ventajoso que los preparados según la presente invención contengan un derivado de s-triazina sustituido asimétricamente cuya estructura química reproduce la fórmula

60

65

5
10
15
20
25
30

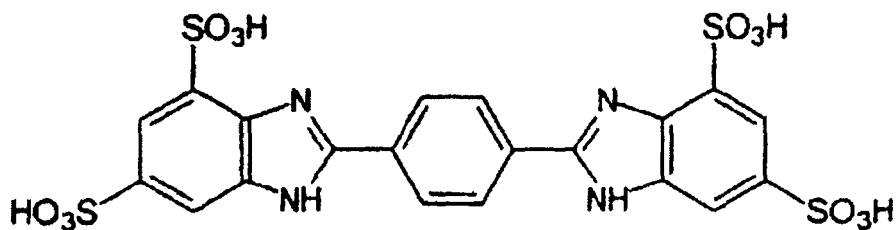


designada también de aquí en adelante como dioctilbutamidotriazona (INCI: Dioctilbutamidotriazone), que vende la firma Sigma 3V con la marca comercial UVASORB HEB.

35 En caso de desearse su presencia, el o los derivados de s-triazina simétrica o asimétricamente sustituidos se incorporan ventajosamente a la fase orgánica de las formulaciones cosméticas o dermatológicas.

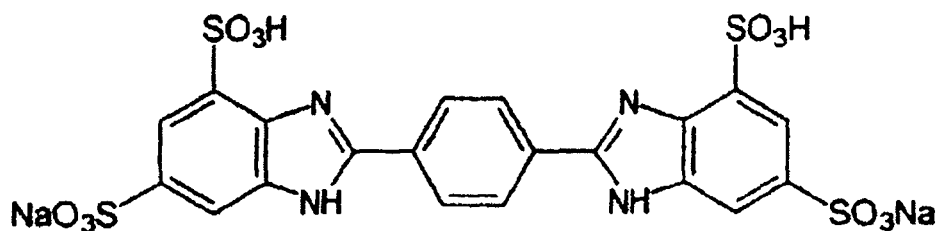
Otras sustancias filtrantes del UV-A son el ácido fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfónico:

40
45
50



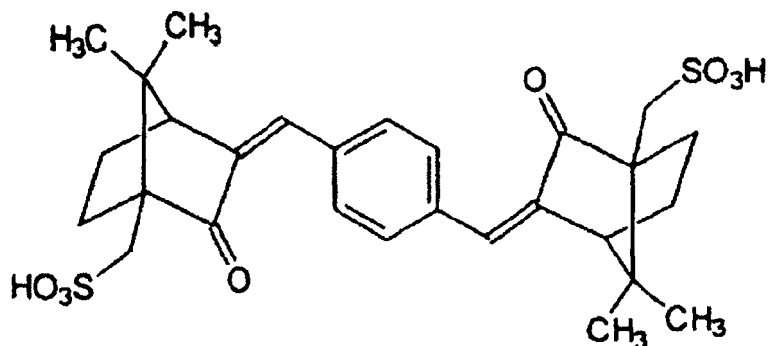
y sus sales, especialmente las de sodio, potasio o trietanol-amonio, sobre todo el fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato disódico:

55
60
65



ES 2 279 779 T3

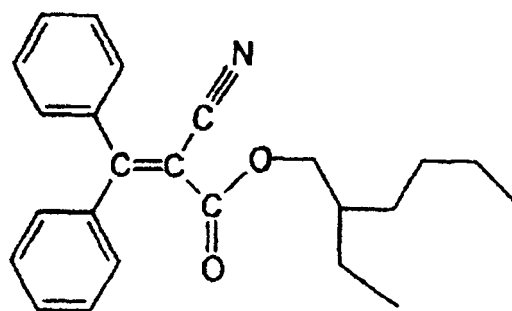
así como el 1,4-di(2-oxo-10-sulfo-3-bornilidenmetil)-benceno y sus sales (sobre todo los correspondientes compuestos 10-sulfato, especialmente la respectiva sal de sodio, potasio o trietanolamonio), denominado también benceno-1,4-di(2-oxo-3-bornilidenmetil-10-ácido sulfónico), que se caracteriza por la siguiente estructura:



Los preparados que contienen filtros UV-A también son objeto de la presente invención. Se pueden utilizar las mismas cantidades que para la combinación UV-B.

