



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 285 584**

51 Int. Cl.:

A61K 8/35 (2006.01)

A61K 8/37 (2006.01)

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **05003253 .1**

86 Fecha de presentación : **16.02.2005**

87 Número de publicación de la solicitud: **1723944**

87 Fecha de publicación de la solicitud: **22.11.2006**

54

Título: **Formulaciones fotoprotectoras cosméticas y dermatológicas con un contenido en filtros UVA químicos y triheptanonina.**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.11.2007

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.11.2007

73

Titular/es:

**Dr. Straetmans Chemische Produktion GmbH
Rahlstedter Bahnhofstrasse 30
22143 Hamburg, DE**

72

Inventor/es: **Straetmans, Udo;
Jänichen, Jan y
Petersen, Wildfried**

74

Agente: **Tomás Gil, Tesifonte Enrique**

ES 2 285 584 T3

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

DESCRIPCIÓN

Formulaciones fotoprotectoras cosméticas y dermatológicas con un contenido en filtros UVA químicos y triheptanonina.

5 Antecedentes técnicos de la invención

10 La protección de la piel humana contra rayos UVA perjudiciales ha adquirido una importancia creciente en los últimos años no sólo por el afinamiento creciente de la capa de ozono en algunas partes de la tierra, sino también por el comportamiento del ser humano en el tiempo libre. Mientras que la zona UVA de ondas muy cortas de < 290 nm normalmente es absorbida por la capa de ozono atmosférica, las radiaciones UV-B de onda más larga, con una longitud de onda de 290 - 320 nm, así como las radiaciones UV-A con una longitud de onda de 320 - 400 nm alcanzan la superficie terrestre relativamente sin impedimento y pueden provocar sobre la piel según el tiempo y la frecuencia de exposición daños temporales, pero también permanentes.

15 Así, ya una acción breve de radiación UVA de aprox. 310 nm conduce rápidamente a una quemadura solar dolorosa, mientras que una acción más larga de radiación UV-A de ondas largas en las capas de piel más profundas puede provocar reacciones fototóxicas y hace envejecer la piel más rápido a través de un deterioro del tejido conjuntivo. Sin embargo, no sólo el aspecto de la piel puede sufrir bajo el efecto extensivo de los UVA, también los cambios celulares malignos, relacionados con la formación de melanomas, se atribuyen a los daños inducidos por los UVA del material genético de las células de la piel.

20 Ante estos antecedentes, los compuestos químicos que son aptos para absorber o reflejar rayos UVA sobre la superficie de la piel constituyen una clase de sustancias importante para productos dermatológicos y cosméticos y hoy en día son aplicados ampliamente no sólo en productos de protección solar sino también en productos de cuidado de la piel de necesidad diaria.

30 El modo de funcionamiento de filtros UVA químicos se basa en que éstos son aptos para absorber radiación UVA de gran energía y, al suceder esto, pasan a un estado estimulado. A partir de éste, a continuación las especies estimuladas bajo entrega incremental de la energía absorbida se relajan de nuevo a su estado básico.

Los pigmentos inorgánicos como TiO₂ o ZnO por el contrario reflejan la radiación UVA e impiden de esta manera su penetración en la piel.

35 Desde el punto de vista estructural, los filtros UVA químicos pertenecen a la clase de compuestos de los aromáticos, cuyo espectro de absorción de UVA fue desplazado por sustituyentes y/o heteroátomos a la zona UVA requerida. Estos compuestos poseen, salvo pocas excepciones, sólo una escasa hidrosolubilidad y frecuentemente se caracterizan por sus propiedades de cristalización muy marcadas. La última propiedad frecuentemente tiene como consecuencia también una solubilidad en aceite delimitada, lo cual limita la concentración de uso de filtros UVA químicos y, por 40 ello, el factor de fotoprotección de la respectiva formulación.

Puesto que los máximos de absorción de los filtros UVA químicos dependen de su estructura y no cubren toda la zona de radiación UV-A y UV-B dañina, se emplean generalmente mezclas de filtros UVA con diferentes máximos de absorción en productos de protección solar, para garantizar una protección de banda ancha de la piel tan efectiva como sea posible contra los efectos dañinos de la radiación UVA.

45 Condición para un efecto óptimo de ambos (de los filtros UVA químicos y de los pigmentos inorgánicos) es sin embargo también su repartición homogénea sobre la superficie de la piel y una escasa tendencia a la penetración en la piel. Esta última en especial es de gran importancia para los filtros químicos, para impedir reacciones de las especies estimuladas sobre la superficie celular de células de la piel.

Objeto de la presente invención

55 Los disolventes adecuados para productos de protección solar forman de manera ideal componentes oleosos que reúnan varias propiedades en sí. Así, éstos deberían:

- disolver bien y de manera estable los filtros protectores solares para diferentes zonas UVA
- dispersar de manera estable los pigmentos inorgánicos
- 60 - disponer de una buena capacidad de separación con el objetivo de una repartición homogénea de los factores de protección solar sobre la piel
- poseer sólo una escasa capacidad de penetración en la piel.

65 Filtros UVA ventajosos, que se caracterizan por sus buenas propiedades de protección solar y que se han aplicado ampliamente en el pasado más reciente son por ejemplo el filtro UV-B 2,4,6-trianilino-p-(carbo-2'-etilhexil-1'oxi)-1,3,5-triazina (NIIC: *etilhexil triazona*), que es comercializado por BASF bajo el nombre comercial Uvinul T 150,

el filtro UV-A 1-(4-tert-butilfenil)-3-(4-metoxifenil)-propano-1,3-diona (NIIC: *butilmetoxidibenzoilmetano*), que se ofrece por ejemplo bajo el nombre comercial Parsol 1789 de la firma DSM, o el Bis-octiloxifenol-metoxifenil triazina (NIIC: *Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil-triazina*), un filtro de banda ancha, que es ofrecido por ejemplo bajo el nombre comercial Tinosorb S por la empresa Ciba Geigy (EP0775698 B1). Como desventaja de estos filtros UVA citados se puede nombrar sin embargo su escasa solubilidad en numerosos componentes oleosos empleados habitualmente en la cosmética y su tendencia de cristalización marcada. Los triglicéridos generalmente no se consideran como disolventes para filtros UVA químicos, puesto que éstos sólo poseen una capacidad muy limitada de disolver aquellos filtros UVA. Más bien se encuentran disolventes, que en cuanto a estos filtros UVA se corresponden con el estado de la técnica, por ejemplo en el grupo de ésteres de ácidos orgánicos aromáticos (por ejemplo, el benzoato de alquilo C12-15), que se ofrecen por ejemplo bajo el nombre Finsolv TN o éster de cadena media del butilenglicol (butilenglicol dicaprilato/dicaprato), el cual se ofrece bajo el nombre comercial Dermofeel® BGC de la Dr. Straetmans GmbH a un nivel de precio más elevado. Ambos productos se basan al menos parcialmente en materias primas sintéticas y por ello no se corresponden con la necesidad creciente del mercado de productos de fuentes de materias primas renovables. Asimismo, en especial los benzoatos de alquilo lineales tienden a atacar embalajes con contenido en plástico, lo cual puede implicar una contaminación de los productos mediante plastificantes o sustancias similares.

Por lo tanto, sería deseable tener disponibles componentes oleosos, los cuales satisfagan los requisitos técnicos exigidos para los filtros UVA químicos arriba citados, que no obstante generen en igual medida una sensación agradable en la piel y que sean fabricados además a partir de materias primas renovables y que cumplan así las exigencias ecológicas de la industria cosmética. Además sería ventajoso, en cuanto a la seguridad del producto, tener disponible un disolvente, el cual se comporte de manera inerte en cuanto a materiales de embalaje con contenido en plástico y que sea lo más económico posible.

De manera sorprendente y no previsible para el experto se observó ahora que con el triheptanoato de glicerilo (NIIC: triheptanoína) se descubrió un triglicérido y materia prima de fuentes renovables, que

- posee una buena capacidad de disolución para los filtros UVA etilhexil triazona, butilmetoxidibenzoilmetano y bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina
- reduce la tendencia de cristalización de los citados filtros UVA también en mezclas con otros componentes oleosos
- posee una buena capacidad de separación y garantiza por consiguiente una distribución homogénea de los citados filtros UVA sobre la piel y produce una sensación agradable sobre la piel
- dispersa bien los pigmentos inorgánicos
- se comporta de manera inerte con respecto a envases de plástico y por consiguiente reduce el riesgo de una contaminación de productos mediante plastificantes u otros componentes del envase

y que cumple por ello los requisitos técnicos arriba citados no sólo para un filtro UV químico sino para todos los filtros citados y remedia las desventajas ecológicas y económicas del estado de la técnica, y por consiguiente resuelve la tarea complicada de una manera excelente.

