

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 236 776**

51 Int. Cl.:

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA MODIFICADA
TRAS OPOSICIÓN

T5

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **10.10.1997 E 97117560 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea modificada tras oposición: **18.06.2014 EP 0838214**

54 Título: **Agente cosmético que contiene una combinación de absorbentes de UV, incluyendo derivados de triacina**

30 Prioridad:

22.10.1996 DE 19643515

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente modificada:

15.09.2014

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)
67056 Ludwigshafen, DE**

72 Inventor/es:

**SPERLING, KARIN, DR.;
WÜNSCH, THOMAS, DR.;
WESTENFELDER, HORST y
TRENTMANN, BEATE, DR.**

74 Agente/Representante:

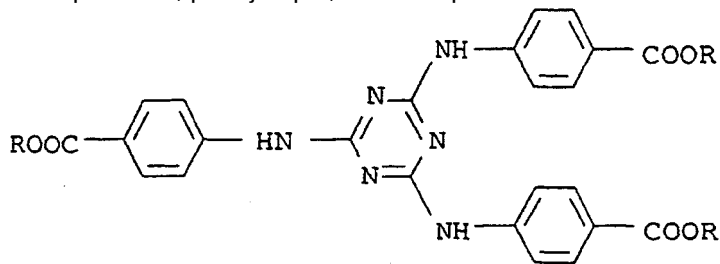
CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

DESCRIPCIÓN

Agente cosmético que contiene una combinación de absorbentes de UV, incluyendo derivados de triacina

La presente invención se refiere a nuevos agentes cosméticos para la aplicación tópica para la protección de la piel y/o el pelo frente a la radiación UV.

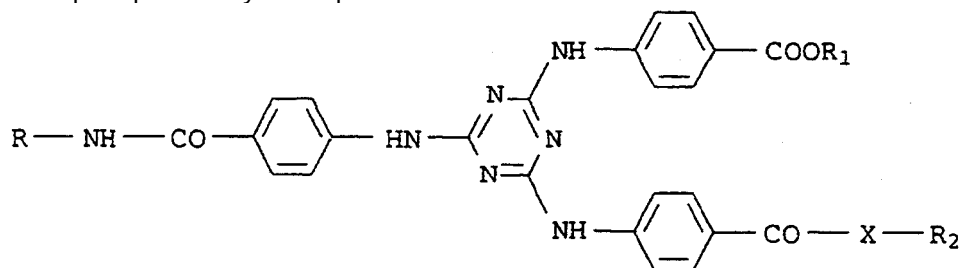
A partir del documento EP 087 098 se conocen como filtro de UV-B derivados de s-triazina de fórmula (II), en la que R representa, por ejemplo, restos alquilo de cadena abierta.



II

El documento EP 517104 describe derivados similares de triazina de fórmula (II), en la que R puede representar, por ejemplo, restos cicloalquilo, y su uso como filtro de UV en preparaciones cosméticas. Estos compuestos se describen como ventajosos frente a los compuestos con restos R de cadena abierta.

El documento EP 570 838 describe nuevos derivados de s-triazina de fórmula (III) como estabilizadores frente a la luz para plásticos y como protectores solares cosméticos.



III

El documento EP 685 223 describe agentes cosméticos que contienen un filtro de UV de fórmula (II) con R = 2-etilhexilo (Uvinul® T150) y además salicilato de homometilo y/o salicilato de octilo como otros componentes. Estos salicilatos provocan una solubilización más rápida del Uvinul® T150 en determinados disolventes.

El documento EP 685 221 describe combinaciones de un derivado de s-triazina de fórmula II (R = 2-etilhexilo, Uvinul® T150) con 2-etilhexilo-2-ciano-3,3-difenilacrilato en formulaciones protectoras solares para alcanzar factores elevados de protección frente a la luz.