Dado el caso, también puede resultar ventajosa la incorporación de otros filtros UV-A y/o UV-B, conforme a la presente invención, a preparados cosméticos o dermatológicos, por ejemplo ciertos derivados de ácido salicílico como salicilato de 4-isopropilbencilo, salicilato de 2-etilhexilo (= salicilato de octilo), salicilato de homomentilo.

Otra sustancia fotofiltrante ventajosa para emplear en la presente invención es el etilhexil-2-ciano-3,3-difenilacrilato (octocrileno), que vende la BASF con la denominación Uvinul® N 539 y se caracteriza por la siguiente estructura:



Naturalmente la lista de los citados filtros UV que se pueden utilizar conforme a la presente invención no debe ser limitativa.

Los siguientes ejemplos sirven para ilustrar la presente invención, pero sin limitarla. Los valores numéricos de los ejemplos representan porcentajes en peso respecto al peso total de los preparados correspondientes.

ES 2 279 779 T3

	Ejemplo 1*	Ejemplo 2	Ejemplo 3	Ejemplo 4	Ejemplo 5
	O/W 1	O/W 2	W/O 1	W/O 2	W/O 3
5	Ácido esteárico	1,50	-	-	-
	Monoestearato de glicerina	3,00	-	-	-
10	Estearato de sorbitán	-	3,00	-	-
	Poligliceril-3-metilglucosa diestearato	-	1,50	-	-
15	Poligliceril-2-dipolihiidroxiestearato	-	-	5,00	-
	Cetil dimeticona copoliol	-	-	-	5,00
20	PEG-30 dipolihiidroxiestearato	-	-	4,00	-
	Dimeticona	2,00	-	2,00	5,00
25	Feniltrimeticona	2,00	-	-	3,00
	Acetato de vitamina E	0,50	0,50	-	-
	Drometrizol trisiloxano	3,00	-	3,00	5,00
30	Bisociltriazol	-	3,00	2,00	2,00
	Aerosil R 972®	-	-	-	0,50
	Hallbrite TQ®	6,00	8,00	5,00	4,00
35	Conservante	0,50	0,50	0,50	0,50
	Glicerina	3,00	10,00	5,00	10,00
40	MgSO ₄	-	-	1,00	1,00
	NaCl	-	-	-	1,00
	Goma xantano	0,30	-	-	-
45	Pemulen TR1®	-	0,10	-	-
	Hidróxido sódico al 45%	0,50	1,20	-	1,30
50	Agua	a 100,00	a 100,00	a 100,00	a 100,00

* no conforme a la presente invención.

55

60

65

ES 2 279 779 T3

	Ejemplo 6	Ejemplo 7	Ejemplo 8	Ejemplo 9*
5	Hidrodispersión	Emulsión de Pickering W/O	Aerosol	Aerosol
10	Monoestearato de glicerina	-	4,00	-
15	Monoestearato de glicerina SE	-	-	4,50
20	Ceteareth-20	-	-	1,00
	Ceteareth-12	-	1,50	-
	Dimeticona	-	-	2,00
	Feniltrimeticona	-	5,00	-
	Acetato de vitamina E	-	0,50	-
25	Drometrizol trisiloxano	2,00	5,00	2,00
	Bisociltiazol	2,00	5,00	2,00
30	Eusolex T2000®	-	4,00	-
	Aerosil R 972®	-	1,00	-
	Hallbrite TQ®	8,00	4,00	5,00
35	Conservante	0,50	0,50	0,50
	Glicerina	-	3,00	10,00
	Goma xantano	0,50	-	-
40	Pemulen TR1®	0,30	-	-
	Hidróxido sódico al 45%	0,30	-	0,40
45	Agua	a 100,00	a 100,00	a 100,00

* no conforme a la presente invención.