La presente patente se refiere por lo tanto a preparaciones fotoprotectoras cosméticas y dermatológicas, en especial preparaciones cosméticas y dermatológicas de cuidado de la piel con un contenido en triheptanoína y uno o varios de los filtros UVA 2,4,6-trianilino-p-(carbo-2'-etilhexil-1'oxi)-1,3,5-triazina (etilhexil triazona), 1-(4-tert-butilfenil)-3-(4-metoxifenil)-propano-1,3-diona (butilmetoxidibenzoilmetano) o bis-octiloxifenol-metoxifenil-triazina (bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina).

Descripción de la invención

El triheptanoato de glicerilo (triheptanoína) se aplica ante todo en el sector alimenticio. Ahí, se utiliza entre otras cosas como marcador para grasas, el cual se añade a la mantequilla que está destinada a la exportación subvencionada de la Unión Europea, para poder demostrar una reimportación ilegal. Recientemente se desarrollaron ante todo en los Estados Unidos otros sectores de aplicación para el tratamiento de enfermedades del metabolismo de la descomposición de ácidos grasos del sector dietético. Así, muestran patentes, que, por un defecto enzimático no están en situación de metabolizar cadenas de ácidos grasos de números pares, síndromes graves en los músculos y en el corazón que pueden mejorarse de manera significativa mediante un tratamiento dietético con triheptanoína (C. R. Roe *et al.* J. Clin. Invest. 110, (2002) 259-269). También en productos cosméticos se describió ya la utilización de triheptanoína, sin embargo sin referencia alguna a las propiedades de fotoprotección o filtros UVA.

La elaboración de triheptanoína se realiza por esterificación de glicerina y ácido heptano. Puesto que la glicerina empleada puede fabricarse a partir de aceites vegetales y el ácido heptano puede fabricarse a partir de aceite de ricino, esta materia prima satisface por consiguiente los criterios exigidos según la invención de provenir de fuentes de materia prima renovables. La triheptanoína puede obtenerse de la Dr. Straetmans GmbH bajo el nombre comercial Dermofeel® TC-7. Se pudo constatar ahora sorprendentemente que a través de la adición de triheptanoína según la invención a formulaciones cosméticas que contienen los filtros UVA arriba citados, podía disolverse una cantidad

ES 2 285 584 T3

comparable de estos filtros UVA, como con los diésteres de butilenglicol o con el benzoato de alquilo C12-15. En el caso de la etilhexil triazona se superó incluso la cantidad de filtro UVA disuelto.

5 En formulaciones según la invención pueden emplearse los filtros UVA citados solos. La cantidad total en 2,4,6-trianilino-p-(carbo-2'-etilhexil-1'oxi)-1,3,5-triazina (etilhexil triazona) es elegida entonces ventajosamente en un intervalo de 0'1% - 10%, preferiblemente 0'5 - 6'0%, la cantidad total en 1-(4-tert-butilfenil)-3-(4-metoxifenil)-propano-1,3-diona (butil metoxidibenzoilmetano) se elige ventajosamente en el intervalo de 0'1 - 6'0% y preferiblemente 0'5 - 4'0%, la cantidad total en bis-octiloxifenol-metoxifenil-triazina (bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazona) se elige ventajosamente en el intervalo 0'1% - 15%, preferiblemente 0'5 - 10%. No obstante, los citados filtros UVA pueden ser combinados por supuesto también de manera arbitraria, para garantizar una protección de banda ancha efectiva.

15 La cantidad total en triheptanoína en formulaciones según la invención asciende a 0'1% - 50%, preferiblemente 0'5% - 15% referida al peso total de la formulación. Puede utilizarse sola, pero naturalmente también en combinación con otros componentes oleosos para disolver los citados filtros UVA, como por ejemplo benzoato de alquilo C12-15 o butilenglicol dicaprilato/dicaprato. Las formulaciones elaboradas según la invención se caracterizan por una sensación sorprendentemente agradable en la piel y una buena distribución sobre la piel.

20 Las fórmulas de protección solar según la invención pueden estar compuestas como de costumbre y pueden servir para la fotoprotección cosmética y/o dermatológica, pero también para el tratamiento, cuidado y limpieza de la piel y/o del cabello o también como producto de la cosmética decorativa.

25 Así, pueden contener sustancias auxiliares cosméticas, como son utilizadas habitualmente en dichas formulaciones como por ejemplo tensioactivos, otros cuerpos oleosos, emulsionantes, ceras de brillo perlado, productos donadores de consistencia, espesantes, sobreengrasantes, estabilizantes, polímeros, compuestos de silicona, grasas, ceras, lecitinas, fosfolípidos, sustancias activas biógenas, factores de fotoprotección UVA, antioxidantes, desodorantes, antitranspirantes, agentes anticasca, formadores de película, agentes hinchantes, repelentes de insectos, autobronceadores, inhibidores de la tirosinina (despigmentadores), hidrótropos, solubilizadores, conservantes, aceites de perfume, colorantes etc., que a continuación están enumerados como ejemplos.

30 *Tensioactivos*

Como sustancias tensioactivas pueden estar contenidos tensioactivos aniónicos, no fónicos, catiónicos y/o anfóteros o zwitteriónicos. En preparaciones cosméticas con contenido en tensioactivos, como por ejemplo geles de ducha, baños de espuma, champús etc. está contenido preferiblemente al menos un tensioactivo aniónico. La proporción de los tensioactivos en este caso habitualmente es de aproximadamente 0'1 a 30%, preferiblemente de 5 a 25% y especialmente de 10 a 20% en peso.

35 Ejemplos típicos para tensioactivos aniónicos son jabones, los alquilbenceno sulfonatos, los alcanosulfonatos, los olefinsulfonatos, los alquiléter sulfonatos, los gliceríneter sulfonatos, los □-metiléster sulfonatos, los ácidos grasos sulfónicos, los alquilsulfatos, los étersulfatos de alcoholes grasos, los étersulfatos de glicerina, los étersulfatos de ácidos grasos, los hidroxietér sulfatos mixtos, los monoglicérido(éter)sulfatos, los (éter)sulfatos de amida de ácido graso, los mono y dialquilsulfosuccinatos, los mono y dialquilsulfosuccinamatos, los sulfotriglicéridos, los jabones de amidas, los ácidos éter carboxílicos, y sus sales, los tionatos de ácidos grasos, los sarcoinatos de ácidos grasos, los tauridos de ácidos grasos, los ácidos N-acilamino, como por ejemplo el lactilato de acilo, el tartrato de acilo, los glutamatos de acilo y los aspartatos de acilo, los alquiloligoglucósido-sulfatos, los condensados de proteína de ácido graso (especialmente productos vegetales sobre base de trigo) y los alquil(éter)fosfatos. Si los tensioactivos aniónicos contienen cadenas de poliglicoléter, éstas pueden presentar una distribución de homólogos convencional, pero preferiblemente limitada. Ejemplos típicos para tensioactivos no iónicos son los ésteres de poliglicerilo de ácido graso, los poliglicoléteres de alcohol graso, los alquilfenolpoliglicoléteres, los poliglicoléteres de ácido graso, los poliglicoléteres de amida de ácido graso, los poliglicoléteres de aminoácido, los triglicéridos alcoxilados, los éteres mixtos o formales mixtos, dado el caso los alqu(en)il oligoglucósidos parcialmente oxidados o derivados del ácido glucorónico, las ácido graso-N-alquilglucamidas, los hidrolizados de proteína (en especial productos vegetales sobre base de trigo), los poliésteres de ácido graso, los ésteres de azúcar, los ésteres de sorbitán, los polisorbatos y los aminoóxidos. Si los tensioactivos no iónicos contienen cadenas de poliglicoléter, éstos pueden presentar una distribución de homólogos convencional, pero preferiblemente limitada. Ejemplos típicos para tensioactivos catiónicos son los compuestos de amonio cuaternarios, como por ejemplo el cloruro de dimetil diestearil amonio, y los esterquats, especialmente las sales de éster trialcanolamínico de ácido graso cuaternizado. Ejemplos típicos para tensioactivos anfóteros o zwitteriónicos son las alquilbetaínas, las alquilamidobetaínas, los aminopropionatos, los aminoglicinatos, las betaínas de imidazolinio y las sulfobetaínas. En los tensioactivos citados se trata exclusivamente de compuestos conocidos. En cuanto a la estructura y fabricación de estas sustancias se hace referencia a trabajos de revisión pertinentes de este sector. Ejemplos típicos para tensioactivos suaves especialmente adecuados, es decir tensioactivos especialmente inofensivos para la piel, son los poliglicolétersulfatos de alcohol graso, los sulfatos de monoglicérido, los mono y/o dialquilsulfosuccinatos, los isotionatos de ácido graso, los sarcosinatos de ácido graso, los tauridos de ácido graso, los glutamatos de ácido graso, los ácidos éter carboxílicos, los □-olefinsulfonatos, los alquiloligoglucósidos, las glucamidas de ácido graso, las alquilamidobetaínas, los amfoacetales y/o los condensados de proteína de ácido graso, los últimos preferiblemente sobre base de proteínas de trigo.