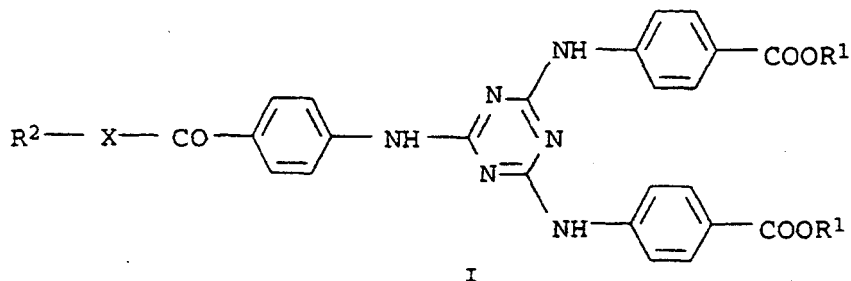
Aunque los compuestos y los agentes descritos arriba ya poseen buenas propiedades protectoras frente a la luz, constantemente aumentan los requisitos que se ponen a los agentes cosméticos protectores frente a la luz, de manera que el objetivo consistió en proporcionar agentes cosméticos protectores frente a la luz que en lo referente a una o varias de las propiedades siguientes presenten valores aún mejores que los medios conocidos hasta ahora:

Los requisitos más importantes en agentes cosméticos protectores frente a la luz son:

1. intervalo de absorción de UV lo más ancho posible,
2. absorción específica elevada en este intervalo,
3. foto- y termoestabilidad,
4. compatibilidad con la piel (sin efectos irritantes y tóxicos sobre la piel),
5. buena sensación en la piel y buena adherencia sobre la piel,
6. resistencia al agua,
7. buena compatibilidad con otras sustancias cosméticas y buena solubilidad,
8. en disoluciones y preparaciones cosméticas.

Son objeto de la invención como se aplica para los Estados Contratantes BE, DE, ES, FR, GB, IT, NL, AT, CH, IE y PT, los agentes cosméticos para la aplicación tópica para la protección de la piel y/o el pelo frente a la radiación UV, que contienen

(a) un filtro de UV A de fórmula general I, en la que



A representa $R^1 = 2$ -etilhexilo, $R^2 =$ terc. butilo, $X = NH$;

(b) otro filtro de UV del grupo del éster etílico etoxilado del ácido p-aminobenzoico (25 mol), éster 2-etilhexílico del ácido p-metoxicinámico, ácido 2-fenilbencimidazolsulfónico y sus sales, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenon-5-sulfónico, 3-(4'-metilbenciliden)-d,l-alcanfor y 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina,

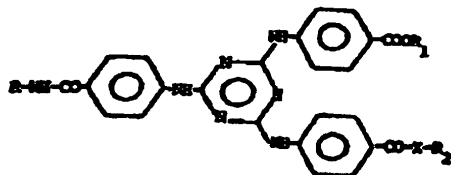
así como agentes de dilución usuales en cosmética; coadyuvantes y excipientes, excepto,

crema de día de aceite/agua, que está constituida por 1,5 g del compuesto C, 3,5 g de 2-etilhexil-4-metoxicinnamato, 4,0 g de trigliceril metilglucosa diestearato, 1,0 g de gliceril estearato, 7,4 g de alquilbenzoato de (C_{12-15}), 5,0 g de aceite de aguacate, 5,0 g de diisopropiladipato, 0,2 g de Carbomer 940, 0,3 g de urea de imidazolidinilo, 0,2 g de metilparabeno, 0,1 g de propilparabeno, 0,15 g de aminometil propanol, 3,0 g de glicerina, agua destilada c.s. hasta 100, o

crema de día de aceite/agua que está constituida por 1,5 g del compuesto C, 3,5 g de 3-(4'-metilbencilideno)-cánfor, 4,0 g de de trigliceril metilglucosa diestearato, 1,0 g de gliceril estearato, 7,4 g de alquilbenzoato de (C_{12-15}), 5,0 g de aceite de aguacate, 5,0 g de diisopropiladipato, 0,2 g de Carbomer 940, 0,3 g de urea de imidazolidinilo, 0,2 g de metilparabeno, 0,1 g de propilparabeno, 0,15 g de aminometil propanol, 3,0 g de glicerina, agua destilada c.s. hasta 100, o

