



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 334 130**

51 Int. Cl.:

A61K 8/06 (2006.01)

A61K 8/86 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **04106547 .5**

96 Fecha de presentación : **14.12.2004**

97 Número de publicación de la solicitud: **1555017**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **20.07.2005**

54 Título: **Emulsiones de viscosidad baja.**

30 Prioridad: **19.01.2004 DE 10 2004 002 996**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
05.03.2010

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
05.03.2010

73 Titular/es: **BEIERSDORF AG.**
Unnastrasse 48
20253 Hamburgo, DE

72 Inventor/es: **Kropke, Rainer;**
Bleckmann, Andreas;
Sugar, Martin;
Heptner, Astrid;
Tesch, Mirko y
Weingarz, Yvonne

74 Agente: **Isern Jara, Jorge**

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

DESCRIPCIÓN

Emulsiones de viscosidad baja.

5 La presente invención se refiere a emulsiones W/O de viscosidad baja, en especial pulverizables.

En una forma especial de ejecución, la presente invención se refiere además la aplicación como producto de protección solar.

10 Las emulsiones forman parte de los sistemas dispersos. Las emulsiones son sistemas bi- o polifásicos de dos o más líquidos que no son solubles o que son difícilmente solubles entre sí. Los líquidos (puros o en forma de soluciones) están presentes en una emulsión en forma de dispersión más o menos fina, que por lo general tiene una estabilidad limitada.

15 Las emulsiones W/O de baja viscosidad conocidas, es decir de una viscosidad inferior a 2000 mPa·s, medida con un viscosímetro de tipo Haake Viskotester VT-02 a 25°C, en especial las que son pulverizables, contienen por lo menos dos emulsionantes, que pueden combinarse entre sí para estabilizar la emulsión. Por ejemplo según el documento DE 10154547 pueden combinarse un emulsionante W/S, un emulsionante W/O y un emulsionante O/W para preparar una emulsión de viscosidad baja.

20 Según el estado actual de la técnica no es posible fabricar emulsiones W/O estables, pulverizables, con un solo emulsionante. Además, las emulsiones pulverizables disponibles de dos o más emulsionantes presentan algunos efectos secundarios no deseados, por ejemplo una mayor inestabilidad de fórmula tanto a temperaturas elevadas como bajas.

25 El objeto de la presente invención es, pues, desarrollar una emulsión W/O de viscosidad baja, que tenga una mejor estabilidad al almacenaje, en especial a temperaturas bajas.

30 Las formulaciones actuales contienen normalmente un porcentaje elevado de aceites de silicona de viscosidad muy baja y punto de ebullición bajo (p.ej. 25-40% en peso de ciclometicona) para facilitar la pulverización, por ejemplo las descritas en US-4,563,346. En tal caso, estos aceites de silicona constituyen, casi exclusivamente, la fase continua de la emulsión.

35 Por lo demás, para estabilizar las emulsiones W/O de viscosidad baja se emplean los silicatos laminares, véase p.ej. WO 9614051, o los organopolisiloxanos, p.ej. WO 9618374. Por esta causa, con los sistemas convencionales de bombeo, no es posible generar una figura pulverizada fina y uniforme.

40 Otro inconveniente del estado de la técnica estriba en que, en este tipo de emulsiones, en especial cuando llevan un contenido elevado de aceite de silicona, solamente pueden disolverse de modo limitado a temperatura ambiente los filtros UV sólidos, por ejemplo los del grupo de las triazinas, y por ello solamente permiten fabricar productos de protección solar con un factor de protección bajo (LSF, SPF).

45 Otro inconveniente es que las emulsiones de viscosidad baja por lo general no son estables a largo plazo y, si además llevan un contenido alto de filtros solares, sufren una separación irreversible del aceite después de un período de tiempo relativamente corto, aprox. de 3 a 6 meses, que, en el caso de almacenaje a temperaturas más elevadas, puede incluso acelerarse.

50 La concentración de uso de las sustancias filtro de protección solar ya conocidas, que despliegan un efecto filtro elevado en especial en la región UV-A, suele ser, pues, a menudo limitada, precisamente en combinación con otras sustancias disueltas. Para poder utilizar, p.ej. cantidades elevadas de sustancias filtro UV solubles en aceite (> 30% en peso o más del 40% en peso). De todos modos, la fase hidrófoba de una emulsión, por ejemplo de una emulsión W/, puede elegirse, como es obvio, tan grande como se quiera, ya que la magnitud de las fases influye decisivamente en la estabilidad de una emulsión. Si se desea que la concentración de aceite sea superior al 30% en peso, entonces según el estado de la técnica tendrán que utilizarse estabilizadores, por ejemplo ceras u otros emulsionantes, con el fin de lograr una emulsión estable a largo plazo, cuya estabilidad cubra varios años. De todos modos, el inconveniente de este proceder estriba en que las emulsiones se convierten en relativamente recias y no es fácil repartirlas bien, sobre todo en el caso de una piel con pelo abundante.

60 Otro método conocido del estado de la técnica para fabricar formulaciones de filtros solares con factores de protección muy elevados (LSF superior a 25), consiste en combinar sustancias filtro UV de tal manera que la cantidad de sustancia filtro UV no se halle en su totalidad dentro de la fase aceite de la emulsión, lo cual obviamente solo será posible si se emplean sustancias filtro UV que sean también solubles en agua. El inconveniente de las emulsiones de este tipo, que contienen sustancias filtro UV solubles en agua, estriba en que normalmente estas emulsiones tienen una resistencia al agua condicional o limitada.

65 Sin embargo, a la resistencia de las formulaciones de sustancias filtro solar al agua debe concedérsele una importancia especial, porque la mayoría de filtros solares se aplican en las proximidades del agua o durante el ejercicio de actividades deportivas (sudor). Un filtro solar resistente al agua protege al usuario no solo después el baño, sino que

ES 2 334 130 T3

lo protege también de las quemaduras durante el baño. Es un error bastante frecuente pensar que el agua da una protección bueno o incluso satisfactoria contra la radiación ultravioleta. Las investigaciones han demostrado lo contrario, que incluso 1 m por debajo de la superficie del agua la incidencia de los rayos UV-B es de aprox. un 50%. Por ello es aconsejable que incluso los que practican deportes acuáticos, p.ej. nadadores, surfistas o buceadores, así como en especial los niños, que a menudo están jugando durante horas junto al agua o dentro del agua, protejan su piel con un producto solar de buena adherencia, que se elimine difícilmente por acción del agua (salada) o del sudor, con el fin de evitar los efectos de una radiación solar intensa y persistente.

Por ello, en el sentido de una resistencia óptima al agua, sería deseable prescindir de los filtros UV solubles al agua.

El objeto de la presente invención es, pues, no solo mejorar el estado de la técnica y paliar sus inconvenientes, sino también desarrollar emulsiones W/O de viscosidad baja, que conservando la estabilidad de la fórmula, posean una concentración elevada de filtros solares.

Por consiguiente, es también objeto de la presente invención conseguir de modo sencillo y event. económico formulaciones, que aporte una alta protección contra rayos UV-A y UV-B, que se aplican en forma de filtros solares pulverizados y al mismo tiempo se caracterizan por una buena resistencia al agua y la facilidad de reparto.

Los objetos mencionados se consiguen con formulaciones definidas en la reivindicación principal. Son objeto de las reivindicaciones secundarias las formas de ejecución ventajosas de las formulaciones de la invención. Por lo demás, la invención se refiere también al uso de dichas formulaciones.

Es sorprendente y en ello reside la solución de estos temas que las formulaciones cosméticas o dermatológicas basadas en una emulsión W/o de viscosidad baja, que contiene más del 30% en peso de lípidos, porcentaje referido al peso total de la formulación, dicha formulación contiene solo un emulsionante, el dipolihidroxiestearato de PEG-30, y tiene una viscosidad comprendida entre 50 y 2000 mPa·s, con preferencia entre 100 y 600 mPa·s, permiten solucionar los temas planteados.

Ha sido sorprendente y no previsible para los expertos que el uso del dipolihidroxiestearato de PEG-30 como único emulsionante permite emplear un contenido alto de lípidos y esta formulación y, por ello, esta formulación permite obtener la viscosidad baja requerida y, en especial, la idoneidad para la pulverización.

La viscosidad puede determinarse con un viscosímetro del tipo Haake Viskotester VT-02 a 25°C y se sitúa con ventaja entre 50 y 2000 mPa·s, de modo ideal entre 100 y 600 mPa·s.

El dipolihidroxiestearato de PEG-30 es conocido y se comercializa por ejemplo con el nombre de ARLACEL® P135. La formulación de la invención no contiene ningún otro emulsionante.

De modo sorprendente, la combinación existente en este emulsionante de un alto contenido de lípidos y una viscosidad ajustada a valores bajos es decisiva para la preparación de una formulación de viscosidad baja, que permite soslayar los inconvenientes ya mencionados del estado de la técnica.

Las formulaciones de la invención constituyen preparaciones satisfactorias desde cualquier punto de vista, que poseen una buena estabilidad de fórmula y al almacenaje, son estables a largo plazo incluso a temperaturas más bajas y, como preparaciones de protección solar, permiten la incorporación de grandes cantidades de filtro solar.

Se considera un contenido elevado de lípidos más de un 30% en peso, en especial más de un 35% en peso, con preferencia especial más de un 37,5% en peso y con preferencia muy especial más de un 40% en peso de lípidos, porcentaje referido en cada caso al peso total de la formulación. Este porcentaje del contenido de lípidos deberá elegirse en función de la forma del producto.

Se cuentan como fase lípida según la invención no el emulsionante ni otros ingredientes activos o aditivos, que en determinadas circunstancias presentan propiedades lipófilas.

En el marco de la presente solicitud se emplea la expresión "lípidos" como término genérico para las grasas, aceites, ceras y similares, expresión que es familiar a los expertos. Se emplean también como sinónimos los términos "fase aceite" y "fase lípida".

Los aceites y las grasas se diferencian entre otros por su polaridad, que es difícil de definir. Ya se ha propuesto tomar la tensión superficial sobre el agua una medida del índice de la polaridad de un aceite o de una fase aceite. En estos casos se considera que la polaridad de la fase aceite en cuestión será tanto mayor, cuanto más baja sea la tensión superficial entre esta fase aceite y el agua. Según la invención, la tensión superficial debe considerarse como un indicativo de la polaridad de un componente aceite determinado.

La tensión superficial es aquella fuerza que actúa a lo largo de un metro de la línea ideal formada por la superficie límite entre dos fases. La unidad física para tensión superficial se calcula de manera clásica como cociente entre la fuerza y la longitud y se expresa habitualmente en mN/m (milinewtones dividido por metros). Tiene signo positivo

ES 2 334 130 T3

cuando tiene tendencia a reducir la superficie límite. En caso contrario tiene signo negativo. En el sentido de la presente invención se consideran polares los lípidos, cuya tensión superficial con el agua es inferior a 20 mN/m; se consideran no polares aquellos, cuya tensión superficial con el agua es superior a 30 mN/m. Los lípidos que tienen una tensión superficial con el agua entre 20 y 30 mN/m se denominan en general de polaridad media.

Los lípidos se eligen con preferencia entre el grupo de los lípidos entre no polares y de polaridad media, que tienen una tensión superficial con el agua entre 20 y 30 mN/m o bien superior a 30 mN/m.

La fracción de lípidos polares, que tienen una tensión superficial con el agua inferior a 20 mN/m, se sitúa con ventaja en menos del 25% en peso, con preferencia en menos del 15% en peso, porcentaje referido al peso total de los lípidos.

Son aceites polares por ejemplo los del grupo de las lecitinas y de los triglicéridos de ácidos grasos, a saber, los triésteres de glicerina de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales, de una longitud de cadena de 8 a 24 átomos de C, en especial de 12 a 18 átomos de C. Los triglicéridos de ácidos grasos pueden elegirse con ventaja por ejemplo entre el grupo de los aceites sintéticos, semisintéticos y naturales, p.ej. el aceite de oliva, el aceite de girasol, el aceite de soja, el aceite de cacahuete, el aceite de colza, el aceite de almendra, el aceite de palma, el aceite de coco, el aceite de ricino, el aceite de germen de trigo, el aceite de pepita de uva, el aceite de cardo, el aceite de enotera, el aceite de macadamia y similares.

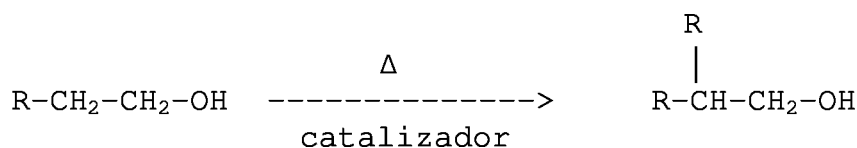
Como representativos de lípidos polares han dado buenos resultados los glúcidos de coco y los glicéridos de coco.