Cuerpo oleoso

Los medios de cuidado corporal, como cremas, lociones y leches, contienen habitualmente una serie de otros cuerpos oleosos y emolientes, que contribuyen a optimizar más las propiedades sensoriales. Los cuerpos oleosos están contenidos habitualmente en una cantidad total de 0'1 - 50% en peso, preferiblemente 5 - 25% en peso y en especial 5 - 15% en peso. Como cuerpos oleosos entran en consideración por ejemplo los alcoholes de Guerbet sobre base de alcoholes grasos con 6 a 18, preferiblemente 8 a 10 átomos de carbono, los ésteres de ácidos grasos C_6-C_{22} lineales con alcoholes grasos C_6-C_{22} lineales o ramificados o ésteres de ácidos carboxílicos C_6-C_{13} ramificados con alcoholes grasos C_6-C_{22} lineales o ramificados, como por ejemplo el miristato de miristilo, el palmitato de miristilo, el estearato de miristilo, el isoestearato de miristilo, el oleato de miristilo, el behenato de miristilo, el erucato de miristilo, el miristato de cetilo, el palmitato de cetilo, el estearato de cetilo, el isoestearato de cetilo, el oleato de cetilo, el behenato de cetilo, el erucato de cetilo, el miristato de estearilo, el palmitato de estearilo, el estearato de estearilo, el isoestearato de estearilo, el oleato de estearilo, el behenato de estearilo, el erucato de estearilo, el miristato de isoestearilo, el palmitato de isoestearilo, el estearato de isoestearilo, el isoestearato de isoestearilo, el oleato de isoestearilo, el behenato de isoestearilo, el miristato de oleilo, el palmitato de oleilo, el estearato de oleilo, el isoestearato de oleilo, el oleato de oleilo, el behenato de oleilo, el erucato de oleilo, el miristato de behenilo, el palmitato de behenilo, el palmitato de behenilo, el estearato de behenilo, el isoestearato de behenilo, el oleato de behenilo, el behenato de behenilo, el miristato de erucilo, el palmitato de erucilo, el estearato de erucilo, el isoestearato de erucilo, el oleato de erucilo, el behenato de erucilo y el erucato de erucilo. Junto a éstos, también son apropiados los ésteres de ácidos grasos C_6-C_{22} lineales con alcoholes polivalentes ramificados o no ramificados como por ejemplo el butilenglicol dicaprilato/dicaprato (Dermofeel® BGC) o ésteres del 2-metil-1,3-propandiol, del 1,1,1-trimetiloletoano o 1,1,1-trimetilpropano. Además son apropiados los ésteres de ácidos grasos C_6-C_{22} lineales con alcoholes ramificados, en especial el 2-etilhexanol, los ésteres de ácidos alquilhidroxi carboxílicos $C_{18}-C_{38}$ con alcoholes grasos C_6-C_{22} lineales o ramificados, en especial los malatos de dioctilo, los ésteres de ácidos grasos lineales y/o ramificados con alcoholes polivalentes (como por ejemplo el propilenglicol, el dimerdiol o el trimetriol) y/o alcoholes de Guerbet, los triglicéridos sobre base de ácidos grasos C_6-C_{10} , las mezclas líquidas de mono/di/triglicéridos sobre base de ácidos grasos C_6-C_{18} , los ésteres de alcoholes grasos C_6-C_{22} y/o los alcoholes de Guerbet con ácidos carboxílicos aromáticos, en especial el ácido benzoico, los ésteres de ácidos dicarboxílicos C_2-C_{12} con alcoholes lineales o ramificados con 1 a 22 átomos de carbono o polioles con 2 a 10 átomos de carbono y 2 a 6 grupos hidroxilos, los aceites vegetales, los alcoholes primarios ramificados, los ciclohexanos sustituidos, los carbonatos de alcoholes grasos C_6-C_{22} lineales y ramificados, como por ejemplo los carbonatos de dicaprililo (Cetiol® CC), los carbonatos de Guerbet sobre base de alcoholes grasos con 6 a 18, preferiblemente 8 a 10 átomos C, los ésteres del ácido benzoico con alcoholes C_6-C_{22} lineales y/o ramificados (por ejemplo Finsolv® TN), los ésteres de dialquilo lineales o ramificados, simétricos o asimétricos con 6 a 22 átomos de carbono por grupo alquilo, como por ejemplo el éter de dicaprililo (Cetiol® OE), los productos de abertura anular de ésteres de ácido graso epoxidados con polioles, aceites de silicona (la ciclometicona, tipos de meticona de silicio, entre otros) y/o los hidrocarburos alifáticos o nafténicos, como por ejemplo el escualano, el escualeno o los dialquilociclohexanos.

Emulsionantes

Como emulsionantes se consideran por ejemplo tensioactivos no ionógenos de al menos uno de los siguientes grupos:

- productos de adición de 2 a 30 mol de óxido de etileno y/o 0 a 5 mol de óxido de propileno en alcoholes grasos lineales con 8 a 22 átomos C, en ácidos grasos con 1 a 22 átomos C, en alquilfenoles con 8 a 15 átomos C en el grupo alquilo así como alquilaminas con 8 a 22 átomos de carbono en el resto de alquilo
- alquiloligoglicósidos con 8 a 22 átomos de carbono en el resto de alquilo y sus análogos etoxilados
- productos de adición de 1 a 15 mol de óxido de etileno en aceite de ricino y/o aceite de ricino endurecido
- productos de adición de 15 a 60 mol de óxido de etileno en aceite de ricino y/o aceite de ricino endurecido
- ésteres parciales de glicerina y/o sorbitan con ácidos grasos insaturados, lineales o saturados, ramificados con 12 a 22 átomos de carbono y/o ácidos hidroxicarboxílicos con 3 a 18 átomos de carbono así como sus aductos con 1 a 30 mol de óxido de etileno.
- ésteres parciales de poliglicerina (grado medio de condensación propia 2 a 8), polietilenglicol (peso molecular 400 a 5.000), trimetilolpropano, pentaeritrito, alcoholes de azúcar (por ejemplo sorbitol), alquilglucósidos (por ejemplo metilglucósido, butilglucósido, laurilglucósido) así como poliglucósidos (por ejemplo, celulosa) con ácidos grasos saturados y/o insaturados, lineales o ramificados con 12 a 22 átomos de carbono y/o ácidos hidroxicarboxílicos con 3 a 18 átomos de carbono y sus aductos con 1 a 30 mol de óxido de etileno
- ésteres mixtos de pentaeritrito, ácidos grasos, ácido cítrico y alcohol graso y/o ésteres mixtos de ácidos grasos con 6 a 22 átomos de carbono, metilglucosa y polioles, preferiblemente glicerina o poliglicerina
- Mono, di y trialquilfosfatos así como mono-, di- y/o tri-PEG-alquilfosfatos y sus sales

ES 2 285 584 T3

- alcoholes de lanolina
- polisiloxano-polialquil-poliéter-copolímeros o derivados correspondientes
- 5 - copolímeros en bloque, por ejemplo polietilenglicol-30-dipolihidroxi-estearato
- emulsionantes de polímero, por ejemplo tipos de Pemulen (TR-1, TR-2) de Goodrich
- polialquilenglicoles así como
- 10 - carbonato de glicerina.

- *Productos de adición de óxido de etileno*

15 Los productos de adición de óxido de etileno y/o de óxido de propileno en alcoholes grasos, ácidos grasos, alquilfenoles o en aceite de ricino representan productos conocidos, disponibles en el comercio. Se trata aquí de mezclas homólogas, cuyo grado medio de alcoxilación se corresponde con la proporción de las cantidades de sustancias de óxido de etileno y/o óxido de propileno y sustrato, con los que se realiza la reacción de adición. Mono y diésteres de 20 ácido graso C_{12/18} de productos de adición de óxido de etileno en glicerina son conocidos como agentes de reengrase para preparaciones cosméticas.

- *Ésteres de sorbitán*

25 Como ésteres de sorbitan entran en consideración el monoisoestearato de sorbitano, el sesquiiisoestearato de sorbitano, el diisoestearato de sorbitano, el triisoestearato de sorbitano, el monooleato de sorbitano, el sequioleato de sorbitano, el dioleato de sorbitano, el trioleato de sorbitano, el monoerucato de sorbitano, el sesquierucato de sorbitano, el dierucato de sorbitano, el trierucato de sorbitano, el monoricinolato de sorbitano, el sesquircinolato de sorbitano, el diricinolato de sorbitano, el triricinolato de sorbitano, el monohidroxiestearato de sorbitano, el monotartrato de sorbitano, el sesquitartrato de sorbitano, el ditartrato de sorbitano, el tritartrato de sorbitano, el monocitrato de sorbitano, el sesquitartrato de sorbitano, el dicitrato de sorbitano, el tricitrato de sorbitano, el monomaleato de sorbitano, el sesquimaleato de sorbitano, el dimaleato de sorbitano, el trimaleato de sorbitano así como sus mezclas técnicas. Igualmente son apropiados los productos de adición de 1 a 30, preferiblemente de 5 a 10 mol de óxido de etileno en los ésteres de sorbitano citados.