crema de día de aceite/agua que está constituida por 1,5 g del compuesto C, 3,5 g de 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, 4,0 g de de trigliceril metilglucosa diestearato, 1,0 g de gliceril estearato, 7,4 g de alquilbenzoato de (C_{12-15}), 5,0 g de aceite de aguacate, 5,0 g de diisopropiladipato, 0,2 g de Carbomer 940, 0,3 g de urea de imidazolidinilo, 0,2 g de metilparabeno, 0,1 g de propilparabeno, 0,15 g de aminometil propanol, 3,0 g de glicerina, agua destilada c.s. hasta 100,

en la que el compuesto C es un agente protector del sol de la fórmula siguiente

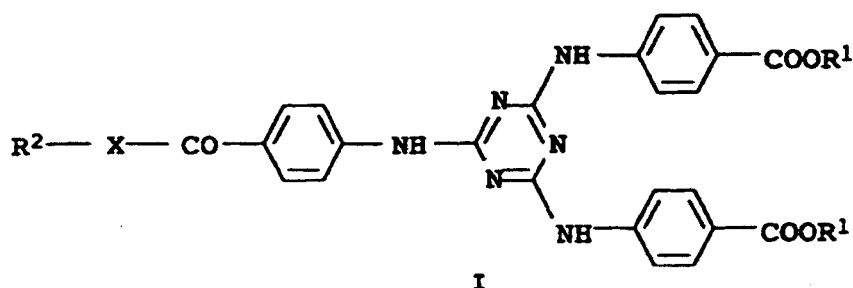


en la que es $R = (CH_3)_3C-$; $R_1 = R_2 = C_4H_9-CH(C_2H_5)-CH_2-$; $X=O$

También son objeto de la invención los agentes cosméticos anteriormente mencionados, caracterizados porque se emplea acrilato de 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenilo como filtro de UV (b).

Además, también es objeto de la invención el uso en los Estados Contratantes mencionados anteriormente de una combinación de

(a) un filtro de UV A de fórmula general I, en la que

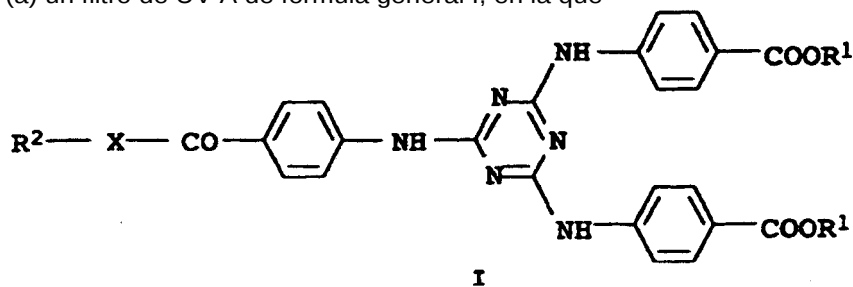


A representa $R^1 = 2$ -etilhexilo, $R^2 =$ terc. butilo, $X = NH$; y

- 5 (b) otro filtro de UV del grupo del éster etílico etoxilado del ácido p-aminobenzoico (25 mol), ácido 2-fenilbencimidazolsulfónico y sus sales, ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona-5-sulfónico, y 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina, como agente protector frente a la luz.