Son lípidos polares especialmente ventajosos en el sentido de la presente invención todos los lípidos naturales, p.ej. el aceite de oliva, el aceite de girasol, el aceite de soja, el aceite de cacahuete, el aceite de colza, el aceite de almendra, el aceite de palma, el aceite de coco, el aceite de ricino, el aceite de germen de trigo, el aceite de pepita de uva, el aceite de cardo, el aceite de enotera, el aceite de macadamia, el aceite de germen de maíz, el aceite de aguacate y similares, así como los que se enumeran a continuación.

Nombre comercial	Nombre INCI	Polaridad [mN/m]
Isofol 14 T	butil-decanol (+) hexil-octanol (+) hexil-decanol (+) butil-octanol	19,8
Lipovol MOS-130	estearato de tridecilo (+) trimelitato de tridecilo (+) hexacaprilato/hexacaprato de dipentaeritritilo	19,4
aceite de ricino		19,2
Isofol Ester 0604		19,1
Miglyol 840	dicaprilato/dicaprato de propilenglicol	18,7
Isofol 12	butil-octanol	17,4
Tegosoft SH	heptanoato de estearilo	17,8
aceite de aguacate		14,5
Cetiol B	adipato de dibutilo	14,3
Dermol 488	dietilenoheptanoato de PEG 2	10,1
Cosmacol ELI	lactato de alquilo C12-13	8,8
Dermol 489	diocetanoato/diisononanoato de dietilenglicol	8,6
Cosmacol ETI	tartrato de dialquilo C12/13	7,1
Emerest 2384	monoisoestearato de propilenglicol	6,2
Myritol 331	glicéridos de coco	5,1
Prisorine 2041 GTIS	triisoestearina	2,4

Además, la fase aceite puede elegirse con ventaja entre el grupo de los éteres de dialquilo, el grupo de los alcoholes saturados o insaturados, ramificados o no ramificados. Es especialmente ventajoso que la fase aceite contenga benzoatos de alquilo C₁₂₋₁₅ o esté formada exclusivamente por ellos.

La fase aceite puede elegirse además con ventaja entre el grupo de los alcoholes de Guerbet. Los alcoholes de Guerbet deben su nombre a Marcel Guerbet, que fue el primero en describir su obtención. Se forman con arreglo al siguiente esquema de reacción:

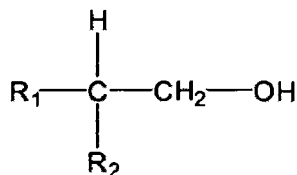


por oxidación de un alcohol a aldehído, por condensación aldólica del aldehído, eliminación del agua del aldol e hidrogenación del alilaldehído. Los alcoholes de Guerbet son líquidos incluso a temperaturas bajas y prácticamente

ES 2 334 130 T3

no provocan irritación en la piel. Pueden utilizarse con ventaja como componentes engrasantes, muy engrasantes y también reengrasantes en productos de cosmética cutánea y capilar.

El uso de los alcoholes de Guerbet en cosmética es de por sí conocido. Por lo general, estos compuestos se caracterizan por la estructura



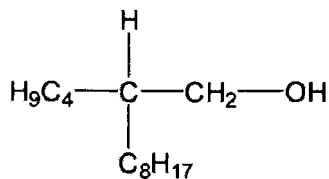
en la que R_1 y R_2 normalmente significan restos alquilo no ramificados.

Según la invención el o los alcoholes de Guerbet se eligen con ventaja entre el grupo, en el que

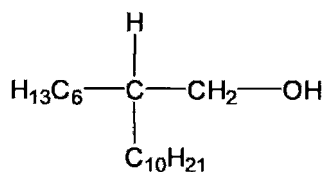
R_1 = propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo u octilo y

R_2 = hexilo, heptilo, octilo, nonilo, decilo, undecilo, dodecilo, tridecilo o tetradecilo.

Los alcoholes de Guerbet preferidos según la invención son el 2-butiloctanol, que tiene la estructura química:



se comercializa por ejemplo con el nombre de Isofol® 12 de la empresa Condea Chemie GmbH, y el 2-hexildecano, que tiene la estructura química:



y se comercializa por ejemplo con el nombre de Isofol® 16 de la empresa Condea Chemie GmbH.

Según la invención pueden utilizarse también con ventaja mezclas de alcoholes de Guerbet. Las mezclas de 2-butiloctanol y 2-hexildecanol se comercializan por ejemplo con el nombre de Isofol® 14 de la empresa Condea Chemie GmbH.

Los lípidos de polaridad media especialmente ventajosos en el sentido de la presente invención son las sustancias que se enumeran seguidamente.

Nombre comercial	Nombre INCI	Polaridad [mN/m]
DUB VCI 10	neopentanoato de isodecilo	29,9
Dermol IHD	decanoato de isohexilo	29,7
Dermol 108	octanoato de isodecilo	29,6
éter de dihexilo	éter de dihexilo	29,2
Dermol 109	hexanoato de isodecil-3,5,5-trimetilo	29,1
Cetiol SN	isononanoato de cetearilo	28,6
palmitato de isopropilo	palmitato de isopropilo	28,8

ES 2 334 130 T3

	DC Fluid 345	ciclotricono	28,5
	Dow Corning Fluid 244	ciclopolidimetilsiloxano	28,5
5	aceite de yoyoba "oro"		26,2
	Wacker AK 100	dimeticona	26,9
	Dermol 98	2-etilhexanoato de 3,5,5-trimetilo	26,2
	Dow Corning Fluid 246	(pendiente)	25,3
10	Eutanol G	octildodecanol	24,8
	Isofol 16	hexil-decanol	24,3
	Dermol 139	hexanonanoato de isotridecil-3,5,5-trimetilo	24,5
	Cetiol PGL	hexildecanol (+) laurato de hexil-decilo	24,3
	Cegesoft C24	palmitato de octilo	23,1
15	M.O.D.	miristato de octildodecilo	22,1
	aceite de macadamia		22,1
	aceite de silicona VP 1120	fenil-trimeticona	22,7
	Isocarb 12	ácido butil-octanoico	22,1
20	estearato de isopropilo	estearato de isopropilo	21,9
	Finsolv TN C12-15	benzoatos de alquilo	21,8
	Dermofeel BGC	caprilato/caprato de butilenglicol	21,5
	Miglyol 812	triglicéridos de ácidos caprílico-cáprico	21,3
25	Trivent OCG	tricaprilina	20,2
	Dermol 866	PEG-hexanoato de dietilo/diisononanoato/isononanoato de etilhexilo	20,1

Los aceites no polares son, por ejemplo, los elegidos entre el grupo de los hidrocarburos y ceras ramificados y no ramificados, en especial las vaselinas, el aceite de parafina, el escualano y el escualeno, las poliolefinas y los poliisobutenos hidrogenados. Entre las poliolefinas, las sustancias preferidas son los polidecanos.

Los lípidos no polares especialmente ventajosos en el sentido de la presente invención son las sustancias que se enumeran a continuación.

nombre comercial	nombre INCI	polaridad [mN/m]
Ecolane 130	cicloparafina	49,1
Nexbase 2006 FG	polideceno	46,7
polisilano	poliisobuteno hidrogenado	44,7
aceite de silicona Wacker AK 50	polidimetilsiloxano	46,5
Solvent ICH	isohexadecano	43,8
Pionier 2076	aceite mineral	43,7
Pionier 6301	aceite mineral	43,7
aceite de silicona Wacker AK 35	polidimetilsiloxano	42,4
isoeicosano	isoeicosano	41,9
aceite de silicona Wacker AK 20	polidimetilsiloxano	40,9
Isofol 1212 Carbonato		40,3

nombre comercial	nombre INCI	polaridad [mN/m]
Softcutol O	oleato de etoxidiglicol	40,5
Lipodermanol OL	olivato de decilo	40,3
Cetiol S	dioctilciclohexano	39,0
Pionier 2071	aceite mineral	38,3
Hydrobrite 1000 PO	parafina líquida	37,6
Tegosoft HP	palmitato de isocetilo	36,2
Isofol Ester 1693		33,5
Ester 1260		33,0
Dow Corning Fluid 245	ciclopentasiloxano	32,3
Prisorine 2036	isoestearato de octilo	31,6
Cetiol CC	carbonato de dicaprililo	31,7
Dermol 99	isononanoato de trimetilhexilo	31,1
Dermol 89	isononanoato de 2-etilhexilo	31,0
Cetiol OE	éter de dicaprililo	30,9
carbonato de dihexilo	carbonato de dihexilo	30,9
Silkflo 366 NF	polideceno	30,1
Estol 1540 EHC	cocoato de octilo	30,0

Sin embargo es también ventajoso emplear mezclas de lípidos de polaridad más alta y más baja.

Los lípidos se eligen con preferencia entre el grupo formado por el carbonato de dicaprililo, el dicaprilato/dicaprato de butilenglicol y los benzoatos de alquilo C12-15.

La fase aceite puede elegirse entre el grupo formado por los hidrocarburos y ceras saturados e insaturados, los éteres de dialquilo, el grupo de los alcoholes saturados e insaturados, ramificados y no ramificados, los triglicéridos de ácidos grasos, a saber los triésteres de glicerina de los ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales, de una longitud de cadena de 8 a 24 átomos de C, en especial de 12 a 18 átomos de C. Los triglicéridos de ácidos grasos pueden elegirse con ventaja por ejemplo entre el grupo de los aceites sintéticos, semisintéticos y naturales, p.ej. el aceite de oliva, el aceite de girasol, el aceite de soja, el aceite de cacahuete, el aceite de colza, el aceite de almendra, el aceite de palma, el aceite de coco, el aceite de ricino, el aceite de germen de trigo, el aceite de pepita de uva, el aceite de cardo, el aceite de enotera, el aceite de macadamia y similares.

Pueden utilizarse también ceras, pero en cualquier caso como máximo un 3,0% en peso, con preferencia como máximo un 1,5%, porcentaje referido al peso total de la formulación.

Los componentes grasa y/o cera a emplear con ventaja según la invención pueden elegirse con ventaja según la invención entre el grupo de las ceras vegetales, las ceras animales, las ceras inorgánicas y las ceras petroquímicas. Según la invención son favorables por ejemplo la cera candelilla, la cera carnauba, la cera japonesa, la cera de esparto (atocha), la cerina, la cera guaruma, la cera de aceite de arroz, la cera de caña de azúcar, la cera de bayas, la cera uricuri, la cera montana, la cera yoyoba, la cera de butirospermo, la cera de abejas, la cera de goma laca, la esperma de ballena, la lanolina, la cera de glándula uropigial, la ceresina, la ozoquerita (cera fósil), las ceras de parafina y las microceras, en el supuesto que cumplan los requisitos formulados en la reivindicación principal.

Otros componentes grasos y/o ceras ventajosos son las ceras modificadas químicamente y las ceras sintéticas, por ejemplo las que la empresa CRODA GmbH suministra con los nombres comerciales de Syncrowax HRC (tribehenato de glicerilo) y Syncrowax AW 1C (ácidos grasos C₁₈₋₃₆), así como las ceras ésteres de montana, ceras de sasol, ceras de yoyoba hidrogenadas, ceras de abeja sintéticas o modificadas (p.ej. cera de abejas-dimeticona-poliol y/o cera de abejas-alquilo C₃₀₋₅₀), ceras de polialquilenos, ceras de polietilenglicol, pero también las grasas modificadas químicamente, p.ej. los aceites vegetales hidrogenados (por ejemplo el aceite de ricino hidrogenado y/o los glicéridos grasos de coco hidrogenados), los triglicéridos, por ejemplo la trihidroxiestearina, los ácidos grasos, los ésteres de ácidos grasos y los ésteres de glicoles, por ejemplo el estearato de alquilo C₂₀₋₄₀, el hidroxistearoilestearato de alquilo C₂₀₋₄₀ y/o el montanato de glicol. Son también ventajosos determinados compuestos orgánicos de silicio, que tienen propiedades físicas similares a los componentes grasos y/o ceras ya mencionados, por ejemplo el estearoxitrimetilsilano, en el supuesto de que se cumplan los requisitos definidos en las reivindicaciones correspondientes.

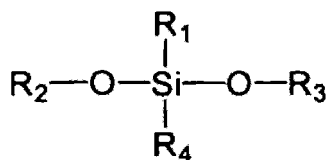
ES 2 334 130 T3

La fase aceite se elige con ventaja entre el grupo formado por el isoestearato de 2-etilhexilo, el octildodecanol, el isononanoato de isotridecilo, el dicaprilato/dicaprato de butilenglicol, el cocoato de 2-etilhexilo, el benzoato de alquilo C₁₂₋₁₅, el triglicérido de los ácidos caprílico-cáprico, el éter de dicaprililo, los carbonatos de dicaprililo y los glicéridos de coco, en el supuesto de que se cumplan los requisitos definidos en las reivindicaciones.

Son especialmente ventajosas las mezclas del octildodecanol, el triglicérido de los ácidos caprílico-cáprico, el éter de dicaprililo, el carbonato de dicaprililo, los glicéridos de coco o las mezclas del benzoato de alquilo C₁₂₋₁₅ y el isoesterato de 2-etilhexilo, las mezclas del benzoato de alquilo C₁₂₋₁₅ y el dicaprilato/dicaprato de butilenglicol, así como las mezclas del benzoato de alquilo C₁₂₋₁₅, el iso-esterato de 2-etilhexilo y el isononanoato de isotridecilo, en el supuesto de que se cumplan los requisitos definidos en las reivindicaciones.

