

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 371 629**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/49** (2006.01)

**A61K 8/31** (2006.01)

**A61Q 19/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **02014323 .6**

96 Fecha de presentación: **27.06.2002**

97 Número de publicación de la solicitud: **1269978**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **02.01.2003**

54 Título: **USO DE DERIVADOS DE BIS-RESORCINILTRIAZINA EN PREPARADOS COSMÉTICOS O DERMATOLÓGICOS.**

30 Prioridad:  
**27.06.2001 DE 10130963**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**05.01.2012**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**05.01.2012**

73 Titular/es:  
**BEIERSDORF AG  
UNNASTRASSE 48  
20245 HAMBURG, DE**

72 Inventor/es:  
**Gottwald, Susen;  
Rapp, Claudius, Dr. y  
Raschke, Thomas, Dr.**

74 Agente: **Isern Jara, Jorge**

**ES 2 371 629 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

Uso de derivados de bis-resorcilnitriazina en preparados cosméticos o dermatológicos

- 5 La presente invención se refiere al uso de derivados de bis-resorcilnitriazina para mejorar la eficacia de los principios activos lipófilos en preparados cosméticos o dermatológicos. La presente invención se refiere preferentemente al uso de derivados de bis-resorcilnitriazina para mejorar la eficacia de sustancias saturadas protectoras de la piel, como por ejemplo ubiquinonas, retinoides y carotenoides, y a preparados cosméticos o dermatológicos en los que tales principios activos se pueden incorporar de manera estable durante largo tiempo y que constituyen un buen medio de transporte para estos principios activos.
- 10 El cuidado cosmético de la piel sirve en primer lugar para reforzar o regenerar la función natural de la piel como barrera frente a factores externos (p.ej. suciedad, productos químicos, microorganismos) y contra la pérdida de sustancias corporales (grasas naturales, electrolitos, etc., además de agua).
- 15 Cuando esta función se altera puede haber una fuerte resorción de sustancias tóxicas o alérgicas o el ataque de microorganismos y como consecuencia pueden aparecer reacciones cutáneas de tipo tóxico o alérgico.
- 20 El cuidado de la piel también tiene por objeto compensar la pérdida de grasa y de agua de la piel debida al lavado diario, lo cual es justamente importante cuando la capacidad de regeneración natural no es suficiente. Además los productos de higiene cutánea deben proteger la piel de los factores ambientales, sobre todo del sol y del viento, y retardar su envejecimiento.
- 25 El envejecimiento cronológico de la piel es causado p.ej. por factores endógenos, genéticamente determinados. En la epidermis y en la dermis aparecen debido a la edad, p.ej., las siguientes lesiones estructurales y alteraciones funcionales, que también pueden englobarse en el término "xerosis senil":
- a) resecaimiento, aspereza y formación de arrugas por sequedad,
  - b) prurito y
  - c) menor regeneración de la grasa por las glándulas sebáceas (p.ej. después del lavado).
- 30 Los factores exógenos como la luz UV y las noxas químicas pueden tener efecto acumulativo y p.ej. acelerar los procesos endógenos de envejecimiento o completarlos. En concreto los factores exógenos provocan en la epidermis y en la dermis, p.ej., las siguientes lesiones estructurales y alteraciones funcionales de la piel, las cuales aparecen cronológicamente según la magnitud y el tipo de lesión:
- d) ensanchamiento visible de los vasos sanguíneos (teleangiectasias, cuperosis);
  - e) flacidez y formación de arrugas;
  - f) hiperpigmentación, hipopigmentación y falta de pigmentación local (p.ej. manchas seniles) y
  - g) mayor sensibilidad al estrés mecánico (p.ej. agrietamiento).
- 35
- 40 La presente invención se refiere especialmente a productos para el cuidado de la piel envejecida naturalmente y para el tratamiento de los daños debidos al envejecimiento por la piel, especialmente los fenómenos enumerados desde a) hasta g), sobre todo a los que se caracterizan por una mayor efectividad.
- 45 Los productos para el cuidado de la piel envejecida son de por sí conocidos. Contienen p.ej. retinoides (ácidos de vitamina A y/o sus derivados) o vitamina A y/o sus derivados. Sin embargo su efecto sobre los daños estructurales es de alcance limitado. Además en el desarrollo de los productos hay dificultades considerables para estabilizar suficientemente los principios activos contra la descomposición oxidativa. El uso de productos que contienen ácidos de vitamina A suele provocar además fuertes irritaciones cutáneas eritematosas. Por tanto los retinoides solo se pueden emplear en pequeñas concentraciones. La presente invención se refiere particularmente a preparados cosméticos con una protección eficaz contra los procesos dañinos de oxidación de la piel, que también sirve para proteger los propios preparados cosméticos y sus componentes de procesos oxidativos perjudiciales.
- 50 La presente invención se refiere asimismo a antioxidantes, preferiblemente a los que se emplean en preparados cosméticos o dermatológicos protectores de la piel. La presente invención también se refiere concretamente a preparados cosméticos o dermatológicos que contienen tales antioxidantes. En una forma de ejecución preferida la presente invención se refiere a preparados cosméticos y dermatológicos para la profilaxis y el tratamiento de las alteraciones cosméticas o dermatológicas de la piel, como p.ej. su envejecimiento, sobre todo el ocasionado por procesos oxidativos.
- 55 Además la presente invención se refiere a principios activos y a preparados que los contienen, para el tratamiento o la profilaxis cosmética o dermatológica de manifestaciones eritematosas, inflamatorias, alérgicas o de reacciones autoinmunes, especialmente las dermatosis.
- 60 En otra forma de ejecución ventajosa la presente invención se refiere a combinaciones de principios activos y a preparados que sirven para la profilaxis y el tratamiento de la piel sensible a la luz, sobre todo de las fotodermatosis.
- 65

El efecto perjudicial de la porción ultravioleta de la radiación solar sobre la piel es generalmente conocido. Así como los rayos de longitud de onda inferior a 290 nm (la denominada región UVC) son absorbidos por la capa de ozono de la atmósfera terrestre, la radiación comprendida entre 290 nm y 320 nm, la llamada región UVB, causa un eritema, una ligera quemazón o incluso quemaduras más o menos fuertes.

5 El máximo efecto eritematoso de la luz solar es provocado por una estrecha región alrededor de los 308 nm.

10 Para la protección contra la radiación UVB se conocen numerosos compuestos, que son derivados del 3-bencilidenalcanfor, del ácido 4-aminobenzoico, del ácido cinámico, del ácido salicílico, de la benzofenona y también del 2-fenilbenzimidazol.

15 Para el intervalo entre aproximadamente 320 nm y 400 nm, la llamada región UVA, también es conveniente disponer de sustancias filtrantes, pues esta radiación puede provocar reacciones en caso de pieles fotosensibles. Se ha demostrado que la radiación UVA produce daños en las fibras elásticas y colágenas del tejido conjuntivo, por lo cual la piel puede envejecer prematuramente, y que debe considerarse como causa de numerosas reacciones fototóxicas y fotoalérgicas. La radiación UVA puede potenciar el efecto dañino de la radiación UVB.

20 Para la protección contra la radiación UVA se emplean ciertos derivados del dibenzoilmetano cuya fotoestabilidad es insuficiente (Int. J. Cosm. Science<sup>10</sup>, 53 (1988)).

La radiación UV también puede producir reacciones fotoquímicas y entonces los productos de estas reacciones intervienen en el metabolismo de la piel.

25 Estos productos de las reacciones fotoquímicas son principalmente compuestos radicalarios, por ejemplo radicales hidroxilo. En la propia piel también se forman fotoproductos radicalarios indefinidos, que por su elevada reactividad pueden desencadenar a su vez otras reacciones incontroladas. Pero además la irradiación UV puede dar lugar a la aparición de oxígeno singulete, un estado excitado no radicalario de la molécula de oxígeno, y también de epóxidos de corta vida y muchos otros. En comparación con el oxígeno triplete (estado radicalario fundamental) normalmente existente, el oxígeno singulete se caracteriza por una mayor reactividad. No obstante también existen tripletes de la molécula de oxígeno excitados, reactivos (radicalarios).