Otro objeto de la invención, como se aplica para los Estados Contratantes DK, FI, GR y SE, son agentes cosméticos para la aplicación tópica para la protección de la piel y/o de los cabellos frente a la radiación-I, que contienen

(a) un filtro de UV A de fórmula general I, en la que



A representa $R^1 = 2$ -etilhexilo, $R^2 =$ terc. butilo, $X = NH$; y

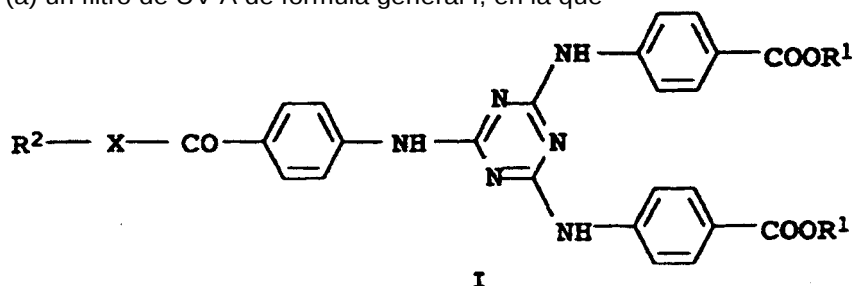
- 15 b) otro filtro de UV del grupo del éster etílico etoxilado del ácido p-aminobenzoico (25 mol), éster 2-etilhexílico del ácido p-metoxicinámico, acrilato de 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenilo, ácido 2-fenilbencimidazolsulfónico y sus sales, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenon-5-sulfónico, 3-(4'-metilbenciliden)-d,l-alcanfor, 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina,

así como sus agentes de dilución, coadyuvantes y sustancias portadoras.

- 20 En este caso se prefieren aquellos agentes que contienen como filtros-IV (2) 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenilacrilato, así como aquéllos que contienen como filtros-UV (b) 2-etilhexiléster del ácido p-metoxicinámico.

Objeto de la invención en los Estados Contratantes DK, FI, GR y SE es, además, el uso de una combinación de

(a) un filtro de UV A de fórmula general I, en la que



- 25 A representa $R^1 = 2$ -etilhexilo, $R^2 =$ terc. butilo, $X = NH$; y

(b) otro filtro-UV del grupo del éster etílico etoxilado del ácido p-aminobenzoico (25 mol), éster 2-etilhexílico del ácido p-metoxicinámico, ácido 2-fenilbencimidazolsulfónico y sus sales, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenon-5-sulfónico, 3-(4'-metilbenciliden)-d,l-alcanfor, 2,4,6-trianilino-(p-carbo-

2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina,

como agentes de protección de la luz

Se muestran los agentes cosméticos protectores frente a la luz según la invención, en lo referente a una o varias de las propiedades indicadas arriba, considerados en comparación con los agentes protectores frente a la luz conocidos hasta ahora. Sobre todo en lo referente al factor de protección solar que se puede alcanzar, los agentes protectores frente a la luz muestran propiedades sorprendentemente buenas.

Los preparados o preparaciones cosméticas contienen los compuestos (a) y (b) en general hasta 0,1 a 15% en peso, con preferencia 5-10% en peso, referido a la formulación, junto a los excipientes o agentes de dilución habituales en cosmética y, dado el caso, coadyuvantes cosméticos habituales.

Depende del tipo de excipiente, coadyuvante o agente de dilución que el preparado acabado que contiene agente protector frente a la luz sea una disolución, un aceite, una crema, una pomada, una loción, un gel o un polvo. Las preparaciones de este tipo se pueden obtener, por ejemplo, de la revista "Seifen, Öle, Fette, Wachse", 1955, página 147.

Los coadyuvantes cosméticos usados normalmente que entran en consideración como aditivos son, por ejemplo, emulsionantes, como etoxilatos de alcoholes grasos, ésteres de sorbitan de ácido graso o derivados de lanolina, agentes espesantes, como carboximetilcelulosa o ácidos poliacrílicos ramificados, agentes conservantes y perfumes.

Otros coadyuvantes son estabilizadores como sales de magnesio o aluminio de ácidos grasos, formadores de complejos como EDTA, antioxidantes como BHT, BHA o alfa-tocoferol.