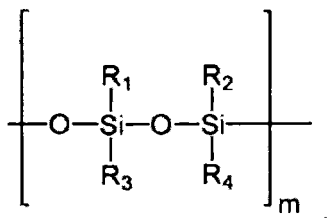
Entre los hidrocarburos se emplean con ventaja especial en el sentido de la presente invención el aceite de parafina, la cicloparafina, el escualano, el escualeno, el poliisobuteno o el polideceno hidrogenados, en el supuesto de que se cumplan los requisitos definidos en las reivindicaciones.

Puede ser también ventajoso elegir una parte o la totalidad de la fase aceite de las formulaciones de la invención entre el grupo formado por las siliconas cíclicas y/o lineales. El contenido de siliconas cíclicas y/o lineales deberá limitarse como máximo al 25% en peso, con preferencia como máximo al 15% en peso, porcentaje referido al peso de la fase lípida en su conjunto. Estas siliconas o aceites de silicona pueden estar presentes en forma de monómeros, que por lo general se caracterizan por los elementos estructurales siguientes:



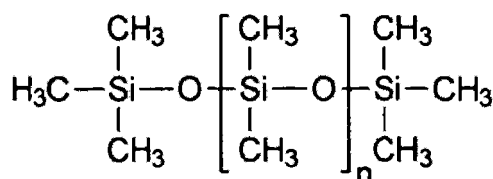
Los aceites de silicona son compuestos poliméricos sintéticos de peso molecular elevado, cuyos átomos de silicio están unidos mediante átomos de oxígeno para formar cadenas y/o redes, las demás valencias del silicio se saturan con restos hidrocarburo (por lo general con grupos metilo, con menor frecuencia: etilo, propilo, fenilo, etc.).

Las siliconas lineales, que pueden utilizarse con ventaja según la invención, se caracterizan en general por los elementos estructurales siguientes:



en los que los átomos de silicio pueden estar sustituidos con restos iguales o diferentes de alquilo y/o de arilo, que aquí para simplificar se representan mediante los restos R₁-R₄ (es decir, el número de restos distintos no necesariamente está limitado a 4); m puede adoptar valores entre 2 y 200.000.

El nombre sistemático de los aceites de silicona lineales es el de poliorganosiloxanos; los poliorganosiloxanos sustituidos con metilos, que en cantidad constituyen los compuestos más importantes de este grupo, se caracterizan por la siguiente fórmula estructural:



y se denominan polidimetilsiloxanos o dimeticonas (INCI). Existen dimeticonas de diferentes longitudes de cadena o de diferentes pesos moleculares. Las dimeticonas de diversas longitudes de cadena y las feniltrimeticonas son aceites de silicona lineales especialmente ventajosos en el sentido de la presente invención.

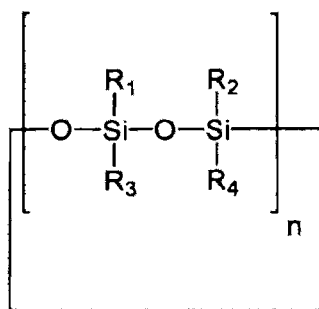
ES 2 334 130 T3

Son también poliorganosiloxanos especialmente ventajosos en el sentido de la presente invención por ejemplo los dimetilpolisiloxanos [poli(dimetilsiloxano)], que p.ej. la empresa Th. Goldschmidt suministra con los nombres comerciales de ABIL 10 hasta 10000. Son también ventajosos los fenilmetilpolisiloxanos (INCI: fenil-dimeticonas, fenil-trimeticonas), las siliconas cíclicas (octametilciclotetrasiloxano o decametilciclopentasiloxano), que se conocen también con los nombres INCI de ciclometiconas, las siliconas modificas con amino (INCI: amodimeticonas) y las ceras de silicona, p.ej. los copolímeros de polisiloxano-polialquileño (INCI: estearil-dimeticona y cetil-dimeticona) y los dialcoxidimetilpolisiloxanos (INCI: estearoxi-dimeticona y behenoxi-estearil-dimeticona), que la empresa Th. Goldschmidt suministra en forma de sus diversos tipos de ceras Abil.

Son también especialmente ventajosos en el sentido de la presente invención los aceites de silicona que se enumeran a continuación:

Nombre comercial	Nombre INCI	Polaridad [mN/m]
aceite de silicona Wacker AK 100	polidimetilsiloxano	26,9
aceite de silicona Wacker AK 50	polidimetilsiloxano	46,5
aceite de silicona Wacker AK 35	polidimetilsiloxano	42,4
aceite de silicona Wacker AK 20	polidimetilsiloxano	40,9
Dow Corning Fluid 245	ciclopentasiloxano	32,3
Dow Corning Fluid 345	ciclopentasiloxano	28,5

Las siliconas cíclicas, que pueden utilizarse con ventaja según la invención, se caracterizan en general por los elementos estructurales siguientes:



en los que los átomos de silicio pueden estar sustituidos con restos iguales o diferentes de alquilo y/o de arilo, que aquí para simplificar se representan mediante los restos R_1 - R_4 (es decir, el número de restos distintos no necesariamente está limitado a 4); n puede adoptar valores entre $3/2$ y 20. Los quebrados del parámetro n toman en consideración que en el ciclo pueden estar presentes números impares de grupos siloxilo.

Los aceites de silicona cíclicos especialmente ventajosos en el sentido de la presente invención son las ciclometiconas, en especial la ciclometicona D5 y/o la ciclometicona D6; pero en especial una mezcla de D4, D5 y D6.

Los aceites de silicona o bien las ceras de silicona que son ventajosos en el sentido de la presente invención son los aceites de silicona y las ceras de silicona cíclicos y/o lineales.

Es especialmente ventajoso en el sentido de la presente invención elegir una proporción entre los lípidos y los aceites de silicona del tipo 1 : 1 (en general $x : y$).

Como aceite de silicona se elige con ventaja la feniltrimeticona. En el sentido de la presente invención puede utilizarse también con ventaja otros aceites de silicona, por ejemplo la dimeticona, la fenildimeticona, las ciclometiconas (octametilciclotetrasiloxano), por ejemplo el hexametilciclotrisiloxano, el polidimetilsiloxano, el poli(metilfenilsiloxano), la cetildimeticona, la behenoxidimeticona.

ES 2 334 130 T3

Son también ventajosas las mezclas de ciclometicona e isononanoato de isotridecilo así como las de ciclometicona e isoestearato de 2-etilhexilo.

5 Pero también es ventajoso elegir aceites de silicona de una constitución similar a la de los compuestos mencionados anteriormente, cuyas cadenas laterales orgánicas se hayan derivatizado, por ejemplo polietoxilado y/o polipropoxilado. Entre ellos se cuentan por ejemplo los copolímeros de polisiloxano-polialquil-poliéter como el cetil-dimeticonapoliol así como el cetildimeticona-poliol (y) el poli(4-iso-estearato de glicerilo) (y) el laurato de hexilo.

10 La cantidad de lípidos se sitúa según la invención muy por encima del 30% en peso, porcentaje referido al peso total de la formulación. La proporción entre las fases aceite y agua es una magnitud decisiva en el ámbito de las emulsiones de agua en aceite (W/O) para poder ajustar el intervalo de viscosidades de las formulaciones de interés: cuanto menor es la porción de la fase acuosa dispersa interna (y, por tanto, cuanto mayor es la porción de la fase lípida continua externa), tanto menores serán los intervalos de viscosidad que podrán lograrse debido a la interacción reducida de la fase acuosa dispersa interna. Debido a la gran distancia que separa las gotas de agua entre sí, si no se usan espesantes
15 de tipo aceite ni ceras, no puede formarse ninguna estructura de tipo gel y, por tanto, no puede haber aumento de la viscosidad. Debido a esta propiedad, los sistemas tradicionales se inestabilizan con gran rapidez (es decir, en el plazo de días o semanas, en especial cuando la temperatura de almacena es alta, es decir, 40°C o más).

20 La proporción entre las fases aceite y agua se sitúa con preferencia en el intervalo entre 30 frente a 70 y 60 frente a 40, en especial entre 35:65 y 50:50, con preferencia especial en 40:60. En tales casos, el emulsionante y eventualmente los demás compuestos lipófilos, no forman parte de la fase aceite.

Según la invención, el problema de la viscosidad baja, la idoneidad para la pulverización y al mismo tiempo la estabilidad se soluciona con la formulación de la invención.

25 Por consiguiente, las formulaciones acordes con la presente invención son especialmente indicadas para actuar como base de las formas de producto destinadas a múltiples fines de aplicación.

La fase acuosa de las formulaciones de la presente invención contiene eventualmente con ventaja: alcoholes, dioles, polioles de bajo número de C, así como sus éteres, con preferencia el etanol, el isopropanol, el propilenglicol, la glicerina, el etilenglicol, el monoetil- o monobutil-éter del etilenglicol, el monometil-, monoetil- o monobutil-éter del propilenglicol, el monometil- o el monoetil-éter del dietilenglicol y productos similares, también alcoholes de bajo número de C, p.ej. el etanol, el isopropanol, el 1,2-propanodiol, la glicerina así como en especial uno o varios espesantes, que se eligen con ventaja entre el grupo formado por el dióxido de silicio, los silicatos de aluminio,
35 los polisacáridos o sus derivados, p.ej. el ácido hialurónico, la goma xantano y/o la hidroxipropilmetilcelulosa, con ventaja especial entre el grupo formado por los poliacrilatos, con preferencia un poliacrilato del grupo de los llamados Carbopoles, por ejemplo los Carbopoles de los tipos 980, 981, 1382, 2984, 5984, en cada caso a título individual o bien en combinación.

40 Los conservantes ventajosos en el sentido de la presente invención son por ejemplo los compuestos que desprenden formaldehído (p.ej. la DMDM-hidantoína, que la empresa Lonza suministra por ejemplo con el nombre de Glydant®), el carbamato de yodopropilbutilo (p.ej. los comercializados con los nombres de Koncyl-L, Koncyl-S y Konkaben LMB), los productos paraben, el fenoxietanol, el etanol, el ácido benzoico y similares. Por lo general, el sistema de conservante abarca también con ventaja auxiliares conservantes, como son por ejemplo la etilhexiloxiglicerina, la glicina de soja, etc.

Por lo demás, la formulación puede contener agentes que conservan la humedad y también humidificantes (los llamados moisturizer). Los humidificantes son aquellas sustancias o mezclas de sustancias, que confieren a las formulaciones cosméticas o dermatológicas la propiedad de que, una vez aplicadas o repartidas sobre la superficie de la piel,
50 reducen la emisión de humedad de la capa córnea (también llamada transepidermal water loss (TEWL)) y/o influyen positivamente en la hidratación de dicha capa córnea.

Los humidificantes ventajosos en el sentido de la presente invención son por ejemplo la glicerina, el ácido láctico, el ácido pirrolidonacarboxílico y la urea. Es también especialmente ventajoso emplear humidificantes poliméricos del grupo de los polisacáridos solubles en agua y/o hinchables en agua y/o gelificables mediante el agua. Son especialmente ventajosos por ejemplo el ácido hialurónico y/o un polisacárido rico en fucosa, que se ha registrado en el Chemical Abstracts con el número 178463-23-5 y que p.ej. la empresa SOLABIA S.A. suministra con el nombre comercial de Fucogel® 1000.

60 Las formulaciones cosméticas o dermatológicas de la invención pueden contener además con ventaja, aunque no sea absolutamente necesario, cargas de relleno que, p.ej., siguen mejorando las propiedades sensoriales y cosméticas de las formulaciones y por ejemplo provocan o potencian una sensación de piel sedosa o aterciopelada.

Las cargas de relleno ventajosas en el sentido de la presente invención son los almidones y derivados de almidón (p.ej. almidón de tapioca, el fosfato de dialmidón, el octenilsuccinato de almidón-aluminio o de almidón sódico y similares), los pigmentos que no tienen fundamentalmente efecto de filtro UV ni efecto colorante (p.ej. el nitrato de boro, etc.) y/o los productos Aerosil® (CAS nº 7631-86-9).

Eventualmente, las composiciones cosméticas de la invención pueden contener también los aditivos habituales de cosmética, por ejemplo perfume, espesantes, desodorantes, sustancias antimicrobianas, agentes reengrassantes, agentes complejantes y secuestrantes, agentes que confieren brillo perlado, extractos vegetales, vitaminas, ingredientes activos, conservantes, bactericidas, colorantes, pigmentos, que tienen efecto colorante, espesantes, humidificantes y/o sustancias que conservan la humedad, grasas, aceites, ceras o demás componentes habituales de una formulación cosmética o dermatológica, como son los alcoholes, polioles, polímeros, estabilizadores de espuma, electrolitos, disolventes orgánicos o derivados de silicona.