30 La radiación UV también pertenece a las radiaciones ionizantes. Es decir, hay el riesgo de que por exposición al UV también se formen especies iónicas, capaces a su vez de intervenir oxidativamente en los procesos bioquímicos.

35 Para prevenir estas reacciones se pueden incorporar antioxidantes adicionales y/o captadores de radicales a las formulaciones cosméticas o dermatológicas.

40 Ya se ha propuesto el empleo de vitamina E, una sustancia de conocido efecto antioxidante, en las formulaciones fotoprotectores, pero el efecto alcanzado también queda muy lejos de las expectativas.

Por lo tanto la presente invención también tenía por objeto conseguir principios activos y preparados cosméticos, dermatológicos y farmacéuticos, y también formulaciones fotoprotectoras, que sirvieran como profilaxis y tratamiento de la piel sensible a la luz, sobre todo de las fotodermatosis y preferentemente de la fotodermatosis polimorfa.

45 Otras denominaciones de la fotodermatosis polimorfa son PLD, PLE, acné de Mallorca y otras varias designaciones, como las indicadas en la literatura (p.ej. A. Voelckel y otros, Zentralblatt Haut- und Geschlechtskrankheiten [*Revista de enfermedades cutáneas y de transmisión sexual*] (1989), 156, p. 2).

50 Las manifestaciones eritematosas de la piel también aparecen como síntomas concomitantes en determinadas enfermedades o irregularidades cutáneas. Por ejemplo la erupción típica del cuadro del acné suele ser más o menos enrojecida.

55 Los antioxidantes se usan principalmente como sustancias protectoras contra el deterioro de los preparados que los contienen. Aun así, es sabido que en la piel humana y animal también pueden desarrollarse procesos de oxidación no deseados. Tales procesos tienen un papel esencial en el envejecimiento de la piel.

60 En el artículo "Skin Diseases Associated with Oxidative Injury" [*Enfermedades cutáneas relacionadas con lesiones oxidativas*] en "Oxidative Stress in Dermatology" [*Tensión oxidativa en dermatología*], p. 323 y siguientes (Marcel Decker Inc., Nueva York, Basilea, Hong Kong, editor: Jürgen Fuchs, Frankfurt, y Lester Packer, Berkeley/ California) se enumeran las lesiones oxidativas de la piel y sus causas detalladas.

En las formulaciones cosméticas o dermatológicas también se pueden incorporar adicionalmente antioxidantes y/o captadores de radicales para prevenir estas reacciones.

65 Algunos antioxidantes y captadores de radicales ya son conocidos. En las patentes US 4,144,325 y 4,248,861 y en muchos otros documentos se ha propuesto el uso de vitamina E, una sustancia de conocido efecto antioxidante, en

las formulaciones fotoprotectores, pero el efecto alcanzado también es muy inferior al esperado.

Por lo tanto el objeto de la presente invención era hallar vías para evitar los inconvenientes del estado técnico. El objetivo debe ser, sobre todo, la eliminación de los daños relacionados con el envejecimiento endógeno, cronológico y exógeno de la piel y la profilaxis duradera y persistente, sin riesgo de efectos secundarios.

Remediar dichos inconvenientes era otro objetivo de la presente invención.

De lejos, el tipo de producto más importante en el campo del cuidado de la piel son las emulsiones. Las emulsiones son sistemas dispersos de dos o más fases y las emulsiones cosméticas constan como mínimo de una fase orgánica (grasas y aceites minerales, ésteres de ácidos grasos, alcoholes grasos, etc.) y de una fase acuosa (agua, glicerina, glicoles, etc.) dispersadas una en otra por medio de emulsionantes, en forma de minúsculas gotitas. Cuando la fase orgánica está finamente dispersa en la fase acuosa, se trata de una emulsión aceite-en-agua (emulsión O/W, como p.ej. la leche). El carácter fundamental de una emulsión O/W viene dado por el agua; por tanto, al contrario que una emulsión W/O, tiene poco efecto lubricante sobre la piel, es más bien mateante y penetra rápidamente en la piel. Gracias a estas ventajas sensoriales las emulsiones O/W se emplean para cremas y lociones que no deben dejar ningún brillo grasiento visible sobre la piel, por ejemplo para cremas (faciales) y lociones diurnas.

En el estado técnico se conoce una serie de diversos principios activos lipófilos efectivos para el cuidado de la piel – como por ejemplo ubiquinonas, retinoides y carotenoides – que contienen elementos estructurales insaturados, aromáticos o benzoides, cuyo empleo en formulaciones cosméticas y dermatológicas, sobre todo en formulaciones del tipo aceite-en-agua, es muy deseable. Por desgracia estas sustancias suelen ser muy inestables, de manera que en medios acuosos, especialmente, se descomponen con rapidez y así se pierde su efectividad.

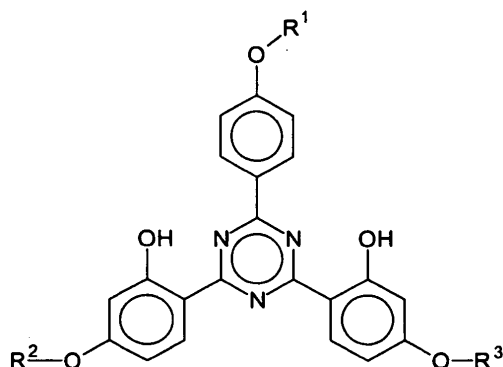
Dado que en este contexto las formulaciones O/W deben tratarse como sistemas acuosos, la incorporación de tales principios activos en este tipo de formulación constituye hasta la fecha un problema bastante considerable, hasta el punto de que frecuentemente resulta difícil alcanzar una concentración efectiva.

Así pues la presente invención tenía concretamente por objeto superar las desventajas del estado técnico y proteger los principios activos lipófilos de cuidado cutáneo, en particular ubiquinonas, retinoides y carotenoides, contra la descomposición, aumentando así su efectividad, preferiblemente en los preparados cosméticos o dermatológicos. Otro objetivo era encontrar preparados cosméticos o dermatológicos que permitieran incorporar de manera estable y duradera los principios activos lipófilos de cuidado cutáneo y que constituyeran un buen medio de transporte para dichos principios activos.

Fue sorprendente e imprevisible para el especialista que el empleo de derivados de bis-resorcilntriazina según la reivindicación 1 para mejorar la eficacia de los principios activos lipófilos en preparados cosméticos o dermatológicos salvara los inconvenientes del estado técnico.

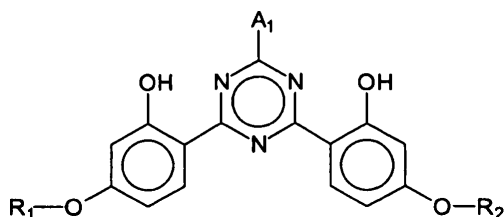
Para el especialista no era previsible que el empleo de derivados de bis-resorcilntriazina según la reivindicación 1 estabilizara los principios activos lipófilos contra la descomposición. Sobre todo fue sorprendente que los derivados de bis-resorcilntriazina utilizados en la presente invención estabilizaran perfectamente los principios activos lipófilos en las emulsiones O/W. La estabilidad de los principios activos lipófilos en las formulaciones aceite-en-agua puede incrementarse considerablemente mediante el uso de la presente invención.

Según la presente invención pueden emplearse ventajosamente, por ejemplo, los derivados de bis-resorcilntriazina con la estructura siguiente:



donde  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  se escogen, independientemente entre sí, entre los grupos alquilo ramificados y lineales de 1 a 10 átomos de carbono o representan un solo átomo de hidrógeno. Se prefiere particularmente la 2,4-bis-[[4-(2-etilhexiloxi)-2-hidroxil]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (INCI: Aniso Triazine), que puede adquirirse de la firma CIBA-Chemikalien GmbH bajo la marca comercial Tinosorb® S.

En la solicitud de patente europea 775 698 también se describen derivados de bis-resorcilntriazina de utilización preferente, cuya estructura química corresponde a la fórmula genérica



5 donde R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> y A<sub>1</sub> representan radicales orgánicos distintos.