Los aceites cosméticos que se usan como coadyuvantes son, por ejemplo, ésteres isopropílicos de ácidos grasos, especialmente estearato de isopropilo, palmitato de isopropilo, isoestearato de isopropilo, miristato de isopropilo, laurato de isopropilo, aceite de parafina y aceite neutro.

Otros componentes de los agentes cosméticos según la invención pueden ser principios activos cosméticos como pantenol, bisabolol, alfa-tocoferol, acetato de alfa-tocoferol, aloe vera, extracto de algas y ácido hialurónico.

Son base para los aceites protectores solares, por ejemplo, los aceites vegetales como aceite de cacahuete, aceite de oliva, aceite de sésamo, aceite de semillas de algodón, aceite de coco, aceite de granilla, aceite de ricino o aceites minerales, como aceite de vaselina o especialmente parafina líquida, ésteres de ácidos grasos sintéticos y glicéridos. Son base para pomadas, por ejemplo, vaselina, lanolina, eucerina o polietilenglicoles.

Son bases para cremas, por ejemplo, cremas ricas en grasa, cremas de glicerina, de polisacárido, de tilosa, para cremas basadas en grasas y ceras, alcohol cetílico, crema de lanolina, manteca de cacao, cera de abejas, ácido esteárico, alcohol estearílico, monoestearato de glicerina, aceites y grasas nativos o minerales.

Son bases para emulsiones, por ejemplo, mezclas de estearilglicol, un aceite vegetal y/o mineral, como aceite de almendra, aceite de parafina y vaselina, y agua o mezclas de alcohol etílico, agua, lanolina y tragacanto, o mezclas de alcohol etílico, estearina, agua, tragacanto y glicerina o mezclas de ácido esteárico, aceite de parafina, alcohol propílico o isopropílico y agua.

La invención se explica más detalladamente en los siguientes ejemplos. "Filtro UV A" es la combinación de la fórmula (I), en la que $R^1 = 2\text{-etilhexilo}$, $R^2 = \text{terc. butilo}$, $X = \text{NH}$.

Todos los datos numéricos en las siguientes recetas están en gramos.

Ejemplo 1

Fabricación de un agente cosmético protector frente a la luz en forma de un gel sin grasa

Producto:	Gel protector solar sin grasa
0,40	Acrilatos / acrilato de alquilo $C_{10}\text{-}C_{30}$ cruzado
0,25	Hidroxietil celulosa
8,00	Metoxicinamato de octilo

1,00	4-metilbenciliden alcanfor
Producto:	Gel protector solar sin grasa
2,00	Filtro UV A
0,20	EDTA disódico
c.s	Agua
5,00	Glicerina
0,15	Fragancia
0,30	Imidazolidinil urea
0,25	Metilparaben sódico
0,15	Propilparaben sódico
5,00	PEG-25 PABA
0,10	Hidróxido sódico

El gel posee un factor de protección solar (SPF, medido con optometría SPF 290) de 13.

Ensayo comparativo:

- 5 Una formulación por lo demás igual, en la que en lugar del filtro UV A se usó la misma cantidad de Uvinul T150, posee un SPF de 8.

Ejemplo 2

- 10 Fabricación de un agente cosmético protector frente a la luz en forma de una crema solar

Producto:	Crema solar
6,00	Aceite de castor PEG-7-hidrogenado
5,00	Óxido de cinc
5,00	Palmitato de isopropilo
6,00	Aceite mineral
3,00	Salicilato de octilo
0,50	Acetato de tocoferilo
8,00	Metoxicinamato de octilo
1,00	4-metilbenciliden alcanfor
2,00	Filtro UV A
0,60	Estearato magnésico
2,00	Co-polímero de PEG-45/dodecil glicol
0,25	Metilpirabeno
0,15	Propilparaben
5,00	Imidazolidinil urea
0,15	Fragancia
Producto:	Crema solar
0,20	EDTA disódico
c.s	Agua

La crema posee un factor de protección solar (SPF, medido con optometría SPF 290) de 16.