- *Ésteres de poliglicerina*

40 Ejemplos típicos apropiados para ésteres de poliglicerina son los poligliceril-3 estearatos (Dermofeel® PS), los poliglicerina-3-palmitatos (Dermofeel® PP), los poligliceril-6 caprilatos (Dermofeel® G 6 CY), los poligliceril-10 lauratos (Dermofeel® G 10 L), los poligliceril-2-lauratos (Dermofeel® G 2 L), los poligliceril-3-lauratos (Dermofeel® G 3 L), los poligliceril-5-lauratos (Dermofeel® G 5 L), los poligliceril-2 dipolihidroxiestearatos (Dehymuls® PGPH), los poliglicerina-3-diisostearatos (Lameform® TGI), los poligliceril-4 isostearatos (Isolan® GI 34), los poligliceril-3 metilglucosa diestearatos (lego Care® 450), la poligliceril-3 cera de abeja (Cera Bellina®), los poligliceril-4 capratos (capratos de poliglicerol T2010/90), los poligliceril-3 cetil éteres (Chimexane® NL), los poligliceril-3 diestearatos (Cremophor® G 32) y los poliricinoleatos de poliglicerilo (Dermofeel® PR) los poligliceril dimerato isoestearatos, así como sus mezclas. Ejemplos para otros poliolésteres apropiados son los mono, di y triésteres de trimetilopropano o pentaeritrilo transformados dado el caso 1 a 30 mol de óxido de etileno con ácido láurico, ácidos de grasa de coco, ácido de grasa de sebo, ácido palmítico, ácido esteárico, ácido oleico, ácido behénico y similares.

- *Emulsionantes aniónicos*

50 Emulsionantes aniónicos típicos son los ácidos grasos alifáticos con 12 a 22 átomos de carbono, como por ejemplo el ácido palmítico, el ácido esteárico o el ácido behénico, así como el ácido dicarboxílico con 12 a 22 átomos de carbono, como por ejemplo ácido azelaico o ácido sebáico.

- *Emulsionantes anfóteros y catiónicos*

60 Además pueden utilizarse tensioactivos zwitteriónicos como emulsionantes. Como tensioactivos zwitteriónicos se denominan aquellos compuestos tensioactivos que en la molécula llevan al menos un grupo amonio cuaternario y al menos un grupo carboxilato y un grupo sulfonato. Los tensioactivos zwitteriónicos especialmente apropiados son las llamadas betaínas como los N-alkil-NN-dimetilamonioglicinatos, por ejemplo el coco alquil dimetilamonioglicinato, los N-acilaminopropil-N,N-dimetilamonioglicinatos, por ejemplo el coco acil aminopropildimetilamonioglicinato, y la 2-alkil-3-carboximetil-3-hidroxiethylimidazolina con respectivamente 8 a 18 átomos C en el grupo alquilo o acilo, así como el coco acil aminoethylhidroxiethylcarboximetilglicinato. Especialmente adecuado es el derivado de amida de ácido graso conocido bajo la denominación CTFA cocoamidopropil betaína. Emulsionantes igualmente adecuados son los tensioactivos anfólicos. Por tensioactivos anfólicos se entienden aquellos compuestos tensioactivos que, salvo un grupo alquilo o acilo C_{8/18} en la molécula contienen al menos un grupo amino libre y al menos un grupo COOH

ES 2 285 584 T3

- o SO₃H y están capacitados para la formación de sales internas. Ejemplos para tensioactivos anfólicos adecuados son la N-alkil glicina, los ácidos N-alkil propiónicos, los ácidos N-alkil aminobutíricos, los ácidos N-alkil iminidipropiónico, la N-hidroxietil-N-alkilamidopropilglicina, las N-alkil taurinas, las N-alkil sarcosinas, los ácidos 2-alkil aminopropiónicos y los ácidos alkil aminoacéticos con cada uno aproximadamente 8 a 18 átomos C en el grupo alkilo. Los tensioactivos anfólicos especialmente preferidos son el N-coco alkil aminopropionato, el coco acil aminoetilaminopropionato y la acil sarcosina C_{12/18}. Finalmente, también se consideran como emulsionantes los tensioactivos catiónicos, siendo especialmente preferidos los del tipo del esterquat, preferiblemente las sales de ésteres de trietanolamina de ácido digraso cuaternizados con metilo.
- 10 Preferidos en el sentido de la invención son las preparaciones cosméticas y/o farmacéuticas, que contienen
- (a) 0'1 - 50% en peso de triheptanoína
 - (b) 0'1 - 20% en peso de tensioactivos y/o emulsionantes y/o coemulsionantes
 - (c) 0'1 - 40% en peso de otros cuerpos oleosos
 - (d) 0 - 98% en peso de agua
- 20 referido a la composición total.

Grasa y ceras

- 25 Se añaden grasas y ceras a los productos de cuidado corporal como productos de cuidado y también para aumentar la consistencia de los cosméticos. Ejemplos típicos para grasas son los glicéridos, es decir, productos sólidos o líquidos, vegetales o animales, que se componen esencialmente de ésteres de glicerina mezclados de ácidos grasos mayores. También los glicéridos parciales de ácido graso, es decir, los mono y/o diésteres técnicos de la glicerina con ácidos grasos con 12 a 18 átomos de carbono como por ejemplo mono/dilaurato, palmitato o estearato de glicerina se consideran para ello. Como ceras entran en consideración entre otras las ceras naturales, como por ejemplo cera de Candelilla, cera Carnaúba, cera del Japón, cera de esparto, cera de corcho, cera de guaruma, cera de aceite de germen de arroz, cera de caña de azúcar, cera Ouricury, cera de Montana, cera de abeja, cera de goma laca, esperma de ballena, lanolina (grasa de lana), grasa de rabadilla, cerasina, ozoquerita, petrolato, ceras de parafina, microceras; ceras modificadas químicamente (ceras duras), como por ejemplo ceras de ésteres de Montana, ceras Sasol, ceras de yoyoba hidrogenadas así como ceras sintéticas, como por ejemplo ceras de polialquileño y ceras de polietilenglicol. Junto a las grasas se consideran como aditivos también sustancias similares a la grasa, como las lecitinas y los fosfolípidos. Bajo la denominación lecitinas, el experto entiende aquellos glicerofosfolípidos que se forman mediante esterificación a partir de ácidos grasos, glicerina, ácido fosfórico y colina. Las lecitinas por lo tanto se denominan en el mundo científico frecuentemente también como fosfatidilcolinas (PC). Como ejemplos para lecitinas naturales se nombran las cefalinas, que se denominan también ácidos fosfatídicos y representan derivados de los ácidos 1,2-diacil-sn-glicerina-3-fosfóricos. Con respecto a ello, se entiende por fosfolípidos habitualmente los monoésteres y preferiblemente los diésteres del ácido fosfórico con glicerina (fosfatos de glicerina), que se cuentan por lo general entre las grasas. Junto a éstos, también se consideran las esfingosinas o los esfingolípidos.

Ceras de brillo perlado

- 45 Como ceras de brillo perlado se consideran por ejemplo: los ésteres de alkilenglicol, especialmente el diestearato de etilenglicol; las alcanolamidas de ácido graso, especialmente la dietanolamida de ácido graso de coco; los glicéridos parciales, especialmente el monoglicérido de ácido esteárico; los ésteres de ácidos carboxílicos polivalentes, dado el caso hidroxil sustituidos, con alcoholes grasos con 6 a 22 átomos de carbono, especialmente ésteres de cadena larga del ácido tartárico; sustancias grasas, como por ejemplo los alcoholes grasos, las cetonas grasas, los aldehídos grasos, los éteres grasos y los carbonatos grasos, que presentan en total al menos 24 átomos de carbono, especialmente Lauron y éter diestearílico; los ácidos grasos como el ácido esteárico, el ácido hidroxiesteárico o el ácido behénico, los productos de apertura de anillo de epóxidos de olefina con 12 a 22 átomos de carbono con alcoholes grasos con 12 a 22 átomos de carbono y/o polioles con 2 - 15 átomos de carbono y 2 a 10 grupos hidroxilos así como sus mezclas.

Estabilizantes y agentes espesantes

- 60 Como otros estabilizantes se consideran en primer lugar los alcoholes grasos o los alcoholes hidroxigrasos con 12 a 22 y preferiblemente 16 a 18 átomos de carbono y, junto a ellos, los glicéridos parciales, los ácidos grasos o los ácidos hidroxigrasos. Preferida es una combinación de estas sustancias con alkiloligoglucósidos y/o ácido graso-N-metilglucamidas de la misma longitud de cadena y/o poliglicerina poli-12-hidroxiestearatos. Espesantes adecuados son por ejemplo tipos de Aerosil (ácido silícico hidrófilo), los polisacáridos, en especial la goma xantano, guar-guar, agar-agar, los alginatos y las tilosas, la carboximetilcelulosa y la hidroxietil e hidroxipropilcelulosa, además mono y diésteres de mayor peso molecular de polietilenglicol de ácidos grasos, los poliácridatos (por ejemplo Carbopole® y tipos de Permulene de Goodrich; Synthalene® de Sigma; tipos de Keltrol de Kelco; tipos de Sepigel de Seppic; tipos de Salcare de Allied Colloids), las poliácridamidas, los polímeros, el alcohol polivinílico y la polivinilpirrolidona. Como especialmente eficaces se han mostrado también la bentonita, como por ejemplo el gel VS-5PC de Bentone® (Rheox),

ES 2 285 584 T3

en el que se trata de una mezcla de ciclopentasiloxano, hectorita de diestardimonio y carbonato de propileno. Además, se consideran tensioactivos como por ejemplo los glicéridos de ácido graso etoxilados, los ésteres de ácidos grasos con polioles como por ejemplo el pentaeritrito o el trimetilolpropano, etoxilados de alcohol graso con una repartición de homólogos apropiada o alquiloligoglucósidos, así como electrolitos como cloruro sódico y cloruro de amonio.