50

55

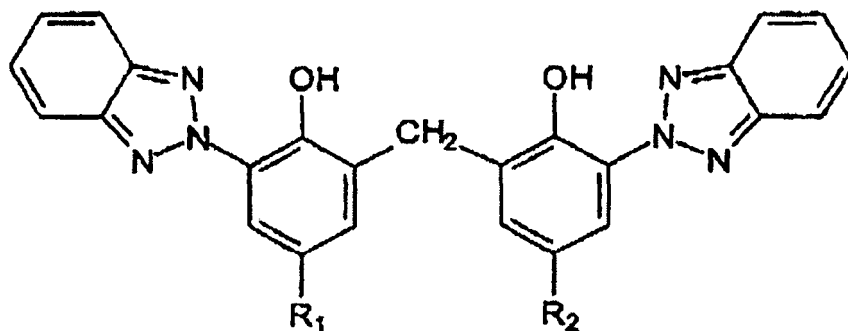
60

65

REIVINDICACIONES

1. Formulación cosmética de acción fotoprotectora, **caracterizada** porque contiene

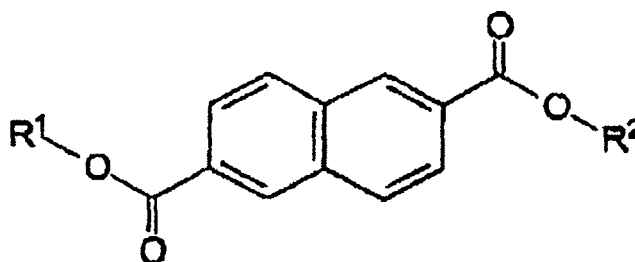
- (a) una o más sustancias filtrantes de UV escogidas del grupo de los derivados de benzotriazol, **caracterizados** por la estructura



donde R_1 y R_2 , independientemente entre sí, se escogen del grupo de los radicales alquilo C_1 - C_{18} ramificados o lineales,

y

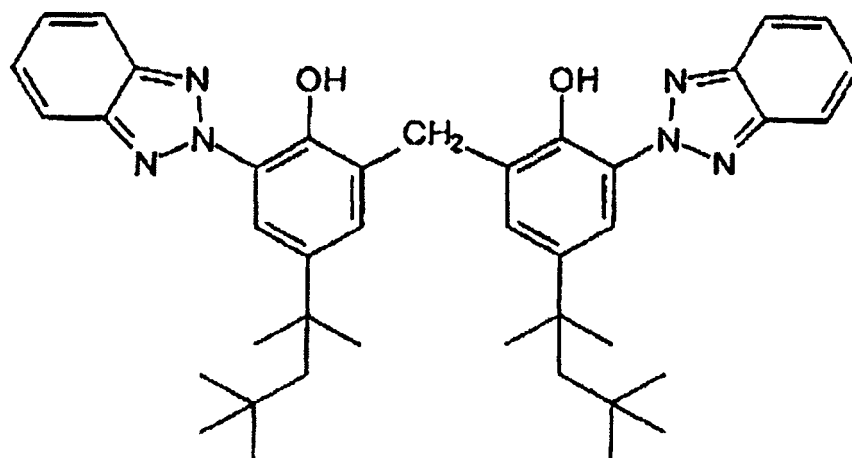
- (b) uno o varios naftalatos de dialquilo con la fórmula estructural



donde R^1 y R^2 , independientemente entre sí, se escogen del grupo de radicales alquilo ramificados y lineales de 6 hasta 24 átomos de carbono.

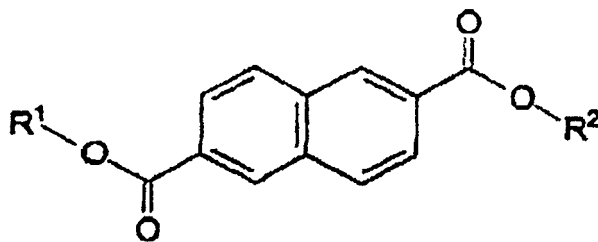
2. Preparado según la reivindicación 1, **caracterizado** porque como naftalato de dialquilo se selecciona el naftalato de dietilhexilo.

3. Preparado según la reivindicación 1 o 2, **caracterizado** porque como benzotriazol se elige el 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-fenol), que se **caracteriza** por la fórmula química estructural



ES 2 279 779 T3

4. Empleo de uno o más naftalatos de dialquilo **caracterizados** por la fórmula estructural



15 donde R^1 y R^2 , independientemente entre sí, están escogidos del grupo de radicales alquilo ramificados y lineales de 6 a 24 átomos de carbono, para mejorar la incorporación de los derivados de triazol en

(a) un componente orgánico aislado o

20 (b) en, al menos, una fase orgánica de un sistema disperso de dos o más fases, que además puede contener una o más fases acuosas.

25

30

35

40

45

50

55

60

65