



(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 290 373**

(51) Int. Cl.:

A61K 8/25 (2006.01)

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

A61K 47/04 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(86) Número de solicitud europea: **03007933 .9**

(86) Fecha de presentación : **08.04.2003**

(87) Número de publicación de la solicitud: **1371357**

(87) Fecha de publicación de la solicitud: **17.12.2003**

(54) Título: **Preparados fotoprotectores cosméticos y dermatológicos que contienen absorbentes de UV, y silicatos laminares.**

(30) Prioridad: **13.06.2002 DE 102 26 351**

(45) Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.02.2008

(45) Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.02.2008

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

(72) Inventor/es: **Lanzendörfer, Ghita;**
Schulz, Jens;
Kruse, Uta y
Knüppel, Anja

(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

Preparados fotoprotectores cosméticos y dermatológicos que contienen absorbentes de UV y silicatos laminares.

5 La presente invención se refiere a preparados fotoprotectores cosméticos y dermatológicos para la protección de la piel y del cabello contra la radiación UV, así como a su uso para dicha finalidad, sobre todo en el campo de la cosmética decorativa.

10 El efecto perjudicial de la fracción ultravioleta de la radiación solar es conocido. La radiación UV en el intervalo entre 290 nm y 320 nm, conocida como gama UV-B, puede causar un eritema, una quemadura solar leve o, como manifestaciones agudas, quemaduras 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.

15 Durante mucho tiempo se ha supuesto falsamente que la radiación UV-A -cuya longitud de onda es más larga y está comprendida entre 320 nm y 400 nm- tenía un efecto biológico inapreciable. Entretanto, no obstante, numerosos estudios han demostrado que la radiación UV-A es mucho más peligrosa que la UV-B, en cuanto a la capacidad de desencadenar reacciones fotodinámicas, sobre todo de tipo fototóxico, y alteraciones crónicas de la piel. El efecto dañino de la radiación UV-B también puede intensificarse mediante la radiación UV-A.

20 Está demostrado, entre otras cosas, que en condiciones diarias perfectamente normales, la radiación UV-A ya basta 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.

30 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.

35 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. Para estos fines ya se encuentran numerosos desarrollos de preparados cosméticos en el estado técnico. No obstante su espectro de acción aún es mejorable. En concreto, los preparados que contienen combinaciones de sustancias filtrantes de UV o de otros principios activos presentan a veces problemas técnicos de formulación en cuanto a las concentraciones que deben emplearse, lo cual dificulta el logro de una buena protección al UV.

40 La patente EP-A-1 077 058 revela preparados cosméticos o dermatológicos, formados por sistemas finamente dispersos del tipo agua-en-aceite, que contienen una combinación de al menos un silicato laminar modificado y nitrato de boro.

45 La patente EP-A-0 987 004 revela emulsiones Pickering que contienen una fase orgánica, una fase acuosa, al menos un tipo de partículas microfinas con tamaño definido y propiedades tanto hidrófilas como lipófilas, al menos un derivado de S-triazina asimétricamente sustituido y, como máximo, 0,5% en peso de emulsionante.

50 La patente DE-A-100 26 571 revela el uso de sustancias astringentes como protectores solares, sobre todo contra la radiación UV e infrarroja de la luz solar.

55 La patente FR-2 816 836 se refiere a una composición cosmética o dermatológica para el autobronceado de la piel, que contiene sustancias filtrantes de la luz UV.

La patente EP-A-1 093 796 revela emulsiones cosméticas o dermatológicas que, junto al menos una sustancia orgánica filtrante de UV, contienen polímeros unidos que son distintos C₈- hasta C₁₆-alquil-poliglucósidos.

60 Aparte de los efectos de la radiación UV anteriormente descritos, la posterior reacción cutánea disminuye la producción de grasa y reseca la piel. Para aliviar y curar estos fenómenos hay productos en el estado técnico, que se aplican tras un baño de sol y que suelen contener principios activos especiales, como por ejemplo

- agentes reengrasantes y humectantes,
- sustancias antiinflamatorias y refrescantes,
- sustancias con acción anestésica local y/o sustancias desinfectantes, para evitar posibles infecciones de la piel.

Estos preparados para después del sol están destinados a refrescar la piel tras el baño de sol y a mejorar su poder de retención de la humedad y aquí juega un papel principal el efecto de enfriamiento. Sin embargo, en el estado técnico no hay productos que protejan la piel del resecaimiento y que la cuiden suficientemente durante la irradiación UV.

Otra desventaja del estado técnico es que las formulaciones fotoprotectoras corrientes casi siempre dejan un film pegajoso sobre la piel. Como consecuencia, cuando estos productos -p.ej. en forma de protectores solares- se utilizan en la playa, queda arena pegada al cuerpo. Esta sensación es desagradable para el usuario y en el peor de los casos puede provocar que el protector solar se use muy poco o se deje de usar. Como en el mar casi siempre sopla una brisa más o menos fuerte, este inconveniente también suele producirse aunque el cuerpo no entre en contacto directo con la arena -por ejemplo tomando el sol en una tumbona- porque la que arremolina el viento se pega igualmente a las partes de la piel untadas con la crema.

El objeto de la presente invención es disponer de preparados fotoprotectores que proporcionen una gran protección contra los diversos efectos perjudiciales de las radiaciones UV-A y UV-B antes citados, en concreto de la radiación solar, y que tengan al mismo tiempo mejores propiedades sensoriales. Los preparados de la presente invención también deben poseer buenas propiedades de higiene cutánea, sobre todo efectividad contra los fenómenos de envejecimiento de la piel (p.ej. formación de arrugas, pérdida de elasticidad), y tienen que ser de uso cómodo, p.ej. repelentes de la arena.

La presente invención ofrece un preparado cosmético de acción fotoprotectora, caracterizado por contener

- (a) al menos 2 sustancias filtrantes de UV, siendo la primera sustancia filtrante de UV 2,4-bis-{{[4-(2-etilhexiloxi)-2-hidroxil]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina y la segunda sustancia filtrante de UV en el componente (a) fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato disódico,
- (b) al menos una carga, seleccionada entre los silicatos laminares no hinchables en agua.

También es objeto de la presente invención un preparado dermatológico con ingredientes como los definidos antes para el preparado cosmético.

Asimismo es objeto de la presente invención el uso de los preparados antes definidos conforme a la presente invención, para proteger la piel y el cabello contra los efectos perjudiciales de la radiación UV, sobre todo de las radiaciones UV-A y UV-B, concretamente de la radiación solar.

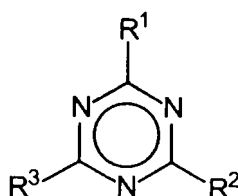
Las reivindicaciones secundarias de la patente exponen formas de ejecución preferidas de la presente invención.

Los preparados de la presente invención son muy satisfactorios en todos los aspectos y la selección de los demás ingredientes no está especialmente limitada. Por consiguiente son muy apropiados como bases de otras formas de preparados, con múltiples aplicaciones. De manera sorprendente los preparados de la presente invención muestran unas propiedades sensoriales y cosméticas sinérgicamente mejoradas. Por ejemplo, se reparten uniformemente sobre la piel, penetrando en ella, y, al mismo tiempo, su eficacia fotoprotectora y sus datos de higiene cutánea son excelentes.

El factor de protección a la luz (FPL o SPF) constituye por ejemplo una medida de la protección al UV en el sentido de la presente invención.

Los preparados cosméticos y dermatológicos conforme a la presente invención no dejan ninguna sensación grasisa o pegajosa sobre la piel, su compatibilidad cutánea es excelente y además tienen la sorprendente característica de repeler la arena.

Las sustancias filtrantes de UV basadas en derivados de triazina que presentan la estructura

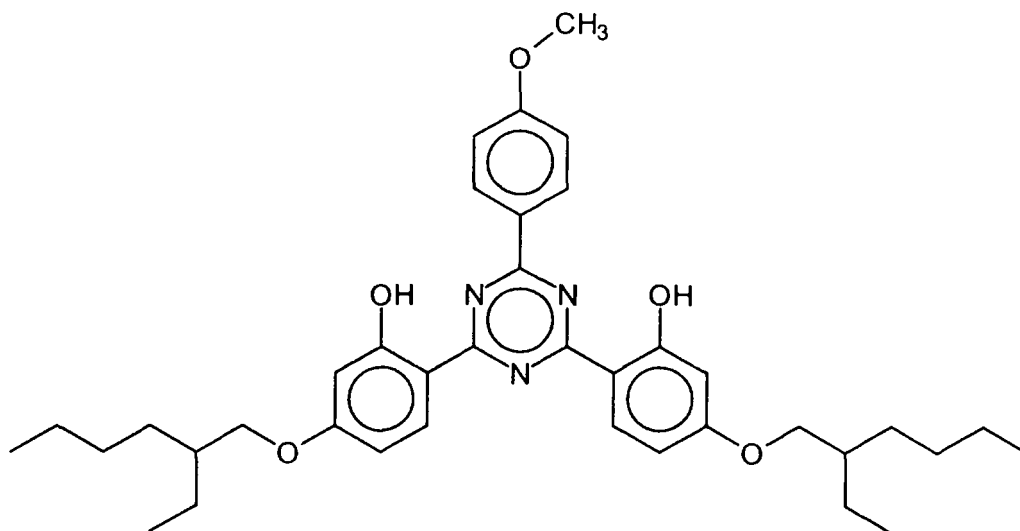


ya son conocidas y se describen por ejemplo en las patentes EP-A-775 698, EP-A-0 878 469 y EP-A-1 027 881.