5

Sobreengrasantes

Como sobreengrasantes pueden utilizarse sustancias como por ejemplo la lanolina y la lecitina así como derivados polietoxilados o acilados de la lanolina y la lecitina, los poliolésteres de ácido graso, los monoglicéridos y las alcanolamidas de ácido graso, sirviendo las últimas al mismo tiempo como estabilizantes de espuma.

10

Estabilizantes

Como estabilizantes pueden utilizarse sales metálicas de ácidos grasos, como por ejemplo estearato o ricinoleato de magnesio, de aluminio y/o de cinc.

15

Polímeros

Polímeros catiónicos adecuados son por ejemplo derivados catiónicos de la celulosa, como por ejemplo una hidroxietilcelulosa cuaternizada, que está disponible bajo la denominación Polymer JR 400[®] de Amerchol, almidón catiónico, copolímeros de sales de dialil amonio y acrilamidas, polímeros cuaternizados de vinilpirrolidona/vinilimidazol, como por ejemplo Luviquat[®] (BASF), productos de condensación de poliglicoles y aminas, polipéptidos de colágeno cuaternizados, como por ejemplo colágeno hidrolizado de hidroxipropil laurildimonio (Lamequat[®] L/Grünau), polipéptidos de trigo cuaternizados, polietilenimina, polímeros catiónicos de silicona, como por ejemplo amodimeticonas, copolímeros del ácido adipínico y dimetilaminohidroxipropildietilentriamina (Cartaretine[®]/Sandoz), copolímeros del ácido acrílico con cloruro de dimetildialilamonio (Merquat[®] 550/Chemviron), poliaminopoliamidas así como sus polímeros reticulados hidrosolubles, derivados catiónicos de la quitina como por ejemplo el quitosano cuaternizado, dado el caso distribuido en forma microcristalina, productos de condensación de dihalógeno alquileo, como por ejemplo dibromobutano con bis dialquilaminas, como por ejemplo bis dimetilamino-1,3-propano, goma guar catiónica, como por ejemplo Jaguar[®] CBS, Jaguar[®] C-17, Jaguar[®] C-16 de la empresa Celanese, polímeros cuaternizados de sal de amonio, como por ejemplo Mirapol[®] A-15, Mirapol[®] AD-1, Mirapol[®] AZ-1 de la empresa Miranol.

20

25

30

Como polímeros aniónicos, zwitteriónicos, anfóteros y no iónicos se consideran por ejemplo copolímeros de vinilacetato/ácido crotonico, copolímeros de vinilpirrolidona/vinilacrilato, copolímeros de vinilacetato/ butilmaleato/isobornilacrilato, copolímeros de metilviniléter/anhídrido de ácido maleico y sus ésteres, ácidos poliacrílicos no reticulados y reticulados con polioles, copolímeros de cloruro de acrilamidopropiltrimetilamonio/de acrilato, copolímeros de octilacrilamida/-metilmecacrilato/tert-butilaminoetil metacrilato/2-hidroxipropilmetacrilato, polivinilpirrolidona, copolímeros de vinilpirrolidona/vinilacetato, terpolímeros de vinilpirrolidona/dimetilaminoetil metacrilato/vinilcaprolactama así como dado el caso éteres de celulosa derivados y siliconas.

35

40

Compuestos de silicona

Compuestos de silicona adecuados son por ejemplo el dimetilpolisiloxano, los metilfenilpolisiloxanos, las siliconas cíclicas así como los compuestos de silicona amino modificados, modificados por ácido graso, por alcohol, por poliéter, por epoxi, por flúor, por glicósido y/o por alquilo, que pueden existir a temperatura ambiente tanto líquidos como en forma de resina. Además son adecuadas las simeticonas, en las que se trata de mezclas de dimeticonas con una longitud de cadena media de 200 a 300 unidades de dimetilsiloxano y silicatos hidratados.

45

Filtros de fotoprotección UVA y antioxidantes

50

Junto a los filtros UVA según la invención pueden existir otros filtros UV en las formulaciones según la invención. Los filtros UV-B pueden ser solubles en aceite o solubles en agua. Como sustancias solubles en aceite se pueden nombrar por ejemplo:

55

- el 3-bencilideno alcanfor o el 3-3-bencilideno nor alcanfor y sus derivados, por ejemplo el 3-(4-metilbencilideno)alcanfor como se describe en la memoria de patente EP 0693471 B1.

60

- Derivados del ácido 4-aminobenzoico, preferiblemente el 2-etilhexil éster del ácido 4-(dimetilamino)benzoico, el octil éster del ácido 4-(dimetilamino)benzoico y el 2-amil éster del ácido 4-(dimetilamino)benzoico.

65

- Ésteres del ácido cinámico, preferiblemente el 2-etilhexil éster del ácido 4-metoxicinámico, el propil éster del ácido 4-metoxicinámico, el isoamil éster del ácido 4-metoxicinámico o el 2-etilhexil éster del ácido 2-ciano-3,3-fenilcinámico (octocrileno)

- Ésteres del ácido salicílico, preferiblemente el 2-etilhexil éster del ácido salicílico, el 4-isopropilbencil éster del ácido salicílico o el homomentil éster del ácido salicílico

ES 2 285 584 T3

- Derivados de la benzofenona, preferiblemente la 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, la 2-hidroxi-4'-metoxibenzofenona, la 2,2'-dihidroxi-4-metoxibenzofenona
- Ésteres del ácido benzalmalónico, preferiblemente el di-2-etilhexil éster del ácido 4-metoxibenzalmalónico
- Derivados de la triacina como por ejemplo la dioctil butamido triazona (Uvasorb HEB)
- Derivados del cetotriciclo(5.2.1.0)decano, como está descrito en la EP 0694521 B1.

Como sustancias hidrosolubles se consideran:

- el ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico y sus sales alcalinas, alcalinotérricas, de amonio, de alquilamonio, de alcanolamonio y de glucamonio
- Derivados del ácido sulfónico de benzofenona, preferiblemente el ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona-5-sulfónico y sus sales
- Derivados del ácido sulfónico del bencilideno alcanfor, como por ejemplo el ácido 4-(2-oxo-3-bornilidenmetil)benzolsulfónico y el ácido 2-metil-5-(2-oxo-3-borniliden)sulfónico y sus sales.

Como filtros UV-A típicos entran en consideración en especial los derivados del benzoilmetano, como por ejemplo la 1-fenil-3-(4'isopropilfenil)-propano-1,3-diona así como compuestos de enamina, como se describe en la DE 19712033 A1. Los filtros UV-A y UV-B pueden emplearse por supuesto también en mezclas. De manera ventajosa, se combinan combinaciones de este tipo con filtros solubles en agua como por ejemplo el ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico y sus sales alcalinas, alcalinotérricas, de amonio, de alquilamonio, de alcanolamonio y de glucamonio.

Junto a las sustancias solubles citadas se consideran para este objetivo también los pigmentos fotoprotectores insolubles, es decir, óxidos metálicos o sales en dispersión fina. Ejemplos para óxidos metálicos adecuados son en especial el dióxido de titanio y el óxido de cinc y además los óxidos de hierro, de circonio, de silicio, de mangano, de aluminio y cerio así como sus mezclas. Como sales pueden utilizarse silicatos (talco), sulfato de bario o estearato de cinc. Los óxidos y sales son utilizados en forma de los pigmentos para emulsiones para el cuidado y la protección de la piel de la cosmética decorativa. Las partículas deben presentar en este caso un diámetro intermedio de menos de 100 nm, preferiblemente entre 5 y 50 nm y en especial entre 15 y 30 nm. Pueden presentar una forma esférica, no obstante pueden emplearse también tales partículas que posean una forma elipsoide o, de lo contrario, una forma diferente a la configuración esférica. Los pigmentos pueden estar presentes también tratados en la superficie, es decir, hidrofílicos o hidrofobizados. Ejemplos típicos son los dióxidos de titanio revestidos, como por ejemplo el dióxido de titanio T 805 de la empresa Degussa o Eusolex T 2000 de la empresa Merck. Como revestimiento hidrófobo se consideran aquí sobre todo las siliconas y, en este caso, en especial los trialkoxi-octilsilanos o las simeticonas. En protectores solares se emplean preferiblemente los llamados micro o nanopigmentos. Preferiblemente se utiliza el óxido de cinc micronizado.