Según la presente invención también se puede usar ventajosamente la 2,4-bis-[[4-(3-sulfonato)-2-hidroxi-propiloxi]-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina sal sódica, la 2,4-bis-[[4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxi-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-[4-(2-metoxietil-carboxil)-fenil-amino]-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-[[4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxi-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-[4-(2-etilcarboxil)-fenil-amino]-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(1-metilpirrol-2-il)-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-[[4-tris(trimetil-siloxi-sililpropiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, la 2,4-bis-[[4-(2"-metilpropeniloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina y la 2,4-bis-[[4-(1',1',1',3',5',5',5'-heptametilsiloxi-2"metil-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina.

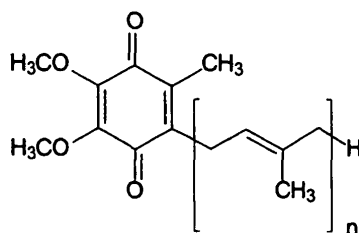
La cantidad de derivados de bis-resorcilntriazina (uno o más compuestos) en los preparados es preferiblemente de 0,05 hasta 20% en peso, con especial preferencia de 0,1 hasta 10% en peso, respecto al peso total del preparado.

20 Principios activos lipófilos ventajosos en el sentido de la presente invención son aquellos cuyo valor del log P es superior a 3,5. P es el coeficiente de distribución; se define como la relación entre las concentraciones en equilibrio de una sustancia disuelta en un sistema de dos fases formado por dos disolventes prácticamente inmiscibles. En este caso los dos disolventes son n-octanol y agua, es decir

$$P_{ow} = \frac{C_{n-Octanol}}{C_{Agua}}$$

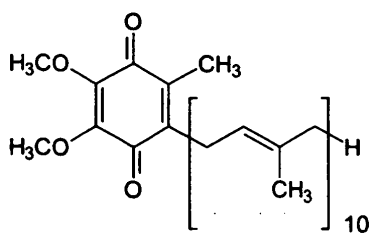
25 Según la presente invención es ventajoso escoger el o los principios activos lipófilos del grupo de las ubiquinonas y las plastoquinonas.

30 Las ubiquinonas se caracterizan por la fórmula estructural

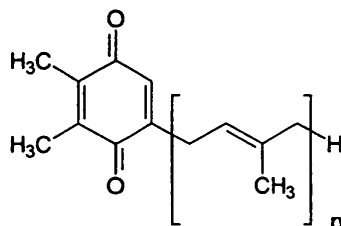


35 y representan las bioquinonas más extendidas y por lo tanto mejor estudiadas. Las ubiquinonas se nombran, según el número de unidades de isopreno enlazadas en la cadena lateral, como Q-1, Q-2, Q-3, etc. o, según el número de átomos de C en dicha cadena, como U-5, U-10, U-15, etc. Aparecen preferentemente con longitudes de cadena determinadas, p.ej. en algunos microorganismos y levaduras con n = 6. En la mayoría de mamíferos, incluyendo el hombre, predomina la Q10.

40 En el sentido de la presente invención es especialmente ventajoso el coenzima Q10, que tiene un valor del log P aproximadamente igual a 15 y se caracteriza por la siguiente fórmula estructural:



Las plastoquinonas poseen en general la fórmula estructural

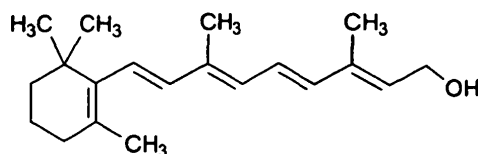


5 Las plastoquinonas se distinguen por el número n de unidades de isopreno y se nombran atendiendo a ello, p.ej. PQ-9 (n = 9). También existen otras plastoquinonas con diferentes sustituyentes en el anillo de quinona.

Fue especialmente sorprendente que según la presente invención pudieran obtenerse preparados muy ventajosos, empleando principio(s) activo(s) escogido(s) solamente del grupo de las ubiquinonas.

10 Como principios activos lipófilos también son ventajosos según la presente invención los retinoides (ácido de la vitamina A y/o sus derivados) o la vitamina A y/o sus derivados. El grupo de los retinoides ventajosos conforme a la presente invención comprende conceptualmente todos los retinoides inocuos desde el punto de vista cosmético y/o farmacéutico, incluyendo el retinol y sus ésteres, el retinal y el ácido retinoico (forma ácida de la vitamina A) y sus ésteres.

El retinol (vitamina A1, alcohol de la vitamina A) se caracteriza por la siguiente estructura:



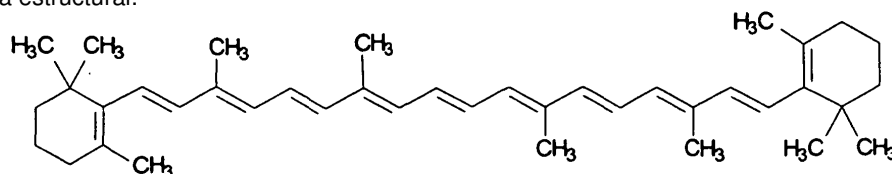
20 Los retinoides son compuestos que proceden del retinol natural o de sus análogos sintéticos. Los retinoides son isoprenoides C<sub>20</sub> con un radical cíclico apolar en un extremo y un grupo polar (carboxilo, éster, amida o alcohol) en el otro extremo.

25 Según la presente invención son especialmente ventajosos el retinol (con un valor de log P de aproximadamente 7) y el palmitato de retinilo (con un valor de log P de aproximadamente 13).

Asimismo fue especialmente sorprendente que según la presente invención pudieran obtenerse preparados muy ventajosos, empleando principio(s) activo(s) escogido(s) solamente del grupo de los retinoides.

30 Como principios activos lipófilos también son ventajosos según la presente invención los carotenoides. El nombre "carotenoide" proviene de caroteno y se usa para los carotenos (hidrocarburos puros) y los xantófilos (carotenos que llevan oxígeno). Su estructura principal consta de ocho unidades de isopreno (tetraterpenos). Los carotenoides se pueden imaginar como dos isoprenoides C<sub>20</sub> unidos de manera que los dos grupos metilo centrales se encuentran confrontados en posición 1,6 (enlace cabeza con cabeza); las dos mitades de la molécula siguen respectivamente la regla del isopreno.

Según la presente invención es especialmente ventajoso, por ejemplo, el β-caroteno, el cual se caracteriza por la siguiente fórmula estructural:



40 y tiene un valor de log P de 15.

45 La cantidad de principios activos lipófilos (uno o más compuestos) en los preparados es preferiblemente de 0,0001 hasta 10% en peso, con especial preferencia de 0,001 hasta 1% en peso, respecto al peso total del preparado.

Según la presente invención es ventajoso escoger la relación ponderal entre los derivados de bis-resorcinitriazina (uno o más compuestos) y el o los principios activos lipófilos en un intervalo de 1000 : 1 hasta 1 : 10. En particular se prefiere una relación ponderal de 100 : 1 hasta 1 : 2, aproximadamente.

Los preparados según la presente invención son preferentemente emulsiones, sobre todo del tipo O/W.

Los preparados cosméticos o dermatológicos usados según la presente invención pueden tener la composición habitual y servir para el tratamiento, cuidado y limpieza de la piel y/o del cabello y como producto de maquillaje en cosmética decorativa.

Según la presente invención es preferible añadir complejantes a los preparados cosméticos o dermatológicos de la presente invención.

Los complejantes son sustancias auxiliares ya conocidas en cosmetología o en galénica medicinal. La formación de complejos de metales molestos como Mn, Fe, Cu y otros puede impedir, por ejemplo, que haya reacciones químicas no deseadas en los preparados cosméticos o dermatológicos.

Los complejantes, en particular los quelantes, forman complejos con átomos metálicos, que en caso de haber uno o más complejantes polibásicos (quelantes) constituyen metalociclos. Los quelatos son compuestos en los que un solo ligando posee más de un punto de coordinación a un átomo central. Por consiguiente, en este caso, al crearse el complejo los compuestos normalmente extendidos se cierran sobre un átomo o ion metálico formando un anillo. La cantidad de ligandos unidos depende del número de coordinación del metal central. La condición para que se forme el quelato es que el compuesto que reacciona con el metal contenga dos o más agrupaciones de átomos capaces de actuar como dadores de electrones.