Las formulaciones cosméticas y dermatológicas de la invención pueden contener colorantes y/o pigmentos de color, en especial en las formulaciones de cosmética "decorativa". Los colorantes y pigmentos pueden elegirse de la lista positiva correspondiente del Reglamento (alemán) de Cosmética o de la lista CE de colorantes cosméticos. En la mayoría de casos son idénticos con los colorantes autorizados para el uso en alimentos. Los pigmentos de color ventajosos son por ejemplo el dióxido de titanio, la mica, los óxidos de hierro (p.ej. Fe_2O_3 , Fe_3O_4 , $\text{FeO}(\text{OH})$) y/o el óxido de estaño.

Los colorantes ventajosos son por ejemplo el carmín, el azul Prusia, el verde óxido de cromo, el azul ultramar y/o el violeta de manganeso. Es ventajoso en especial elegir los colorantes y/o los pigmentos coloreados de la siguiente lista. Los números de Colour Index (CIN) se pueden encontrar en el manual Rowe Colour Index, 3ª edición, Society of Dyers and Colourists, Bradford, Inglaterra, 1971.

Son también ventajosas en el sentido de la presente invención las formulaciones que contiene pigmentos de brillo perlado.

Son especialmente preferidos los siguientes tipos de pigmentos de brillo perlado que se enumeran a continuación.

Los colorantes y pigmentos pueden estar presentes a título individual o bien en forma de mezcla y puede el uno ser el recubrimiento del otro o viceversa, de este modo con distintas capas de recubrimiento se pueden conseguir en general efectos coloristas diversos. La cantidad total de colorantes y pigmentos de color se elige con ventaja en el intervalo p.ej. del 0,1% en peso al 30% en peso, con preferencia entre el 0,5 y el 15% en peso, en especial entre el 1,0 y el 10% en peso, porcentaje referido en cada caso el peso total de las formulaciones.

Se consiguen formulaciones especialmente ventajosas cuando estas incorporan antioxidantes como aditivos o como ingredientes activos. Según la invención, las formulaciones contienen con ventaja uno o más antioxidantes. Como anti-oxidantes favorables, aunque opcionales, pueden incorporarse todos los antioxidantes idóneos o habituales de las aplicaciones cosméticas y/o dermatológicas.

Los antioxidantes se eligen con ventaja especial entre el grupo formado por los aminoácidos (p.ej. glicina, histidina, tirosina, triptófano) y sus derivados, los imidazoles (p.ej. ácido urocánico) y sus derivados, los péptidos, p.ej. D,L-carnosina, D-carnosina, L-carnosina y sus derivados (p.ej. anserina), los carotinoides, las carotinas (p.ej. α -caroteno, β -caroteno, licopeno) y sus derivados, el ácido lipónico y sus derivados (p.ej. el ácido dihidrolipónico), la aurotio-glucosa, el propiltiouracilo y otros tioles (p.ej. la tioredoxina, la glutatióna, la cisteína, la cistina, la cistamina y sus ésteres de glucosilo, de N-acetilo, de metilo, de etilo, de propilo, de amilo, de butilo y de laurilo, de palmitoilo, de oleilo, de γ -linoleilo, de colesterilo y de glicerilo) así como sus sales, el tiodipropionato de dilaurilo, el tiodipropionato de diestearilo, el ácido tiodipropiónico y sus derivados (ésteres, éteres, péptidos, lípidos, nucleótidos, nucleósidos y sales) así como los compuestos sulfoximina (p.ej. la butioninasulfoximina, la homocisteinasulfoximina, la butioninasulfona, la penta-, hexa-, heptationinasulfoximina) en dosificaciones muy pequeñas y compatibles (p.ej. de $\mu\text{moles/kg}$), también quelantes (de metales) (p.ej. los ácidos α -hidroxigrasos, el ácido palmítico, el ácido fítico, la lactoferrina), los α -hidroxiácidos (p.ej. el ácido cítrico, el ácido láctico, el ácido málico), el ácido húmico, los ácidos biliares, los extractos biliares, la bilirrubina, la biliverdina, el EDTA, el EGTA y sus derivados, los ácidos grasos insaturados y sus derivados (p.ej. el ácido γ -linolénico, el ácido linoleico, el ácido oleico), el ácido fólico y sus derivados, la ubiquinona y el ubiquinol y sus derivados, la vitamina C y sus derivados (p.ej. el palmitato de ascorbilo, el ascorbifosfato de Mg, el acetato de ascorbilo), los tocoferoles y derivados (p.ej. el acetato de la vitamina E), la vitamina A y sus derivados (el palmitato de la vitamina A) así como el benzoato de coniferilo de la resina de benjuí, el ácido rutínico y sus derivados, el ácido ferulánico y sus derivados, el butilhidroxitolueno, el butilhidroxianisol, el ácido nordihidroguayaresínico, el ácido nordihidroguayarético, la trihidrobutirofenona, el ácido úrico y sus derivados, la manosa y sus derivados, el cinc y sus derivados (p.ej. el ZnO , el ZnSO_4), el selenio y sus derivados (p.ej. la metionina de selenio), el estilbeno y sus derivados (p.ej. el óxido de estilbeno, el óxido de transestilbeno) y los derivados idóneos según la invención (sales, ésteres, éteres, azúcares, nucleótidos, nucleósidos, péptidos y lípidos) de estos ingredientes activos.

De modo especialmente ventajoso en el sentido de la presente invención pueden utilizarse antioxidantes solubles en agua, por ejemplo las vitaminas, p.ej. el ácido ascórbico y sus derivados.

Una propiedad sorprendente de las formulaciones de la invención es que son muy buenos vehículos para los ingredientes activos cosméticos y dermatológicos para la aportación a la piel, los ingredientes activos preferidos son antioxidantes que protegen la piel de la oxidación. Los antioxidantes preferidos son la vitamina E y sus derivados así como la vitamina A y sus derivados.

ES 2 334 130 T3

La cantidad de antioxidantes (uno o más compuestos) en las formulaciones se sitúa con ventaja entre el 0,001 y el 30% en peso, con preferencia especial entre el 0,05 y el 20% en peso, en especial entre el 0,1 y el 10% en peso, porcentaje referido al peso total de la formulación.

En el supuesto de que el o los antioxidantes sean la vitamina E y/o sus derivados, es ventajoso elegir sus concentraciones dentro del intervalo del 0,001 al 10% en peso, porcentaje referido al peso total de la formulación.

En el supuesto de que el o los antioxidantes sean la vitamina A, los derivados de la vitamina A o la carotina o sus derivados, es ventajoso elegir sus concentraciones dentro del intervalo del 0,001 al 10% en peso, porcentaje referido al peso total de la formulación.

Según la invención, los ingredientes activos (uno o más compuestos) pueden elegirse también con ventaja entre el grupo de los ingredientes activos lipófilos, en especial entre el grupo siguiente:

el ácido acetilsalicílico, la atropina, el azuleno, la hidrocortisona y sus derivados, p.ej. el valerato de hidrocortisona-17, las vitaminas de las series B y D, son muy favorables la vitamina B₁, la vitamina B₁₂, la vitamina D₁, pero también el bisabolol, los ácidos grasos insaturados, a saber los ácidos grasos esenciales (a menudo llamados también vitamina F), en especial el ácido gamma-linolénico, el ácido oleico, el ácido eicosapentaenoico, el ácido docosahexaenoico y sus derivados, el cloranfenicol, la cafeína, las prostaglandinas, el timol, el alcanfor, los extractos y otros productos de origen vegetal y animal, p.ej. el aceite de enotera (diego de noche), el aceite de borraja o el aceite de grosella, los aceites de pescado, el aceite de hígado de bacalao y también las ceramidas y los compuestos similares a las ceramidas, etcétera.

Es también ventajoso elegir las sustancias activas entre el grupo de las sustancias reengrasantes, tales como el aceite llamado Purcellinöl (empresa Dragoco), el Eucerit® y el Neocerit®.

De modo especialmente ventajoso, el o los ingredientes activos se eligen entre el grupo de los inhibidores de la NO-sintasa, en especial cuando los preparados de la presente invención deban utilizarse para el tratamiento o la profilaxis de los síntomas de alteraciones cutáneas intrínsecas o extrínsecas así como para el tratamiento y profilaxis de los efectos nocivos de los rayos ultravioleta en la piel.

El inhibidor preferido de la NO-sintasa es la nitro-arginina.

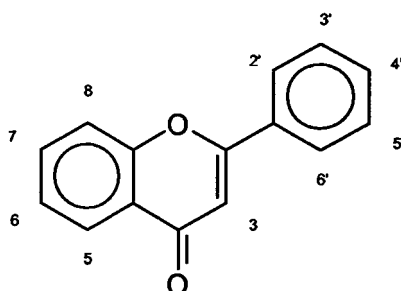
El o los ingredientes activos se eligen también con ventaja entre el grupo que abarca a la catequina y los ésteres de ácidos biliares y los extractos orgánicos o acuosos de plantas o de partes de plantas, que lleven catequina o ésteres de ácidos biliares de catequina, por ejemplo las hojas del grupo de las plantas teáceas, en especial la especie *Camellia sinensis* (té verde). Son especialmente ventajosos sus ingredientes activos típicos (p.ej. polifenoles o catequinas, cafeína, vitaminas, azúcar, sales minerales, aminoácidos, lípidos).

Las catequinas forman un grupo de compuestos, que deben considerarse flavonas hidrogenadas o antocianidinas y los derivados de la "catequina" (3,3',4',5,7-flavanopentaol, 2-(3,4-dihidrofénil)-cromano-3,5,7-triol). También la epicatequina ((2R,3R)-3,3',4',5,7-flavanopentaol) es un ingrediente activo ventajoso en el sentido de la presente invención.

Son también ventajosos los extractos vegetales que contienen catequinas, en especial los extractos del té verde, p.ej. los extractos de las plantas de la especie *Camellia spec.*, muy en especial las clases de té de la *Camellia sinensis*, la *C. assamica*, la *C. taliensis*, o la *C. irrawadiensis* y los cruces de estas últimas por ejemplo con la *Camellia japónica*.

Son también ingredientes activos preferidos los polifenoles o las catequinas elegidos entre la (-)-catequina, (+)-catequina, galato de (-)-catequina, galato de (-)-galocatequina, (+)-epicatequina, (-)-epicatequina, galato de (-)-epicatequina, (-)-epigalocatequina, galato de (-)-epigalocatequina.

También la flavona y sus derivados (a menudo llamados de modo colectivo "flavonas") son ingredientes activos ventajosos en el sentido de la presente invención. Se caracterizan por tener la estructura siguiente (se indican las posiciones de sustitución):



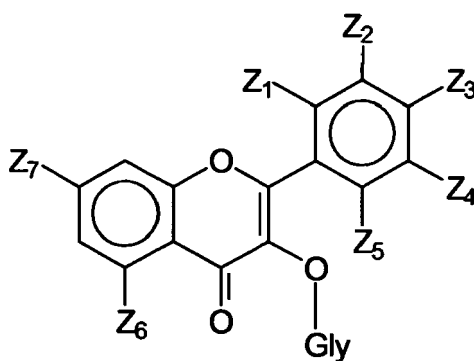
ES 2 334 130 T3

Algunas de las flavonas más importantes, que pueden utilizarse con preferencia en los preparados de la invención, se recogen en la siguiente tabla:

	posiciones de sustitución de OH							
	3	5	7	8	2'	3'	4'	5'
flavona	–	–	–	–	–	–	–	–
flavonol	+	–	–	–	–	–	–	–
crisina	–	+	+	–	–	–	–	–
galangina	+	+	+	–	–	–	–	–
apigenina	–	+	+	–	–	–	+	–
fisetina	+	–	+	–	–	+	+	–
luteolina	–	+	+	–	–	+	+	–
canferol	+	+	+	–	–	–	+	–
quercetina	+	+	+	–	–	+	+	–
morina	+	+	+	–	+	–	+	–
robinetina	+	–	+	–	–	+	+	+
gosipetina	+	+	+	+	–	+	+	–
miricetina	+	+	+	–	–	+	+	+

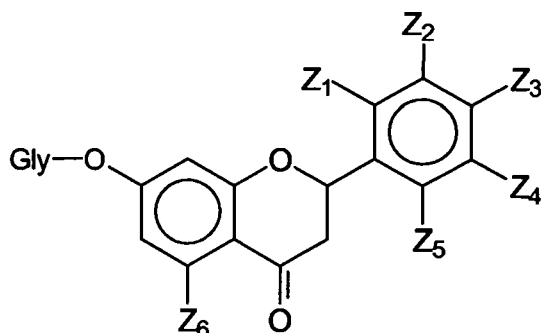
En la naturaleza, las flavonas se presentan por lo general en forma glucosidada.

Según la invención, los flavonoides se eligen con preferencia entre el grupo de sustancias que tienen la fórmula genérica:



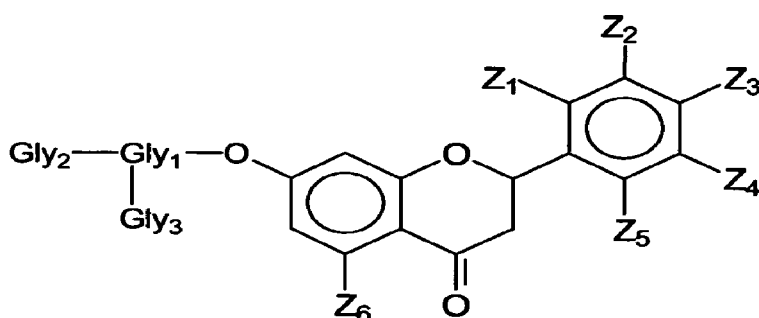
en la que de Z₁ a Z₇ con independencia entre sí se eligen entre el grupo formado por H, OH, grupos alcoxi e hidroxialcoxi, dichos grupos alcoxi e hidroxialcoxi pueden ser ramificados o sin ramificar y tener de 1 a 18 átomos de C, y en la que Gly se elige entre el grupo formado por restos mono- y oligoglucósidos.

Según la invención, los flavonoides pueden elegirse también con ventaja entre el grupo de sustancias de la fórmula estructural genérica



en la que de Z_1 a Z_6 con independencia entre sí pueden elegirse entre el grupo formado por H, OH, grupos alcoxi e hidroxialcoxi, dichos grupos alcoxi e hidroxialcoxi pueden ser ramificados o sin ramificar y tener de 1 a 18 átomos de C, y en la que Gly se elige entre el grupo formado por restos mono- y oligoglucósidos.

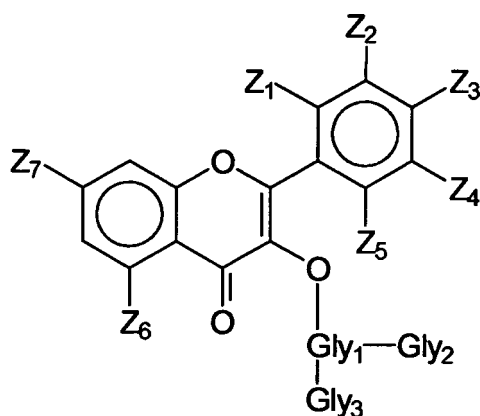
Tales estructuras se eligen con preferencia entre el grupo formado por las sustancias de la fórmula estructural genérica:



en la que Gly_1 , Gly_2 y Gly_3 con independencia entre sí significan grupos monoglucósido. Gly_2 y Gly_3 a título individual o en ambos casos pueden ser saturaciones realizadas con átomos de hidrógeno.

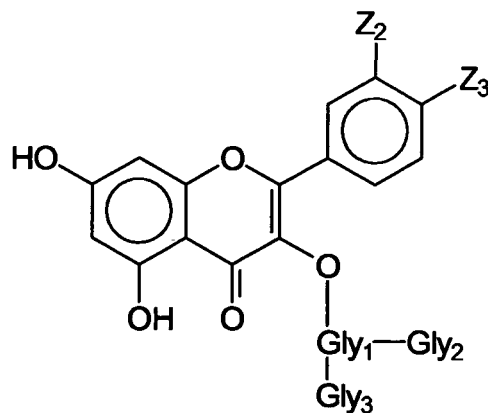
Gly_1 , Gly_2 y Gly_3 con independencia entre sí se eligen con preferencia entre el grupo de los restos hexosilo, en especial de los restos ramnosilo y glucosilo. Pero eventualmente pueden utilizarse también con ventaja otros restos hexosilo, por ejemplo alosilo, altrosilo, galactosilo, gulosilo, idosilo, manosilo y talosilo. Puede ser también ventajoso según la invención el uso de restos pentosilo.

Los restos de Z_1 a Z_5 con independencia entre sí pueden elegirse con ventaja entre el grupo formado por H, OH, metoxi, etoxi y 2-hidroxietoxi, y los flavonaglicósidos tienen la estructura



ES 2 334 130 T3

Los flavonaglucósidos de la invención se eligen con ventaja especial entre el grupo, que se ajusta a la siguiente fórmula estructural:



en la que Gly₁, Gly₂ y Gly₃ con independencia entre sí significan restos monoglucósido. Gly₂ y Gly₃ pueden significar también a título individual o en ambos casos saturaciones realizadas mediante átomos de hidrógeno.

Gly₁, Gly₂ y Gly₃ con independencia entre sí se eligen con preferencia entre el grupo de los restos hexosilo, en especial de los restos ramnosilo y glucosilo. Pero eventualmente pueden utilizarse también con ventaja otros restos hexosilo, por ejemplo alosilo, altrosilo, galactosilo, gulosilo, idosilo, manosilo y talosilo. Puede ser también ventajoso según la invención el uso de restos pentosilo.

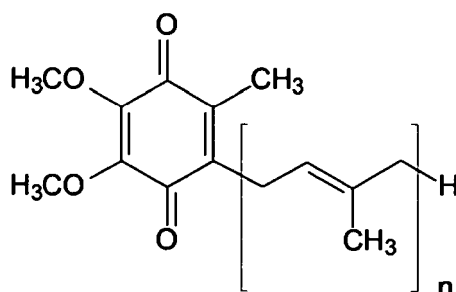
Es especialmente ventajoso en el sentido de la presente invención elegir el o los flavonaglucósidos entre el grupo formado por la α -glucosilrutina, la α -glucosilmiricetina, la α -glucosilisoquercitrina, la α -glucosilisoquercetina y la α -glucosilquercitrina.

Según la invención es especialmente preferida la α -glucosilrutina.

Son también ventajosas según la invención la naringina (aurantiina, naringenina-7-ramnoglucósido), la hesperidina (3',5,7-trihidroxi-4'-metoxiflavanona-7-rutinósido, hesperidósido, hesperetina-7-O-rutinósido), la rutina (3,3',4',5,7-pentahidroxi-flavona-3-rutinósido, quercetina-3-rutinósido, soforina, birutano, rutabiona, taurrutina, fitomelina, melina), troxerrutina (3,5-dihidroxi-3',4',7-tris(2-hidroxietoxi)-flavona-3-(6-O-(6-desoxi- α -L-manopiranosil)- β -D-glucopiranosido)), monoxerrutina (3,3',4',5'-tetrahidroxi-7-(2-hidroxietoxi)-flavona-3-(6-O-(6-fesoxi- α -L-manopiranosil)- β -D-glucopiranosido)), dihidrorrobinetina (3,3',4',5',7-pentahidroxiflavanona), taxifolina (3,3',4',5,7-pentahidroxi-flavanona), eriodictiol-7-glucósido (3',4',5,7-tetrahidroxi-7-glucósido), flavanomareína (3',4',7,8-tetrahidroxi-7-glucósido) e isoquercetina (3,3',4',5,7-pentahidroxiflavanona-3-(β -D-glucopiranosido).

Es también ventajoso elegir el o los ingredientes activos entre el grupo de las ubiquinonas y las plastoquinonas.

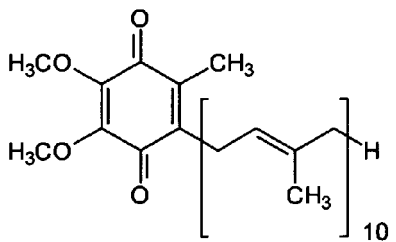
Las ubiquinonas se caracterizan por la fórmula estructural:



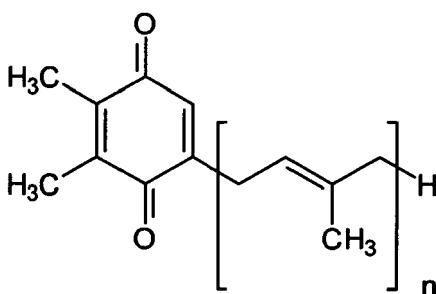
y constituyen el grupo de las bioquinonas más frecuentes y mejor estudiadas. Según el número de unidades isopreno unidas a la cadena lateral, las ubiquinonas se denominan Q-1, Q-2, Q-3, etc. y según el número de átomos de C se denominan U-5, U-10, U-15, etc. Aparecen con longitudes de cadena determinadas, p.ej. en algunos microorganismos y levaduras en las que n = 6. En la mayor parte de mamíferos, incluido el hombre, predomina la Q-10.

ES 2 334 130 T3

Es especialmente ventajosa la coenzima Q10, que se caracteriza por la siguiente fórmula estructural:

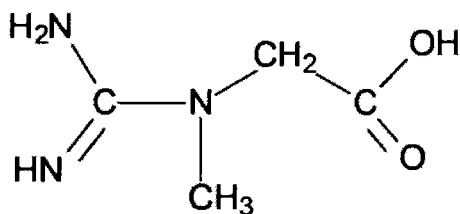


Las plastoquinonas tienen la fórmula estructural general:



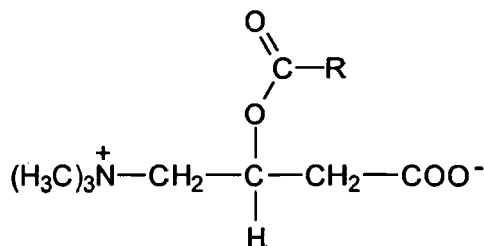
Las plastoquinonas se diferencian en el número n de restos isopreno y se denominan en consonancia, p.ej. PQ-9 (n = 9). Existen también otras plastoquinonas que tienen diferentes sustituyentes sobre el anillo quinona.

También la creatina y/o los derivados de creatina son ingredientes activos preferidos en el sentido de la presente invención. La creatina se caracteriza por tener la estructura siguiente:



Los derivados preferidos son el fosfato de creatina y el sulfato de creatina, el acetato de creatina, el ascorbato de creatina y los derivados esterificados por reacción del grupo carboxilo con alcoholes mono- o polifuncionales.

Otro ingrediente activo ventajoso es la L-carnitina [betaína del ácido 3-hidroxi-4-(trimetilamonio)-butírico]. Son también ingredientes activos ventajosos en el sentido de la presente invención las acilcarnitinas elegidas entre el grupo formado por las sustancias de la siguiente fórmula estructural:



en la que R se elige entre el grupo de los restos alquilo ramificados o sin ramificar, que hasta 10 átomos de carbono. Son preferidas las propionilcarnitina y en especial la acetilcarnitina. Ambos enantiómeros (formas D y L) pueden emplearse con ventaja en el sentido de la presente invención. Puede ser también ventajoso utilizar mezclas discrecionales de enantiómeros, por ejemplo un racemato de las formas D y L.

Otros ingredientes activos ventajosos son la sericosida, el piridoxol, la vitamina K, la biotina, la cafeína y los aromas.

Es obvio que la lista de los ingredientes activos o mezclas de ingredientes activos mencionados, que pueden utilizarse en las formulaciones de la presente invención, no deberá tomarse en sentido restrictivo. Los ingredientes activos pueden utilizarse a título individual o en forma de combinaciones discrecionales entre sí.

Además son también idóneas las formulaciones seleccionadas de la presente invención que contienen p.ej. los ya conocidos ingredientes activos antiarrugas, como son los flavonaglicósidos (en especial la α -glucosilrutina), la coenzima Q10, la vitamina E y/o derivados y similares, con ventaja especial para la profilaxis y el tratamiento de alteraciones cosméticas o dermatológicas de la piel, que surgen p.ej. a raíz del envejecimiento de la misma. Son también idóneas con ventaja contra el conjunto de síntomas de la piel seca o rugosa.

El envejecimiento de la piel está causado p.ej. por factores endógenos, determinados genéticamente. En la epidermis y en la dermis aparecen como consecuencia de la edad p.ej. los siguientes daños estructurales y trastornos funcionales, que pueden considerarse incluidos dentro del término "xerosis senil":

- a) sequedad, rugosidad y formación de arrugas de desecación,
- b) prurito y
- c) menor actividad reengrasante de las glándulas sebáceas (p.ej. después de un lavado).

Los factores exógenos, como son la luz UV y los compuestos nocivos de origen químico, pueden actuar de forma acumulada y p.ej. acelerar o completar los procesos endógenos de envejecimiento. En la epidermis y la dermis, los factores exógenos provocan sobre todo los siguientes daños estructurales y trastornos funcionales, que según el grado y la condición de los daños causados pueden derivar del envejecimiento cronológico:

- d) dilatación visible de los vasos sanguíneos (tele-angiectasias, cuperosis),
- e) flaccidez y formación de arrugas,
- f) pigmentación localmente excesiva, insuficiente o defectuosa (p.ej. manchas de vejez) y
- g) mayor proclividad a sufrir el estrés mecánico (p.ej. tendencia al agrietamiento).

En una forma especial de ejecución, la presente invención se refiere, pues, a productos para el cuidado de la piel envejecida por causas naturales así como para el tratamiento de las secuelas del envejecimiento provocado por la luz, en especial de los fenómenos descritos en los apartados de a) a g).

Las formulaciones cosméticas y/o dermatológicas de la invención pueden tener una composición convencional y destinarse a la protección solar cosmética y/o dermatológica y también al tratamiento, cuidado y limpieza de la piel y/o del cabello o bien utilizarse como producto de maquillaje en la cosmética decorativa.

Para la aplicación se extienden las formulaciones cosméticas y dermatológicas de la invención del modo habitual en cosmética sobre la piel y/o el cabello, en una cantidad suficiente.

Debido a la viscosidad baja del intervalo de viscosidades deseado y debido a las propiedades especiales del producto, la aplicación sobre la piel puede realizarse en especial mediante la pulverización de la formulación. La pulverización puede realizarse por ejemplo con un pulverizador simple accionado por bomba, con bombas pulverizadoras manuales disparadas con un dedo o con "gatillo", con bombas de aerosol, en las que la proyección del contenido hacia el exterior se realiza mediante un gas propelente, con bombas dispensadoras o con botellas aplastables o con los sistemas llamados de bolsa dentro de bote ("bag-in-can").

Las formulaciones de la invención pueden aplicarse sin problemas con bombas estándar convencionales y generar un aerosol fino y uniforme.

Otra forma preferida de ejecución de la presente invención consiste en productos de protección solar. Es especialmente ventajosa la adición de filtros UV solubles en aceite y/o solubles en agua y/o de pigmentos inorgánicos que reflejan y/o absorben la radiación UV.

ES 2 334 130 T3

Es también ventajoso en el sentido de la presente invención fabricar formulaciones cosméticas y dermatológicas, cuya finalidad principal no sea la protección de la luz solar, pero que en cualquier caso contengan sustancias de protección UV. A saber, en muchos casos se incorporan p.ej. a las cremas de día o a los productos de maquillaje sustancias filtro UV-A o UV-B. Por otro lado, las sustancias de protección UV al igual que los antioxidantes y, si se desea, los conservantes constituyen una protección eficaz contra la descomposición para las formulaciones propiamente dichas. Son también favorables las formulaciones cosméticas y dermatológicas que se presentan en forma de producto de protección solar.

Por consiguiente, las formulaciones en el sentido de la presente invención contienen con preferencia por lo menos una sustancia filtro UV-A y/o UV-B. Aunque no sea necesario, las formulaciones pueden contener eventualmente uno o varios pigmentos orgánicos y/o pigmentos inorgánicos en calidad de sustancias filtro UV, que pueden estar presentes en la fase acuosa y/o en la fase aceite.

Los pigmentos inorgánicos preferidos son óxidos de metales y/u otros compuestos metálicos insolubles o difícilmente solubles en agua, en especial los óxidos de titanio (TiO_2), de cinc (ZnO), de hierro (p.ej. Fe_2O_3), de circonio (ZrO_2), de silicio (SiO_2), de manganeso (p.ej. MnO), de aluminio (Al_2O_3), de cerio (p.ej. Ce_2O_3), los óxidos mixtos de los metales correspondientes así como las mezclas de tales óxidos y además el sulfato de bario (BaSO_4).

Los pigmentos de dióxido de titanio pueden estar presentes en la modificación cristalina rutilo y también en la anatasa y en el sentido de la invención puede ser ventajoso que hayan recibido un tratamiento superficial (coating), cuya finalidad es que conferir o generar un carácter hidrófilo, anfífilo o hidrófobo. Este tratamiento superficial puede consistir en que los pigmentos se doten de una capa inorgánica y/u orgánica, hidrófila y/o hidrófoba, por procedimientos ya conocidos. Los diferentes recubrimientos superficiales pueden contener también agua en el sentido de la presente invención.

Los dióxidos de titanio recubiertos o sin recubrir descritos pueden aplicarse también en el sentido de la presente invención en forma de predispersiones acuosa o aceitosas, que son productos comerciales. Estas predispersiones pueden incorporar con ventaja dispersantes y/o solubilizantes.

Los dióxidos de titanio de la invención se caracterizan por tener un tamaño de partícula primaria comprendido entre 10 nm y 150 nm.

nombre comercial	recubrimiento	otros componentes de la predispersión	fabricante
MT-100TV	hidróxido de aluminio/ácido esteárico	-	Tayca Corporation
MT-100Z	hidróxido de aluminio/ácido esteárico	-	Tayca Corporation
MT-100F	óxido de hierro/ácido esteárico	-	Tayca Corporation
MT-500SAS	alúmina, sílice, silicio	-	Tayca Corporation
MT-100AQ	sílice, hidróxido de aluminio, ácido algínico	-	Tayca Corporation
Eusolex T-2000	alúmina, dimeticona	-	Merck KgaA
Eusolex TS	alúmina, ácido esteárico	-	Merck KgaA
dióxido de titanio T25	ninguno	-	Degussa
dióxido de titanio T805 (Uvinul TiO_2)	octiltrimetilsilano	-	Degussa
UV-Titan X170	alúmina, dimeticona	-	Kemira
UV-Titan X161	alúmina, sílice, ácido esteárico	-	Kemira
Tioveil AQ 10PG	alúmina, sílice	agua, propilenglicol	Solaveil/Uniquema
Mirasun TiW 60	alúmina, sílice	agua	Rhone-Poulenc

En el sentido de la presente invención, los dióxido de titanio especialmente preferidos son el MT-100 y el MT-100 TV de Tayca Corporation, el Eusolex T-2000 y el Eusolex TS de Merck y el dióxido de titanio T 805 de Degussa.

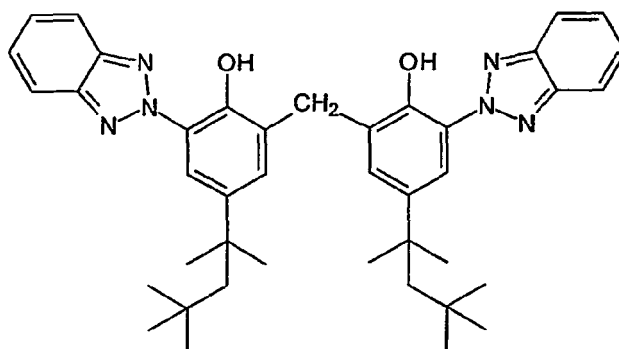
Los óxidos de cinc en el sentido de la invención pueden utilizarse también en forma de predispersiones acuosas o aceitosas que son productos comerciales. Las partículas de óxido de cinc idóneas según la invención y las predispersiones de partículas de óxido de cinc se caracterizan por tener un tamaño de partícula primaria de <300 nm y pueden adquirirse de las empresas suministradoras con los nombres comerciales que se indican:

Nombre comercial	Recubrimiento	Fabricante
Z-Cote HP1	2 % de dimeticona	BASF
Z-Cote	/	BASF
ZnO NDM	5 % de dimeticona	H&R
Mz 707M	7 % de meticona	Tayca Corporation
Nanox 500	/	Elementis
ZnO neutro	/	H&R

Los óxidos de cinc especialmente preferidos en el sentido de la invención son el Z-Cote HP1 de la empresa BASF y el óxido de cinc NDM de la empresa Haarmann & Reimer.

La cantidad total de uno o más pigmentos inorgánicos en la formulación cosmética final se elige con ventaja en el intervalo comprendido entre el 0,1% en peso y el 25% en peso, con preferencia entre el 0,5% en peso y el 18% en peso.

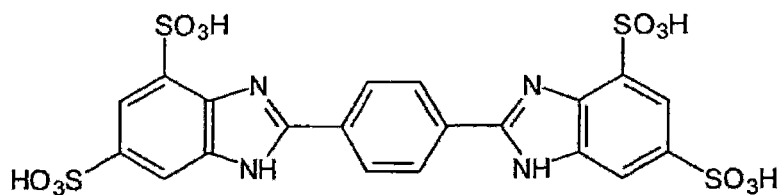
El pigmento orgánico ventajoso en el sentido de la presente invención es el 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol) [INCI: bisoctiltriazol], que se caracteriza por la siguiente fórmula química



y se suministra con el nombre comercial Tinosorb® M por la empresa CIBA-Chemikalien GmbH.

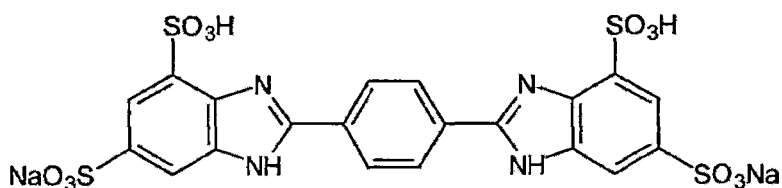
Las sustancias filtro UV-A ventajosas en el sentido de la presente invención son los derivados de dibenzoilmetano, en especial el 4-(tert-butil)-4'-metoxidibenzoilmetano (CAS n° 70356-09-1), que la empresa Givaudan suministra con el nombre comercial de Parsol® 1789 y Merck con el nombre comercial de Eusolex® 9020.

Otras sustancias filtro UV-A ventajosas son el ácido fenileno-1,4-bis(2-benzimidazol)-3,3',5,5'-tetrasulfónico:



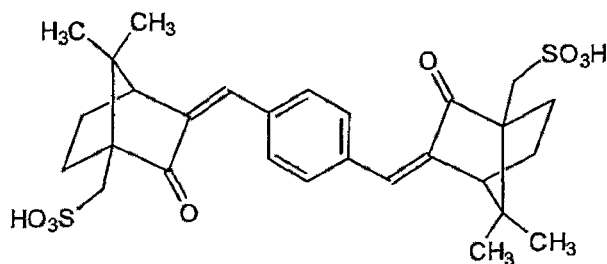
ES 2 334 130 T3

y sus sales, en especial sus sales sódica, potásica o de trietanolamonio, en especial la sal disódica del ácido fenileno-1,4-bis(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfónico

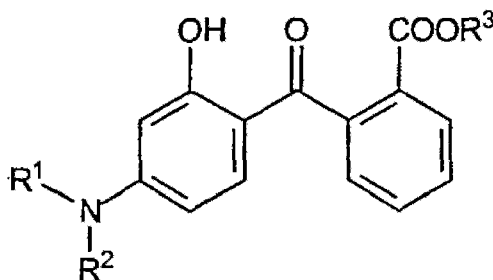


cuya denominación INCI es bisimidazilato y, por ejemplo, la empresa Haarmann & Reimer suministra con el nombre comercial de Neo Heliopan AP.

Son también ventajosos el 1,4-di-(2-oxo-10-sulfo-3-bornilidenometil)-benceno y sus sales (en especial los correspondientes compuestos 10-sulfato, en especial las correspondientes sales sódica, potásica o de trietanol-amonio), que también se denomina ácido benceno-1,4-(2-oxo-3-bornilidenometil-10-sulfónico) y se caracteriza por tener la estructura siguiente:



Otras sustancias filtros UV-A ventajosas son las hidroxibenzofenonas, que se caracterizan por la siguiente fórmula estructural:

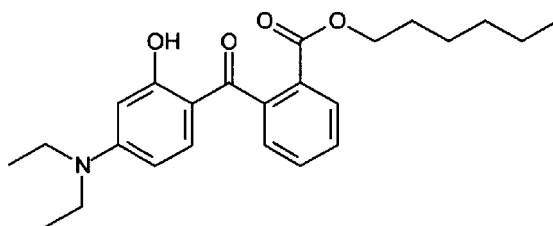


en la que

- R^1 y R^2 con independencia entre si son hidrogeno, alquilo C_1-C_{20} o cicloalquilo C_3-C_{10} , y los sustituyentes R^1 y R^2 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 5 ó 6 eslabones, y

- R^3 significa un resto alquilo C_1-C_{20} .

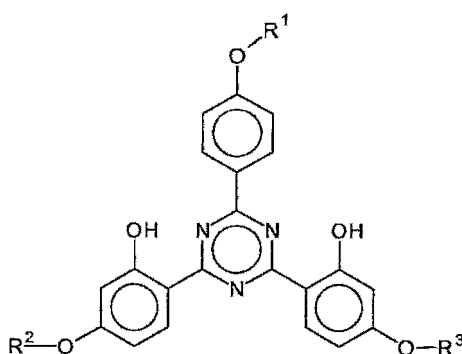
Una hidroxibenzofenona especialmente ventajosa en el sentido de la presente invención es el 2-(4'-dietilamino-2'-hidroxibenzoil)-benzoato de hexilo (también llamado: aminobenzofenona), que se caracteriza por la siguiente estructura:



y la empresa BASF suministra con el nombre comercial de Uvinul A Plus.

Las sustancias filtro UV ventajosas en el sentido de la presente invención son también los llamados filtros de banda ancha, es decir, sustancias filtro que absorben tanto la radiación UV-A como la UV-B.

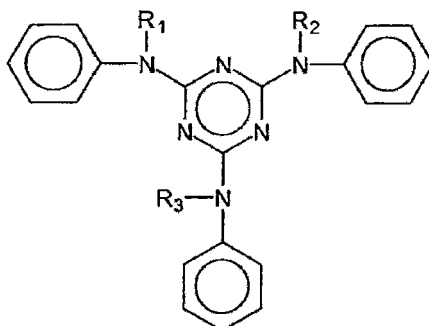
Las sustancias filtro de banda ancha ventajosas son por ejemplo los derivados de bis-resorciniltriazina que tienen la estructura siguiente:



en la que R^1 , R^2 y R^3 , con independencia entre sí, se eligen entre el grupo de los grupos alquilo ramificados y no ramificados, de 1 a 10 átomos de carbono, o bien significan un átomo de hidrógeno individual. Es especialmente preferida la 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxil]-fenil]-6-(metoxifenil)-1,3,5-triazina (nombre INCI: aniso-triazina), que la empresa CIBA-Chemikalien GmbH suministra con el nombre comercial de Tinosorb® S.

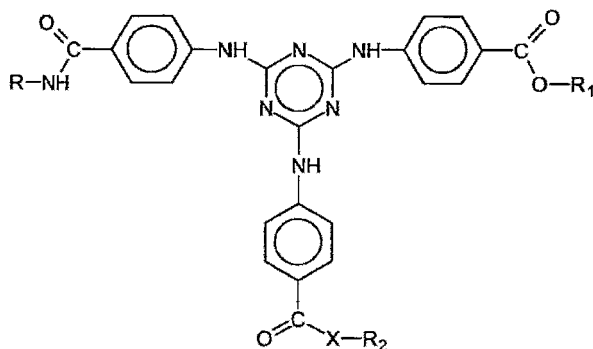
Las formulaciones especialmente ventajosas en el sentido de la presente invención, que se caracterizan por una protección UV-A alta o muy alta, contienen con preferencia varios filtros UV-A y/o de banda ancha, en especial derivados del dibenzoilmetano [por ejemplo el 4-(tert-butil)-4'-metoxi-dibenzoilmetano], derivados de benzotriazol [por ejemplo el 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol)], el ácido fenileno-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfónico y/o sus sales, el 1,4-di(2-oxo-10-sulfo-3-bornilidenometil)-benceno y/o sus sales y/o la 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxil]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, en cada caso a título individual o en forma de mezclas entre sí.

También otras sustancias filtro UV descritas, que tienen el motivo estructural



ES 2 334 130 T3

son sustancias filtro UV ventajosas en el sentido de la presente invención, por ejemplo los derivados de s-triazina descritos en el documento de publicación de patente europea EP-570 838 A1, cuya estructura química se ajusta a la fórmula genérica

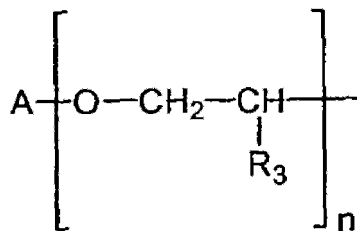


en la que

R significa un resto alquilo C_1-C_{18} ramificado o sin ramificar, un resto cicloalquilo C_5-C_{12} , eventualmente sustituido por uno o varios grupos alquilo C_1-C_4 ,

X significa un átomo de oxígeno o un grupo NH,

R_1 significa un resto alquilo C_1-C_{18} ramificado o sin ramificar, un resto cicloalquilo C_5-C_{12} , eventualmente sustituido por uno o varios grupos alquilo C_1-C_4 , o un átomo de hidrógeno, un átomo de metal alcalino, un grupo amonio o un grupo de la fórmula



en la que

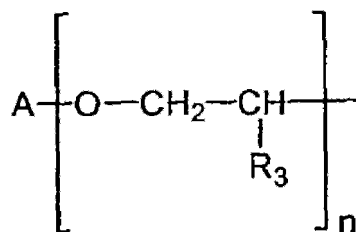
A significa un resto alquilo C_1-C_{18} ramificado o sin ramificar, un resto cicloalquilo C_5-C_{12} o un resto arilo eventualmente sustituidos por uno o varios grupos alquilo C_1-C_4 ,

R_3 es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo,

n es un número de 1 a 10,

R_2 significa un resto alquilo C_1-C_{18} ramificado o sin ramificar, un resto cicloalquilo C_5-C_{12} , eventualmente sustituido por uno o varios grupos alquilo C_1-C_4 , cuando X es un grupo NH, y

un resto alquilo C_1-C_{18} ramificado o sin ramificar, un resto cicloalquilo C_5-C_{12} , eventualmente sustituido por uno o varios grupos alquilo C_1-C_4 , o bien un átomo de hidrógeno, un átomo de metal alcalino, un grupo amonio o un grupo de la fórmula



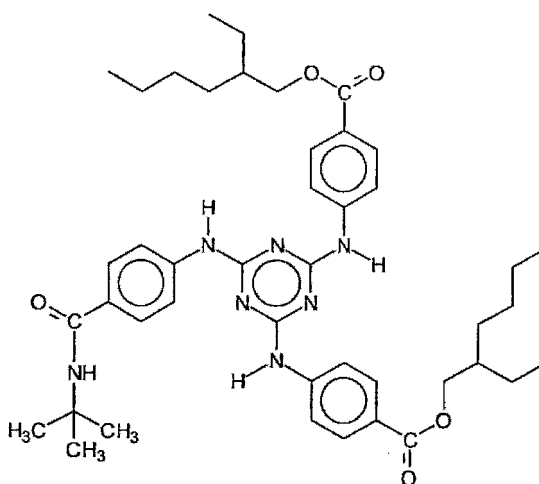
en la que

A significa un resto alquilo C₁-C₁₈ ramificado o sin ramificar, un resto cicloalquilo C₅-C₁₂ o un resto arilo eventualmente sustituidos por uno o varios grupos alquilo C₁-C₄,

R₃ es un átomo de hidrógeno o un grupo metilo,

n es un número de 1 a 10, cuando X es un átomo de oxígeno.

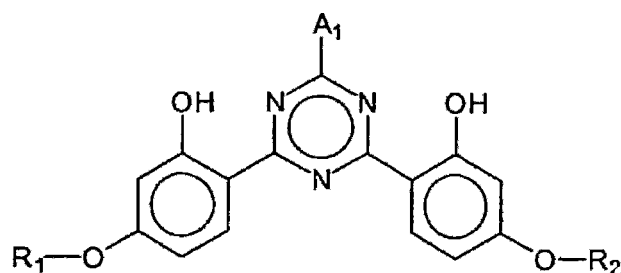
Es también una sustancia filtro UV especialmente preferida en el sentido de la invención una s-triazina sustituida asimétrica, cuya estructura se caracteriza por la fórmula



que a continuación se denominará también dioctilbutilamidotriazona (nombre INCI: dioctilbutamidotriazona) y la empresa Sigma 3V suministra con el nombre comercial de UVASORB HEB.

Son especialmente ventajosos el 4,4',4'-(1,3,5-triazina-2,4,6-triiltriimino)-tris-benzoato de tris(2-etilhexilo), sinónimo: 2,4,6-tris-[anilino-p-carbo-2-etil-2-hexiloxi)-1,3,5-triazina (nombre INCI: octil-triazona), que la empresa BASF Aktiengesellschaft suministra con el nombre comercial de UVINUL® T 150.

En el documento de publicación de patente europea 775 698 se describen derivados de bis-resorciniltriiazina de uso preferido, cuya estructura química se ajusta a la fórmula genérica

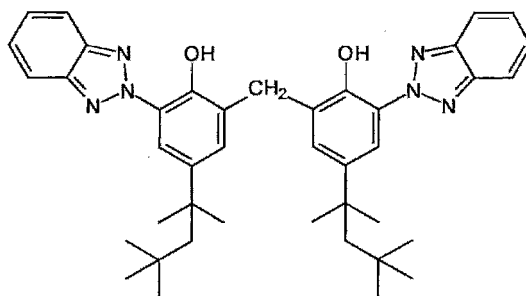


en la que R₁, R₂ y A₁ representan a los restos orgánicos más diversos.

ES 2 334 130 T3

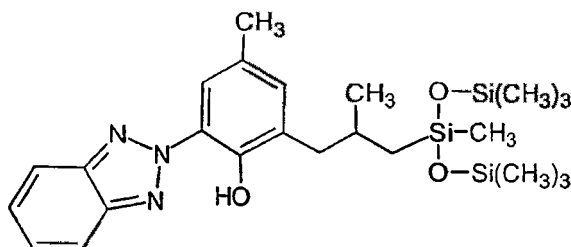
Son también ventajosas en el sentido de la invención la sal sódica de la 2,4-bis-{{[4-(3-sulfonato)-2-hidroxi-propilo-
loxi]-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-{{[4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxi-propiloxi)-2-hidro-
xi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-{{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-[4-(2-metoxietil-carbo-
xil)-fenilamino]-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-{{[4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxi-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-[4-(2-etil-car-
boxil)-fenilamino]-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-{{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(1-metil-pirrol-2-il)-1,3,5-triazi-
na, la 2,4-bis-{{[4-tris(trimetilsiloxi-sililpropiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-{{[4-
(2"-metilpropeniloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina y la 2,4-bis-{{[4-(1',1',1',3',5',5',5'-heptame-
tilsiloxi-2"-metilpropiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina.

Otro filtro UV ventajoso en el sentido de la presente invención es el 2,2'-metilen-bis(6-(2H-benzotriazol-2-il)-
4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol), que se caracteriza por la siguiente fórmula estructural química:



y la empresa CIBA-Chemikalien GmbH suministra con el nombre comercial de Tinosorb® M.

Es también ventajoso en el sentido de la presente invención el 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-[2-metil-3-
[1,3,3,3-tetrametil-1-[(trimetilsilil)oxi]disiloxanil]propil]-fenol (CAS nº 155633-54-8), cuya denominación INCI es
drometizol-trisiloxano, que se caracteriza por la fórmula estructural química:



Las sustancias filtro UV-B y/o de filtro de banda ancha pueden ser solubles en aceite o solubles en agua. Las
sustancias filtro UV-B y/o filtro de banda ancha solubles en aceite, ventajosas, son p.ej.

- los derivados de 3-bencilidenoalcanfor, con preferencia el 3-(4-metilbencilideno)alcanfor, el 3-bencilideno-
alcanfor;
- los derivados del ácido 4-aminobenzoico, con preferencia el 4-(dimetilamino)benzoato de 2-etilhexilo y el
4-(dimetilamino)-benzoato de amilo;
- la 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etil-1'-hexiloxi)-1,3,5-triazina;
- los ésteres del ácido benzalmalónico, sobre todo el 4-metoxibenzalmalonato de di(2-etilhexilo);
- los ésteres del ácido cinámico, con preferencia el 4-metoxicinamato de 2-etilhexilo, el 4-metoxicinamato
de isopentilo;
- los derivados de la benzofenona, con preferencia la 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, la 2-hidroxi-4-metoxi-
4'-metilbenzofenona, la 2,2'-dihidroxi-4-metoxibenzofenona,
- también los filtros UV fijados sobre polímeros.

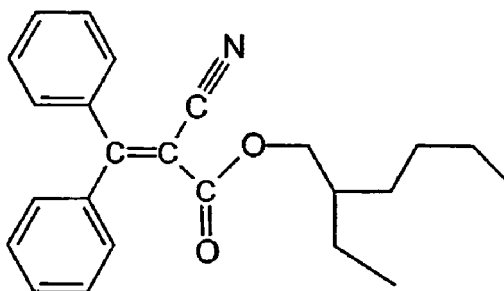
ES 2 334 130 T3

Las sustancias filtro UV-B y/o filtro de banda ancha solubles en agua ventajosas son, por ejemplo:

- las sales del ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico, por ejemplo la sal sódica, potásica o de trietanolamio, así como el ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico propiamente dicho;
- los derivados ácido sulfónico del 3-bencilidenoalcanfor, p.ej. el ácido 4-(2-oxo-3-bornilidenometil)bencenosulfónico, el ácido 2-metil-5-(2-oxo-3-bornilidenometil)sulfónico y sus sales.

Las sustancias filtro UV líquidas a temperatura ambiente, especialmente ventajosas en el sentido de la presente invención son el salicilato de homomentilo (nombre INCI: homosalato), el 2-hidroxibenzoato de 2-etilhexilo (salicilato de 2-etilhexilo, salicilato de octilo, nombre INCI: salicilato de octilo), el salicilato de 4-isopropilbencilo y los ésteres del ácido cinámico, con preferencia el 4-metoxycinamato de 2-etilhexilo (4-metoxycinamato de 2-etilhexilo, nombre INCI: metoxycinamato de octilo) y 4-metoxycinamato de isopentilo (4-metoxycinamato de isopentilo, nombre INCI: p-metoxycinamato de isoamilo), el copolímero de 3-(4-(2,2-bis-etoxycarbonilvinil)-fenoxi)propenil)-metoxisiloxano/dimetilsiloxano (nombre INCI: benzalmalonato de dimeticodietilo), que por ejemplo la empresa Hoffmann-La Roche suministra con el nombre comercial de Parsol® SLX.

Otra sustancia filtro de protección solar que puede emplearse con ventaja según la invención es el 2-ciano-3,3-difenilacrilato de etilhexilo (octocrileno), que suministra la empresa BASF con el nombre comercial de Uvinul® N 539 y se caracteriza por la estructura siguiente:



Puede ser también de una ventaja muy considerable en las formulaciones de la presente invención el uso de sustancias filtro UV poliméricas o fijadas sobre polímeros, en especial las descritas en el documento WO-A-92/20 690.