Respecto al eje C₃ del anillo de triazina de estos compuestos cabe pensar tanto en sustituciones simétricas como asimétricas. En tal sentido los derivados de s-triazina sustituidos simétricamente presentan tres sustituyentes iguales R¹, R² y R³, mientras que, por consiguiente, los derivados de s-triazina sustituidos asimétricamente presentan sustituyentes distintos, rompiendo la simetría C₃. En el sentido de la presente invención, "asimétricamente" se refiere siempre

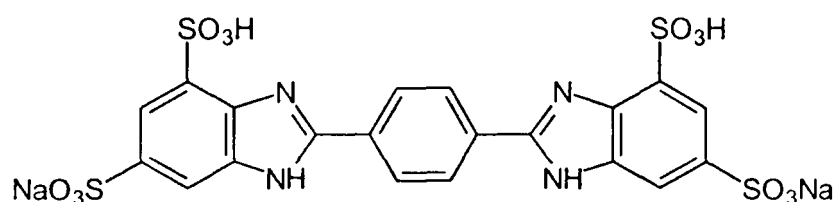
a la asimetría respecto al eje C₃ del anillo de triazina, a no ser que se haya mencionado expresamente otra cosa. A continuación los derivados de s-triazina sustituidos asimétricamente según la presente invención también se designan sencillamente como derivados de triazina.

Según la presente invención, el componente (a) contiene 2,4-bis-{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (INCI: Aniso triazine), que vende CIBA-Chemikalien GmbH con la marca comercial Tinosorb® S y que se caracteriza por la siguiente estructura



El derivado de s-triazina sustituido asimétricamente de la presente invención se incorpora ventajosamente en la fase orgánica de las formulaciones cosméticas o dermatológicas.

Otra sustancia filtrante de UV-A conforme al componente (a) de los preparados de la presente invención es el fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato disódico



con la denominación INCI Bisimidazylate, que vende por ejemplo Haarmann & Reimer con la marca comercial Neo Heliopan AP.

Por lo tanto, según la presente invención, en el componente (a) se usan conjuntamente, al menos, las dos sustancias filtrantes siguientes:

2,4-bis-{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina con fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato disódico.

Otra forma de ejecución de la presente invención lleva 2,4-bis-{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (Tinosorb® S) con fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato disódico (Neo Heliopan AP) y 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol) (Tinosorb® M), como sustancias filtrantes de UV en el componente (a).

La cantidad global de las sustancias filtrantes de UV arriba citadas en el componente (a) es ventajosamente de 0,1% en peso hasta 20% en peso, preferiblemente de 0,5 hasta 15% en peso, sobre todo de 1 hasta 10% en peso, respecto al peso total de los preparados.

ES 2 290 373 T3

Los preparados cosméticos y dermatológicos de la presente invención contienen como segundo componente (b) de la combinación sinérgica, al menos, una carga escogida entre los silicatos laminares no hinchables en agua. Las cargas son de materiales particulados que no tiñen ni el producto (o sea el propio preparado cosmético y dermatológico) ni la piel.

Dichos silicatos estratificados (filosilicatos, silicatos laminares) son (idealmente) estructuras silíceas formadas por capas bidimensionales continuas de tetraedros de $[\text{SiO}_4]^{4-}$, donde cada tetraedro está unido a tetraedros vecinos mediante 3 puentes de oxígeno.

Las fórmulas químicas de los silicatos laminares solo se pueden establecer aproximadamente, porque poseen una gran capacidad de intercambio iónico y el silicio se puede canjear por aluminio y éste a su vez por magnesio, Fe^{2+} , Fe^{3+} , Zn y análogos. La probable carga negativa resultante en las capas suele compensarse con cationes, sobre todo con Na^+ y Ca^{2+} , en posiciones intermedias.

Silicatos laminares ventajosos según la presente invención son concretamente:

⇒ Talco: $\text{Mg}_3[\text{Si}_4\text{O}_{10}](\text{OH})_2$,

⇒ Caolín: $\text{Al}_2[\text{Si}_2\text{O}_5](\text{OH})_4$,

⇒ Mica, un aluminosilicato fácilmente exfoliable de estructura cristalina tabular. La mica es desde transparente hasta translúcida y tiene brillo nacarado. La forma más importante es la moscovita: $\text{K Al}_2[\text{AlSi}_3\text{O}_{10}](\text{OH}, \text{F})_2$. La sericita es una forma especial de mica que tiene unas plaquitas más pequeñas que la moscovita.

Las cargas según la presente invención pueden emplearse tanto individualmente como mezcladas. También es ventajosa la combinación de los silicatos laminares no hinchables en agua con dióxidos de silicio esféricos o colorantes orgánicos.

La cantidad total de las cargas es, ventajosamente, de 0,1% en peso hasta 30% en peso, preferiblemente de 0,5 hasta 15% en peso, sobre todo de 1,0 hasta 10% en peso, respecto al peso total de los preparados.

Seguidamente se citan otras cargas que pueden emplearse junto con las del componente (b) en los preparados de la presente invención:

Aerosiles como los productos que pueden adquirirse bajo las siguientes marcas comerciales Aerosil 130 (Degussa Hüls), Aerosil 200 (Degussa Hüls), Aerosil 255 (Degussa Hüls), Aerosil 300 (Degussa Hüls), Aerosil 380 (Degussa Hüls), B-6C (Suzuki Yushi), CAB-O-SIL Fumed Silica (Cabot), CAB-O-SIL EH-5 (Cabot), CAB-O-SIL HS-5 (Cabot), CAB-O-SIL LM-130 (Cabot), CAB-O-SIL MS-55 (Cabot), CAB-O-SIL M-5 (Cabot), E-6C (Suzuki Yushi), Fossil Flour MBK (MBK), MSS-500 (Kobo), Neosil CT 11 (Crosfield Co.), Ronasphere (Rona/EM Industries), Silica, Anhydrous 31 (Whittaker, Clark & Daniels), Silica, Crystalline 216 (Whittaker, Clark & Daniels), Silotrat-1 (Vevey), Sorbosil AC 33 (Crosfield Co.), Sorbosil AC 35 (Crosfield Co.), Sorbosil AC 37 (Crosfield Co.), Sorbosil AC 39 (Crosfield Co.), Sorbosil AC 77 (Crosfield Co.), Sorbosil TC 15 (Crosfield Co.), Spherica (Ikeda), Spherglass (Potters-Ballotini), Spheron L-1500 (Presperse), Spheron N-2000 (Presperse), Spheron P-1500 (Presperse), Wacker HDK H 30 (Wacker-Chemie), Wacker HDK N 20 (Wacker-Chemie), Wacker HDK P 100 H (Wacker Silicones), Wacker HDK N 20P (Wacker-Chemie), Wacker HDK N 25P (Wacker-Chemie), Wacker HDK S 13 (Wacker-Chemie), Wacker HDK T 30 (Wacker-Chemie), Wacker HDK V 15 (Wacker-Chemie), Wacker HDK V 15 P (Wacker-Chemie), Zelec Sil (DuPont).

También son ventajosos los nitruros de boro, sobre todo los siguientes productos comerciales:

<i>Marca comercial</i>	<i>Suministrador:</i>
Boron Nitride Powder	Advanced Ceramics
Boron Nitride Powder	Sintec Keramik
Ceram Blanche	Kawasaki
HCST Boron Nitride	Stark
Très BN®	Carborundum
Wacker-Bornitrid BNP	Wacker-Chemie

Otras cargas que pueden incorporarse en los preparados de la presente invención son los carbonatos, como p.ej. el carbonato magnésico (MgCO_3) y el carbonato cálcico (CaCO_3). Según la presente invención los carbonatos se usan especialmente como cargas para los productos secos en polvo.

ES 2 290 373 T3

También pueden emplearse adicionalmente polímeros orgánicos naturales como el polvo de seda, la celulosa microcristalina y/o el estearato de cinc.