El o los complejantes pueden escogerse ventajosamente del grupo de los compuestos habituales, preferiblemente de manera que al menos una sustancia sea del grupo constituido por el ácido tartárico y sus aniones, el ácido cítrico y sus aniones, el ácido iminodisuccínico y sus aniones, los ácidos aminopolicarboxílicos y sus aniones (como por ejemplo el ácido etilendiaminotetraacético (EDTA) y sus aniones, el ácido nitrilotriacético (NTA) y sus aniones, el ácido hidroxietilendiaminotriacético (HOEDTA) y sus aniones, el ácido dietilenaminopentaacético (DPTA) y sus aniones, el ácido trans-1,2-diaminociclohexantetraacético (CDTA) y sus aniones), así como el quitosan metileno fosfonato sódico.

El contenido del o de los complejantes en los preparados cosméticos o dermatológicos está comprendido ventajosa y preferiblemente según la presente invención entre 0,01% en peso y 15% en peso, con mayor preferencia entre 0,05% en peso y 7% en peso, sobre todo entre 0,1 y 2,0% en peso, respecto al peso total de los preparados.

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

Los preparados cosméticos y dermatológicos de la presente invención pueden hallarse en formas diferentes. Así, p.ej. pueden ser una solución, un preparado anhidro, una emulsión o microemulsión del tipo agua-en-aceite (W/O), una emulsión múltiple, por ejemplo del tipo agua-en-aceite-en-agua (W/O/W), un gel, una barra sólida, una pomada o también un aerosol. Según la presente invención son especialmente ventajosos los preparados cosméticos y dermatológicos en forma de emulsiones aceite-en-agua con al menos una fase acuosa.

Según la presente invención también es posible y ventajoso formular preparados conforme a la misma en forma de sistemas acuosos o productos tensioactivos para la limpieza de la piel y del cabello.

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

Asimismo se obtienen preparados especialmente ventajosos según la presente invención, usando antioxidantes como aditivos o principios activos. Según la presente invención los preparados contienen ventajosamente uno o más antioxidantes. Aunque su uso es facultativo, como antioxidantes convenientes pueden emplearse todos aquellos que son apropiados o usuales para las aplicaciones cosméticas 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 urocánico) y sus derivados, péptidos como D,L-carnosina, D-carnosina, L-carnosina y sus derivados (p.ej. anserina), carotenoides, carotenos (p.ej.  $\alpha$ -caroteno,  $\beta$ -caroteno, licopeno) y sus derivados, ácido lipónico y sus derivados (p.ej. ácido dihidrolipónico), aurotioglucosa, propiltiouracilo y otros tioles (p.ej. tiorredoxina, glutatión, cisteína, cistina, cistamina y sus ésteres de glicosilo, N-acetilo, metilo, etilo, propilo, amilo, butilo y laurilo, palmitoilo, oleilo,  $\gamma$ -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. butionínsulfoximina, homocisteín-sulfoximina, butionínsulfoximas, penta-, hexa-, heptationínsulfoximina) en dosis compatibles muy pequeñas (p.ej. pmol

5 hasta  $\mu\text{mol/kg}$ ), también quelantes (de metales) (p.ej. ácidos grasos  $\alpha$ -hidroxilados, ácido palmítico, ácido fitínico, lactoferrina), ácidos  $\alpha$ -hidroxilados (p.ej. ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico), ácido húmico, ácido biliar, extractos biliares, bilirrubina, biliverdina, EDTA, EGTA y sus derivados, ácidos grasos insaturados y sus derivados (p.ej. ácido  $\gamma$ -linolénico, ácido linólico, ácido oleico), ácido fólico y sus derivados, ubiquinona y ubiquinol y sus  
 10 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  
 15 derivados, manosa y sus derivados, cinc y sus derivados (p.ej.  $\text{ZnO}$ ,  $\text{ZnSO}_4$ ), selenio y sus derivados (p.ej. seleno-metionina), estilbeno y sus derivados (p.ej. óxido de estilbeno, óxido de trans-estilbeno) y los derivados adecuados según la presente invención (sales, ésteres, éteres, azúcares, nucleótidos, nucleósidos, péptidos y lípidos) de dichos principios activos.

15 De manera especialmente ventajosa según la presente invención pueden emplearse antioxidantes hidrosolubles como por ejemplo vitaminas, p.ej. el ácido ascórbico y sus derivados.

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

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

25 Siempre que el o los antioxidantes sean vitamina A o derivados de vitamina A o carotenos o sus derivados conviene que las respectivas concentraciones estén comprendidas en el intervalo de 0,001 hasta 10% en peso, respecto al peso total de la formulación.

30 Los preparados en forma de emulsiones según la presente invención contienen uno o varios emulsionantes. Los emulsionantes O/W pueden escogerse ventajosamente, por ejemplo, del grupo de los productos polietoxilados o polipropoxilados o de los productos polietoxilados y polipropoxilados, p.ej.:

- de los alcoholes grasos etoxilados,
- de los alcoholes de lanolina etoxilados,
- de los polietilenglicoléteres de fórmula general  $\text{R-O}(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n\text{-R}'$ ,
- de los ácidos grasos etoxilados de fórmula general  $\text{R-COO}(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n\text{-H}$ ,
- 35 • de los ácidos grasos etoxilados eterificados de fórmula general  $\text{R-COO}(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n\text{-R}'$ ,
- de los ácidos grasos etoxilados esterificados de fórmula general  $\text{R-COO}(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n\text{-C(O)-R}'$ ,
- de los polietilenglicol-glicéridos de ácido graso,
- de los ésteres de sorbitán etoxilados,
- 40 • de los colesteroles etoxilados,
- de los triglicéridos etoxilados,
- de los ácidos alquilétercarboxílicos de fórmula general  $\text{R-O}(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n\text{-CH}_2\text{-COOH}$  donde n representa un número de 5 hasta 30,
- de los polioxietilen-ésteres de sorbitán de ácidos graso,
- de los alquilétersulfatos de fórmula general  $\text{R-O}(-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n\text{-SO}_3\text{-H}$ ,
- 45 • de los alcoholes grasos propoxilados de fórmula general  $\text{R-O}(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O})_n\text{-H}$ ,
- de los polipropilenglicoléteres de fórmula general  $\text{R-O}(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O})_n\text{-R}'$ ,
- de los alcoholes de lanolina propoxilados,
- de los ácidos grasos propoxilados eterificados de fórmula general  $\text{R-COO}(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O})_n\text{-R}'$ ,
- de los ácidos grasos propoxilados esterificados de fórmula general  $\text{R-COO}(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O})_n\text{-C(O)-R}'$ ,
- 50 • de los ácidos grasos propoxilados de fórmula general  $\text{R-COO}(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O})_n\text{-H}$ ,
- de los polipropilenglicol-glicéridos de ácidos graso,
- de los ésteres de sorbitán propoxilados,
- de los colesteroles propoxilados,
- de los triglicéridos propoxilados,
- 55 • de los ácidos alquilétercarboxílicos de fórmula general  $\text{R-O}(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{O})_n\text{-CH}_2\text{-COOH}$ ,
- de los alquilétersulfatos o de los ácidos de los cuales derivan estos sulfatos, de fórmula general  $\text{R-O}(-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O})_n\text{-SO}_3\text{-H}$ ,
- de los alcoholes grasos etoxilados/propoxilados de fórmula general  $\text{R-O-X}_n\text{-I}_m\text{-H}$ ,
- de los polipropilenglicoléteres de fórmula general  $\text{R-O-X}_n\text{-I}_m\text{-R}'$ ,
- 60 • de los ácidos grasos propoxilados eterificados de fórmula general  $\text{R-COO-X}_n\text{-I}_m\text{-R}'$ ,
- de los ácidos grasos etoxilados/propoxilados de fórmula general  $\text{R-COO-X}_n\text{-I}_m\text{-H}$ .