Junto a los dos grupos previamente citados de sustancias fotoprotectoras primarias pueden emplearse también fotoprotectores secundarios del tipo de antioxidantes, que interrumpen la cadena de reacción fotoquímica, la cual es provocada si la radiación UVA daña penetra en la piel. Ejemplos típicos para ello son el aminoácido (por ejemplo la histidina, la tirosina o el triptófano) y sus derivados, los imidazoles (por ejemplo, el ácido urocánico) y sus derivados, péptidos como la D,L-Carnosina, la D-Carnosina, la L-Carnosina y sus derivados, los carotinoides, los carotenos (por ejemplo, la α -carotina, la β -carotina, la lycopina) y sus derivados, el ácido lipoico y sus derivados (por ejemplo, el ácido dihidrolipoico), la aurotioglucosa, el propiltiouracil y otros tioles (por ejemplo la tioredoxina, el glutatión, la cisteína, la cistina, la cisteamina y sus glicósidos, N-acetil, metil, etil, propil, amil, butil, lauril, palmitoil, oleil, α -linoleil ésteres, ésteres de ácido linólico, colesterilo y glicerilo) así como sus sales, el dilauriltiopropionato, el diesteariltiodipropionato, el ácido tioldipropiónico y sus derivados (ésteres, éteres, péptidos, lípidos, nucleótidos, nucleósidos y sales) así como compuestos de sulfoximina (por ejemplo la butionina sulfoximina, la homocisteína sulfoximina, las butionina sulfoxinas, la penta, hexa, heptationina sulfoximina) en dosificaciones tolerables muy reducidas (por ejemplo pmol hasta μ mol), además formadores de complejos como por ejemplo los ácidos D-hidroxiácidos, el ácido palmítico, el ácido fítico, la lactoferrina), los ácidos α -hidroxilados (por ejemplo, el ácido cítrico, el ácido láctico, el ácido málico), el ácido humínico, el ácido biliar, los extractos biliares, la bilirrubina, la biliverdina, el AEDT, el EGTA y sus derivados, los ácidos grasos insaturados y sus derivados (por ejemplo el ácido α -linoléico, el ácido linoleico, el ácido oleico), el ácido fáltico y sus derivados, la ubiquinona y el ubiquinol y sus derivados, la vitamina C y derivados (por ejemplo, el ascorbil palmitato, el magnesio ascorbil fosfato, el ascorbil acetato), los tocoferoles (por ejemplo, el α -tocoferol, el β -tocoferol, el γ -tocoferol) y sus derivados (el tocoferil acetato), la vitamina A y derivados (la vitamina A palmitato) así como el benzoato de coniferilo de la resina benzoica, el ácido rutínico y sus derivados, la α -glicosil rutina, el ácido de férula, el furfuralideno glucitol, la carnosina, el butilhidroxitoluol, el butilhidroxianisol, el ácido nordihidro-guarjak de resina, el ácido nordihidro-guarjaret, la trihidroxibutirofenona, el ácido úrico y sus derivados, la manosa y sus derivados, la esperóxido dismutasa, el cinc y sus derivados (ZnO , $ZnSO_4$), el selenio y sus derivados (por ejemplo, la selenio metionina), el estilbena y sus derivados (por ejemplo, el óxido de estilbena, el óxido de trans-estilbena) y los derivados apropiados según la invención (sales, ésteres, éteres, azúcares, nucleótidos, nucleósidos, péptidos y lípidos) de estas sustancias activas nombradas.

Sustancias activas biógenas

Por sustancias activas biógenas se entienden por ejemplo el tocoferol, el tocoferol acetato, el tocoferol palmitato, el ácido ascórbico, el ácido (desoxi) ribonucleico y sus productos de fragmentación, los α -glucanos, el retinol, el bisabolol, la alantoína, el fitantriol, el pantenol, los ácidos AHA, los aminoácidos, las ceramidas, las pseudoceramidas, los aceites esenciales, los extractos vegetales, como por ejemplo el extracto de almendra amarga, el extracto de nuez de bambara y los complejos vitamínicos.

Desodorantes y medios inhibidores de gérmenes

Los desodorantes cosméticos (desodorantes) actúan contra los olores corporales, los cubren o los eliminan. Los olores corporales se producen a través del efecto de bacterias de la piel sobre el sudor apocrino, formándose productos de descomposición de olor desagradable. Conforme a ello, los desodorantes contienen sustancias activas que actúan como medios inhibidores de gérmenes, inhibidores de enzimas, absorbentes de olores o cubridores de olores.

- Medios inhibidores de gérmenes

Como medios inhibidores de gérmenes son adecuadas básicamente todas las sustancias eficaces contra bacterias gram-positivas, como por ejemplo el ácido 4-hidroxibenzoico y sus sales y ésteres, la N-(4-clorofenil)-N'-(3,4-diclorofenil)urea, el éter 2,4,4'-triclora-2'-hidroxi-difenílico (triclosano), el 4-cloro-3,5-dimetilfenol, el 2,2'-metilen-bis(6-bromo-4-clorofenol), el 3-metil-4-(1-metiletil)-fenol, el 2-bencil-4-clorofenol, el 3-(4-clorofenoxi)-1,2-propandiol, el 3-iodo-2-propinilbutilcarbamato, la clorohexidina, la 3,4,-'triclorocarbanilida (TTC), sustancias odoríferas antibacterianas, el timol, el aceite de tomillo, el eugenol, el aceite de claveles, el mentol, el aceite de menta, el farnesol, el fenoxietanol, el monocaprinato de glicerina, el monocaprilato de glicerina, el monolaurato de glicerina (GML), el monocaprinato de diglicerina (DMC), el ácido salicílico-N-alkilamidas como por ejemplo el ácido salicílico-n-octilamida o el ácido salicílico-n-decilamida.

- Inhibidores de enzimas

Como inhibidores de enzimas son adecuados por ejemplo los inhibidores de la esterasa. En este caso, se trata preferiblemente de citratos de trialquilo como el citrato de trimetilo, el citrato de tripropilo, el citrato de triisopropilo, el citrato de tributilo y en especial el citrato de trietilo (Hydagen® CAT). Las sustancias inhiben la actividad enzimática y reducen a través de ello la formación de olores. Otras sustancias que se consideran como inhibidores de la esterasa son los sulfatos de esteroles o fosfatos de esteroles, como por ejemplo el sulfato o el fosfato de lanosterina, de colesterol, de campesterina, de estigmasterina y de sitosterina, los ácidos dicarboxílicos y sus ésteres, como por ejemplo el ácido glutárico, los ésteres monoetílicos del ácido glutárico, los ésteres dietílicos del ácido glutárico, el ácido adipínico, los ésteres monoetílicos del ácido adipínico, los ésteres dietílicos del ácido adipínico, el ácido malónico y los ésteres dietílicos del ácido malónico, los ácidos hidroxicarboxílicos y sus ésteres como por ejemplo el ácido cítrico, el ácido málico, el ácido tartárico o los ésteres dietílicos del ácido tartárico, así el como el glicinato de cinc.

- Absorbentes de olores

Como absorbentes de olores sirven sustancias que absorben compuestos que producen olor y que los pueden retener en gran medida. Éstos reducen la presión parcial de los componentes individuales y reducen así también su velocidad de difusión. Es importante que al suceder esto los perfumes deban permanecer no perjudicados. Los absorbentes de olores no tienen eficacia contra las bacterias. Éstos contienen por ejemplo como componente principal una sal de cinc compleja del ácido ricinoleico o sustancias odoríferas especiales en gran medida de olor neutro que sean conocidas para el experto como "fijadores", como por ejemplo extractos de labdano o stirax o determinados derivados del ácido abietínico. Como cubridores de olores actúan las sustancias odoríferas o aceites de perfume, que de manera adicional a su función como cubridores de olores confieren su nota de fragancia respectiva a los desodorantes. Como aceites de perfume se pueden nombrar por ejemplo mezclas de sustancias odoríferas naturales y sintéticas. Sustancias odoríferas naturales son los extractos florales, tallos y hojas, frutos, cáscaras de fruta, raíces, maderas, plantas y hierbas, pinos y ramas así como resinas y bálsamos. Además entran se consideran las materias primas animales, como por ejemplo la algalia y el castóreo. Compuestos de sustancias odoríferas sintéticos típicos son productos del tipo de los ésteres, éteres, aldehídos, cetonas, alcoholes e hidrocarburos. Compuestos de sustancias odoríferas del tipo de los ésteres son por ejemplo el acetato de bencilo, el acetato de p-tert-butilciclohexilo, el acetato de linalilo, el acetato de feniletilo, el benzoato de linalilo, el formiato de bencilo, el propionato de alil ciclohexilo, el propionato de estiralilo, y el salicilato de bencilo. A los éteres pertenecen por ejemplo el éter benciletílico, a los aldehídos pertenecen por ejemplo los alcanos lineales con 8 a 18 átomos de carbono, el citral, citronellal, citroneliloxiacetaldehído, aldehído de ciclamen, hidroxicitronelal, lialil y bourgeonal, a las cetonas por ejemplo las yoyonas y la metilcedrilcetona, a los alcoholes el anetol, el citronelol, el eugenol, el isoeugenol, el geraniol, el linalool, el alcohol feniletílico y el terpineol, a los hidrocarburos pertenecen principalmente los terpenos y los bálsamos. Preferiblemente son utilizadas no obstante mezclas de diferentes sustancias odoríferas que produzcan de manera conjunta una nota de fragancia agradable. También los aceites etéricos de escasa volatilidad, que se usan en la mayoría de los casos como componentes aromáticos, sirven como aceites de perfume, por ejemplo el aceite de salvia, el aceite de camomila, el aceite de claveles, el aceite de melisa, el aceite de menta, el aceite de hojas de canela, el aceite de flores de tila, el aceite de enebrina, el