Ensayo comparativo:

Una formulación igual, en la que en lugar del filtro UV A se usó la misma cantidad de Uvinul T150, posee un SPF de 12.

Ejemplo 3 (solamente para los Estados Contratantes DK, FI, GR y SE)

Fabricación de un agente cosmético protector frente a la luz en forma de una crema bloqueante solar

Producto:	Crema bloqueante solar LSF 6
6,00	Aceite de castor PEG-7-hidrogenado
5,00	Palmitato de isopropilo
10,00	Aceite mineral

ES 2 236 776 T5

3,00	Triglicéridos caprílicos / cápricos
0,60	Estearato de magnesio
0,50	Acetato tocoferil
2,00	Co-polímero de PEG-45/dodecil glicol
0,05	Tocoferol
2,00	Filtro-UV A
c.s.	Agua
0,30	Glicerina
0,70	Sulfato de magnesio
0,25	Metilparabeno
0,15	Propilparabeno
0,15	Fragancia

El gel posee un factor de protección solar (SPF, medido con optometría SPF 290) de 8.

Ensayo comparativo:

- 5 Una formulación por lo demás igual, en la que en lugar del filtro UV A se usó la misma cantidad de Uvinul T150, posee un SPF de 4.

Ejemplo 4

- 10 Fabricación de un agente cosmético protector frente a la luz en forma de un bloqueante solar para labios

Producto:	Bloqueante solar para labios
48,00	Eucerinum anhydricum
2,00	Cera de abejas
2,00	Filtro UV A
4,00	Estearato/caprato/caprilato de pentaeritritilo
2,00	Cera microcristalina
10,00	Metoxicinamato de octilo
3,00	Estearato de glicerilo
10,00	Glicerina
2,00	Bentonita Quaternium-18
1,50	Co-polímero de PEG-45/dodecil glicol
5,00	Óxido de cinc
10,00	Dióxido de titanio

El bloqueante solar para labios posee un factor de protección solar (SPF, medido con optometría SPF 290) de 35.

15

Ensayo comparativo:

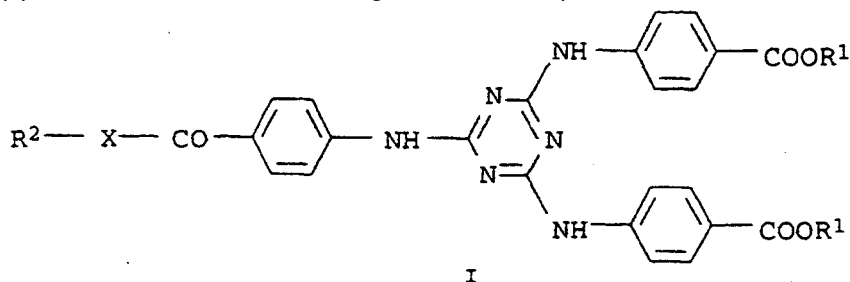
Una formulación igual, en la que en lugar del filtro UV A se usó la misma cantidad de Uvinul T150, posee un SPF de 28.

20

REIVINDICACIONES

para los siguientes Estados Contratantes BE, DE, ES, FR, GB, IT, NL, AT, CH, IE y PT

- 5 1.- Agentes cosméticos para la aplicación tópica para la protección de la piel y/o el pelo frente a la radiación UV, que contienen
(a) un filtro de UV A de fórmula general I, en la que



A representa R^1 = 2-etilhexilo, R^2 = terc. butilo, X = NH;

- 10 (b) otro filtro de UV del grupo del éster etílico etoxilado del ácido p-aminobenzoico (25 mol), éster 2-etilhexílico del ácido p-metoxicinámico, ácido 2-fenilbencimidazolsulfónico y sus sales, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenon-5-sulfónico, 3-(4'-metilbenciliden)-d,l-alcanfor y 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina,