Conforme a la presente invención, los emulsionantes O/W polietoxilados o polipropoxilados o bien polietoxilados y polipropoxilados se escogen de manera especialmente ventajosa del grupo de sustancias con valores HLB entre 11





carboxílicos ramificados y/o lineales, saturados y/o insaturados de 8 hasta 24, sobre todo de 12 - 18 átomos de carbono de longitud de cadena.

5 Como emulsionantes W/O especialmente ventajosos cabe mencionar: monoestearato de glicerilo, monoisoestearato de glicerilo, monomiristato de glicerilo, monooleato de glicerilo, monoestearato de diglicerilo, monoisoestearato de diglicerilo, monoestearato de propilenglicol, monoisoestearato de propilenglicol, monocaprilato de propilenglicol, monolaurato de propilenglicol, monoisostearato de sorbitán, monolaurato de sorbitán, monocaprilato de sorbitán, monoisooleato de sorbitán, diestearato de sacarosa, alcohol cetílico, alcohol estearílico, alcohol araquidílico, alcohol behenílico, alcohol isobehenílico, alcohol selaquílico, alcohol quimílico, polietilenglicol(2)esteariléter (esteareth-2),  
10 monolaurato de glicerilo, monocaprato de glicerilo, monocaprilato de glicerilo.

Como emulsionantes son especialmente adecuados el estearato-citrato de glicerilo, el estearato de glicerilo, el PEG-éster del ácido esteárico y la combinación estearato de glicerilo/ácido esteárico.

15 Los geles empleados según la presente invención suelen contener alcoholes de bajo número de C, p.ej. etanol, isopropanol, 1,2-propanodiol, glicerina y agua o uno de los aceites antes citados, en presencia de un espesante que en el caso de los geles óleo-alcohólicos es preferentemente dióxido de silicio o un silicato aluminico y en el caso de los geles hidroalcohólicos o alcohólicos es preferentemente un poliacrilato.

20 Las barras sólidas contienen p.ej. ceras naturales o sintéticas, alcoholes grasos o ésteres de ácidos grasos.

Como materias básicas habituales, adecuadas para emplear como barras cosméticas en el sentido de la presente invención, cabe citar aceites fluidos (p.ej. aceites de parafina, aceite de ricino, miristato de isopropilo), componentes semisólidos (p.ej. vaselina, lanolina), componentes sólidos (p.ej. cera de abejas, ceresina y ceras microcristalinas u  
25 ozoquerita) y ceras de alto punto de fusión (p.ej. cera de carnauba, cera de candelilla).

La fase lípida de los preparados según la presente invención puede escogerse ventajosamente del siguiente grupo de sustancias:

- 30 – aceites minerales, ceras minerales;
- aceites como los triglicéridos del ácido cáprico o del ácido caprílico, también aceites naturales como p.ej. el aceite de ricino;
- grasas, ceras y otras sustancias sólidas naturales y sintéticas, preferiblemente ésteres de ácidos grasos con alcoholes de bajo número de C, p.ej. con isopropanol, propilenglicol o glicerina, o ésteres de alcoholes grasos con alcanocidos de bajo número de C o con ácidos grasos;
- 35 – benzoatos de alquilo;
- aceites de silicona como dimetilpolisiloxano, dietilpolisiloxano, difenilpolisiloxano y formas mixtas de los mismos.

La fase orgánica en el sentido de la presente invención también se puede escoger ventajosamente del grupo de los ésteres de ácidos alcanocarboxílicos ramificados y/o lineales, saturados y/o insaturados de 3 hasta 30 átomos de  
40 carbono de longitud de cadena con alcoholes ramificados y/o lineales, saturados y/o insaturados de 3 hasta 30 átomos de C de longitud de cadena, y del grupo de los ésteres de ácidos carboxílicos aromáticos con alcoholes ramificados y/o lineales, saturados y/o insaturados de 3 hasta 30 átomos de C de longitud de cadena. Dichos esteroides pueden escogerse ventajosamente del grupo formado por miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, estearato de isopropilo, oletao de isopropilo, estearato de n-butilo, laurato de n-hexilo, oletao de n-decilo, estearato de isoocitilo, estearato de isononilo, isononanoato de isononilo, palmitato de 2-etilhexilo, laurato de 2-etilhexilo,  
45 estearato de 2-hexildecilo, palmitato de 2-octildodecilo, oletao de oleílo, erucato de oleílo, oletao de erucilo, erucato de erucilo, así como mezclas sintéticas, semisintéticas y naturales de tales ésteres, p.ej. aceite de jojoba.

La fase orgánica también se puede escoger ventajosamente del grupo de los hidrocarburos y ceras ramificados y  
50 lineales, de los aceites de silicona, de los dialquilétetes, del grupo de los alcoholes ramificados y lineales, así como de los triglicéridos de ácido graso, en particular de los triglicerínesteres de ácidos alcanocarboxílicos ramificados y/o lineales, saturados y/o insaturados de 8 hasta 24, sobre todo de 12 - 18 átomos de C de longitud de cadena. Los triglicéridos de ácido graso se pueden escoger ventajosamente, por ejemplo, del grupo de los aceites sintéticos, semisintéticos y naturales, como p.ej. aceite de oliva, aceite de girasol, aceite de soja, aceite de cacahuete, aceite  
55 de colza, aceite de almendra, aceite de palma, aceite de coco, aceite de palmiste y otros similares.

Según la presente invención también se puede usar ventajosamente cualquier mezcla de dichos componentes oleosos y céreos. Asimismo puede ser ocasionalmente ventajoso el empleo de ceras, por ejemplo palmitato de  
60 cetilo, como único componente lípido de la fase orgánica.

La fase orgánica se escoge ventajosamente del grupo formado por isoestearato de 2-etilhexilo, octildodecanol, isononanoato de isotridecilo, isoicosano, cocoato de 2-etilhexilo, benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub>, triglicérido caprílico-cáprico y dicapriléter.

65 Son especialmente ventajosas las mezclas de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> e isoestearato de 2-etilhexilo, las mezclas de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub> e isononanoato de isotridecilo y las mezclas de benzoato de alquilo C<sub>12-15</sub>, isoestearato

de 2-etilhexilo e isononanoato de isotridecilo.

Entre los hidrocarburos puede emplearse ventajosamente según la presente invención aceite de parafina, escualano y escualeno.

5 La fase orgánica también puede contener ventajosamente aceites de silicona cíclicos o lineales o estar totalmente formada por ellos, aunque de todos modos es preferible usar otros componentes de dicha fase además del aceite o aceites de silicona.

10 Como aceite de silicona ventajoso para la presente invención se usa ciclometicona (octametilciclotetrasiloxano), pero en el sentido de la presente invención también pueden emplearse ventajosamente otros aceites de silicona, como por ejemplo hexametilciclotrisiloxano, polidimetilsiloxano, poli(metilfenilsiloxano).

15 Además son especialmente útiles las mezclas de ciclometicona e isononanoato de isotridecilo, de ciclometicona e isoestearato de 2-etilhexilo.

La fase acuosa de los preparados según la presente invención contiene ventajosamente, si es preciso, alcoholes, dioles o polioles de bajo número de C, así como sus éteres, preferiblemente etanol, isopropanol, propilenglicol, glicerina, etilenglicol, etilenglicolmonoetil- o -monobutiléter, propilenglicolmonometil-, monoetil- o -monobutiléter, dietilenglicolmonometil- o -monoetiléter y productos análogos, también alcoholes de bajo número de C, p.ej. etanol, isopropanol, 1,2-propanodiol, glicerina, así como, particularmente, uno o más espesantes que pueden escogerse ventajosamente del grupo formado por dióxido de silicio, silicatos de aluminio, polisacáridos o sus derivados, p.ej. ácido hialurónico, goma xantana, hidroxipropilmetilcelulosa, de manera especialmente ventajosa del grupo de los poliacrilatos, con preferencia un poliacrilato del grupo de los llamados carbopoles, por ejemplo carbopoles de los tipos 980, 981, 1382, 2984, 5984, respectivamente solos o combinados.

25 En concreto se usan mezclas de los disolventes anteriormente citados. En el caso de los disolventes alcohólicos el agua puede ser un componente adicional.