ES 2 285 584 T3

aceite de vetiver, el aceite de olíbano, el aceite de gálbano, el aceite de labdano y el aceite de lavandina. Preferiblemente son utilizados el aceite de bergamota, el dihidromircenol, el lialial, el lyral, el citronelol, el alcohol feniletílico, el α -aldehído hexilcinámico, el geraniol, la acetona de bencilo, el aldehído de ciclamen, el linalool, el Boisambrene Forte, el ambroxan, el indol, la hediona, el sandelice, el aceite de limón, el aceite de mandarina, el aceite de naranja, el glicolato de alilamilo, el cyclovertal, el aceite de lavandina, el aceite de salvia de moscatel, la α -damascona, el aceite de geranio Bourbon, el salicilato de ciclohexilo, el Vertofix Couer, el Iso-E-Super, el Fixolid NP, el Evernyl, el Iraldein gamma, el ácido fenilacético, el acetato de geraniol, el acetato de bencilo, el óxido de rosas, el Romilat, el Irotyl y el floramato solo o en mezclas.

10 - *Antitranspirantes*

Los antitranspirantes (antiperspirantes) reducen la formación de sudor mediante la influencia de la actividad de las glándulas sudoríparas ecrinas y actúan por consiguiente contra la humedad de axilas y el olor corporal. Las formulaciones acuosas o anhidras de antitranspirantes contienen típicamente las siguientes sustancias de contenido:

- 15 - sustancias activas adstringentes
- componentes oleosos
- 20 - emulsionantes no iónicos
- coemulsionantes
- estabilizantes
- 25 - sustancias auxiliares como por ejemplo espesantes o medios complejantes y/o
- disolventes no acuosos como por ejemplo el etanol, el propilenglicol y/o la glicerina.

30 Como sustancias activas antitranspirantes adstringentes sirven ante todo las sales del aluminio, del circonio o del zinc. Tales sustancias activas antihidroticas eficaces apropiadas son por ejemplo el cloruro de aluminio, el clorhidrato de aluminio, el diclorhidrato de aluminio, el sesquiclorhidrato de aluminio y sus compuestos complejos, por ejemplo con el propilenglicol-1,2, el hidroxialantoinato de aluminio, el tartrato de cloruro de aluminio, el triclorhidrato de aluminio-circonio, el tetraclorhidrato de aluminio-circonio, el pentaclorhidrato de aluminio-circonio y sus compuestos complejos, por ejemplo con aminoácidos como la glicina. Junto a éstos, pueden estar contenidas en cantidades reducidas en los antitranspirantes sustancias auxiliares solubles en aceite e hidrosolubles habituales. Tales sustancias auxiliares solubles en aceite pueden ser por ejemplo:

- 40 - Aceites etéricos antiinflamatorios, protectores de la piel o de olor agradable
- Sustancias activas sintéticas protectoras de la piel y/o
- Aceites de perfume solubles en aceite.

45 Adiciones hidrosolubles habituales son por ejemplo los conservantes, las sustancias aromáticas hidrosolubles, agentes de ajuste del valor del pH, por ejemplo mezclas de tampón, agentes espesantes hidrosolubles, por ejemplo polímeros naturales o sintéticos hidrosolubles como por ejemplo la goma xantano, la hidroxietilcelulosa, la polivinilpirrolidona o los óxidos de polietileno de alto peso molecular.

50 *Formadores de película*

Formadores de película usuales son por ejemplo el quitosano, el quitosano microcristalino, el quitosano cuaternizado, la polivinilpirrolidona, los copolimerizados de vinilpirrolidona-vinilacetato, los polímeros de la serie del ácido acrílico, los derivados cuaternarios de la celulosa, el colágeno, el ácido hialurónico o sus sales y compuestos similares.

Sustancias activas anticaspa

60 Como sustancias activas anticaspa se consideran la piroctona olamina (sal de monoetanolamina 1-hidroxi-4-metil-6-(2,4,4-trimetilpentil)-2-(1H)-piridinona), la Baypival® (climbazol), la Ketoconazol®, (4-acetil-1-{4-[2-(2,4-diclorofenil)-r-2-(1H-imidazol-1-ilmetil)-1,3-dioxilano-c-4-ilmetoxifenil]piperazina, el elubiol, el disulfuro de selenio, el azufre coloidal, el monooleato de polietilenglicol sorbitano de azufre, el ricinolpolietoxilato de azufre, destilados de azufre-alquitrán, el ácido salicílico (o en combinación con hexaclorofenos), la sal sódica del ácido undecilénico monoetanolamida sulfosuccinato, la Lampeon® UD (condensado de proteína-ácido undecilénico), la piritona de zinc, la piritona de aluminio y la piritona de magnesio/sulfato de dipiritona-magnesio.

ES 2 285 584 T3

Agente hinchante

Como agentes hinchantes para fases acuosas pueden servir la montmorillonita, las sustancias minerales de arcillas, Pemulen así como tipos de carbopol aiquil modificados (Goodrich). Otros polímeros adecuados o agentes hinchantes pueden extraerse del cuadro sinóptico de R. Lochhead en *Cosm. Toil.* 108,95 (1993).

Repelentes de insectos

Como repelentes de insectos se consideran por ejemplo la N,N-dietil-m-toluamida, el 1,2-pentandiol o el éster etílico del ácido 3-(N-n-butil-N-acetil-amino)-propiónico), el cual se comercializa bajo la denominación Insect Repellent® 3535 de la empresa Merck KGaA, así como los aminopropionatos de butilacetilo.

Autobronceadores y agentes de despigmentación

Como autobronceador es apropiada la dihidroxiacetona. Como inhibidores de la tirosinina, que impiden la formación de melanina y que se aplican en agentes de despigmentación, se consideran por ejemplo la arbutina, el ácido de férula, el ácido kójico, el ácido cumarínico y el ácido ascórbico (vitamina C).

Hidrótropos

Para la mejora del comportamiento de flujo pueden emplearse además hidrótropos, como por ejemplo el etanol, el alcohol isopropílico o los polioles. Los polioles que se consideran aquí poseen preferiblemente 2 a 15 átomos de carbono y al menos dos grupos hidroxilos. Los polioles pueden contener aún otros grupos funcionales, en especial grupos amino, o pueden estar modificados con nitrógeno.

Ejemplos típicos son:

- la glicerina
- los alquilenglicoles, como por ejemplo el etilenglicol, el dietilenglicol, el propilenglicol, el butilenglicol, el hexilenglicol, el 1, 2-hexandiol y el caprilil glicol así como los polietilenglicoles con un peso molecular medio de 100 a 1.000 Dalton.
- mezclas técnicas de oligoglicerina con un grado de condensación propio de 1' 5 a 10% como por ejemplo mezclas de diglicerina técnicas con un contenido en diglicerina de 40 a 50% en peso
- compuestos de metilol, como en especial el trimetiloetano, el trimetilopropano, el trimetilobutano, el pentaeritrito y el dipentaritrito
- alquilglucósidos bajos, en especial aquellos con 1 a 8 carbonos en el resto alquilo, como por ejemplo el metil y el butilglucósido
- alcoholes de azúcar con 5 a 12 átomos de carbono, como por ejemplo el sorbitol o la manita
- azúcar con 5 a 12 átomos de carbono, como por ejemplo la glucosa o la sacarosa
- aminoazúcar, como por ejemplo la glucamina
- aminas de dialcohol, como la dietanolamina o el 2-amino-1,3-propandiol.

Conservantes

Como conservantes sirven por ejemplo el fenoxietanol, la solución de formaldehído, los parabenos, el pentandiol o el ácido sórbico así como los complejos de plata conocidos bajo la denominación Surfactive® y las otras clases de sustancias enumeradas en el anexo 6, Parte A y B del reglamento de cosmética.

Aceites de perfume y aromas

Como aceites de perfume una mezcla nombrada de sustancias odoríferas naturales y sintéticas. Sustancias odoríferas naturales son extractos de flores (azucena, lavanda, rosas, jazmín, neroli, ylang-ylang), tallos y hojas (geranio, pachulí, petitgrain), frutos (anís, cilantro, comino, enebro), cáscaras de fruta (bergamotas, limón, naranja), raíces (Maccis, Angélica, apio, cardamomo, Costus, iris, Calmus), maderas (madera de pino, de sándalo, de guayaco, de cedro, palo de rosa), plantas y hierbas (estragón, citronela, salvia, tomillo), pinos y ramas (píceas, abeto, pino, pino carrasco), resinas y bálsamos (gálbano, elemí, benzoína, mirra, olíbano, opoponax). Además se consideran materias primas animales, como por ejemplo la algalia y el castoreo. Los compuestos de sustancias odoríferas sintéticas típicos son productos del tipo de los ésteres, éteres, aldehídos, cetonas, alcoholes e hidrocarburos. Compuestos de sustancias odo-

ríferas del tipo de los ésteres son por ejemplo el acetato de bencilo, el isobutirato de fenoxietilo, el acetato de p-ter-
 butilciclohexilo, el acetato de linalilo, el acetato de dimetilbencilcarbinilo, el acetato de feniletilo, el benzoato de lina-
 lilo, el formiato de bencilo, el glicinato de etilmetilfenilo, el propionato de alilciclohexilo, el propionato de estiralilo y
 el salicilato de bencilo. A los éteres pertenece por ejemplo el éter benciletílico, a los aldehídos por ejemplo los alcanos
 5 lineales con 8 a 18 átomos de carbono, el citral, el citronellal, el citroneliloxiacetaldehído, el aldehído ciclamen, el
 hidroxicitronelal, el lilial y el bourgeonal, a las cetonas pertenecen por ejemplo las yoyonas, la □-ilsometilionona y la
 metilcedrilcetona, a los alcoholes el anetol, el citronelol, el eugenol, el isoeugenol, el geraniol, el linalool, el alcohol
 feniletílico y el terpineol, a los hidrocarburos pertenecen principalmente los terpenos y los bálsamos. Sin embargo,
 se utilizan preferiblemente mezclas de diferentes sustancias odoríferas que generen de manera conjunta una nota de
 10 fragancia agradable. También los aceites etéricos de escasa volatilidad, que se utilizan en la mayoría de los casos co-
 mo componentes aromáticos, sirven como aceites de perfume, por ejemplo el aceite de salvia, el aceite de camomila,
 el aceite de claveles, el aceite de melisa, el aceite de menta, el aceite hojas de canela, el aceite de flores de tila, el
 aceite de enebrina, el aceite de vetiver, el aceite de olíbano, el aceite de gálbano, el aceite de labdano y el aceite de
 lavandina. Preferiblemente se emplean el aceite de bergamota, el dihidromircenol, el lilial, el lyral, el citronelol, el
 15 alcohol feniletílico, el □-aldehído hexilcinámico, el geraniol, la acetona de bencilo, el aldehído ciclamen, el linalool,
 el Boisambrene Forte, el ambroxan, el indol, la hediona, el sandelice, el aceite de limón, el aceite de mandarina, el
 aceite de naranja, el glicolato de alilamilo, el cyclovertal, el aceite de lavandina, el aceite de salvia de moscatel, la □-
 damascona, el aceite de geranio Bourbon, el salicilato de ciclohexilo, el Vertofix Coeur, el Iso-E-Super, el Fixolide
 NP, el Evernyl, el Iraldein gamma, el ácido fenilacético, el acetato de geraniol, el acetato de bencilo, el óxido de rosas,
 20 el Romilat, el Irotlyl y el floramato solo o en mezclas.

Como aromas se consideran por ejemplo el aceite de menta, el aceite de menta rizada, el aceite de anís, el aceite de
 anís estrellado, el aceite de comino, el aceite de eucalipto, el aceite de hinojo, el aceite de limón, el aceite de eburnea,
 el aceite de claveles, el mentol y similares.

25 *Colorantes*

Como colorantes pueden utilizarse sustancias apropiadas y permitidas para usos cosméticos. Ejemplos son el rojo
 de cochinilla A (C.I. 16255), el azul patente V (C.I. 42051), la indigotina (C.I. 73015), la clorofilina (C.I. 75810), el
 30 amarillo de quinolona (C.I. 47005), el dióxido de titanio (C.I. 77891), el azul idantreno RS (C.I. 69800) y laca granza
 (C.I. 58000). Como colorante luminiscente puede ser contenido también luminol.

Las formulaciones según la invención pueden ser producidas de manera correspondiente con el estado de la técnica.
 A continuación, se citan algunos ejemplos que deben aclarar la presente invención, sin limitar la misma.

35

Leche solar aceite/agua		
		%
40	A	Agua
		hasta 100
		Glicerina
		3'5
		Conservantes
		c.s.
45	B	Citrato de gliceril estearato
		2'5
		Triheptanoína
		12'0
		Etilhexil metoxicinamato
		2'0
50		Butil metoxidibenzoilmetano
		2'0
		Bis-etilhexiloxifenol-metoxifenil-triazina
		1'0
		Isoamil metoxicinamato
		5'0
		Estearato de glicerilo
		2'0
55		Alcohol cetearílico
		1'0
	C	Carbómero sódico
		0'2
	D	Perfume
		c.s.

60

65

ES 2 285 584 T3

Leche solar agua/aceite		
		%
A	Agua	hasta 100
	Glicerina	2'0
	Sulfato de magnesio	0'7
B	Triheptanoína	12'0
	Etilhexil metoxicinamato	7'0
	Butilmetoxidibenzoilmetano	1'0
	Etilhexil triazona	2'0
	PEG-30 Dipolihidroxiestearato	3'0
	Estearato de magnesio	0'5
	Acetato de tocoferilo	1'0
	Hectorita de diestearidimonio	0'3
	DC 345	10'0
	Conservantes	c.s.
	Perfume	c.s.

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

REIVINDICACIONES

5 1. Preparaciones fotoprotectoras cosméticas y dermatológicas que contienen una combinación de sustancias activas, compuestas por uno o varios filtros UVA del grupo compuesto por 2,9,6-trianilino-p-(carbo-2'-etilhexil-1'oxi)-1,3,5-triazina (etilhexil triazona), 1-(4-tert-butilfenil)-3-(4-metoxifenil)-propano-1,3-diona (butilmetoxidibenzoilmetano), bis-octiloxi-fenol-metoxifenil-triazina (bis-etilhexiloxifenol metoxifenil-triazina) y la triheptanoína.

10 2. Combinación según la reivindicación 1 **caracterizada** por el hecho de que la 2,4,6-trianilino-p-(carbo-2'-etilhexil-1'oxi)-1,3,5-triazina (etilhexil triazona) está contenida en la preparación fotoprotectora cosmética o dermatológica lista en una concentración de 0'1% - 10%, preferiblemente 0'5% - 6'0% referida al peso total de la formulación.

15 3. Combinación según la reivindicación 2 **caracterizada** por el hecho de que la triheptanoína está contenida en la preparación fotoprotectora cosmética o dermatológica lista en una concentración de 0'1% - 50%, preferiblemente 0'5% - 15'0% referida al peso total de la formulación.

20 4. Combinación según la reivindicación 1 **caracterizada** por el hecho de que el 1-(4-tert-butilfenil)-3-(4-metoxifenil)-propano-1,3-diona (butilmetoxidibenzoilmetano) está contenido en la preparación fotoprotectora cosmética o dermatológica lista en una concentración de 0'1% - 6'0%, preferiblemente 0'5% - 9'0% referida al peso total de la formulación.

25 5. Combinación según la reivindicación 4 **caracterizada** por el hecho de que la triheptanoína está contenida en la preparación fotoprotectora cosmética o dermatológica lista en una concentración de 0'1% - 50%, preferiblemente 0'5% - 15'0% referida al peso total de la formulación.

30 6. Combinación según la reivindicación 1 **caracterizada** por el hecho de que la bis-octiloxifenol-metoxifenil-triazina (bis-etilhexiloxifenolmetoxifenol-triazina) está contenida en la preparación fotoprotectora cosmética o dermatológica lista en una concentración de 0'1% - 15'0%, preferiblemente 0'5% - 10'0% referida al peso total de la formulación.

35 7. Combinación según la reivindicación 6 **caracterizada** por el hecho de que la triheptanoína está contenida en la preparación fotoprotectora cosmética o dermatológica lista en una concentración de 0'1% - 50%, preferiblemente 0'5% - 15'0% referida al peso total de la formulación.

40

45

50

55

60

65

DOCUMENTOS CITADOS EN LA DESCRIPCIÓN

Esta lista de los documentos citados por el solicitante fue incluida exclusivamente para la información del lector y no forma parte del documento de patente europea. Aquella fue compuesta con la mayor diligencia; sin embargo, la OEP no asume ninguna responsabilidad por posibles errores u omisiones.

Documentos de patente citados en la descripción:

- EP0775698 B1 [0010]
- EP0693471 B1 [0038]
- EP0694521 B1 [0038]
- DE19712033 A1 [0040]

Literatura no relativa a patentes citada en la descripción

- C. ROE et al. *J. Clin. Invest.* 2002, vol. 110, 259-269 [0014]
- R. LOCHHEAD. *Cosm. Toil.* 1993, vol. 108, 95 [0053]