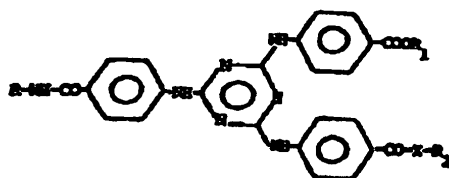
- 15 así como agentes de dilución usuales en cosmética; coadyuvantes y excipientes, excepto,

crema de día de aceite/agua, que está constituida por 1,5 g del compuesto C, 3,5 g de 2-etilhexil-4-metoxicinnamato, 4,0 g de trigliceril metilglucosa diestearato, 1,0 g de gliceril estearato, 7,4 g de alquilbenzoato de (C_{12-15}), 5,0 g de aceite de aguacate, 5,0 g de diisopropiladipato, 0,2 g de Carbomer 940, 0,3 g de urea de imidazolidinilo, 0,2 g de metilparabeno, 0,1 g de propilparabeno, 0,15 g de aminometil propanol, 3,0 g de glicerina, agua destilada c.s. hasta 100, o

crema de día de aceite/agua que está constituida por 1,5 g del compuesto C, 3,5 g de 3-(4'-metilbencilideno)-cánfor, 4,0 g de de trigliceril metilglucosa diestearato, 1,0 g de gliceril estearato, 7,4 g de alquilbenzoato de (C_{12-15}), 5,0 g de aceite de aguacate, 5,0 g de diisopropiladipato, 0,2 g de Carbomer 940, 0,3 g de urea de imidazolidinilo, 0,2 g de metilparabeno, 0,1 g de propilparabeno, 0,15 g de aminometil propanol, 3,0 g de glicerina, agua destilada c.s. hasta 100, o

crema de día de aceite/agua que está constituida por 1,5 g dl compuesto C, 3,5 g de 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, 4,0 g de de trigliceril metilglucosa diestearato, 1,0 g de gliceril estearato, 7,4 g de alquilbenzoato de (C_{12-15}), 5,0 g de aceite de aguacate, 5,0 g de diisopropiladipato, 0,2 g de Carbomer 940, 0,3 g de urea de imidazolidinilo, 0,2 g de metilparabeno, 0,1 g de propilparabeno, 0,15 g de aminometil propanol, 3,0 g de glicerina, agua destilada c.s. hasta 100,

en la que el compuesto C es un agente protector del sol de la fórmula siguiente

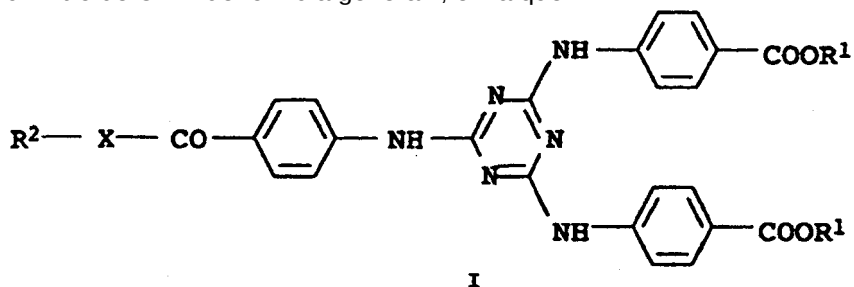


- 35 en la que es $R = (CH_3)_3C-$; $R_1 = R_2 = C_4H_9-CH(C_2H_5)-CH_2-$; $X=O$

2. Agente según la reivindicación 1, caracterizado porque como filtro de UV (b) se emplea éster 2-etilhexílico del ácido p-metoxicinámico.

3. Uso de una combinación de

(a) un filtro de UV A de fórmula general I, en la que



A representa $R^1 = 2$ -etilhexilo, $R^2 =$ terc. butilo, $X = NH$;

y
(b) otro filtro de UV del grupo del éster etílico etoxilado del ácido p-aminobenzoico (25 mol), ácido 2-fenilbencimidazolsulfónico y sus sales, ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenon-5-sulfónico, 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina, como agente protector frente a la luz.