30 Asimismo, según la presente invención, es ventajoso elaborar preparados cosméticos y dermatológicos cuyo fin principal no es la protección de la luz solar, pero que contienen 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 propias sustancias protectoras de UV, igual que los antioxidantes y, si es preciso, los conservantes, constituyen una protección eficaz contra la descomposición. También son ventajosos los preparados cosméticos y dermatológicos en forma de protectores solares.

35 Por consiguiente los preparados según la presente invención contienen preferiblemente al menos otra sustancia filtrante de UV-A y/o de UV-B. Dado el caso las formulaciones también pueden contener, aunque no sea necesario, uno o más pigmentos orgánicos y/o inorgánicos como sustancias filtrantes de UV, que pueden hallarse en la fase acuosa y/o en la fase orgánica.

40 Los pigmentos inorgánicos preferidos son óxidos metálicos y/u otros compuestos metálicos difícilmente solubles o insolubles en agua, sobre todo óxidos de titanio ( $\text{TiO}_2$ ), cinc ( $\text{ZnO}$ ), hierro (p.ej.  $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ), circonio ( $\text{ZrO}_2$ ), silicio ( $\text{SiO}_2$ ), manganeso (p.ej.  $\text{MnO}$ ), aluminio ( $\text{Al}_2\text{O}_3$ ), cerio (p.ej.  $\text{Ce}_2\text{O}_3$ ), óxidos mixtos de los respectivos metales y mezclas de dichos óxidos. El sulfato bórico también es ventajoso en el sentido de la presente invención.

50 Según la presente invención tales pigmentos pueden recubrirse ventajosamente mediante un tratamiento superficial, por el cual adquieren o mantienen, por ejemplo, un carácter anfifílico o hidrófobo. Este tratamiento superficial puede consistir en recubrir los pigmentos con una delgada capa hidrófoba, empleando procedimientos bien conocidos.

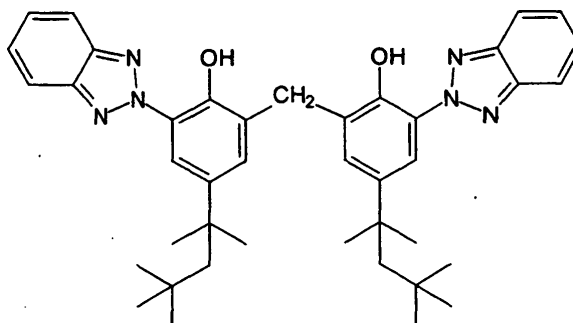
Según la presente invención son ventajosos p.ej. los pigmentos de dióxido de titanio recubiertos con octilsilanol. Se pueden conseguir partículas apropiadas de dióxido de titanio bajo la marca comercial T805 de la firma Degussa. Además son especialmente ventajosos los pigmentos de  $\text{TiO}_2$  recubiertos, p.ej. los que pueden obtenerse de la firma TAYCA con la marca comercial MT 100 T. Otros pigmentos de dióxido de titanio ventajosos son los que pueden obtenerse de la firma TAYCA con las marcas comerciales MT 100 TV, MT 100 Z y MT 100 AQ.

60 Otro recubrimiento ventajoso de los pigmentos inorgánicos está formado por dimetilpolisiloxano (también llamado dimeticona), una mezcla de polímeros lineales de siloxano totalmente metilados cuyos extremos están bloqueados con unidades trimetilsiloxi. Según la presente invención son especialmente ventajosos los pigmentos de óxido de cinc recubiertos de este modo.

También es ventajoso un recubrimiento de los pigmentos inorgánicos con una mezcla de dimetilpolisiloxano, sobre todo dimetilpolisiloxano con una longitud media de cadena de 200 hasta 350 unidades de dimetilsiloxano, y gel de sílice, también denominada simeticona. Resulta especialmente ventajoso recubrir adicionalmente los pigmentos inorgánicos con hidróxido u oxihidrato de aluminio (también: alúmina, n° CAS 1333-84-2). Son particularmente ventajosos los dióxidos de titanio recubiertos con simeticona y alúmina, de tal modo que el recubrimiento también

puede contener agua. Como ejemplo de ello cabe citar el dióxido de titanio que puede adquirirse de la firma Merck con la marca comercial Eusolex T2000.

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

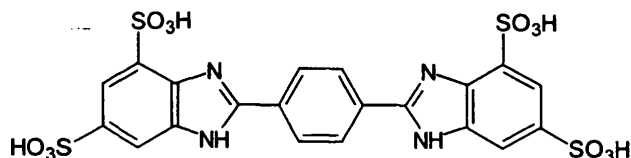


10 y comercializa la firma CIBA-Chemikalien GmbH con marca comercial Tinosorb® M.

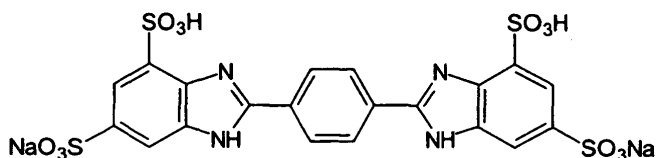
Los preparados de la presente invención contienen ventajosamente sustancias que absorben la radiación UV en la región UV-A y/o UV-B, siendo la cantidad total de sustancias filtrantes p.ej. de 0,1% en peso hasta 30% en peso, preferiblemente de 0,5 hasta 20% en peso, sobre todo de 1,0 hasta 15,0% en peso, respecto al peso total de los preparados, para proporcionar preparados cosméticos que protejan la piel o el cabello frente a todo el espectro de la radiación ultravioleta. También pueden servir de protector solar para la piel o el cabello.

15 Sustancias filtrantes de UV-A ventajosas según la presente invención son los derivados de dibenzoilmetano, sobre todo el (terc-butil)-4'-metoxidibenzoilmetano (nº CAS 70356-09-1), que vende Givaudan con la marca Parsol® 1789 y Merck con la marca Eusolex® 9020.

20 Otras sustancias filtrantes de UV-A ventajosas son el ácido fenilen-1,4-bis-(2-benzimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfónico

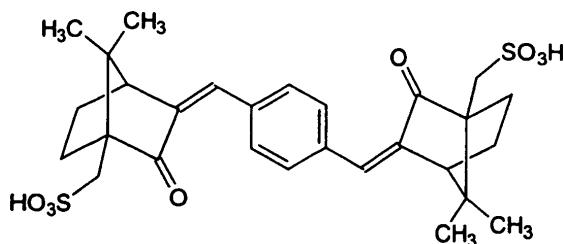


25 y sus sales, especialmente la correspondiente sal de sodio, potasio o trietanolamonio, sobre todo el fenilen-1,4-bis-(2-benzimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonato bisódico



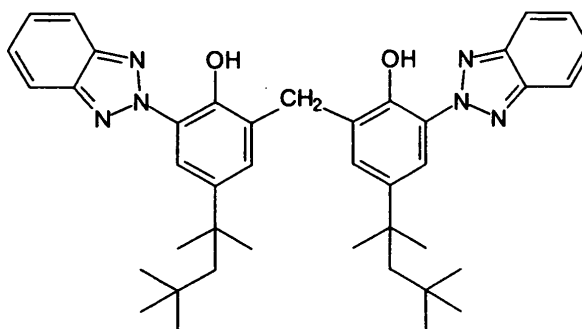
30 con el nombre INCI Bisimidazylate, que por ejemplo puede adquirirse de la firma Haarmann & Reimer con la marca comercial Neo Heliopan AP.

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



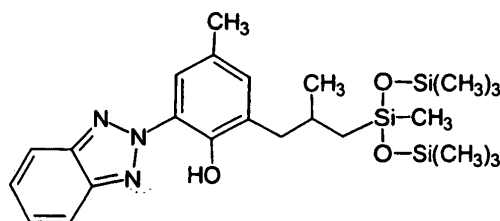
También son sustancias filtrantes de UV ventajosas según la presente invención los llamados filtros de banda ancha, es decir, sustancias filtrantes que absorben tanto radiación UV-A como UV-B.