Asimismo son cargas orgánicas ventajosas el almidón y sus derivados, como:

- ⇒ Almidón de maíz Zea Mays (Amidon De Mais MST (Wackherr), Argo Brand Corn Starch (Corn Products), Pure-Dent (Grain Processing), Purity 21C (National Starch)),
- ⇒ Almidón de arroz (D.S.A. 7 (Agrana Stärke), Oryzapearl (Ichimaru Pharcos)),
- ⇒ Fosfato de dialmidón (Corn PO4 (Agrana Stärke), Corn PO4 (Tri-K)),
- ⇒ Almidón de maíz octenilsuccinato sódico (C* EmCap - Instant 12639 (Cerestar USA)),
- ⇒ Almidón octenilsuccinato de aluminio (Covafluid AMD (Wackherr), Dry Flo-PC (National Starch), Dry Flo Pure (National Starch), Fluidamid DF 12 (Roquette)).

Las cantidades totales de dichas cargas complementarias pueden ser las mismas anteriormente indicadas para las cargas del componente (b) según la presente invención.

A continuación se enumeran otras sustancias filtrantes de UV corrientes, que pueden emplearse junto a las del componente (a) en los preparados de la presente invención:

Como filtros de UV-B liposolubles son ventajosos p.ej.:

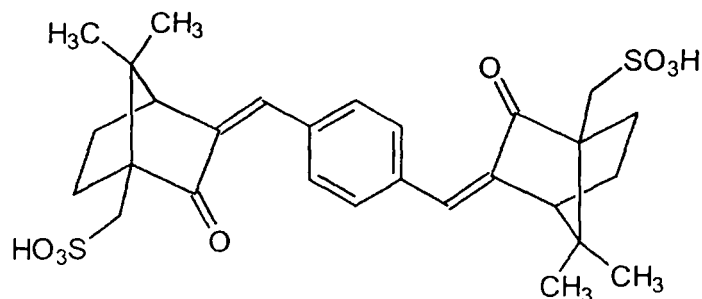
- derivados del 3-bencilidenalcanfor, preferiblemente 3-(4-metilbenciliden)alcanfor [INCI: 4-Methylbenzylidene Camphor], que vende la Merck bajo la marca comercial Eusolex 6300, y/o 3-bencilidenalcanfor;
- derivados del ácido 4-aminobenzoico, preferiblemente 4-(dimetilamino)-benzoato de 2-etilhexilo, 4-(dimetilamino)-benzoato de amilo;
- ésteres del ácido cinámico, preferiblemente 4-metoxicinamato de 2-etilhexilo, 4-metoxicinamato de isopentilo;
- ésteres del ácido salicílico, preferiblemente salicilato de 2-etilhexilo, salicilato de 4-isopropilbencilo, salicilato de homomentilo;
- derivados de la benzofenona, preferiblemente 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, 2-hidroxi-4-metoxi-4'-metilbenzofenona, 2,2'-dihidroxi-4-metoxibenzofenona;
- ésteres del ácido benzalmalónico, preferiblemente 4-metoxibenzalmalonato de di(2-etilhexilo);
- derivados de triazina simétricos respecto al eje C₃ del anillo 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 firma BASF AG con la denominación comercial UVINUL® T 150;
- derivados de benzotriazol, preferiblemente 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametil-butyl)-fenol);
- así como filtros UV unidos a polímeros.

Como sustancias filtrantes del UV-B hidrosolubles son ventajosas p.ej.:

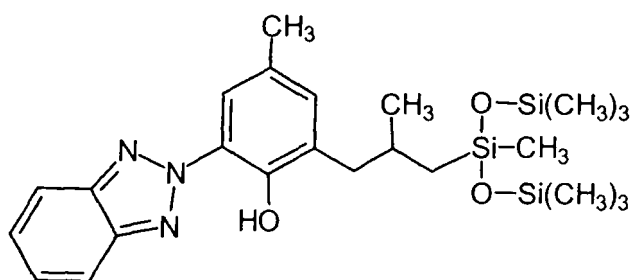
- sales del ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfónico, como las de sodio, potasio o trietanolamonio, y el propio ácido sulfónico;
- derivados de ácido sulfónico del 3-bencilidenalcanfor, como p.ej. ácido 4-(2-oxo-3-bornilidenmetil)benzenosulfónico, ácido 2-metil-5-(2-oxo-3-bornilidenmetil)sulfónico y sus sales.

En los preparados de la presente invención también se pueden usar filtros de UV-A corrientes, como por ejemplo los derivados del dibenzoflmetano, en concreto 1-(4'-terc.-butil-fenil)-3-(4'-metoxifenil)propano-1,3-diona y 1-fenil-3-(4'-isopropilfenil)propano-1,3-diona. Como sustancia filtrante de UV-A también es útil el 4-(terc.-butil)-4'-metoxidibenzoflmetano (n° CAS 70356-09-1), que vende Givaudan con la marca Parsol® 1789 y Merck con la marca comercial Eusolex® 9020.

Asimismo es útil el 1,4-di(2-oxo-10-sulfo-3-bornilidenmetil)-benceno, y sus sales (en especial los correspondientes compuestos 10-sulfato y, sobre todo, las respectivas sales de sodio, potasio o trietanolamonio), también llamado benceno-1,4-di(2-oxo-3-bornilidenmetil-10-ácido sulfónico), el cual se caracteriza por la siguiente estructura:

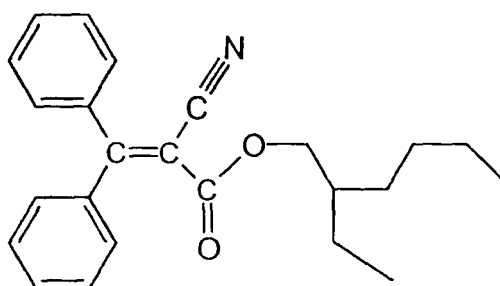


Sustancias filtrantes ventajosas que absorben tanto la radiación UV-A como la UV-B, conocidos como filtros de banda ancha, son p.ej. 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol) o bien 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-[2-metil-3-[1,3,3,3-tetrametil-1-[(trimetil-silil)oxi]disiloxanil]propil]-fenol (n° CAS 155633-54-8), con la denominación INCI Drometizole Trisiloxane, que se caracteriza por la fórmula estructural química



Como sustancias filtrantes de UV también son adecuados ciertos derivados del ácido salicílico, como el salicilato de 4-isopropilbencilo, salicilato de 2-etilhexilo (= salicilato de octilo), salicilato de homomentilo.

Otra sustancia filtrante fotoprotectora que puede usarse ventajosamente en la presente invención es el etilhexil-2-ciano-3,3-difenilacrilato (octocrileno), que vende BASF con la marca Uvinul® N 539 y que se caracteriza por la siguiente estructura:

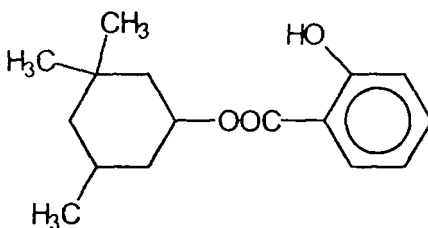


Además los preparados de la presente invención -cuando están formulados como productos cosméticos o dermatológicos exentos de aceite que contienen una fase acuosa y al menos una sustancia filtrante de UV líquida a temperatura ambiente como fase adicional- pueden llevar las sustancias filtrantes de UV líquidas a temperatura ambiente citadas a continuación.

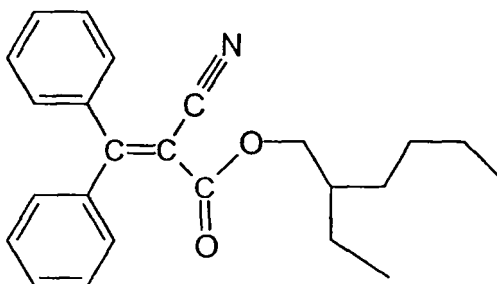
Como sustancias filtrantes de UV líquidas a temperatura ambiente son útiles el salicilato de homomentilo, el 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenilacrilato, el 2-hidroxibenzoato de 2-etilhexilo y los ésteres del ácido cinámico, preferiblemente el 4-metoxicinamato de 2-etilhexilo y el 4-metoxicinamato de isopentilo.