La lista de los filtros UV mencionados, que pueden emplearse en el sentido de la presente invención, no debe tomarse obviamente como limitante.

Aquí son posibles cantidades elevadas tanto de filtros UV-A como de filtros UV-B en la formulación de la invención. Cabe mencionar en especial los filtros UV: el metoxycinamato de etilhexilo (Parsol MCX), el ácido fenilbencimidazol-sulfónico (Eusolex 232), la etilhexil-triazona (Uvinul T150), la bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina así como el butil-metoxidibenzoilmetano (Parsol 1789) y el dióxido de titanio.

Las formulaciones de la invención contienen con ventaja sustancias que absorben la radiación UV en la región UV-A y/o UV-B, en una cantidad total p.ej. del 0,1% en peso al 30% en peso, con preferencia del 0,5 al 20% en peso, en especial del 1,0 al 15,0% en peso, porcentajes referidos en cada caso al peso total de las formulaciones, para proporcionar formulaciones cosméticas que protejan el cabello o la piel en la totalidad de la región de la radiación ultravioleta. Pueden actuar también como filtros de protección solar para el cabello o la piel.

Las formulaciones de la invención constituyen preparaciones satisfactorias en todos los aspectos, porque poseen muy buenas propiedades sensoriales y cosméticas, por ejemplo se reparten fácilmente sobre la piel o penetran fácilmente en ella. Se caracterizan además por una gran eficacia protectora contra la luz solar, sobre todo una gran eficacia protectora contra la radiación UV-A y por una excelente tolerancia en la piel y al mismo tiempo por excelentes datos de cuidado de la piel.

La ventaja de la presente invención consiste en que, a pesar de su alto contenido de fase aceite, superior al 30% en peso, porcentaje referido al peso total de la formulación, la formulación no precisa de otro emulsionante ni coemulsionante.

Además, y esta es otra característica de la presente invención, pueden incorporarse cantidades elevadas de filtros de protección solar, en especial de filtros UV-A y/o UV-B, en la formulación de la invención sin merma para su estabilidad ni inconvenientes para su viscosidad. Una cantidad muy elevada de filtros de protección solar significa en

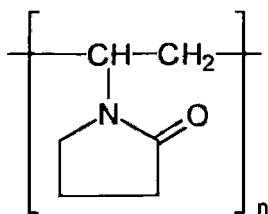
función del factor de protección correspondiente entre el 15 y el 25 por ciento en peso, porcentaje referido al peso total de la formulación.

Además puede estar presente con ventaja un contenido muy alto de lípidos, superior al 35% en peso. Por ello se ha observado que es especialmente ventajosa una formulación que contenga del 17 al 23% en peso, con preferencia un 20% en peso de filtros de protección solar, del 35 al 45% en peso, con preferencia un 40% en peso de lípidos y del 2 al 7% en peso, con preferencia un 5% en peso de emulsionante, porcentaje referido en cada caso al peso total de la formulación.

Puede ser también eventualmente ventajosa la incorporación de agentes filmógenos a las formulaciones cosméticas o dermatológicas de la invención, por ejemplo para mejorar la resistencia al agua o para aumentar la protección UV (elevación o "boosting" del nivel de protección UV-A y/o UV-B). Son apropiados los filmógenos tanto solubles en agua como los dispersables en agua, en cada caso a título individual o en combinación entre sí.

Los filmógenos solubles o dispersables en agua ventajosos son p.ej. los poliuretanos (p.ej. los tipos Avalure® de Goodrich), los dimeticona-copoliol-poliacrilatos (Silsoft Surface® del Witco Organo Silicones Group), los copolímeros de PVP/VA (VA = acetato de vinilo) (Luviscol VA 64 Powder de BASF), etc.

Los filmógenos solubles en grasa ventajoso son p.ej. el filmógeno del grupo de los polímeros basados en la polivinilpirrolidona (PVP):



Son especialmente preferidos los copolímeros de la polivinilpirrolidona, por ejemplo el copolímero PVP-hexadeceno el copolímero PVP-eicoseno, que se comercializan con los nombres de Antaron V216 y Antaron V220 por la empresa GAF Chemicals Corporation, el tricontaflo-PVP y similares.

Según la invención, estas emulsiones pueden utilizarse también en forma de formulaciones cosméticas y dermatológicas como productos limpiadores.

Las formulaciones cosméticas, que se presentan en forma de formulaciones cosméticas limpiadoras para la piel, pueden adoptar una forma líquida o sólida. Además de la combinación de ingredientes activos de la invención contienen con preferencia por lo menos una sustancia tensioactiva aniónica, no iónica o anfótera o una mezcla de sustancias de este tipo, si se desea uno o más electrolitos y auxiliares, que se emplean habitualmente para este fin. La sustancia tensioactiva puede estar presente en las formulaciones limpiadoras en una cantidad del 1 al 94% en peso, porcentaje referido al peso total de la formulación.

Otra forma ventajosa de ejecución de la presente invención consiste en productos repelentes de insectos.

Los ingredientes activos ventajosos como repelentes son amidas de bajo punto de fusión o las amidas líquidas, los alcoholes, los ésteres y los éteres que tengan puntos de fusión superiores a 150°C y que a temperatura ambiente se evaporan lentamente.

Han demostrado ser especialmente ventajosos los siguientes ingredientes activos a título individual o en combinación entre sí o con otros: el 3-(N-n-Butil-N-acetil-amino)-propionato de etilo (nombre comercial: Insekt-Repellent 3535 de la empresa Merck), la N,N-dietil-3-metilbenzamida (DEET), el ftalato de dimetilo, el etilhexanodiol, la dietilamida del ácido caprílico y las esencias vegetales naturales, por ejemplo la esencia de citronela, la esencia de eucalipto, la esencia de lavanda, la esencia de clavo.

Otra forma ventajosa de ejecución de la presente invención son los autobronceadores.

Los ingredientes activos ventajosos de los autobronceadores son los cetoles o aldoles naturales o sintéticos.

Han demostrado ser ventajosos la dihidroxiacetona (DHA), el glicerolaldehído, la eritrola, el aloxano, el hidroximetilglioxal, el γ -dialdehído, la 6-aldó-D-fructosa, la ninhidrina y el dialdehído del ácido tartárico.

Han demostrado ser especialmente ventajosas la mezclas de los ingredientes activos recién mencionados entre sí con el dialdehído mucónico y/o con naftoquinonas, p.ej. con la 5-hidroxi-1,4-naftoquinona (yuglona) y la 2-hidroxi-1,4-naftoquinona.

ES 2 334 130 T3

Otros agentes autobronceadores ventajosos son los compuestos ciclohexeno con 4 sustituyentes, en especial la base de Schiff, la retinalcanolamina, descrita en el documento DE 10212865 que de este modo se incorpora como referencia al contenido de la presente invención.

5 Ejemplos de formulación

Los siguientes ejemplos se presentan como ilustrativos de la presente invención, sin limitarla. Los valores numéricos de los ejemplos son porcentajes en peso, referidos al peso total de la formulación correspondiente.

ejemplo	1	2	3	4	5
metilparaben	0	0	0,3	0,3	0,3
propilparaben	0	0	0,15	0,15	0,15
agua	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100
sulfato magnésico	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
ácido cítrico	0,086	0,086	0	0	0
glicerina	10	5	5	15	3
acetato de tocoferilo	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
EDTA trisódico	1	1	1	1	1
metoxicinamato de etilhexilo + BHT	9	9	9	9	9
benzoato de alquilo C12-15	9,5	9,5	9,5	9,5	9,5
butil-metoxidibenzoilmetano	2	1	1	0,5	1
ácido fenilbencimidazol-sulfónico	0	0	4	4	4
citrato sódico	0,174	0,174	0	0	0
hidróxido sódico	0	0	0	0	0
alcohol desnat.	3	0	0	0	0
glicina	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
etilhexil-triazona	3	3	3	3	3
CI 77891 + trimetoxicaprililsilano	2	2	2	2	2
etilhexilglicerina	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
dipolihiidroxiestearato de PEG-30	5	5	3	6	7
bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina	2	2	2	2	2
cetil-dimeticona	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
dicaprilato/dicaprato de butilenglicol	9,5	9,5	9,5	9,5	9,5
glicéridos de coco	10	5	10	15	10
sorbato potásico	0,067	0,067	0	0	0
perfume	0,2	0,2	0,2	0,2	0,2
carbonato de dicaprililo	10	15	10	15	10

REIVINDICACIONES

1. Formulaci3n cosm3tica o dermatol3gica basada en una emulsi3n W/O de viscosidad baja que contiene m3s del 30% en peso de l3pidos, porcentaje referido al peso total de la formulaci3n, **caracterizada** porque la formulaci3n contiene solo un emulsionante, el dipolihidroxiestearato de PEG-30, y presenta una viscosidad comprendida entre 50 y 2000 mPa·s, con preferencia entre 100 y 600 mPa·s.
2. Formulaci3n seg3n la reivindicaci3n 1, **caracterizada** porque el contenido de l3pidos es superior al 35% en peso, con preferencia especial superior al 37,5% en peso y con preferencia muy especial superior al 40% en peso, porcentaje referido en cada caso al peso total de la formulaci3n, en ella los emulsionantes, filtros solares y dem3s ingredientes activos o auxiliares no forman parte de la fase l3pida de la formulaci3n.
3. Formulaci3n seg3n la reivindicaci3n 1 3 2, **caracterizada** porque los l3pidos se eligen entre el grupo formado por los l3pidos de polaridad media y los no polares, que tienen una tensi3n superficial frente al agua de 20 a 30 mN/m y de m3s de 30 mN/m, respectivamente.
4. Formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizada** porque como l3pidos se eligen el carbonato de dicaprililo, el dicaprilato/dicaprato de butilenglicol y/o los benzoatos de alquilo C12-15.
5. Formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizada** porque el contenido de l3pidos polares, que tienen una tensi3n superficial frente al agua de menos de 20 mN/m, es inferior al 25% en peso, con preferencia es inferior al 15% en peso, porcentaje referido al peso total de los l3pidos.
6. Formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizada** porque la proporci3n entre la fase aceite y la fase acuosa se sit3a en el intervalo comprendido entre 30:70 y 60:40, en especial entre 35:65 y 50:50, con preferencia especial en 40:60, en ella los emulsionantes, filtros solares y dem3s ingredientes activos o auxiliares no forman parte de la fase l3pida de la formulaci3n.
7. Formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizada** porque contiene adem3s uno o m3s filtros de protecci3n solar, en especial filtros UV-A y/o UV-B.
8. Formulaci3n seg3n la reivindicaci3n 7, **caracterizada** porque como filtros solares se eligen el metoxicinamato de etilhexilo, el 3cido fenilbencimidazol-sulf3nico, la etilhexil-triazona, la bis-etilhexiloxifenil-metoxifenil-triazina, el butilmetoxidibenzoilmetano y/o el di3xido de titanio.
9. Formulaci3n seg3n la reivindicaci3n 7 3 8, **caracterizada** porque el contenido de filtros solares se sit3a como m3ximo en el 25% en peso, con preferencia entre el 17 y el 23% en peso, porcentaje referido al peso total de la formulaci3n.
10. Formulaci3n seg3n la reivindicaci3n 7, 8 3 9, **caracterizada** porque contiene:
 - del 17 al 23% en peso, con preferencia el 20% en peso de filtros de protecci3n solar,
 - del 35 al 45% en peso, con preferencia el 40% en peso de l3pidos y
 - del 2 al 7% en peso, con preferencia el 5% en peso de emulsionante, porcentaje referido en cada caso al peso total de la formulaci3n.
11. Formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizada** porque contiene uno o m3s aditivos y/o ingredientes activos adicionales, en especial repelentes de insectos y/o autobronceadores y/o pigmentos.
12. Formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizada** porque posee una gran resistencia al agua.
13. Uso de una formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones anteriores para la pulverizaci3n sobre la piel.
14. Uso de una formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones de 1 a 12 como producto cosm3tico, en especial para el cuidado de la piel y/o para repeler insectos y/o para autobroncear la piel.
15. Uso de una formulaci3n seg3n una de las reivindicaciones de 7 a 12 para la fabricaci3n de un producto de protecci3n solar.
16. Uso de una formulaci3n seg3n una de las antes citadas reivindicaciones de 1 a 12 para la fabricaci3n de un producto de protecci3n contra el envejecimiento de la piel causado por la luz.

ES 2 334 130 T3

17. Uso de una formulación según una de las antes citadas reivindicaciones de 1 a 12 para humidificación de la piel.

5 18. Uso de una formulación según una de las antes citadas reivindicaciones de 1 a 12 en pulverizadores de bomba, en bombas pulverizadoras manuales de accionamiento con un dedo o “gatillo”, en bombas de aerosoles, en bombas dispensadoras, en frascos aplastables o en los sistemas de “bolsa en bote” (bag-in-can).

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65