5 Un filtro de banda ancha ventajoso según la presente invención es el 2,2'-metilenbis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol), que se caracteriza por la fórmula química estructural



10 y puede adquirirse de la firma CIBA-Chemikalien GmbH con la marca comercial Tinosorb® M.

Otro filtro de banda ancha ventajoso según la presente invención es el 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-[2-metil-3-[1,3,3,3-tetrametil-1-[(trimetilsilil)oxi]disiloxanil]propil]-fenol (nº CAS 155633-54-8), que tiene la denominación INCI Drometrizole Trisiloxane y se caracteriza por la fórmula química estructural



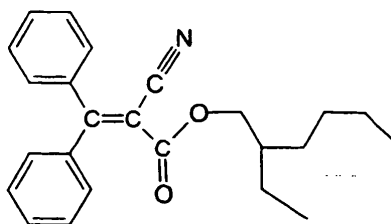
15 Los filtros de UV-B y/o de banda ancha pueden ser liposolubles o hidrosolubles. Como sustancias filtrantes de UV-B y/o de banda ancha liposolubles son útiles p.ej.:

- 20 ■ los derivados del 3-bencilidenalcanfor, preferentemente 3-(4-metilbenciliden)alcanfor, 3-bencilidenalcanfor;
- los derivados del ácido 4-aminobenzoico, preferentemente 4-(dimetilamino)-benzoato de 2-etilhexilo, 4-(dimetilamino)-benzoato de amilo;
- la 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etil-1'-hexiloxi)-1,3,5-triazina;
- los ésteres del ácido benzalmalónico, preferentemente 4-metoxibenzalmalonato de di(2-etilhexilo);
- 25 ■ los ésteres del ácido cinámico, preferentemente 4-metoxicinamato de 2-etilhexilo, 4-metoxicinamato de isopentilo;
- los derivados de la benzofenona, preferentemente 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, 2-hidroxi-4-metoxi-4'-metilbenzofenona, 2,2'-dihidroxi-4-metoxibenzofenona,
- así como los filtros de UV unidos a polímeros.

30 Como sustancias filtrantes de UV-B y/o de banda ancha hidrosolubles son útiles p.ej.:

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

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



40 También puede ser de gran utilidad utilizar sustancias filtrantes de UV poliméricas o unidas a polímeros en los

preparados según la presente invención, sobre todo aquellas que se describen en la patente WO-A-92/20690.

Asimismo, según la presente invención, puede ser ocasionalmente ventajoso incorporar otros filtros de UV-A y/o de UV-B en los preparados cosméticos o dermatológicos, por ejemplo ciertos derivados del ácido salicílico como el salicilato de 4-isopropilbencilo, el salicilato de 2-etilhexilo (= salicilato de octilo), el salicilato de homomentilo.

Los preparados especialmente ventajosos según la presente invención que se caracterizan por una protección alta o muy alta frente al UV-A llevan preferiblemente, además de uno o más derivados de bis-resorcilniltiazina conforme a la presente invención, varios filtros de UV-A y/o de banda ancha, sobre todo derivados de dibenzoilmetano [por ejemplo el 4-(terc-butil)-4'-metoxidibenzoilmetano], derivados de benzotriazol [por ejemplo el 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol)], ácido fenilén-1,4-bis-(2-benzimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfónico y/o sus sales, 1,4-di(2-oxo-10-sulfo-3-bornilidenmetil)-benceno y/o sus sales, bien solos o en cualquier combinación entre ellos.

Naturalmente la lista de los citados filtros de UV que pueden emplearse según la presente invención no debe ser limitativa.

Los preparados según la presente invención llevan ventajosamente sustancias que absorben la radiación UV de la región UV-A y/o UV-B en una cantidad total de p.ej. 0,1% en peso hasta 30% en peso, preferiblemente de 0,5 hasta 20% en peso, sobre todo de 1,0 hasta 15,0% en peso, referido respectivamente al peso total de los preparados, con el fin de proporcionar preparados cosméticos que protejan el cabello o la piel de todo el espectro de la radiación ultravioleta. Además pueden servir de protectores solares para el cabello o la piel. Asimismo es objeto de la presente invención el uso de una combinación de los preparados empleados según la presente invención con al menos un filtro de UV-A y/o al menos un filtro de UV-B como antioxidante o el uso de una combinación de los preparados empleados según la presente invención con al menos un filtro de UV-A y/o al menos un filtro de UV-B como antioxidante en una formulación cosmética o dermatológica.

Otros preparados cosméticos o dermatológicos según la presente invención son p.ej. formulaciones para proteger el cabello de la radiación UV, champús, preparados para enjuagar el cabello antes o después de la aplicación del champú, antes o después de una permanente, antes o después de teñirlo o desteñirlo, preparados para el secado o encrespado del cabello, preparados para teñir o desteñir, lociones de peinado o tratamiento o también productos para la permanente.

Dichos preparados pueden estar, por ejemplo, en forma de soluciones acuosas, emulsiones, geles, espumas o similares y contienen ventajosamente principios activos y sustancias auxiliares de empleo habitual en este tipo de preparados para el cuidado y el tratamiento del cabello, como p.ej. conservantes, tensioactivos, antiespumantes, espesantes, emulsionantes, grasas, aceites, ceras, disolventes orgánicos, bactericidas, perfumes, colorantes o pigmentos para teñir el propio preparado cosmético o dermatológico, electrolitos, sustancias para evitar el cabello grasiento.

Estos preparados cosméticos o dermatológicos también pueden ser espumas o formulaciones espumables, o bien aerosoles con los productos auxiliares empleados normalmente en tal caso. Para pulverizar estos preparados en envases de aerosol sirven los propelentes volátiles licuados generalmente conocidos, por ejemplo hidrocarburos (propano, butano, isobutano), los cuales pueden utilizarse solos o mezclados entre sí. También se puede usar aire comprimido.

También son ventajosos según la presente invención los preparados cosméticos de limpieza de la piel, que pueden estar p.ej. en forma líquida o sólida. Además de los principios activos empleados según la presente invención llevan preferentemente al menos una sustancia surfactante aniónica, no iónica o anfótera o mezclas de ellas, si se desea uno o más electrolitos y productos auxiliares como los usuales en estos preparados. En los preparados de limpieza la sustancia tensioactiva puede estar a una concentración comprendida entre 1 y 94% en peso respecto al peso total de los preparados.

Además de los citados tensioactivos los preparados de limpieza según la presente invención también contienen agua y dado el caso los aditivos usuales en cosmética, por ejemplo perfume, espesantes, colorantes, desodorantes, sustancias antimicrobianas, agentes reengrasantes, agentes complejantes y secuestrantes, agentes perlescentes, extractos vegetales, vitaminas, principios activos y similares.

Los siguientes ejemplos sirven para aclarar la presente invención sin limitarla. Todos los datos de cantidades, partes y porcentajes se refieren al peso y a la cantidad total o al peso total de los preparados, a no ser que se indique de otro modo.