ES 2 290 373 T3

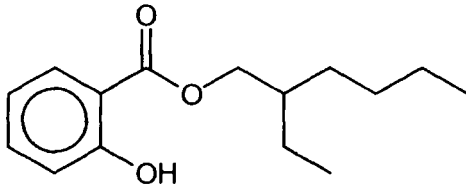
El salicilato de homomentilo (INCI: Homosalate) se distingue por la siguiente estructura:



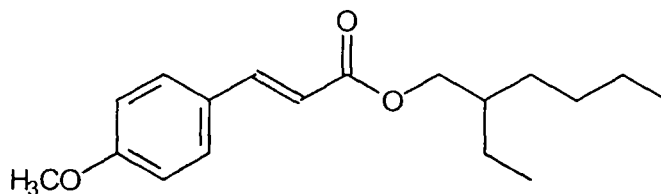
El 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenilacrilato (INCI: Octocrylene) lo vende BASF con la marca Uvinul® N 539 y se caracteriza por la siguiente estructura:



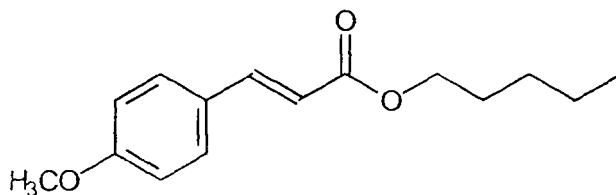
El 2-hidroxibenzoato de 2-etilhexilo (salicilato de 2-etilhexilo, salicilato de octilo, INCI: Octyl Salicylate) lo vende, por ejemplo, Haarmann & Reimer con la marca comercial Neo Heliopan OS y se caracteriza por la siguiente estructura:



El 4-metoxycinamato de 2-etilhexilo (2-etilhexilo-4-metoxycinamato, INCI: Octyl Methoxycinnamate) lo vende, por ejemplo, Hoffmann-La Roche con la marca comercial Parsol MCX y se caracteriza por la siguiente estructura:



El 4-metoxycinamato de isopentilo (isopentyl-4-metoxycinamato, INCI: Isoamyl p-Methoxycinnamate) lo vende Haarmann & Reimer con la marca Neo Heliopan E 1000, por ejemplo, y se caracteriza por la siguiente estructura:



En los preparados cosméticos o dermatológicos finales, la cantidad total de una o más sustancias filtrantes de UV, líquidas a temperatura ambiente, está comprendida ventajosamente en el intervalo de 0,1% en peso hasta 30% en peso, con preferencia de 0,5 hasta 20% en peso, respecto al peso total de los preparados.

- 5 Naturalmente, la lista de dichas sustancias filtrantes de UV convencionales que pueden emplearse conforme a la presente invención no debe ser limitativa.

Ventajosamente, los preparados de la presente invención contienen las sustancias que absorben la radiación del intervalo UV-A y/o UV-B en una cantidad total de p.ej. el 0,1% en peso hasta el 30% en peso, con preferencia de 0,5 hasta 20% en peso, sobre todo 1,0 hasta 15,0% en peso, respecto al peso total de los preparados.

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

Como conservantes son ventajosos, por ejemplo, los compuestos que desprenden formaldehído (como p.ej. DMDM, hidantoína), los yodopropilbutilcarbamatos (p.ej. los que vende la firma Lonza con las marcas comerciales Konkyl-L, Konkyl-S y Konkaben LMB), los Parabenos, el fenoxietanol, el etanol, el ácido benzoico y otros parecidos. Además el sistema conservante según la presente invención suele comprender ventajosamente coadyuvantes de conservación, como por ejemplo octoxiglicerina, glicina soja, etc.

Además se obtienen preparados especialmente ventajosos cuando se utilizan antioxidantes como aditivos o principios activos. Según la presente invención los preparados contienen ventajosamente uno o varios antioxidantes. Como antioxidantes favorables, aunque de uso facultativo, pueden emplearse todos aquellos que son usuales o apropiados para las aplicaciones cosméticas y/o dermatológicas.

Los antioxidantes se escogen ventajosamente del grupo formado por aminoácidos (p.ej. glicina, histidina, tirosina, triptófano) y sus derivados, imidazoles (p.ej. ácido urocanínico) 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 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, IDS (ácido iminodisuccínico) y sus derivados, ácidos grasos insaturados y sus derivados (p.ej. ácido γ -linolénico, 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 (palmitato de vitamina A) así como benzoato de coniferilo del benjuí, ácido rutínico y sus derivados, ácido ferúlico y sus derivados, 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 conforme a la presente invención (sales, ésteres, éteres, azúcares, nucleótidos, nucleósidos, péptidos y lípidos) de dichos principios activos.

Una propiedad sorprendente de los preparados de la presente invención es que constituyen un vehículo excelente para la penetración en la piel de principios activos cosméticos o dermatológicos, entre los cuales se prefieren los antioxidantes que son capaces de protegerla contra el ataque oxidativo. Los antioxidantes preferidos en tal caso son la vitamina E y sus derivados, así como la vitamina A y sus derivados.

La cantidad de antioxidantes (uno o varios compuestos) en los preparados es preferiblemente del 0,001 hasta el 30% en peso, con especial preferencia de 0,05 hasta 20% en peso, sobre todo de 0,1 hasta 10% en peso, referido al peso total del preparado.

Siempre que los antioxidantes sean de vitamina E y/o de sus derivados, conviene que sus concentraciones respectivas estén comprendidas en el intervalo de 0,001 hasta 10% en peso respecto al peso total del preparado.

Siempre que los antioxidantes sean de vitamina A o de sus derivados, o de caroteno o de sus derivados, conviene que sus concentraciones respectivas estén comprendidas en el intervalo de 0,001 hasta 10% en peso respecto al peso total del preparado.

ES 2 290 373 T3

Según la presente invención los principios activos (uno o más compuestos) también se pueden elegir muy ventajosamente del grupo de los principios activos lipófilos, sobre todo del siguiente grupo:

Ácido acetilsalicílico, atropina, azuleno, hidrocortisona y sus derivados, p.ej. hidrocortisona-17-valerato; vitaminas de las series B y D, muy favorablemente la vitamina B₁, la vitamina B₁₂ y la vitamina D₁; y también bisabolol, ácidos grasos insaturados, sobre todo los ácidos grasos esenciales (a menudo también llamados vitamina F), en concreto el ácido gamma-linolénico, el ácido oleico, el ácido eicosapentanoico, el ácido docosahexanoico y sus derivados; cloranfenicol, cafeína, prostaglandina, timol, alcanfor, extractos u otros productos de origen vegetal y animal, p.ej. aceite de onagra, aceite de borraja o aceite de grosella; aceites de pescado, aceite de hígado de bacalao; y también ceramidas, compuestos análogos a la ceramida, etc.

De manera especialmente ventajosa, el o los principios activos también se escogen del grupo de los inhibidores de la NO-sintasa, sobre todo cuando los preparados de la presente invención van destinados al tratamiento y profilaxis de los síntomas del envejecimiento intrínseco y/o extrínseco de la piel, así como al tratamiento y profilaxis de los trastornos causados por la radiación ultravioleta en la piel.

El inhibidor preferido de la NO-sintasa es la nitroarginina.

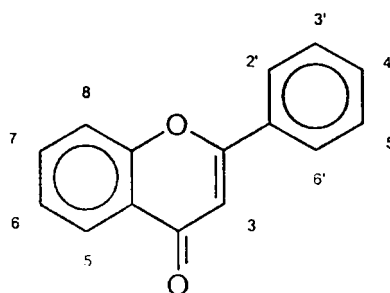
El o los principios activos también se escogen ventajosamente del grupo que comprende las catequinas y los ésteres de ácidos biliares con catequinas, y los extractos acuosos u orgánicos de plantas o de partes de las mismas que contienen catequinas o ésteres de ácidos biliares con catequinas, como por ejemplo las hojas de la familia botánica de las teáceas, sobre todo de la especie *Camellia sinensis* (té verde). Son especialmente ventajosos sus componentes típicos (como p.ej. polifenoles y catequinas, cafeína, vitaminas, azúcares, minerales, aminoácidos, lípidos).

Las catequinas forman un grupo de compuestos que deben considerarse como flavonas hidrogenadas o antocianidinas, y que son derivados de la "catequina" (catecol, 3,3',4',5,7-flavanpentaol, 2-(3,4-dihidroxifenil)-cromano-3,5,7-triol). La epicatequina ((2R,3R)-3,3',4',5,7-flavanpentaol) también es un principio activo ventajoso según la presente invención.

También son ventajosos los extractos vegetales que contienen catequinas, especialmente extractos del té verde como p.ej. los de las hojas de las plantas de la especie *Camellia spec.*, sobre todo de las variedades de té *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* y *C. irrawadiensis*, y de sus cruces con *Camellia japonica*, por ejemplo.

Asimismo son principios activos preferidos los polifenoles y catequinas del grupo (-)-catequina, (+)-catequina, galato de (-)-catequina, galato de (-)-galocatequina, (+)-epicatequina, (-)-epicatequina, galato de (-)-epicatequina, (-)-epigalocatequina, galato de (-)-epigalocatequina.

La flavona y sus derivados (a menudo también llamados colectivamente "flavonas") son igualmente principios activos ventajosos conforme a la presente invención y se caracterizan por la siguiente estructura básica (indicando las posiciones de sustitución):



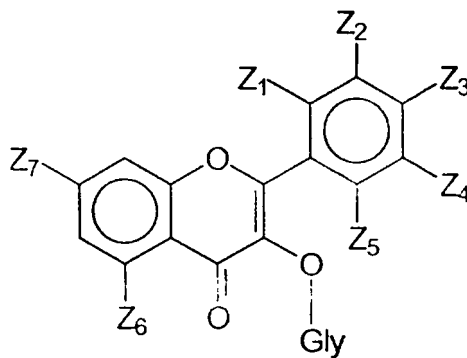
ES 2 290 373 T3

En la tabla siguiente figuran algunas de las flavonas más importantes, que también pueden emplearse preferentemente en los preparados de la presente invención:

	Posiciones de sustitución con OH							
	3	5	7	8	2'	3'	4'	5'
Flavona	-	-	-	-	-	-	-	-
Flavonol	+	-	-	-	-	-	-	-
Crisina	-	+	+	-	-	-	-	-
Galangina	+	+	+	-	-	-	-	-
Apigenina	-	+	+	-	-	-	+	-
Fisetina	+	-	+	-	-	+	+	-
Luteolina	-	+	+	-	-	+	+	-
Camferol	+	+	+	-	-	-	+	-
Quercetina	+	+	+	-	-	+	+	-
Morina	+	+	+	-	+	-	+	-
Robinetin	+	-	+	-	-	+	+	+
Gosipetina	+	+	+	+	-	+	+	-
Miricetina	+	+	+	-	-	+	+	+

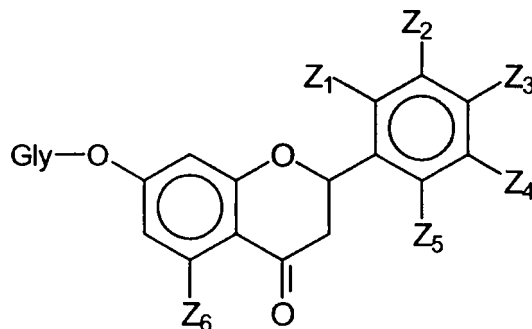
En la naturaleza, las flavonas suelen existir en forma glicosidada.

Según la presente invención los flavonoides se escogen preferentemente del grupo de sustancias de la fórmula estructural genérica



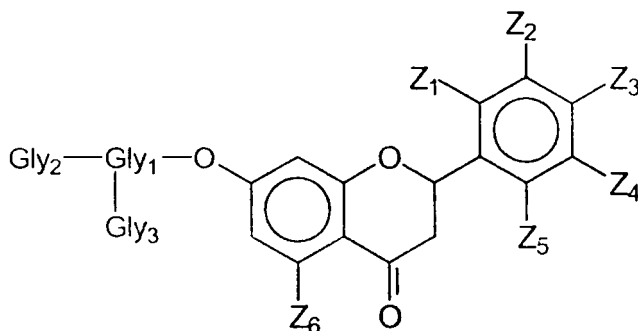
donde Z_1 hasta Z_7 , independientemente entre sí, se eligen del grupo formado por H, OH, alcoxi e hidroxialcoxi, de modo que los grupos alcoxi e hidroxialcoxi pueden ser ramificados o lineales y llevar 1 hasta 18 átomos de C, y Gly se escoge del grupo de los radicales mono- y oligoglicósidos.

Pero, conforme a la presente invención, los flavonoides también se pueden escoger ventajosamente del grupo de sustancias de la fórmula estructural genérica



en que Z_1 hasta Z_6 , independientemente entre sí, se escogen del grupo formado por H, OH, alcoxi e hidroxialcoxi, de modo que los grupos alcoxi e hidroxialcoxi pueden ser ramificados o lineales y llevar de 1 hasta 18 átomos de C, y Gly se elige del grupo de los radicales mono- y oligoglicósidos.

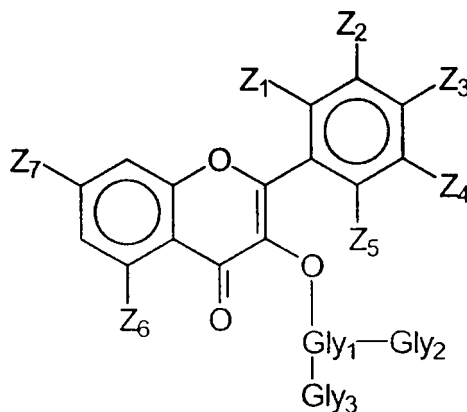
Preferentemente se pueden escoger aquellas estructuras que pertenecen al grupo de sustancias de fórmula estructural genérica



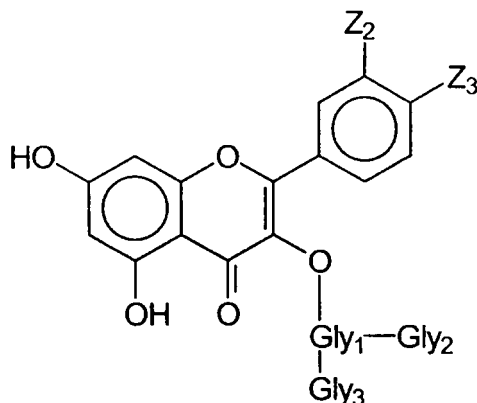
donde Gly_1 , Gly_2 y Gly_3 , independientemente entre sí, representan radicales monoglicósidos. Gly_2 y Gly_3 también pueden representar individual o conjuntamente saturaciones mediante átomos de hidrógeno.

De manera preferente Gly_1 , Gly_2 y Gly_3 se escogen, independientemente entre sí, del grupo de los sobre todo de los radicales ramnosilo y glucosilo. Pero, si es preciso, también se pueden usar ventajosamente otros radicales hexosilo, por ejemplo alosilo, altrosilo, galactosilo, gulosilo, idosilo, manosilo y talosilo. Para la presente invención también puede ser ventajoso el uso de radicales pentosilo.

De modo ventajoso Z_1 hasta Z_5 , independientemente entre sí, se escogen del grupo formado por H, OH, metoxi, etoxi y 2-hidroxietoxi, y los flavonglicósidos poseen la estructura



De manera especialmente ventajosa los flavonglicósidos de la presente invención se escogen del grupo representado por la siguiente estructura:



donde Gly₁, Gly₂ y Gly₃, independientemente entre sí, representan radicales monoglicósidos. Gly₂ y Gly₃ también pueden representar individual o conjuntamente saturaciones mediante átomos de hidrógeno.

De manera preferente Gly₁, Gly₂ y Gly₃ se escogen, independientemente entre sí, del grupo de los sobre todo de los radicales ramnosilo y glucosilo. Pero, si es preciso, también se pueden usar ventajosamente otros radicales hexosilo, por ejemplo alosilo, altrosilo, galactosilo, gulosilo, idosilo, manosilo y talosilo. Para la presente invención también puede ser ventajoso el uso de radicales pentosilo.

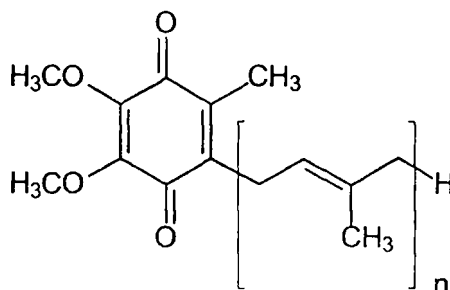
Según la presente invención, resulta especialmente ventajoso elegir el o los flavonglicósidos del grupo formado por α -glucosilrutina, α -glucosilmiricetina, α -glucosilisoquercitrina, α -glucosilisoquercetina y α -glucosilquercitrina.

Para la presente invención se prefiere especialmente la α -glucosilrutina.

También son útiles para la presente invención la naringina (aurantina, naringenin-7-ramnoglicósido), hesperidina (3',5,7-trihidroxi-4'-metoxiflavanon-7-rutinósido, hesperidósido, hesperetin-7-O-rutinósido), rutina (3,3',4',5,7-penta-hidroxiflavanon-3-rutinósido, quercetin-3-rutinósido, soforina, birután, rutabión, tauritina, fitomelina, melina), troxerrutina (3,5-dihidroxi-3',4',7-tris(2-hidroxietoxi)-flavon-3-(6-O-(6-deoxi- α -L-manopiranosil)- β -D-glucopiranosido)), monoxerrutina (3,3',4',5-tetrahidroxi-7-(2-hidroxietoxi)-flavon-3-(6-O-(6-deoxi- α -L-manopiranosil)- β -D-glucopiranosido)), dihidrorrobinetina (3,3',4',5',7-pentahidroxiflavanona), taxifolina (3,3',4',5,7-pentahidroxiflavanona), eriodictiol-7-glucósido (3',4',5,7-tetrahidroxiflavanon-7-glucósido), flavanomareína (3',4',7,8-tetrahidroxiflavanon-7-glucósido) e isoquercetina (3,3',4',5,7-pentahidroxiflavanon-3-(β -D-glucopiranosido).

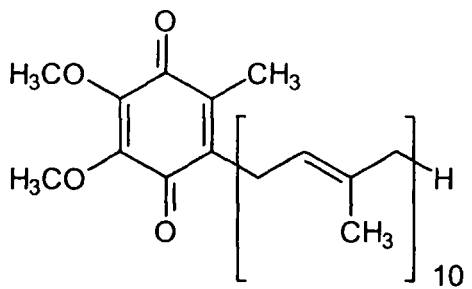
También resulta ventajoso escoger el o los principios activos del grupo de las ubiquinonas y plastoquinonas.

Las ubiquinonas se caracterizan por la fórmula estructural

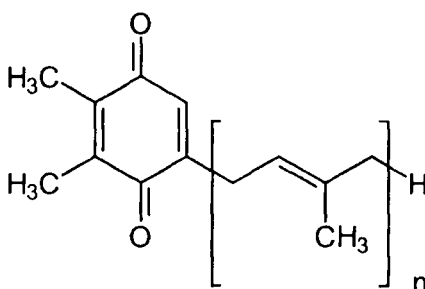


y son las bioquinonas más difundidas y por tanto mejor investigadas. Las ubiquinonas se designan como Q-1, Q-2, Q-3, etc. según el número de unidades de isopreno de la cadena lateral o como U-5, U-10, U-15, etc. según su número de átomos de C. Se hallan preferentemente con longitudes de cadena definidas, p.ej. en algunos microorganismos y levaduras con $n = 6$. En la mayor parte de los mamíferos, incluyendo el hombre, predomina la Q-10.

Es especialmente ventajoso el coenzima Q10, caracterizado por la siguiente fórmula estructural:

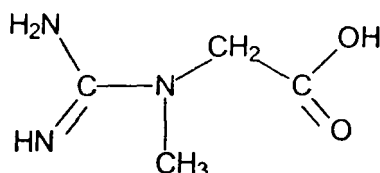


Las plastoquinonas presentan generalmente la fórmula estructural:



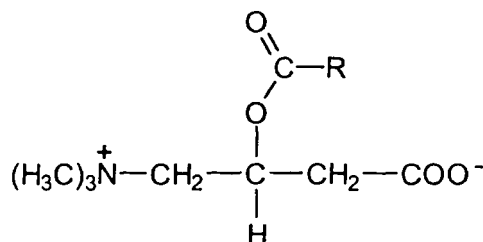
Las plastoquinonas se diferencian por el número n de restos de isopreno y se denominan correspondientemente, p.ej. PQ-9 (n = 9). Además existen otras plastoquinonas con diferentes sustituyentes en el anillo quinónico.

La creatina y/o sus derivados también son principios activos preferidos según la presente invención. La creatina se caracteriza por la siguiente estructura:



Los derivados preferidos son el fosfato de creatina y también el sulfato, el acetato y el ascorbato de creatina, así como los derivados en que el grupo carboxilo está esterificado con alcoholes mono- o polifuncionales.

Otro principio activo ventajoso para la presente invención es la L-carnitina [3-hidroxi-4-(trimetilamonio)-butiro-betaína]. También lo son las acil-carnitinas, que se eligen del grupo de sustancias de la siguiente fórmula estructural genérica:



donde R se escoge del grupo de los radicales alquilo ramificados y lineales de hasta 10 átomos de carbono. Se prefiere la propionilcarnitina y sobre todo la acetilcarnitina. Ambos enantiómeros (las formas D y L) pueden usarse ventajosamente según la presente invención. También puede resultar ventajoso el empleo de cualquier mezcla enantiomérica, como por ejemplo un racemato de las formas D y L.

Otros principios activos ventajosos son la sericosida, el piridoxol, la vitamina K, la biotina y las sustancias aromatizantes.

5 Evidentemente, la lista de dichos principios activos o combinaciones de principios activos que pueden emplearse en los preparados de la presente invención no debe ser restrictiva. Los principios activos pueden usarse individualmente o en cualquier combinación entre ellos.

10 Los preparados de la presente invención pueden hallarse en forma de emulsiones agua-en-aceite (W/O) o aceite-en-agua (O/W), de emulsiones complejas (O/W/O, W/O/W), como loción de esencias en alcohol, como dispersión vesicular de un lípido iónico o no iónico anfifílico, como gel, como barras exentas de agua o hidratadas, o como polvo suelto o prensado.

15 Los preparados de la presente invención son preferentemente emulsiones o composiciones exentas de agua, sobre todo barras.

La fase orgánica de los preparados de la presente invención 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 triglicerínésteres 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. 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.

25 Como componentes ventajosos conforme a la presente invención también se pueden escoger 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 iso-octilo, 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.

40 La fase orgánica también puede escogerse ventajosamente del grupo formado por los dialquiléteres y los dialquilcarbonatos, como p.ej. el dicaprileter y/o el dicaprilcarbonato, por ejemplo el que vende la firma Cognis con la marca comercial Cetiol CC.

También es preferible seleccionar 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, triisostearina, hexacaprilato/hexacaprato de dipentaeritritilo, monoisosteato de propilenglicol, tricaprilina, 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.

50 Como componentes oleosos también resultan útiles p.ej. el salicilato de butiloctilo (como por ejemplo el que vende la firma CP Hall con la marca comercial *Hallbrite BHB*), el benzoato de hexadecilo y el benzoato de butiloctilo y mezclas de los mismos (*Hallstar AB*) y/o el naftalato de dietilhexilo (*Hallbrite/Corapan TQ*).

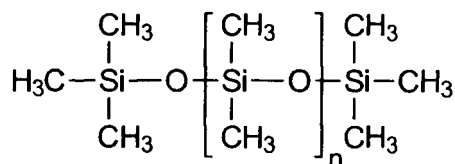
55 Según la presente invención también se puede utilizar ventajosamente cualquier mezcla de dichos componentes oleosos y céreos.

60 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 isohexadecano. 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.

65 Los aceites de silicona son compuestos poliméricos sintéticos macromoleculares, en que los átomos de silicio están unidos mediante átomos de oxígeno, de manera encadenada y/o reticulada, y las restantes valencias del silicio están saturadas con radicales de hidrocarburo (básicamente con grupos metilo y más raramente con grupos etilo, propilo, fenilo, y otros). Los aceites de silicona se denominan sistemáticamente poliorganosiloxanos. Los poliorganosiloxanos

sustituídos con metilo, que son los compuestos más abundantes de este grupo y que se caracterizan por la siguiente fórmula estructural



se designan asimismo como polidimetilsiloxanos o dimeticonas (INCI). Hay dimeticonas con diferentes longitudes de cadena o distintos pesos moleculares.

Poliorganosiloxanos particularmente ventajosos según la presente invención son, por ejemplo, los dimetilpolisiloxanos [poli(dimetilsiloxano)] que vende por ejemplo Th. Goldschmidt con las marcas comerciales Abil 10 hasta 10.000. Asimismo son útiles los fenilmetilpolisiloxanos (INCI: fenil dimeticona, fenil trimeticona); las siliconas cíclicas (octametilciclotetrasiloxano o decametilciclopentasiloxano), también llamadas ciclometiconas según la INCI); las siliconas aminomodificadas (INCI: amodimeticonas), y las ceras de silicona, p.ej. los copolímeros polisiloxano-polialqueno (INCI: estearil dimeticona y cetil dimeticona) y los dialcoxidimetilpolisiloxanos (estearoxi dimeticona y behenoxi estearil dimeticona), que vende Th. Goldschmidt como diversos tipos de marca Abil-Wax. Pero hay otros aceites de silicona que son igualmente útiles para emplear en la presente invención, por ejemplo cetildimeticona, hexametilciclotrisiloxano, polidimetilsiloxano, poli-(metilfenilsiloxano).

Para la presente invención también son ventajosas p.ej. las ceras naturales 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 de la presente invención puede llevar 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 monoetiléter y productos análogos, polímeros, estabilizadores de la espuma, electrolitos y, sobre todo, uno o más espesantes, que pueden escogerse ventajosamente del grupo constituido por dióxido de silicio, silicatos de aluminio, polisacáridos y sus derivados, p.ej. ácido hialurónico, goma xantana, hidroxipropilmetilcelulosa, y, de modo especialmente ventajoso, del grupo constituido 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, ya sea solos o en combinación. También pueden emplearse preferentemente hidratantes.

Se denominan 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, tras 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 pirrolidonicarboxílico y la urea. Asimismo es ventajoso el uso de hidratantes poliméricos del grupo de los polisacáridos solubles y/o hinchables y/o gelificables con agua. Son 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 vende p.ej. la firma SOLABIA, S.A. bajo la marca Fucogel® 1000.

Los preparados cosméticos o dermatológicos de la presente invención también pueden llevar ventajosamente, aunque no sea obligado, colorantes y/o pigmentos cromáticos, sobre todo cuando están en forma de cosméticos decorativos.

Los colorantes y pigmentos cromáticos pueden seleccionarse de la respectiva lista positiva del reglamento de cosmética o de la lista de colorantes cosméticos de la UE. En la mayor parte de los casos son idénticos a los colorantes autorizados para los productos alimenticios. Son pigmentos ventajosos por ejemplo el dióxido de titanio, la mica, los óxidos de hierro (p.ej. Fe₂O₃, Fe₃O₄, FeO(OH)) y/o el óxido de cinc. Son colorantes ventajosos por ejemplo el carmín, el azul de Berlín, el verde óxido de cromo, el azul ultramarino y/o el violeta de manganeso.

Los colorantes y pigmentos cromáticos pueden emplearse tanto individualmente como mezclados y también pueden estar recubiertos mutuamente uno con otro, de manera que, mediante distintos espesores de capa, se provocan diferentes efectos cromáticos. La cantidad total de colorantes y pigmentos cromáticos está comprendida ventajosamente en el intervalo de p.ej. 0,1% en peso hasta 30% en peso, con preferencia de 0,5 hasta 20% en peso, sobre todo de 1,0 hasta 15% en peso, respecto al peso total de los preparados.

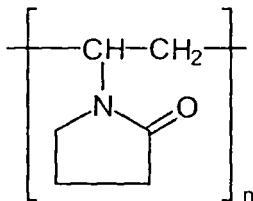
Los pigmentos también pueden actuar ventajosamente como sustancias filtrantes de UV.

ES 2 290 373 T3

Dado el caso, también puede resultar ventajoso incorporar filmógenos en los preparados cosméticos o dermatológicos de la presente invención, por ejemplo, para mejorar su resistencia al agua o para aumentar la protección al UV (potenciadores del efecto protector al UV-A- y/o UV-B). Para ello son apropiados tanto los filmógenos hidrosolubles o dispersables en agua, como los filmógenos liposolubles, ya sea solos o combinados entre sí.

Como filmógenos hidrosolubles, o dispersables en agua, son útiles p.ej. los poliuretanos (p.ej. los tipos Avalure® de Goodrich), los poliacrilatos de dimeticona copoliol (Silsoft Surface® de Witco Organo Silicones Group), los copolímeros de PVP/VA (VA = acetato de vinilo) (Luvicol VA 64 Powder de BASF), los copolímeros acrílicos (Dermacryl 79, National Starch), etc.

Filmógenos liposolubles ventajosos son, p.ej., los del grupo de los polímeros basados en polivinilpirrolidona (PVP)



Se prefieren especialmente copolímeros de la polivinilpirrolidona, por ejemplo el copolímero de PVP hexadeceno y el copolímero de PVP eicoseno, que vende la firma GAF Chemicals Cooperation con las marcas comerciales Antaron V216 y Antaron V220, así como el Tricontayl PVP y otros parecidos.

Las formulaciones fotoprotectoras cosméticas o dermatológicas de la presente invención pueden servir para la protección cosmética o dermatológica frente a la luz, p.ej. como protector solar, y además para el tratamiento, cuidado y limpieza de la piel y/o del cabello, y como producto de maquillaje en cosmética decorativa.

Dependiendo de su forma, las composiciones cosméticas o dermatológicas de uso tópico según la presente invención pueden emplearse, por ejemplo, como crema protectora de la piel, leche limpiadora, crema diurna o crema nocturna. Si es necesario, las composiciones según la presente invención también pueden utilizarse ventajosamente como base de formulaciones farmacéuticas.

También pertenecen a la presente invención los preparados cosméticos y dermatológicos cuyo objeto principal no es la protección contra la luz solar, aunque llevan sustancias protectoras de UV. Así p.ej., en las cremas diurnas o en los productos de maquillaje suelen incorporarse sustancias filtrantes de UV-A o de UV-B. Las sustancias protectoras del UV, así como los antioxidantes y, si se desea, los conservantes protegen efectivamente los preparados contra incluso contra la putrefacción.

Además, algunas recetas escogidas de la presente invención -que p.ej. contienen conocidos principios activos antiarrugas como los flavonglicósidos (sobre todo la α -glicosil-rutina), coenzima Q10, vitamina E y/o derivados y análogos- son especialmente apropiadas para la profilaxis y el tratamiento de alteraciones cutáneas de tipo cosmético o dermatológico. El envejecimiento de la piel se debe p.ej. a factores endógenos determinados genéticamente. En la epidermis y en la dermis se producen p.ej. los siguientes daños estructurales y trastornos funcionales condicionados por la edad, que también pueden incluirse en la definición de "xerosis senil":

- a) sequedad, rugosidad y formación de arrugas (por sequedad),
- b) prurito y
- c) menor regeneración de la grasa por las glándulas sebáceas (p.ej. tras el lavado).

Los factores exógenos, como la luz UV y los productos químicos nocivos, pueden tener efecto acumulativo y acelerar o completar, p.ej., los procesos de envejecimiento endógenos. En la epidermis y en la dermis los factores exógenos provocan especialmente los siguientes daños estructurales y trastornos funcionales de la piel, p.ej., que superan de modo cuantitativo y cualitativo las alteraciones debidas al envejecimiento cronológico:

- d) vasodilataciones visibles (telangiectasias, cuperosis);
- e) flaccidez y formación de arrugas;
- f) hiperpigmentación, hipopigmentación y falta de pigmentación locales (p.ej. lentigo senil) y
- g) mayor sensibilidad frente a la tensión mecánica (p.ej. agrietamiento).

En una forma de ejecución especial, la presente invención se refiere por tanto a productos para el cuidado de la piel envejecida de modo natural y para el tratamiento de las consecuencias del envejecimiento por la luz, concretamente de los fenómenos relacionados desde a) hasta g).

ES 2 290 373 T3

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

Los preparados según la presente invención se elaboran siguiendo los métodos conocidos del estado técnico, que p.ej. están descritos en las páginas 219 y siguientes de la Enciclopedia Uhlmann de química industrial, vol. A 24, editorial VHC GmbH, Weinheim (1993) y en la literatura ahí citada.

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

Ejemplos

Ejemplos de recetas para barras de labios

	1	2
Cera microcristalina	3,5	3,0
Cera de carnauba	3,2	1,5
Cera candelilla	8,0	4,2
Cera de abejas	0,6	
Estearato de alquilo C24-40		12,0
Alcohol cetílico	1,5	
Aceite de lanolina	10,0	
Bis-digliceril poliaciladipato-2		16,0
Triglicérido caprílico/cáprico	4,0	
Palmitato de isopropilo	4,0	
Triisoestearina		3,0
Tetraisoestearato de pentaeritritilo		3,0
Lactato de miristilo		1,0
Octildodecanol	6,0	2,0
Polideceno hidrogenado	4,0	3,0
Escualano	2,0	
Copolímero de PVP/hexadeceno	3,0	
Poligliceril-3 diisoestearato		0,5
Dióxido de titanio micronizado	2,0	0,5
Metoxicinamato de etilhexilo	4,50	

ES 2 290 373 T3

	Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina	2,50	1,00
5	Ácido fenil dibencimidazol tetrasulfónico	3,00	2,00
	Octocrileno	3,00	2,00
10	Dietilhexil butamido triazona	1,50	
	Mica	4,5	5,0
15	Polimetilsilsesquioxano	5,0	
	Pigmentos de interferencia	0,6	
20	Dióxido de titanio CI 77891		2,0
	Óxidos de hierro CI 77491, 77492, 77499	1,6	3,5
	Rojo D&C 7	0,6	3,5
25	Rojo D&C 33		0,75
	Amarillo FD&C 6	0,2	
30	Rojo D&C 30		0,75
	Rojo D&C 28		0,5
35	Acetato de tocoferilo	1	1,5
	Perfume, conservantes, antioxidantes, etc.	c.s.	c.s.
40	Aceite de ricino	a 100	a 100

Ejemplo de receta para emulsiones O/W

	Ingredientes	Mascarilla
50	Poligliceril-3 metilglucosa estearato	3,5
	Estearato de sorbitán	1,5
55	Alcohol cetílico	1,0
	Hidroxietilcelulosa	0,1
60	Triglicérido caprílico/cáprico	3,0
	Dicaprililéter	3,0
	Octildodecanol	3,0
65	Dimeticona	3,0

ES 2 290 373 T3

	Ciclometicona	3,0
5	Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina	4,00
	Ácido fenil dibencimidazol tetrasulfónico	1,00
10	Etilhexil triazona	4,00
	Dietilhexil butamido triazona	1,00
15	Ácido fenilbencimidazol sulfónico	1,00
	Nylon-12	5,0
20	Lauroíl Lisina	0,5
	Caolín	1,0
25	Óxidos de hierro CI 77491, 77492, 77499	8,0
	Azul ultramarino, CI 77007	2,0
30	Óxido de cromo, CI 77288	0,6
	Glicerina	5,0
35	Perfume, antioxidante, neutralizador, secuestrante, conservantes	c.s.
	Agua	hasta 100

Emulsiones O/W de protección solar

		1
45	Estearato de glicerilo SE	2,00
	Ácido esteárico	2,00
50	Alcohol cetearílico	2,00
	Alcohol estearílico	0,50
55	Alcohol de lanolina	0,50
	Alcohol miristílico	2,00
60	Triglicérido de ácido C18-36	2,00
	Metoxicinamato de etilhexilo	7,50
65	Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina	3,00

ES 2 290 373 T3

	Ácido fenil dibencimidazol tetrasulfónico	1,50
5	Etilhexil triazona	4,00
	Ácido fenilbencimidazol sulfónico	2,50
10	Drometrizol trisiloxano	2,00
	Ácido tereftaliden dicanforsulfónico	2,00
15	Homosalato	4,00
	Dietilhexil-2,6-naftalato	7,50
	Aerosil	1,50
20	Carbonato de dicaprililo	2,00
	Dicaprilato/Dicaprato de butilenglicol	4,50
25	Carbomer	0,30
	Acetato de tocoferilo	0,50
30	Poliuretanos	2,00
	Goma xantana	0,60
35	Glicerina	3,50
	Mica	3,50
40	Pigmentos de interferencia	6,00
	Etanol	1,50
45	Konkaben LMB ®	0,20
	Fenoxietanol	0,50
	Perfume	0,20
50	Agua	hasta 100

55		2
	Estearato de glicerilo SE	3,00
60	PEG-100 estearato	1,00
	Alcohol cetílico	1,00
65	Metoxicinamato de etilhexilo	7,50

ES 2 290 373 T3

	Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina	3,00
5	Ácido fenil dibencimidazol tetrasulfónico	1,50
	Etilhexil triazona	4,00
10	Ácido fenilbencimidazol sulfónico	2,50
	Drometrizol Trisiloxan	2,00
15	Ácido tereftaliden dicamfor sulfónico	2,00
	Homosalato	4,00
20	Dietilhexil-2,6-naftalato	8,50
	Dióxido de titanio	0,50
25	Aerosil	1,00
	Carbonato de dicaprililo	2,00
30	Dicaprilato/dicaprato de butilenglicol	4,50
	Carbomer	0,30
35	Acetato de tocoferilo	0,50
	Poliuretanos	2,00
40	Goma xantana	0,60
	Copolímero de estireno/acrilato	1,50
45	Glicerina	3,50
	Caolín	3,00
50	Pigmentos de interferencia	6,00
	Etanol	1,50
55	Konkaben LMB ®	0,20
	Fenoxietanol	0,50
60	Perfume	0,20
65	Agua	hasta 100

ES 2 290 373 T3

Emulsiones W/O

5		1	2
	Triglicerininisoestearato	1,0	
10	Diglicerindipolihiidroxiestearato	3,0	
	PEG-30 Dipolihiidroxiestearato		5,0
	Cetildimeticona copoliol		1,0
15	Aceite de parafina	12,5	17,5
	Vaselina	8,0	2,5
20	Cocoglicérido hidrogenado	2,0	0,25
	Oleato de decilo	0,5	0,25
25	Octildodecanol	0,5	0,25
	Estearato de aluminio	0,4	0,05
30	Estearato magnésico	0,1	1,0
	Aceite de ricino hidrogenado	0,5	5,0
35	Ciclometicona	1,0	1,0
	Poliisobuteno hidrogenado	0,5	3,0
40	Triglicérido caprílico/cáprico	3,0	10,0
	Sulfato magnésico	0,5	1,0
45	Glicerina	3,0	1,5
	Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina	1,50	3,00
	Butil metoxidibenzoílmétano		2,00
50	Ácido fenil dibencimidazol tetrasulfónico	0,50	4,00
	Etilhexil triazona		1,50
55	Octocrileno	4,00	
	Dietilhexil-2,6-naftalato		4,50
60	Óxido de cinc NDM	4,50	
	Dióxido de titanio, CI 777891	3,6	5,2
65	Óxidos de hierro, CI 77491, 77492, 77499	2,2	2,8

ES 2 290 373 T3

	Azul ultramarino; CI 77007	0,4	0,4
5	Almidón octenilsuccinato sódico	0,25	0,75
	Caolín	2,0	2,0
10	Perfume, conservante, ácido cítrico	c.s.	c.s.
	Agua	a 100	a 100

Ejemplo de receta para mascarillas

		1
20	Ácido esteárico	3,5
	Cera de parafina	4,0
25	Cera de carnauba	3,0
	Cera de abejas	3,0
30	Aceite neutro	3,0
	Talco	5,0
35	Pigmentos cromáticos (óxidos de hierro)	8,0
	Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina	1,25
40	Ácido fenil dibencimidazol tetrasulfónico	0,50
	Etilhexil triazona	0,5
45	Dimeticodietilbenzalmalonato	5,00
	Copolímero de PVP	3,0
50	Butanodiol	2,0
	Pantenol	1,3
55	Perfume, conservante, neutralizador, anti-oxidantes, secuestrante, etc.	c.s.
60	Agua, desmineralizada	hasta 100

REIVINDICACIONES

1. Preparado cosmético, **caracterizado** porque contiene

(a) al menos 2 sustancias filtrantes de UV, siendo la primera sustancia filtrante de UV 2,4-bis-{{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina y la segunda sustancia filtrante de UV en el componente (a) fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato disódico, y

(b) al menos una carga, seleccionada entre los silicatos laminares no hinchables en agua.

2. Preparado dermatológico, **caracterizado** porque contiene

(a) al menos 2 sustancias filtrantes de UV, siendo la primera sustancia filtrante de UV 2,4-bis-{{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina y la segunda sustancia filtrante de UV en el componente (a) fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato disódico, y

(b) al menos una carga, seleccionada entre los silicatos laminares no hinchables en agua.

3. Preparado según la reivindicación 1 o 2, **caracterizado** porque como sustancia(s) filtrante(s) de UV adicional(es) se elige(n) la(s) triazina(s) asimétricamente sustituida(s) del grupo:

diocetilbutilamidotriazona,

2,4-bis-{{[4-(3-sulfonato)-2-hidroxi-propiloxi]-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina sal sódica,

2,4-bis-{{[4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxi-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina,

2,4-bis-{{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-[4-(2-metoxietil-carboxil)-fenilamino]-1,3,5-triazina,

2,4-bis-{{[4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxi-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-[4-(etilcarboxil)-fenilamino]-1,3,5-triazina,

2,4-bis-{{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(1-metil-pirrol-2-il)-1,3,5-triazina,

2,4-bis-{{[4-tris(trimetilsiloxi-sililpropiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina,

2,4-bis-{{[4-(2-metilpropeniloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina y

2,4-bis-{{[4-(1',1',1',3',5',5'-heptametilsiloxi-2-metil-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina.

4. Preparado según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado** porque al menos una carga está escogida entre caolín, talco y mica.5. Preparado según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado** porque como filtro de UV contiene 2,4-bis-{{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, fenilen-1,4-bis-(2-bencimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato disódico, y 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol) en combinación con talco o caolín como carga.6. Preparado según una de las reivindicaciones anteriores, que produce o acentúa una sensación aterciopelada o sedosa en la piel, **caracterizado** porque también contiene como mínimo un polímero orgánico como carga(s) adicional(es) del componente (b).7. Uso de preparados según la reivindicación 1 o una de las reivindicaciones 3 hasta 6, en cuanto se refieren a la reivindicación 1, para proteger la piel y el cabello contra los efectos dañinos de la radiación UV-A y UV-B, sobre todo de la radiación solar, **caracterizado** porque el preparado sirve para decoración de la piel, de los labios y/o del cabello.

8. Uso de preparados según la reivindicación 2 o una de las reivindicaciones 3 hasta 6, en cuanto se refieren a la reivindicación 2, para elaborar un producto protector de la piel y del cabello contra los efectos dañinos de la radiación UV-A y UV-B, sobre todo de la radiación solar.

9. Uso según la reivindicación 8, **caracterizado** porque el producto sirve para proteger la piel contra el envejecimiento prematuro, sobre todo contra la formación de arrugas y la pérdida de elasticidad.