#### **Ejemplos:**

65 Cremas O/W

ES 2 371 629 T3

<b>Ejemplo número</b>	<b>1</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>7</b>	<b>9</b>	<b>10</b>
Estearato-citrato de glicerilo	2	2				
Estearato de glicerilo, autoemulsionante			2			
PEG-40-estearato			1			
PEG-100-estearato						
Poligliceril-3-diisoestearato						
Poligliceril-3-metilglucosa diestearato				3		
Estearato de sorbitán				1		
Polietilenglicol(21)esteariléter (esteareth-21)						
Polietilenglicol(2)esteariléter (esteareth-2)						
Cetearilglucósido					2	
Ácido esteárico						2,5
Miristato de miristilo	1		1		1	
Alcohol behenílico				1		2
Alcohol estearílico	2				5	
Alcohol cetearílico		4	2			1
Alcohol cetílico	1			1		
Glicéridos de coco hidrogenados	2					1
Manteca de Shea		1				
Benzoato de alquilo C12-15			3	2	2	
Dicaprilato/dicaprato de butilenglicol	1	1				2
Triglicérido caprílico/cáprico		2		1		
Polideceno hidrogenado					1	
Cocoato de etilhexilo	3					2
Octildodecanol						
Aceite mineral						
Vaselina	4					
Octametiltetrasiloxano (ciclometicona)		5	3	3		
Dimetilpolisiloxano (dimeticona)			1			1
Dicapriléter	1					
Dicaprililcarbonato		1		2		4
Polideceno					5	
TiO <sub>2</sub>			1			1
Metoxicinamato de etilhexilo	3		2	3	5	3
Etilhexiltriazona				2		
Diethylhexilbutamidotriazona						
Butilmetoxidibenzoímetano						
Bis-etilhexiloxifenol-metoxifeniltriazina	1	3	1	1	2	2
Ubiquinona (Q 10)	0,05		0,05	0,1		0,1
β-Catroteno		0,1				
α-Glucosilrrutina		0,1				
Citrato sódico						
Tartrato sódico						
Ácido fitínico			0,1			
Ácido ascórbico						
Retinol					0,1	
Hidroxipropil-β-ciclodextrina			0,5			
Lactoferrina						0,05
EDTA trisódico					0,2	
Iminodisuccinato	0,2	0,3				
Fenoxietanol	0,3	0,2		0,4		0,3
p-Hidroxibenzoato de alquilo (parabén)	0,6	0,3	0,3		0,4	0,6
Hexamidindiisetionato			0,04			
Diazolidinilurea	0,25	0,2		0,2	0,1	
1,3-Dimetilol-5,5-dimetilhidantoína (DMDM hidantoína)						
Yodopropinilbutilcarbamato	0,1		3			
Etanol desnaturalizado	1				8 3	
2-Etilhexilglicerinéter (octoxiglicerina)						
Goma xantana	0,6			0,1		
Ácido poliacrílico (carbomer)	0,05		0,1			
Poliacrilamida				0,2		
Glicerina	5	7,5	5	5	4	5

(continuación)

Ejemplo número	1	4	5	7	9	10
Butilenglicol	2		2		2	
Colorantes hidrosolubles y/o liposolubles	0,05					0,1
Cargas (fosfato de dialmidón, SiO <sub>2</sub> , talco, estearato de aluminio)		0,5			5	1
Perfume	c.s.	c.s.	c.s.	c.s.	c.s.	c.s.
Agua	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100	hasta 100

**Ejemplo: hidrodispersión/crema gel**

Alcohol cetearílico	2
Manteca de Shea	1
Triglicérido caprílico/cáprico	2
Octildodecanol	1
Octametiltetrasiloxano (ciclometicona)	5
Dimetilpolisiloxano (dimeticona)	1
Polideceno	2
Metoxicinamato de etilhexilo	5
Bis-etilhexiloxifenol-metoxifeniltriaza	1
Ubiquinona (Q 10)	0,1
Iminodisuccinato	0,2
Fenoxietanol	0,3
p-Hidroxibenzoato de alquilo (parabén)	0,4
Ácido poliacrílico (carbomer)	0,1
Acrilato de alquilo reticulado (polímero cruzado de acrilato de alquilo)	0,2
Glicerina	5
Perfume	c.s.
Agua	hasta 100

5

**Ejemplos de recetas, bases**

Ingredientes	2	3
PEG-30 estearato		
Estearato de glicerilo		
Ceteareth-20		
Poligliceril-3 metilglucosa estearato		3,5
Estearato de sorbitán		1,5
Ácido esteárico		
Estearato-citrato de glicerilo	3,5	
Alcohol cetílico	0,75	1,0
Lecitina		
Veegum K = silicato de Mg-Al		
Goma xantana		
Carbomer	0,2	
Hidroxietilcelulosa		0,1
Triglicérido caprílico/cáprico	2	3
Dicapriléter	2	3
Octildodecanol		3
Dimeticona		3
Ciclometicona	4	3
Benzoato de alquilo C12-15		
Octanoato de cetearilo		
Escualano		
Palmitato de isopropilo		
PPG-15-esteariléter	3	
Glicéridos de coco hidrogenados		
Estearildimeticona		
Aceite de lanolina acetilado	0,2	
Metoxicinamato de octilo	2	
TiO <sub>2</sub>	2	
Etilhexiltriaza		
Bis-etilhexiloxifenol-metoxifeniltriaza	1	2



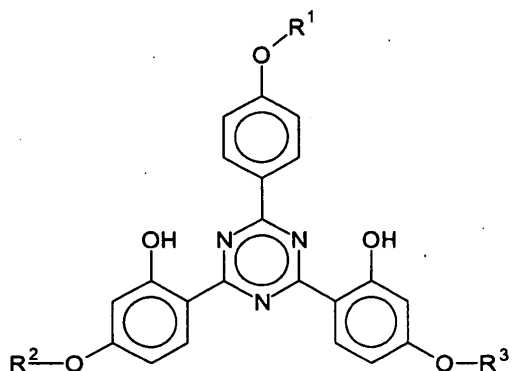
ES 2 371 629 T3

(continuación)

<b>Ingredientes</b>	<b>2</b>	<b>3</b>
Ubiquinona (Q 10)	0,05	0,02
Palmitato de retinilo		
Silicona	0,8	
Nylon-12		5
Lauroíl-lisina		0,5
Caolín		1
Almidón-octenilsuccinato sódico	1	
Óxidos de hierro	2,4	2,6
Dióxido de titanio	5,6	4,5
Pigmentos de interferencia		
Pigmento de bajo lustre		
ZnO	1	
Polimetilsilsesquioxano (Tospearl 2000B)	2	
EDTA	0,6	1
Glicerina	5	5
Fenoxietanol y parabenos (fenonip)	0,5	
Imidazonidilurea	0,3	
Neutralizante	c.s.	c.s.
Perfume, antioxidante	c.s.	c.s.
Agua	hasta 100	hasta 100

## REIVINDICACIONES

1. Uso de compuestos escogidos del grupo de los compuestos



donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, independientemente entre sí, se eligen del grupo de los radicales alquilo ramificados y lineales de 1 hasta 10 átomos de carbono o representan un solo átomo de hidrógeno, para mejorar la eficacia de los principios activos lipófilos en los preparados cosméticos o dermatológicos.

2. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado porque** los principios activos lipófilos se escogen del grupo de principios activos que tienen un valor de log P superior a 3,5.

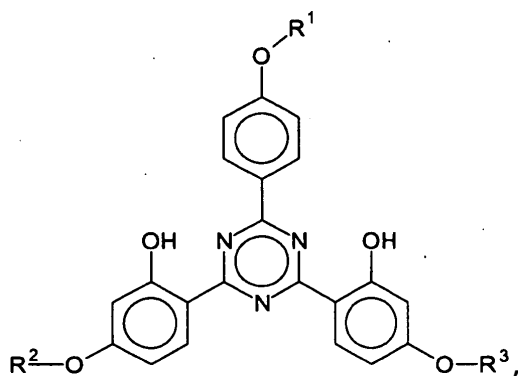
3. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado porque** los principios activos lipófilos (uno o más compuestos) se escogen de los grupos de las ubiquinonas, de los retinoides y/o de los carotenoides.

4. Uso según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado porque** la cantidad de principios activos lipófilos (uno o más compuestos) en los preparados se elige en el intervalo de 0,0001 hasta 1% en peso respecto al peso total del preparado.

5. Uso según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado porque** la cantidad de derivados de bis-resorciniltriazina (uno o más compuestos) en los preparados se elige en el intervalo de 0, 1 hasta 10% en peso respecto al peso total del preparado.

6. Uso según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado porque** la relación ponderal entre los derivados de bis-resorciniltriazina (uno o más compuestos) y el o los principios activos lipófilos se escoge en un intervalo de 1000 : 1 hasta 1 : 10.

7. Uso según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado porque** como compuestos escogidos del grupo de los compuestos



donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, independientemente entre sí, son grupos alquilo ramificados o lineales de 1 a 10 átomos de carbono y/o un átomo de hidrógeno individual, se emplea uno o más compuestos escogidos del grupo formado por 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)-fenil-amino]-1,3,5-triazina, 2,4-bis-[[4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxi-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-[4-(2-etil-carboxil)-fenil-amino]-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(trimetil-siloxi-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',5'-heptametilsiloxi-2"-metil-propiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina.