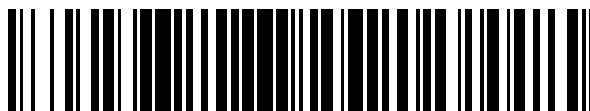


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 377 132**

51 Int. Cl.:

A61K 8/34

(2006.01)

A61Q 17/04

(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05787285 .5**

96 Fecha de presentación: **29.08.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1784156**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **16.05.2007**

54 Título: **Composición orgánica micro-particulada absorbente de UV**

30 Prioridad:
01.09.2004 EP 04104185

73 Titular/es:
BASF SE
67056 LUDWIGSHAFEN, DE

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
22.03.2012

72 Inventor/es:
DESHAYES, Cyrille y
MONGIAT, Sébastien

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
22.03.2012

74 Agente/Representante:
Carvajal y Urquijo, Isabel

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).

ES 2 377 132 T3

DESCRIPCIÓN

Composición orgánica micro-particulada absorbente de UV

La presente invención se relaciona con formulaciones agua en aceite (w/o) o agua en silicona (w/Si) aplicables tópicamente, en particular, con nuevas formulaciones de protección UV que comprenden un absorbente UV micronizado, en donde el absorbente UV micronizado se combina con alcohol de ácido graso específico.

Desde hace tiempo se sabe que la exposición prolongada a radiación UV puede conducir a la formación de eritemas o dermatosis por luz, así como también una mayor incidencia de los cánceres de piel, o envejecimiento acelerado de la piel.

Se han propuesto diversas formulaciones de protección solar que incluyen materiales que están destinados a contrarrestar la radiación UV, inhibiendo por lo tanto los efectos no deseados sobre la piel.

Se ha propuesto un gran número de compuestos para uso como protectores UV en las formulaciones de protección solar, especialmente absorbentes UV orgánicos solubles y los compuestos inorgánicos micronizados insolubles, en particular óxido de zinc y dióxido de titanio.

Con respecto al uso en formulaciones de protección solar de absorbentes UV orgánicos solubles, tienen las desventajas de que su efectividad como protectores UV en términos de SPF (Factor de Protección Solar) en una formulación de protección solar es a menudo muy baja para propósitos comerciales; como un resultado de su solubilidad, exhiben potencial alergénico relativamente alto; y que como un resultado de la capacidad fotoquímica intrínseca, la duración del efecto protector es a menudo muy baja.

El alto peso específico de los compuestos inorgánicos insolubles, tales como dióxido de titanio lleva a una estabilidad reducida de las formulaciones que los contienen. Más aún, se han reivindicado tales compuestos inorgánicos para generar radicales tóxicos bajo la influencia de la luz y el agua ("Redox Mechanisms in Heterogeneous Photocatalysis", Serpone et al., *Electrochemistry in Colloids and Dispersions*, Editors Mackay y Texter, VCH Publishers Inc., New York 1992).

En la GB-A-2303549, se describe un método para producir absorbentes UV orgánicos insolubles, micronizados, así como también una composición de protección solar que comprende una formulación micronizada de un absorbente UV orgánico insoluble, producida de acuerdo con el dicho método.

Los absorbentes UV orgánicos insolubles micronizados así obtenidos cuando se utilizan en formulaciones de protección solar proporcionan protección UV excelente y tienen un índice de SPF que es por lo menos tan alto como las formulaciones de protección solar correspondientes que contienen un absorbente UV inorgánico conocido. A diferencia de los últimos absorbentes UV, los absorbentes UV orgánicos insolubles, micronizados no muestran tendencia para generar radicales que puedan dañar o sensibilizar la piel humana bajo la influencia de la luz.

En la WO99/66896 se describe una composición de protección solar de un absorbente UV orgánico micronizado, en donde el absorbente UV orgánico micronizado está presente en la fase de aceite de la formulación.

La US6521,217 describe formulaciones de protección solar, que comprenden absorbentes UV orgánicos micronizados y un portador cosméticamente aceptable, en donde el absorbente UV orgánico micronizado está presente en la fase de aceite. El Ejemplo 5 describe una emulsión W/O que comprende 1,2 g de Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol (TinosorbM) y 6g de Octildodecanol.

La EP1068866 describe el uso de mezclas de micropigmentos para broncear la prevención e iluminación de piel y cabello. El Ejemplo 38 describe una emulsión W/O que comprende Octildodecanol y una mezcla de micropigmento que comprende Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol (TinosorbM).

La US6,746,666 describe el uso de mezclas de filtros UV orgánicos micronizados como Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol (TinosorbM) en la protección de la piel y el pelo de humano y animales contra el efecto del daño de la radiación UV.

La WO03/063814 describe mezclas de absorbente UV que comprenden un filtro de banda ancha UV micronizado como Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol (TinosorbM) y un dióxido de titanio recubierto dispersable en agua y/o dispersable en aceite. En la página 29 se describe una formulación W/O genérica con 10-15% en peso de un alcohol graso y 1-20% en peso de filtros UV micronizados.

La CA140:275747 describe protectores solares de agua en silicona que comprenden Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol(TinosorbM) y polioles.

5 La WO03/070202 describe composiciones de protección solar bifásicas que comprenden una emulsión W/O, una fase lipófila o acuosa, por lo menos un emulsificante W/O y por lo menos un filtro UV orgánico y/o inorgánico, en donde por lo menos una fase no es transparente o translúcida. El Ejemplo 1, columna 3 describe un protector solar W/O que comprende Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol (TinosorbM) y opcionalmente un alcohol que está presente en la fase externa.

10 La EP1285648 describe protectores solares que comprenden un filtro UV soluble en aceite y ácido imidosuccínico. El Ejemplo 3.col.3 describe un protector solar W/O que comprende Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol(TinosorbM) y opcionalmente un alcohol que está presente en la fase externa.

15 De forma sorprendente se encuentra que la combinación de un absorbente UV orgánico micronizado y un alcohol graso específico permite un máximo de miscibilidad de partículas orgánicas micronizadas dentro de la fase continua de las emulsiones w/o en donde las partículas micronizadas se estabilizan en la fase de aceite de la composición. De forma simultánea el crecimiento de cristal de los absorbentes UV orgánicos micronizados dentro de las emulsiones W/O se limita o incluso se elimina.

Por lo tanto, la presente invención se relaciona con una formulación agua en aceite (w/o) o agua en silicona (w/Si) tópicamente aplicable que comprende:

(a) 10 a 90% en peso de por lo menos una fase acuosa;

(b) 1 a 60% en peso de por lo menos una fase grasa;

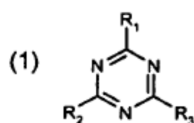
20 (c) 0.1 a 30% en peso de una composición fotoprotectora UV efectiva que comprende

(C₁) 20% a 99% de por lo menos un activo de detección UV orgánico micronizado insoluble con una tamaño de partícula promedio que varía de 0,01µm a 2µm;

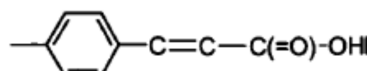
(C₂) 0.5% a 80% de una mezcla de octanol lineal y decanol lineal; 0 a 30% en peso de por lo menos un emulsificante; y 0 a 88.9% en peso de adyuvantes cosméticamente aceptables adicionales.

25 El absorbente UV orgánico adecuado (C₁) puede ser, por ejemplo una triazina, un benzotriazol, una benzofenona, un grupo vinilo que contiene amida, una amida de ácido cinámico o un absorbente UV de bencimidazol sulfonatado.

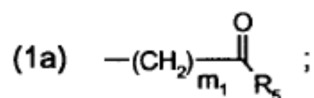
Una clase preferida de compuestos de triazina es aquella que tiene la fórmula



30 , en donde R₁, R₂ y R₃, independientemente uno del otro, son hidrógeno; hidroxi; alcoxi C₁-C₃; NH₂; NHR₄; N(R₄)₂; OR₄; arilo C₆-C₁₂; fenoxi; anilino; pirrolo; en el que las unidades estructurales fenilo, fenoxi, anilino o pirrolo son no sustituidas o sustituidas por uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de OH, carboxi, CO-NH₂, alquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂, un grupo metilidenocanfor, un grupo -(CH=CH)_mC(=O)-OR₄, un grupo

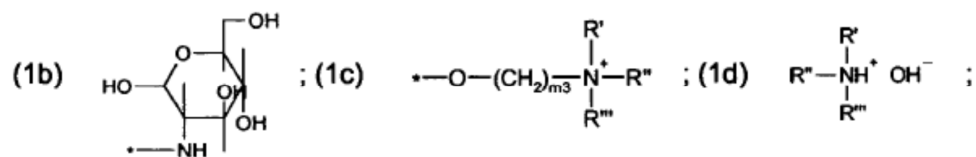


35 o el metal alcalino correspondiente, sales de amonio, mono-, di- o tri-alquilamonio C₁-C₄, mono-, di- o tri-alcanolamonio C₂-C₄, o los ésteres de alquilo C₁-C₃ de los mismos o mediante un radical de la fórmula

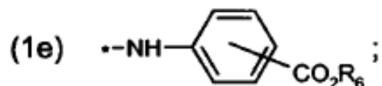


R₄ es alquilo C₁-C₅;

R₅ es hidroxilo; alquilo C₁-C₅ que no se sustituye o se sustituye por uno o más grupos OH; alcoxi C₁-C₅; amino; mono o di-alquilamino C₁-C₅; M; un radical de la fórmula

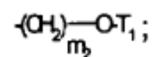


o



R', R'' y R''' independientemente del otro son alquilo C₁-C₄ que no se sustituye o se sustituye por uno o más grupos OH;

R₆ es hidrógeno; M; alquilo C₁-C₅; o un radical de la fórmula



M es un catión de metal;

T₁ es hidrógeno; o alquilo C₁-C₈;

m es 0 o 1;

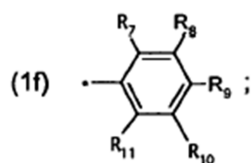
m₁ es de 1 a 5;

m₂ es de 1 a 4; y

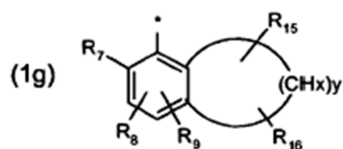
m₃ es de 2 a 14.

Los compuestos preferidos de la fórmula (1) son aquellos, en donde

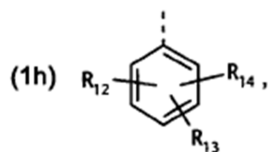
R₁, R₂ y R₃ independientemente uno del otro son un radical de la fórmula



o



R₇ y R₁₁ independientemente uno del otro son hidrógeno; alquilo C₁-C₁₈; o arilo C₆-C₁₂; R₈, R₉ y R₁₀, independientemente uno del otro, son hidrógeno; o un radical de la fórmula



en donde, en la fórmula (1f), por lo menos uno de los radicales R_8 , R_9 y R_{10} son un radical de la fórmula (1h);

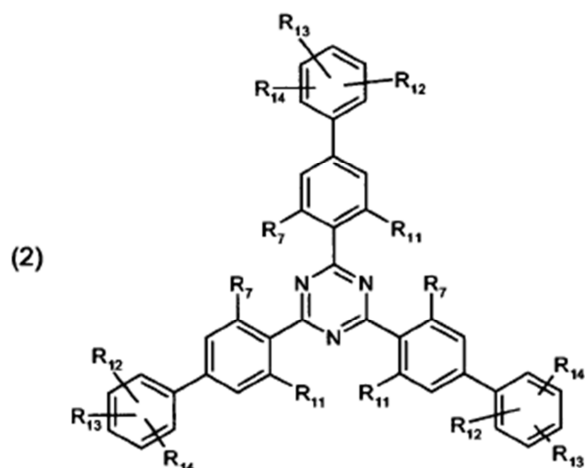
R_{12} , R_{13} , R_{14} , R_{15} y R_{16} independientemente uno del otro son hidrógeno; hidroxi; halógeno; alquilo C_1 - C_{18} ; alcoxi C_1 - C_{18} ; arilo C_6 - C_{12} ; bifenililo; ariloxi C_6 - C_{12} ; alquiltio C_1 - C_{18} ; carboxi; $-COOM$; alquilcarboxilo C_1 - C_{18} ; aminocarbonilo; o mono- o di-alquilamino C_1 - C_{18} ; acilamino C_1 - C_{10} ; $-COOH$;

M es un ión de metal alcalino;

x es 1 o 2; y

y es un número de 2 a 10.

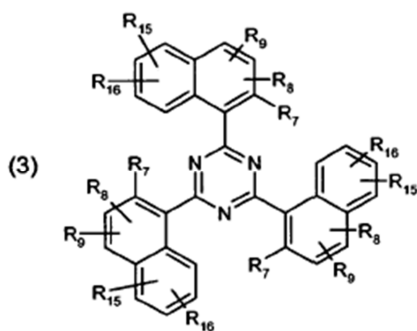
Los derivados de triazina más preferidos son compuestos de la fórmula



en donde

R_7 , R_{11} , R_{12} , R_{13} y R_{14} se definen como en la fórmula (1f), (1g) o (1h), y más preferiblemente el compuesto de la fórmula (2), en donde R_7 y R_{11} son hidrógeno.

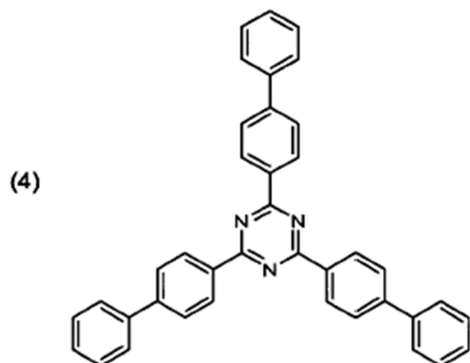
Adicionalmente, se prefieren los derivados de triazina de la fórmula



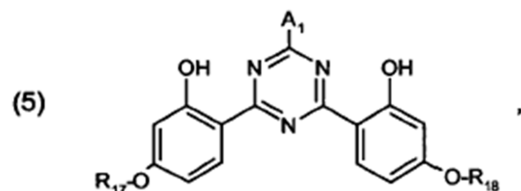
, en donde

R_7 , R_8 , R_9 , R_{15} y R_{16} se definen como en la fórmula (1g), y más preferiblemente los compuestos de la fórmula (3), en donde R_7 , R_8 , R_9 , R_{15} y R_{16} son hidrógeno; o, independientemente uno del otro, alquilo C_1 - C_{16}

Más preferidos como componente (C₁) son derivados de triazina de la fórmula

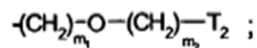


Los derivados de triazina preferidas adicionales de acuerdo con el componente (C₁) corresponde a la fórmula

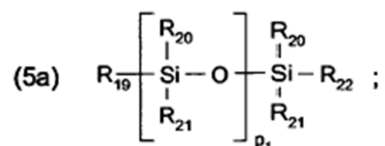


5 en donde

R₁₇ y R₁₈, independientemente uno del otro, son alquilo C₁-C₁₈; alqueno C₂-C₁₈; un radical de la fórmula -CH₂-CH(-OH)-CH₂-O-T₁; o un radical de la fórmula



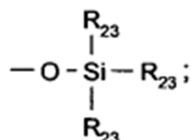
un radical de la fórmula



R₁₉ es un enlace directo; una cadena recta o radical alqueno C₁-C₄ ramificado o un radical de la fórmula



R₂₀, R₂₁ y R₂₂, independientemente uno del otro, son alquilo C₁-C₁₈; alcoxi C₁-C₁₈ o un radical de la fórmula



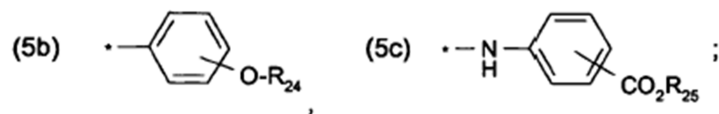
15 R₂₃ es alquilo C₁-C₅;

T₁ y T₂, independientemente uno del otro, son hidrógeno; o alquilo C₁-C₈;

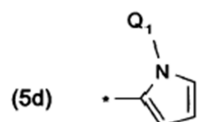
m₁, m₂ y m₃, independientemente uno del otro, son 1 a 4;

p₁ es 0; o un número de 1 a 5;

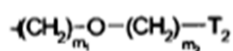
A₁ es un radical de la fórmula



o de la fórmula



- 5 R₂₄ es hidrógeno; alquilo C₁-C₁₀, -(CH₂CHR₂₆-O)_{n1}R₂₅; un -CH₂-CH(-OH)-CH₂-O-T₁; o radical de la fórmula



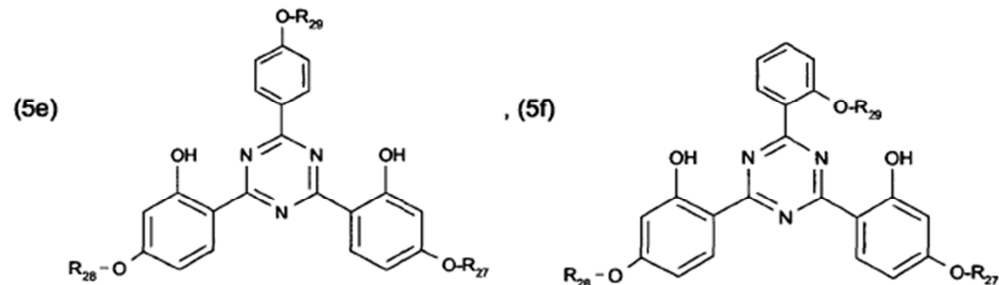
R₂₅ es hidrógeno; M; alquilo C₁-C₅; o un radical de la fórmula -(CH₂)_{m2}-O-T₁;

R₂₆ es hidrógeno; o metilo;

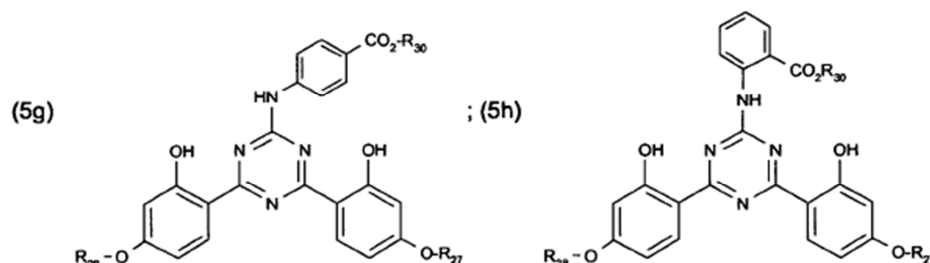
Q₁alquilo C₁-C₁₈; M es un catión de metal; y

- 10 N₁ es 1-16.

Derivados de triazina preferidos adicionales de acuerdo con componente (C₁) son compuestos de las fórmulas

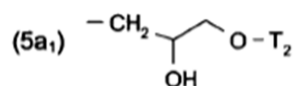


la fórmula



- 15 en los que

R₂₇ y R₂₈, independientemente uno del otro, son alquilo C₃-C₁₈; o -CH₂CH(-OH)-CH₂-O-T₁; R₃₀ es alquilo C₁-C₁₀ o un radical de la fórmula



o la fórmula



R₃₀ es hidrógeno; M; alquilo C₁-C₅; -NH-alquilo C₁-C₅, preferiblemente -NH-tert.alquilo; o un radical de la fórmula $-(\text{CH}_2)_m-\text{O}-\text{T}_2$; T₁ y T₂, independientemente uno del otro, son hidrógeno; o alquilo C₁-C₅; y

5 m es 1 a 4.

De más interés son los compuestos de las fórmulas (5e) y (5f), en las que

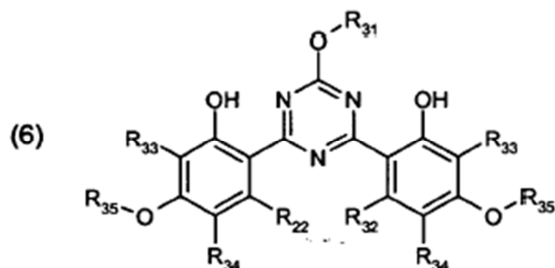
R₂₇ y R₂₈, independientemente uno del otro, son alquilo C₃-C₁₈; o $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2-\text{O}-\text{T}_1$;

R₂₉ es alquilo C₁-C₁₀;

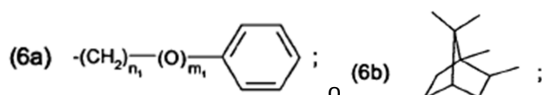
10 y los compuestos de las fórmulas (5g) y (5h), en los que R₂₇ y R₂₈, independientemente uno del otro, son alquilo C₃-C₁₈ o $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2-\text{O}-\text{T}_1$; y T₁ es hidrógeno; o alquilo C₁-C₅.

Muy particularmente preferidos en este caso son los compuestos de triazina de la fórmula (5e)-(5h), en la que R₂₇ y R₂₈ tienen el mismo significado.

Adicionalmente, las triazinas de interés corresponden a la fórmula



15 en el que R₃₁ es alquilo C₁-C₃₀; alqueno C₂-C₃₀; no sustituido o alquilo C₁-C₅ - cicloalquilo C₅-C₁₂ mono o polisustituido, alcoxi C₁-C₅- alquilo C₁-C₁₂; amino- alquilo C₁-C₁₂; monoalquilamino C₁-C₅- alquilo C₁-C₁₂; dialquilamino C₁-C₅- alquilo C₁-C₁₂; un radical de la fórmula

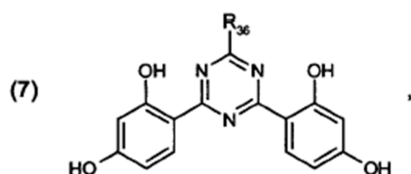


20 R₃₂, R₃₃ y R₃₄, independientemente uno del otro, son hidrógeno; hidroxilo; alquilo C₁-C₃₀; o alqueno C₂-C₃₀; R₃₅ es hidrógeno; o alquilo C₁-C₅;

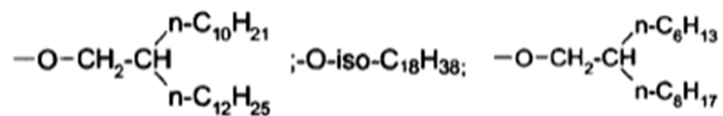
m₁ es 0 o 1; y

n₁ es 1 a 5.

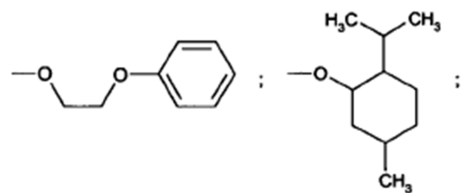
Los compuestos preferidos corresponden a la fórmula



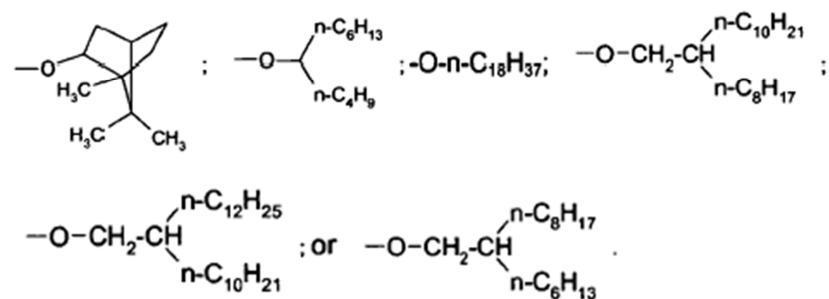
25 en donde

R₃₆ es
$$-\text{O}-n-\text{C}_{18}\text{H}_{37}; 0$$

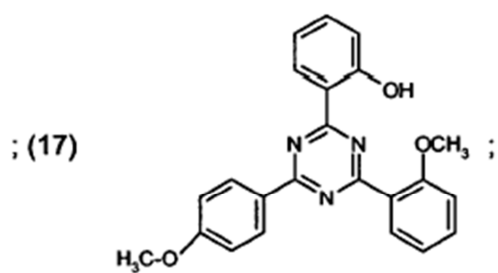
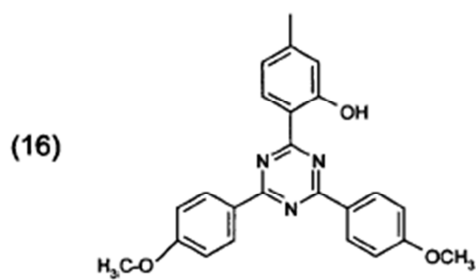
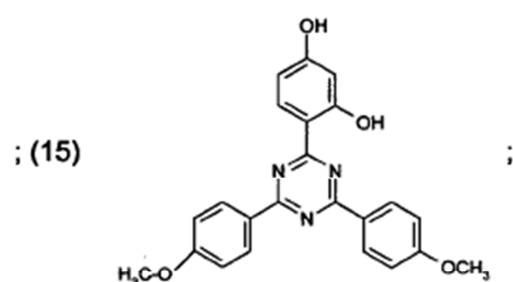
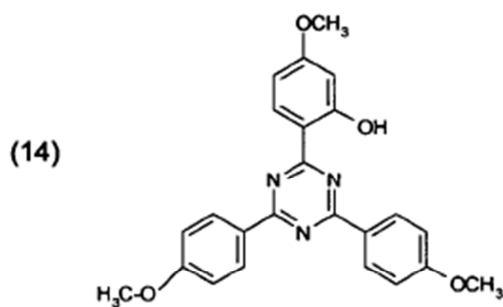
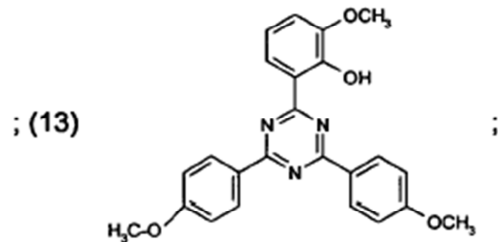
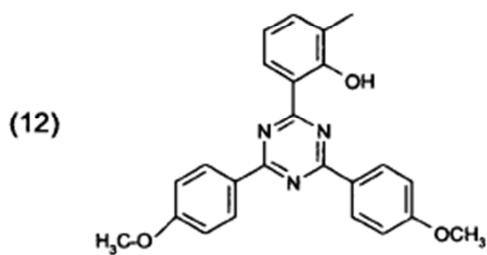
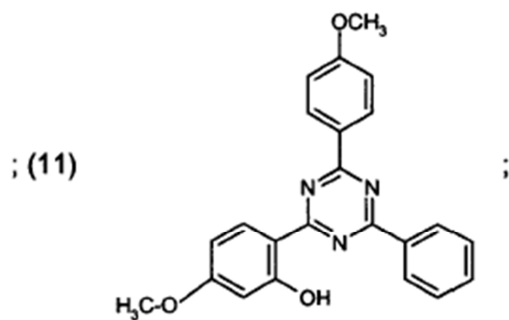
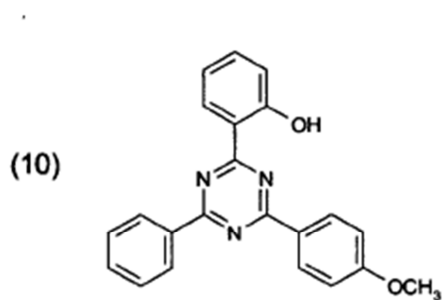
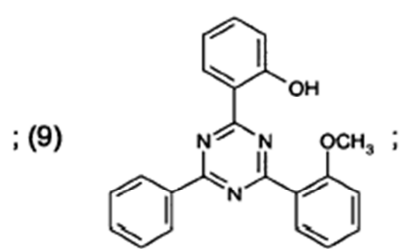
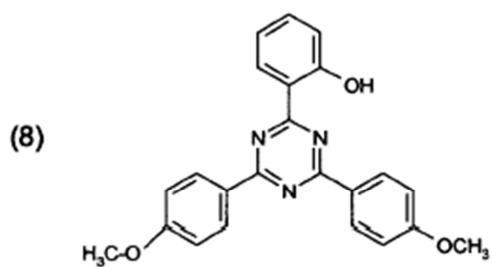
-O-2-etilhexilo; -O-(CH₂)₃-N(C₂H₅)₂;

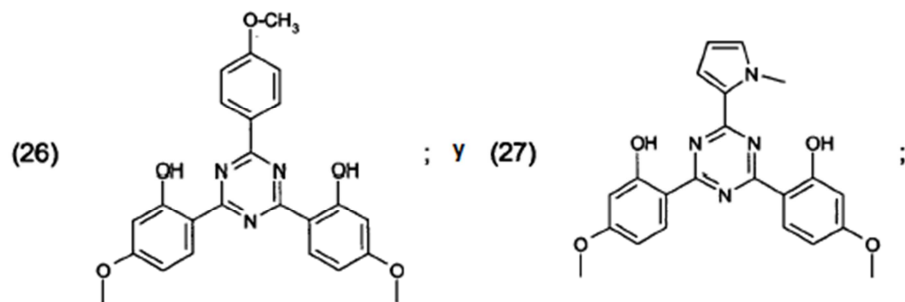
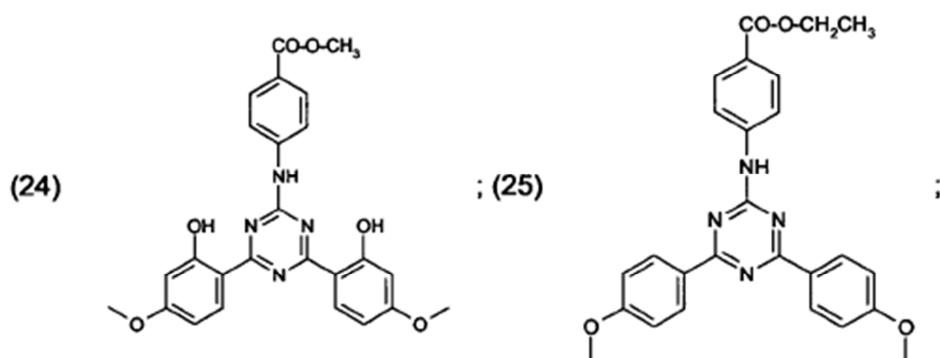
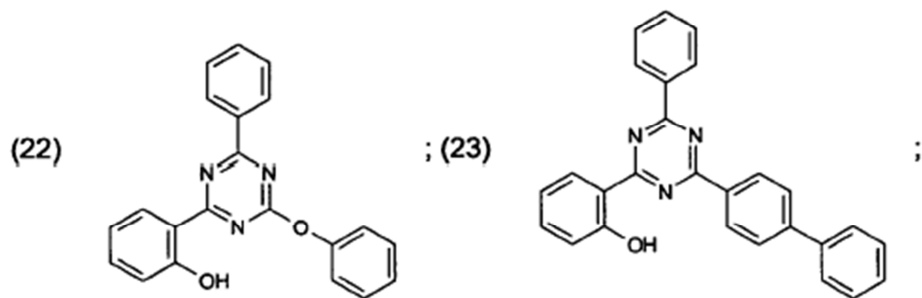
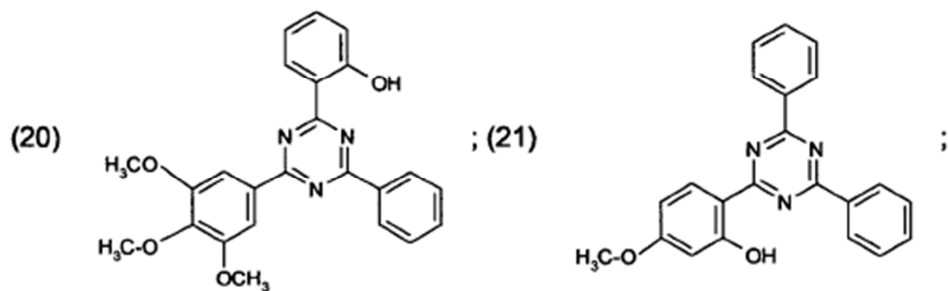
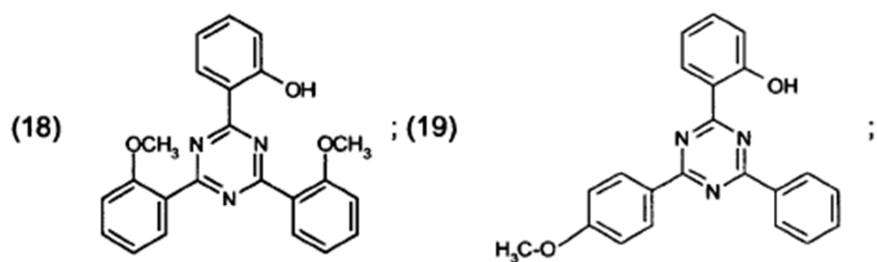


5



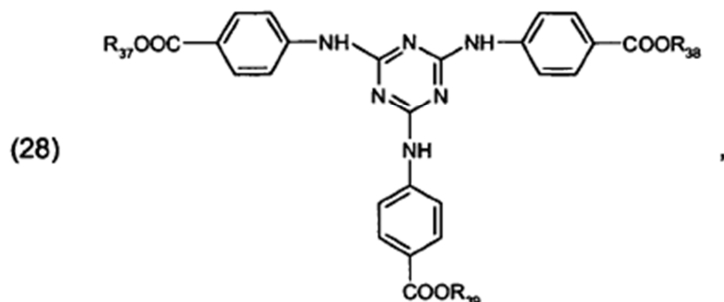
Los derivados de triazina preferidos adicionales de acuerdo con el componente (C₁) son aquellos compuestos que tienen una de las fórmulas





así como también 2,4,6-tris (diisobutil-4'-aminobenzalmalonato) -s- triazina y 2,4-bis (diisobutil-4'-aminobenzalmalonato) - 6-(4'-aminobencilidenocanfor) -s- triazina.

Particularmente los compuestos preferidos de la fórmula (1) son aquellos que tienen la fórmula:

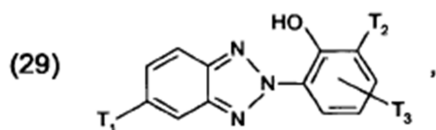


en donde

- 5 R_{37} , R_{38} y R_{39} , independientemente uno del otro son hidrógeno; un metal alcalino; o un grupo amino $N^+(R_{40})_4$; R_{40} es hidrógeno; o un radical orgánico; alquilo C_1-C_3 ; o un radical polioxietileno que contiene de 1 a 10 unidades de óxido de etileno y el grupo terminal OH del cual se puede eterificar mediante un alcohol C_1-C_3 .

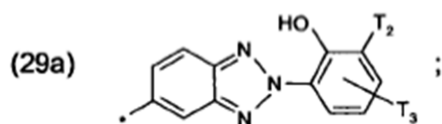
- 10 En relación con los compuestos de la fórmula (28), cuando R_{37} , R_{38} y R_{39} es un metal alcalino es preferiblemente potasio o, especialmente sodio; cuando R_{37} , R_{38} y R_{39} es un grupo $N(R_{40})_4$ en el que R_{40} tiene su significado previo, este es preferiblemente una sal de mono-, di- o tri-alquilamonio C_1-C_4 , una sal mono-, di- o tri-alcanolamonio C_2-C_4 o un éster de alquilo C_1-C_3 del mismo; cuando R_{40} es un grupo alquilo C_1-C_3 , es preferiblemente un grupo alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente un grupo metilo; y cuando R_{30} es un grupo polioxietileno, este preferiblemente contiene de 2-6 unidades de óxido de etileno.

Una clase preferida de absorbentes UV orgánicos micronizados de triazol es aquella que tiene la fórmula



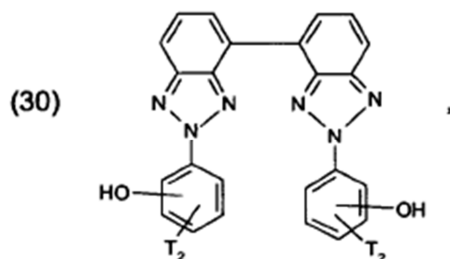
- 15 en donde

T_1 es alquilo C_1-C_3 o, preferiblemente, hidrógeno; o un radical de la fórmula



y T_2 y T_3 , independientemente uno del otro son alquilo C_1-C_{12} , preferiblemente i-octilo; o alquilo C_1-C_4 sustituido por fenilo, preferiblemente α,α -dimetilbencilo.

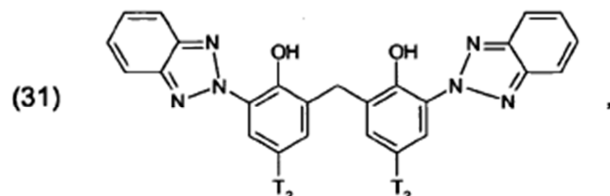
- 20 Una clase preferida adicional de absorbentes UV orgánicos micronizados de triazol corresponde a la fórmula



en donde

T_2 tiene su significado previo.

Aún una clase preferida adicional de absorbentes UV orgánicos micronizados de triazol corresponde a la fórmula



en donde

T₂ es hidrógeno; alquilo C₁-C₁₂, preferiblemente iso-octilo, o alquilo C₁-C₄ sustituido por fenilo, preferiblemente α,α-dimetilbencilo.

Una clase preferida del absorbentes UV orgánicos micronizados amida que contiene un grupo vinilo corresponde a la fórmula:

(32) R₄₁-(Y)_m-CO-C(R₄₂) - C(R₄₃) -N(R₄₄) (R₄₅), en donde

R₄₁ es alquilo C₁-C₃, preferiblemente alquilo C₁-C₂, o fenilo opcionalmente sustituido por uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de OH, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o CO-OR₄₆,

R₄₆ alquilo C₁-C₃;

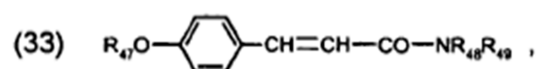
R₄₂, R₄₃, R₄₄ y R₄₅ son los mismos o diferente y cada uno es alquilo C₁-C₃, preferiblemente alquilo C₁-C₂; o hidrógeno;

Y es -NH-; o -O-; y

m es 0; o 1.

Los compuestos preferidos de la fórmula (32)son 4-metil-3-penten-2- ona, etil-3-metilamino-2-butenato, 3-metilamino-1-fenil-2-buten-1- ona y 3-metilamino-1-fenil-2-buten-1- ona.

Una clase preferida de amida de absorbentes UV orgánicos micronizados de amida de ácido cinámico corresponde a la fórmula:



en donde

R₄₇ es hidroxilo o alcoxi C₁-C₄, preferiblemente metoxi o etoxi;

R₄₈ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄, preferiblemente metilo o etilo; y

R₄₉ es-(CONH)_m-fenilo en el que m es 0 o 1 y el grupo fenilo es opcionalmente sustituido por uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de OH, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o CO-OR₅₀; y

R₅₀ es alquilo C₁-C₄.

Las clases preferidas adicionales de los absorbentes UV micronizados o micronizables utilizados por la presente invención son:

- derivados de ácido p-aminobenzoico, típicamente 2-etilhexil-4- dimetilaminobenzoato

- derivados de ácido salicílico, típicamente salicilato de 2-etilhexilo; homosalatos; y silicilatos de isopropilo;

- derivados de benzofenona, típicamente 2-hidroxil-4- metoxibenzofenona;

- derivados de dibenzoilmetano, típicamente 1-(4-tert-butilfenil) -3-(4-metoxifenil) -propano-1,3-diona;
- difenilacrilatos, típicamente 2-etilhexil -2-ciano- 3,3-difenilacrilato y 3-(benzofuranil) -2-cianoacrilato;
- ácido 3-imidazol-4-il-acrílico y 3-imidazol-4-il-acrilato;
- derivados de benzofurano, preferiblemente derivados de 2-(p-aminofenil) benzofurano, descritos en la EP-A-582189, US-A-5338539, US-A-5518713 y EP-A-613893;
- absorbentes UV poliméricos, tales como los derivados de bencilidenomalonato descrito, entre otros en la EPA-709080;
- derivados de ácido cinámico, típicamente el 2-etilhexil-4-metoxicinamato o isoamilato o derivados de ácido cinámico descrito, interalia, en la US-A-5601811 y WO97/00851;
- derivados de canfor, típicamente 3-(4'-metil) bencilidenobornan-2-ona, 3-bencilidenobornan-2-ona, polímero de N-[2(y 4) -2-oxibom-3-ilidenometil) bencil] acrilamida, 3-(4'-trimetilamonio)bencilidenobornan-2-ona metilsulfato, ácido 3,3'-(1,4-fenilenodimetino) -bis (7,7-dimetil-2-oxobiciclo- [2.2.1] heptano-1-metanosulfónico) y las sales de los mismos, 3-(4'-sulfo) bencilidenobornan-2-ona y las sales de los mismos;
- ácidos 2-fenilbencimidazol-5- sulfónicos y las sales de los mismos; y
- mentil-o -aminobenzoato.

En general se entiende que los alcoholes grasos son alcoholes primarios saturados o insaturados (1-alcoholes) que tienen 6 a 22 átomos de carbono. Se obtienen mediante reducción de triglicéridos, ácidos grasos o ésteres de metil de ácido graso.

Las combinaciones preferidas de los activos de detección UV orgánico micronizados insolubles (componente (C₁) y alcoholes grasos C₆-C₂₈ primarios (componente (C₂)) son:

activo de detección UV orgánico micronizado insoluble (C ₁)	alcohol graso C ₆ -C ₂₈ primario (=C ₂)
Compuesto de la fórmula (31), en donde T ₂ es isoctilo	mezcla de octanol lineal y decanol lineal
Compuesto de la fórmula (4)	mezcla de octanol lineal y decanol lineal

El absorbente UV orgánico micronizado, componente (C₁), se produce preferiblemente mediante el método descrito en GBA-2303549, a saber mediante un proceso que comprende moler el absorbente UV orgánico correspondiente, en forma de partícula gruesa, en un aparato de molido, en la presencia de 1 a 50%, preferiblemente 5 a 40% en peso, con base en el absorbente UV orgánico micronizado, de una poliglucósida alquilo que tiene la fórmula C_nH_{2n+1}O(C₆H₁₀O₅)_xH, en la que n es un entero que varía de 8 a 16 y x es el nivel de polimerización promedio de la unidad estructural de glucósida (C₆H₁₀O₅) y varía de 1.4 a 1.6, o un éster del mismo.

Cualquier proceso conocido adecuado para la preparación de micropartículas se puede utilizar para la preparación de los absorbentes UV micronizados, por ejemplo molido en húmedo, amasado en húmedo, secado por rociado de un solvente adecuado, mediante la expansión de acuerdo con el proceso RESS (Expansión Rápida de Soluciones Supercríticas), mediante reprecipitación de solventes adecuados, que incluyen fluidos supercríticos (proceso GASR= Recristalización de Gas Anti-Solvente / proceso PCA= Precipitación con Anti-solventes comprimidos).

Los absorbentes UV micronizados de tal manera obtenidos usualmente tienen un tamaño de partícula promedio de 0.02 a 2, preferiblemente de 0.03 a 1.5, y más especialmente de 0.05 a 1.0 micrómetro.

Los absorbentes UV de acuerdo con el componente (C₁) también se puede utilizar como los sustratos secos en forma de polvo.

La formulación de agua en aceite (w/o) o agua en silicona (w/Si) aplicable tópicamente de acuerdo con la presente invención puede contener adicionalmente uno o más de un filtro UV no micronizado adicional como se enumera en las Tablas 1 y 2.

- 5 Los absorbentes UV como se describe en las Tablas 1 y 2 adelante se pueden agregar a las formulaciones de agua en aceite (w/o) o agua en silicona (w/Si) aplicables tópicamente de acuerdo con la presente invención en una cantidad de 0.1 a 20% en peso. Se pueden utilizar las mezclas de estos absorbentes UV, inter alia, para mejorar la solubilidad o para incrementar la absorción UV.

Tabla 1. Sustancias de filtro UV no micronizadas adecuadas que se pueden utilizar adicionalmente con los absorbentes UV de acuerdo con la presente invención
derivados de ácido p-aminobenzoico, por ejemplo éster de 2-etilhexilo de ácido 4-dimetilaminobenzoico;
derivados de ácido salicílico, por ejemplo éster de 2-etilhexilo de ácido salicílico;
derivados de benzofenona, por ejemplo 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona y su derivado de ácido 5-sulfónico;
derivados de dibenzoilmetano, por ejemplo 1-(4-tert-butilfenil) -3-(4-metoxifenil) -propano-1,3-diona;
difenilacrilatos, por ejemplo 2-etilhexil 2-ciano-3,3-difenilacrilato, y 3-(benzofuranil) 2-cianoacrilato;
Ácido 3-imidazol-4-ilacrílico y ésteres;
derivados de benzofurano, especialmente derivados de 2-(p-aminofenil) benzofurano, descritos en la EP-A-582 189, US-A-5 338 539, US-A-5 518 713 y EP-A-613 893;
absorbentes UV poliméricos, por ejemplo los derivados de malonato bencilideno descritos en la EP-A-709 080;
derivados de ácido cinámico, por ejemplo el éster de 2-etilhexilo de ácido 4-metoxicinnámico y éster de isoamilo o derivados de ácido cinámico descritos en la US-A-5 601 811 y WO 97/00851;
derivados de canfor, por ejemplo 3-(4'-metil) bencilideno-bornan-2-ona, 3-bencilideno-bornan-2-ona, polímero N-[2(y 4) - 2-oxiborn-3-ilideno-metil] -bencil] acrilamida, 3-(4'-trimetilamonio) -bencilideno-bornan-2-ona metil sulfato, 3,3'-(1,4-fenilenedimetino) -bis (ácido 7,7-dimetil-2-oxo-biciclo [2.2.1] heptano-1-metanosulfónico) y sales, 3-(4'-sulfo)bencilideno-bornan-2-ona y sales; metosulfato de canforbenzalconio;
Compuestos de hidroxifeniltriazina, por ejemplo 2-(4'-metoxifenil) -4,6-bis (2'-hidroxi-4'-n-octiloxifenil) -1,3,5- triazina; 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-etilhexiloxi) -2-hidroxi]- fenil}- 6-[4-(2-metoxietil-carboxil) -fenilamino]-1,3,5- triazina; 2,4- bis{[4-(tris (trimetilsililoxi-sililpropiloxi) -2-hidroxi)- fenil]- 6-(4-metoxifenil) -1,3,5- triazina; 2,4-bis{[4-(2"- metilprofeniloxi) -2-hidroxi]- fenil}- 6-(4-metoxifenil) -1,3,5- triazina; 2,4-bis{[4-(1',1',1',3',5',5',5'- heptametiltrisilil-2"-metil-propiloxi) -2-hidroxi]- fenil}- 6-(4-metoxifenil) -1,3,5- triazina; 2,4-bis{[4-(3-(2- propiloxi) -2-hidroxi-propiloxi) -2-hidroxi]- fenil}- 6-[4-etilcarboxi) -fenilamino]-1,3,5- triazina;
compuestos de benzotriazol, por ejemplo 2,2'-metileno-bis (6-(2H-benzotriazol-2-il) -4-(1,1,3,3- tetrametilbutil) -fenol;
Derivados de trianilino-s- triazina, por ejemplo 2,4,6-trianilina-(p-carbo-2'-etil-1'-oxi) -1,3,5- triazina y los absorbentes UV descritos en la US-A-5 332 568, EP-A-517 104, EP-A-507 691, WO 93/17002 y EP-A-570 838;
ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico y sales de los mismos;
Mentil o-aminobenzoatos;

(continuación)

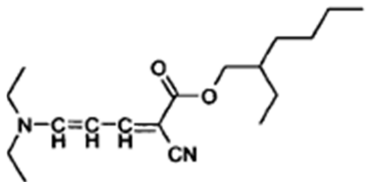
Tabla 1. Sustancias de filtro UV no micronizadas adecuadas que se pueden utilizar adicionalmente con los absorbentes UV de acuerdo con la presente invención
Protectores solares físicos o no como dióxido de titanio, óxido de zinc, óxidos de hierro, mica, MnO, Fe ₂ O ₃ Ce ₂ O ₃ , Al ₂ O ₃ , ZrO ₂ . (recubrimientos de superficie: polimetilmetacrilato, meticona (metilhidrogenopolisiloxano como se describe en CAS 9004-73-3), dimeticona, triisoesterato de isopropil titanio (como se describe en CAS 61417-49-0), jabones de metal como estearato de magnesio (como se describe en CAS 4086-70-8), fosfatos de perfluoroalcohol como fosfato de fluoroalcohol C9-15 (como se describe en CAS 74499-44-8; JP 5-86984 , JP 4-330007)). El tamaño de partícula principal tienen u promedio de 15 nm-35 nm y el tamaño de partícula en dispersión está en el rango de 100 nm – 300 nm.
derivados de aminohidroxi- benzofenona descritos en la DE 10011317, EP 1133980 y EP 1046391
Derivados de fenil-bencimidazol como se describe en la EP 1167358
los absorbentes UV descritos en "Sunscreens", Eds. N.J. Lowe, N.A.Shaath, Marcel Dekker, Inc. , New York y Basle or in Cosmetics & Toiletries (107), 50ff (1992) también se pueden utilizar como sustancias protectoras UV adicionales.

Tabla 2: Sustancias y adyuvantes de filtro UV no micronizado específico que se pueden utilizar adicionalmente con los absorbentes UV de acuerdo con la presente invención		
No.	Nombre químico	CAS No.
1	(+/-) -1,7,7-trimetil-3-[(4- metilfenil)metileno] biciclo- [2.2.1] heptan-2- ona; p- metil bencilideno canfor	36861-47-9
2	1,7,7-trimetil-3-(fenilmetileno) biciclo [2.2.1] heptan-2- ona; bencilideno canfor	15087-24-8
3	(2-Hidroxi-4-metoxifenil)(4- metilfenil) metanona	1641-17-4
4	2,4-dihidroxibenzofenona	131-56-6
5	2,2',4,4'- tetrahidroxibenzofenona	131-55-5
6	2-Hidroxi-4-metoxi benzofenona;	131-57-7
7	Ácido 2-Hidroxi-4-metoxi benzofenona-5-sulfónico	4065-45-6
8	2,2'-dihidroxi-4,4'- dimetoxibenzofenona	131-54-4
9	2,2'-Dihidroxi-4- metoxibenzofenona	131-53-3
10	Ácido alfa -(2-oxobom-3-ilideno) toluene-4-sulfónico y sus sales; Mexoryl SL	56039-58-8
11	1-[4-(1,1-dimetiletil)fenil]- 3-(4-metoxifenil)propano-1,3- diona; avobenzona	70356-09-1
12	Sulfato de Metil N,N,N-trimetil-4-[(4,7,7- trimetil-3-oxobiciclo [2,2,1]hept-2- ilideno) metil]anilinio; Mexoryl SO	52793-97-2
22	benzoato de 3,3,5-Trimetil ciclohexil-2- hidroxi; homosalato	118-56-9

(continuación)

Tabla 2: Sustancias y adyuvantes de filtro UV no micronizado específico que se pueden utilizar adicionalmente con los absorbentes UV de acuerdo con la presente invención		
23	Isopentil p-metoxicinamato; cinamato isoamil metoxi	71617-10-2
27	Mentil-o-aminobenzoato	134-09-8
28	Mentil salicilato	89-46-3
29	2-Etilhexil 2-ciano,3,3- difenilacrilato; octocrileno	6197-30-4
30	Benzoato de 2- etilhexil 4- (dimetilamino)	21245-02-3
31	2-etilhexil 4-metoxicinamato; octil metoxi cinamato	5466-77-3
32	2- etilhexil salicilato	118-60-5
33	Ácido Benzoico, 4, 4', 4"- (1, 3, 5- triazina-2, 4, 6-triiltriimino)tris-, tris (2-etilhexil) éster; 2,4,6- Trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'- oxi) -1,3,5- triazina; octil triazona	88122-99-0
34	Ácido 4- aminobenzoico	150-13-0
35	Ácido Benzoico, 4-amino-, éster de etilo, polímero con oxirano	113010-52-9
38	Ácido 2- fenil- 1H- bencimidazol- 5- sulfónico; ácido fenilbencimidazolsulfónico	27503-81-7
39	2-Propenamida, N-[[4-[(4,7,7- trimetil-3-oxobiciclo [2.2.1] hept-2- ilideno)metil] fenil]metil]-, homopolímero	147897-12-9
40	Trietanolamina salicilato	2174-16-5
41	3, 3'-(1,4-fenilonedimetileno)bis [ácido 7, 7-dimetil-2-oxo-biciclo [2.2.1] heptano-1 metanosulfónico]; Cibafast H	90457-82-2
42	Dióxido de titanio	13463-67-7
44	Óxido de zinc	1314-13-2
45	2,4-bis[[4-(2-etilhexiloxi) -2- hidroxil- fenil]- 6-(4- metoxifenil) - (1,3,5) - triazina; Tinosorb S	187393-00-6
46	Ácido 1H-Bencimidazol-4,6-disulfónico , 2,2'-(1,4-fenilene)bis-, sal de sodio	180898-37-7
47	Ácido Benzoico, 4,4'-[[6-[[4-[(1,1- dimetiletil)amino]carbonil] fenil]amino]1,3,5- triazina-2,4- diil]diimino]bis-, bis(2-etilhexil) éster; dietilhexil butamido triazona; Uvasorb HEB	154702-15-5
48	Fenol, 2-(2H-benzotriazol-2-il) -4- metil-6-[2-metil-3-[1,3,3,3-tetrametil-1-[(trimetilsilil)oxi] disiloxanil]propil]-; drometrisol trisiloxano; Mexoryl XL	155633-54-8

(continuación)

Tabla 2: Sustancias y adyuvantes de filtro UV no micronizado específico que se pueden utilizar adicionalmente con los absorbentes UV de acuerdo con la presente invención		
49	Dimeticodietilbenzmalonato; Polisilicona 15; Parsol SLX	207574-74-1
50	Ácido Bencenosulfónico, 3-(2H- benzotriazol-2-il) -4-hidroxi-5-(1- metilpropil) -, sal de monosodip; Tinogard HS	92484-48-5
51	Ácido benzoico, 2-[4-(dietilamino) -2- hidroxibenzoil]-, hexil éster; Uvinul a plus	302776-68-7
52	1-Dodecanaminium, N-[3-[[4-(dimetilamino)benzoil] amino]propil]-N,N-dimetil-, sal con ácido 4-metilbencenosulfónico (1:1); Escalol HP610	156679-41-3
53	1-Propanaminio, N,N,N-trimetil- 3-[(1-oxo-3-fenil-2- propenil) -amino]-, cloruro	177190-98-6
54	Ácido 1H-Bencimidazol-4,6-disulfónico , 2,2'-(1,4-fenilene)bis-	170864-82-1
55	1,3,5- triazina, 2,4,6-tris (4- metoxifenil) -	7753-12-0
56	1,3,5- triazina, 2,4,6-tris[4-[(2- etilhexil)oxi]fenil]-	208114-14-1
57	1-Propanaminio, 3-[[3-[3-(2H- benzotriazol-2-il) -5-(1,1-dimetiletil) -4-hidroxifenil]-1- oxopropil]amino]-N,N-dietil-N-metil-, metil sulfato (sal)	340964-15-0
58	Ácido 2-Propenoico, 3-(1H-imidazol-4- il)-	104-98-3
59	Ácido Benzoico, 2-hidroxi-, [4-(1- metiletil)fenil]metil +éster	94134-93-7
60	1,2,3-Propanotriol, 1-(4- aminobenzoato); gliceril PABA	136-44-7
61	Ácido Bencenoacético, 3,4-dimetoxi- α -oxo-	4732-70-1
62	Ácido 2-Propenoico, 2-ciano-3,3- difenil-, etil éster	5232-99-5
63	Ácido Antralínico, p-ment-3-il éster	134-09-8
64	Ácido 2,2'-bis (1,4-fenilene) -1H- bencimidazol-4,6-disulfónico sal de mono sodio o Disodio fenil dibenzimidazol tetrasulfonato o Neoheliopan AP	349580-12-7,
65	1,3,5- triazina-2,4,6-triamina, N,N'- bis[4-[5-(1,1-dimetilpropil) -2- benzoxazolil] fenil]-N''-(2- etilhexil) - o Uvasorb K2A	288254-16-0
66	Derivados de Merocianina como se describe en la WO 2004006878 y en IPCOM000022279D	
67		

(continuación)

Tabla 2: Sustancias y adyuvantes de filtro UV no micronizado específico que se pueden utilizar adicionalmente con los absorbentes UV de acuerdo con la presente invención		
68	esteroles (colesterol, lanosterol, fitosteroles), como se describe en WO0341675	
69	micosporinas y/o aminoácidos similares a micosporina acids como se describe en la WO2002039974, e.g. Helioguard 365 de Milbelle AG, isolated aminoácidos similares a micosporina del alga roja porphyra umbilicalis (INCI: Porphyrin Umbilicalis) que se encapsula en liposomea,)	
70	Ácido alfa -lipoico como se describe en DE 10229995	
71	Polímeros orgánicos sintéticos como se describe en la EP 1371358, [0033]-[0041]	
72	filosilicatos como se describe en la EP 1371357 [0034]-[0037]	
73	Compuestos de sílice como se describe en la EP1371356, [0033]-[0041]	
74	partículas inorgánicas como se describe en la DE10138496 [0043]-[0055]	
75	Partículas de látex como se describe en la DE10138496 [0027]-[0040]	
76	Ácido 1H-Bencimidazol-4,6-disulfónico, 2,2'-(1,4-fenileno)bis-, sal de disodio; Bisimidaziato; Neo Heliopan APC	180898-37-7

Las formulaciones aplicables tópicamente de la presente invención comprenden por lo menos una fase de agua y una fase oleosa.

- 5 Preferiblemente se formulan como emulsiones o microemulsiones agua en aceite (w/o) o agua en silicona (w/Si).

Pueden contener emulsificantes de bajo peso molecular seleccionados de emulsificantes no-iónico, catiónico, anfotérico y aniónico de 0.1 a 20 % en peso.

La composición fotoprotectora UV (c) se prepara al incorporar el componente (C₂) en la dispersión del absorbente UV que contiene el absorbente UV micronizado al mezclar simplemente los 2 componentes.

- 10 La composición fotoprotectora UV así obtenida (c) preferiblemente se incorpora en la fase de aceite de la emulsión W/O.

La adición simple de tal composición fotoprotectora UV ayuda a estabilizar o aún eliminar el crecimiento de cristal del agente de detección UV orgánico micronizado seleccionado dentro de la fase oleosa de la emulsión W/O o W/Si, o en la fase Si- de la emulsión w/Si respectivamente.

- 15 Las formulaciones W/O o W/Si finales de acuerdo con la presente invención pueden existir en una amplia variedad de formas de presentación, por ejemplo:

- en la forma de preparaciones líquidas como una emulsión W/O, O/W, O/W/O, W/O/W o PIT y todas las clases de microemulsiones,

- en la forma de un gel,

- en la forma de un aceite, una crema, leche o loción,
- en la forma de un palillo,
- en la forma de un rociador (rociador con gas propulsor o rociador con acción de bomba) o un aerosol,
- en la forma de una espuma, o
- 5 - en la forma de una pasta.

De especial importancia como las preparaciones cosméticas para la piel son las preparaciones protectoras de luz, tales como leches solares, lociones, cremas, aceites, filtros solares o tropicales, preparaciones para prebronceado o preparaciones para después del sol, también de bronceado para la piel, por ejemplo, cremas de auto- bronceado. De particular interés son las cremas de protección solar, lociones de protección solar, leche de protección solar y preparaciones de protección solar en forma de un aerosol.

De especial importancia como preparaciones cosméticas para el cabello son las preparaciones mencionadas anteriormente para el tratamiento del cabello, especialmente preparaciones para lavado del cabello, en forma de champús, acondicionadores para el cabello, preparaciones para el cuidado del cabello, por ejemplo, preparaciones de pretratamiento, tónicos para el cabello, cremas fijadoras, geles fijadores, pomadas, enjuagues para el cabello, paquetes de tratamiento, tratamientos intensivos para cabello, preparaciones de alisado de cabello, preparaciones para fijación del cabello líquidas, espumas y lacas del cabello. De especial interés son las preparaciones para lavado del cabello en forma de champú.

Como emulsiones o microemulsiones que contienen agua y aceite las preparaciones contienen, por ejemplo, de 0.1 a 30 % en peso, preferiblemente de 0.1 a 15 % en peso y especialmente de 0.5 a 10 % en peso, con base en el peso total de la composición, de una composición fotoprotectora UV efectiva (= componente (c));

de 1 a 60 % en peso, especialmente de 5 a 50 % en peso y preferiblemente de 10 a 35 % en peso, con base en el peso total de la composición, de por lo menos un componente aceite,

de 0 a 30 % en peso, especialmente de 1 a 30 % en peso y preferiblemente de 4 a 20 % en peso, con base en el peso total de la composición, de por lo menos un emulsificante,

de 10 a 90% en peso, especialmente de 30 a 90% en peso, con base en el peso total de la composición, de agua, y de 0 a 88.9 % en peso, especialmente de 1 a 50 % en peso, de adyuvantes cosméticamente aceptables adicionales.

La formulación de agua en aceite (w/o) o agua en silicona (w/Si) aplicable tópicamente también puede contener uno o más compuestos adicionales como ésteres de ácidos grasos, triglicéridos naturales o sintéticos que incluyen ésteres de glicerilo y derivados, ceras de brillo perlado, aceites de hidrocarburos, siliconas o siloxanos (polisiloxanos organosustituidos), aceites fluorados o perfluorados, agentes de super-engorde, agentes tensoactivos, reguladores de consistencia/ espesantes y modificadores de reología, polímeros, ingredientes activos biogénicos, ingredientes activos desodorantes, agentes anticasca, antioxidantes, agentes hidrotropicos, conservantes y agentes inhibidores de las bacterias, aceites de perfume, colorantes, repelentes de insectos o gránulos de polímeros o esferas huecas como potenciadores de SPF.

Las formulaciones cosméticas o farmacéuticas están contenidas en una amplia variedad de preparaciones cosméticas, como preparaciones para el cuidado de la piel, preparaciones para el baño, preparaciones cosméticas para el cuidado personal, preparaciones de cuidado de los pies, preparaciones para protección de luz, preparaciones para auto-bronceado, preparaciones despigmentantes, repelentes de insectos, preparaciones de desodorantes para la limpieza y el cuidado de la piel manchada, por ejemplo, detergentes sintéticos (sólido o líquido), preparaciones exfoliación o depuración o máscaras para exfoliar, preparaciones para eliminación del vello en forma química (depilación), - preparaciones para el afeitado, preparaciones de fragancias, preparaciones de tratamiento para el cabello cosméticas .

La preparación cosmética de acuerdo con la invención se caracteriza por una excelente protección de la piel humana contra los efectos dañinos de la luz solar

Ejemplos

Ejemplo 1: TINOSORB®M & Tinosorb®OMC que contienen protector solar W/O

(c): ejemplo de referencia

Composición		Ej. 1a ⁽²⁾	Ej. 1b
	Nombre INCI	%p/p (tal como se suministra)	% p/p (tal como se suministra)
Parte A	Oleato de glicerilo	4.50	4.50
	Aceite de ricino hidrogenado PEG-7	1.50	1.50
	Aceite de ricino hidrogenado	0.50	0.50
	Cera microcristalina	2.00	2.00
	Metoxicinamato Etilhexilo	5,00	5,00
	Cera de abejas	1.50	1.50
	Benzoato de alquilo C ₁₂ -15	8.00	8.00
	Isostearato Isopropilo	5.00	5.00
	Aceite Mineral	5.00	5.00
Parte B	Agua	cs. para 100	cs. para 100
	Sulfato de magnesio	0.50	0.50
	Ácido cítrico	0.05	0.05
Parte C	Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutil-fenol (y) Agua (and) Propilenglicol (y) Decil Glucósida (y) goma Xantano	3,75 a.i.	3,75 a.i.
	Butiloctanol	1.40	-
	Mezcla de Octanol y Decanol	-	0.90

Instrucción de manufactura: Se calienta separadamente la parte A a 80°C y la B a 80°C. Se agrega lentamente la parte B a la parte A bajo agitación rápida. Se disminuye la velocidad hasta una agitación moderada de 500 rpm. Se deja enfriar hasta 35°C y se agrega la parte C.

Ejemplo 2: Protector solar W/O (c): ejemplo de referencia

Composición		Ej. 2a(2)	Ej. 2b
	Nombre INCI	%p/p (tal como se suministra)	% p/p (tal como se suministra)
Parte A	Dipolihiroxistearato PEG-30	2.00	2.00
	Isononanoato Cetearilo	5.00	5.00
	Polideceno hidrogenado	3.50	3.50

(continuación)

Composición		Ej. 2a(2)	Ej. 2b
	Nombre INCI	%p/p (tal como se suministra)	% p/p (tal como se suministra)
	Metoxicinamato de Etilhexilo	5.00	5.00
	Benzoato alquilo C ₁₂₋₁₅	4.00	4.00
	Ciclometicona	3.00	3.00
Parte B	Agua	cs. para 100	cs. para 100
	Sorbeth-30	3.00	3.00
	Sulfato de magnesio	0.70	0.70
Parte C	Propilenglicol (y) Diazolidinil Urea (y) Metilparabeno (y) Propilparabeno	0.30	0.30
	Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametil-butilfenol (y) Agua (y) Propilenglicol (y) Decil Glucosida (y) Goma xantano	3,75 a.i.	3,75 a.i.
	Butiloctanol	2.80	-
	Mezcla de Octanol y Decanol	-	1.40

- 5 Instrucción de fabricación: Caliente la parte A y parte B de forma separada a 80 C bajo agitación. Agregue la parte B a la parte A con agitación continua. Homogenice durante 30 seg. con Ultra Turrax a 11000 rpm. Deje enfriar por debajo de 40°C y agregue la parte C. Enfríe a temperatura ambiente bajo agitación continua.

Ejemplo 3: Protector solar W/O

Composición		Ej. 3a(c)	Ej. 3b
	Nombre INCI	% p/p (tal como se suministra)	% p/p (tal como se suministra)
Parte A	Dipolihiroxistearato PEG-30		5.00
	Lsononanoatp de Cetearilo		2.50
	Polideceno hidrogenado		6,50
	Metoxicinamato Etilhexilo		4,00
	Benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅		0.50
Parte B	Agua		Cs. para 100
	Sorbeth-30		1.00

(continuación)

Composición		Ej. 3a(c)	Ej. 3b
	Nombre INCI	% p/p (tal como se suministra)	% p/p (tal como se suministra)
Parte C	Propilenglicol (y) Diazolidinyl Urea (y) Metilparabeno (y) Propilparabeno		3,75 a.i.
	Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol (y) Agua (y) Propilenglicol (y) Decil Glucosida (y) Goma xantano		0.30
	Butiloctanol	1.15	-
	Mezcla de Octanol y Decanol	-	1.15
(c): ejemplo de referencia			
Apariencia: emulsión viscosa blanca Viscosidad (Brookfield DVIII+LV/T-C/50 rpm): 80000-100000 mPas			

- 5 Instrucción de fabricación: Caliente la parte A a 70°C bajo agitación continua. Agregue la parte B a la parte A y homogenice durante un minuto por 11000 rpm. Deje enfriar a temperatura ambiente y agregue la parte C bajo agitación suave.

Ejemplo 4: Emulsión solar W/O

Composición		Ej. 4a(c)	Ej. 4b
	Nombre INCI	% p/p (tal como se suministra)	% p/p (tal como se suministra)
Parte A	Isostearato de Sorbitán	5.00	5.00
	Alcohol Lanolina	1.00	1.00
	Aceite de ricino hidrogenado PEG-7	1.50	1.50
	Cera microcristalina	1.50	1.50
	Vaselina	3.00	3.00
	Triglicérido caprílico/cáprico	1,50	1,50
	Metoxicinamato Etilhexilo	5.00	5.00
	Parafinium Subliquidum	5.00	5.00
Parte B	Agua	cs. para 100	cs. para 100
	Sulfato de magnesio	0.70	0.70
Parte C	Metileno Bis-Benzotriazolil Tetrametil-butilfenol (y) Agua (y) Propilenglicol (y) Decil Glucosida (y) Goma xantano	3,75 a.i.	3,75 a.i.

ES 2 377 132 T3

(continuación)

Composición		Ej. 4a(c)	Ej. 4b
	Nombre INCI	% p/p (tal como se suministra)	% p/p (tal como se suministra)
Parte C	Propilenglicol (y) Diazolidinyl Urea (y) Metilparabeno (y) Propilparabeno	0.30	0.30
	Butiloctanol	0.80	
	Mezcla de Octanol y Decanol		0.80
* Medición hecha sobre Analizador de Transmitancia UV Labsphere 1.2 $\mu\text{l}/\text{cm}^2$ sobre PMMA (c) :ejemplo de referencia			

- 5 Instrucción de fabricación: Caliente la fase Aa 75° C. agregue la parte B a la parte A y homogenice durante 30 seg.a11000 rpm. Deje enfriar a 50°C y agregue la p arte C. Agitación continua hasta temperatura ambiente.

REIVINDICACIONES

1. Una formulación de agua en aceite (w/o) o agua en silicona (w/Si) aplicable tópicamente que comprende:

(a) 10 a 90% en peso de por lo menos una fase acuosa:

(b) 1 a 60% en peso de por lo menos una fase grasa;

5 (c) 0.1 a 30% en peso de una composición fotoprotectora UV efectiva que comprende

(C₁) 20% a 99% de por lo menos un activo de detección UV orgánico micronizado insoluble con una tamaño de partícula promedio que varía de 0,01 µm a 2 µm;

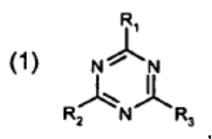
(C₂) 0.5% a 80% de una mezcla de octanol lineal y decanol lineal;

0 a 30% en peso de por lo menos un emulsificante: y

10 0 a 88.9% en peso de adyuvantes cosméticamente aceptables adicionales.

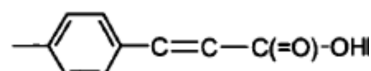
2. Formulación de acuerdo con la reivindicación 1, en donde (C₁) se selecciona de una triazina, un benzotriazol, una benzofenona, una amida que contiene grupo vinilo, una amida de ácido cinámico y un absorbente UV de bencimidazol sulfonatado.

15 3. Formulación de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde el absorbente UV de triazina corresponde a la fórmula

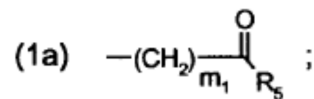


en donde

20 R₁, R₂ y R₃, independientemente uno del otro, son hidrógeno; hidroxilo; alcoxi C₁-C₃; NH₂; NHR₄; N(R₄)₂; OR₄; arilo C₆-C₁₂; fenoxi; anilino; pirrolo; en el que las unidades estructurales fenilo, fenoxi, anilino o pirrolo son no sustituidas o sustituidas por uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de OH, carboxi, CO-NH₂, alquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂, un grupo metilidenocanfor, un grupo -(CH=CH)_mC(=O)-OR₄, un grupo



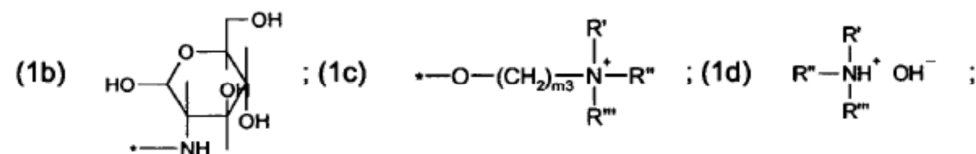
o el metal alcalino correspondiente, sales de amonio, mono-, di- o tri-alquilamonio C₁-C₄, mono-, di- o tri-alcanolamonio C₂-C₄, o los ésteres de alquilo C₁-C₃ de los mismos o mediante un radical de la fórmula



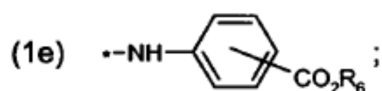
25

R₄ es alquilo C₁-C₅;

R₅ es hidroxilo; alquilo C₁-C₅ que no se sustituye o se sustituye por uno o más grupos OH; alcoxi C₁-C₅; amino; mono o di-alquilamino C₁-C₅; M; un radical de la fórmula o

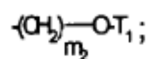


30 o



R', R'' y R''' independientemente del otro son alquilo C₁-C₄ que no se sustituye o se sustituye por uno o más grupos OH;

R₆ es hidrógeno; M; alquilo C₁-C₅; o un radical de la fórmula



M es un catión de metal;

T₁ es hidrógeno; o alquilo C₁-C₈;

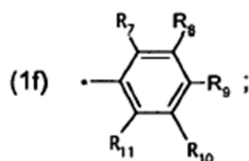
m es 0 o 1;

m₁ es de 1 a 5;

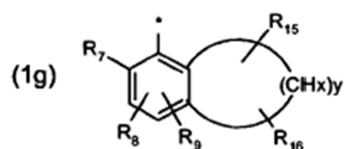
m₂ es de 1 a 4; y

m₃ es de 2 a 14.

4. Formulación de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde el absorbente UV de triazina corresponde a la fórmula (1), en donde R₁, R₂ y R₃ independientemente uno del otro son un radical de la fórmula

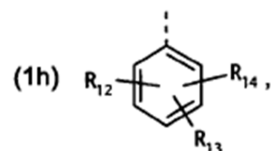


o



R₇ y R₁₁ independientemente uno del otro son hidrógeno; alquilo C₁-C₁₈; o arilo C₆-C₁₂;

R₈, R₉ y R₁₀, independientemente uno del otro, son hidrógeno; o un radical de la fórmula



en donde, en la fórmula (1f), por lo menos uno de los radicales R₈, R₉ y R₁₀ son un radical de la fórmula (1h);

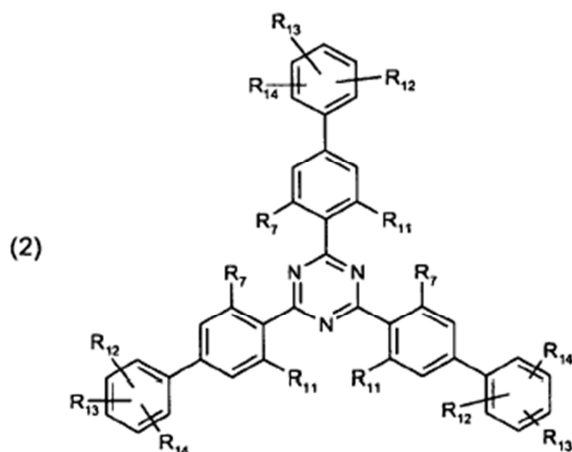
R₁₂, R₁₃, R₁₄, R₁₅ y R₁₆ independientemente uno del otro son hidrógeno; hidroxilo; halógeno; alquilo C₁-C₁₈; alcoxi C₁-C₁₈; arilo C₆-C₁₂; bifenililo; ariloxi C₆-C₁₂; alquiltio C₁-C₁₈; carboxi; -COOM; alquilcarboxilo C₁-C₁₈; aminocarbonilo; o mono- o di-alquilamino C₁-C₁₈; acilamino C₁-C₁₀; -COOH;

M es un ión de metal alcalino;

x es 1 o 2; y

y es un número de 2 a 10.

5. Formulación de acuerdo con la reivindicación 4, en donde las triazinas corresponden a la fórmula



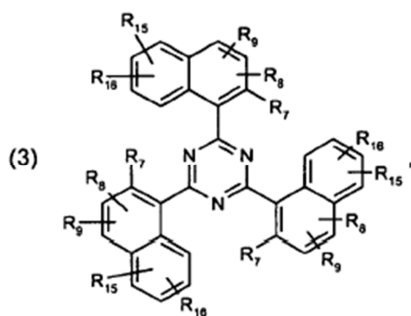
en donde

5 R₇, R₁₁, R₁₂, R₁₃ y R₁₄ se definen como en la reivindicación 4.

6. Formulación de acuerdo con la reivindicación 5, en donde

R₇ y R₁₁ son hidrógeno.

7. Formulación de acuerdo con la reivindicación 4, en donde el componente (C₁) se relaciona con compuestos de la fórmula



10

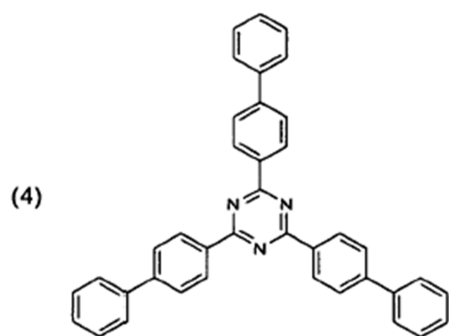
en donde

R₇, R₈, R₉, R₁₅ y R₁₆ se definen como en la reivindicación 4.

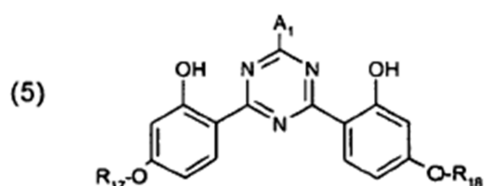
8. Formulación de acuerdo con la reivindicación 7, en donde

R₇, R₈, R₉, R₁₅ y R₁₆ son hidrógeno; o, independientemente uno del otro, alquilo C₁-C₁₈.

15 9. Formulación de acuerdo con la reivindicación 5, en donde el componente (C₁) corresponde a la fórmula

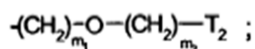


10 Formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el absorbente UV de triazina tiene la fórmula

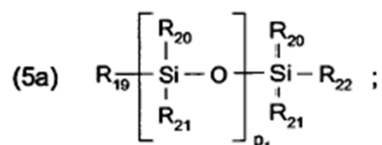


5 en donde

R₁₇ y R₁₈, independientemente uno del otro, son alquilo C₁-C₁₈; alqueno C₂-C₁₈; un radical de la fórmula -CH₂-CH(-OH)-CH₂-O-T₁; o un radical de la fórmula



un radical de la fórmula

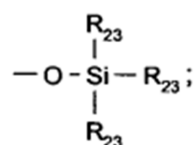


10

R₁₉ es un enlace directo; una cadena recta o radical alqueno C₁-C₄ ramificado o un radical de la fórmula



R₂₀, R₂₁ y R₂₂, independientemente uno del otro, son alquilo C₁-C₁₈; alcoxi C₁-C₁₈ o un radical de la fórmula



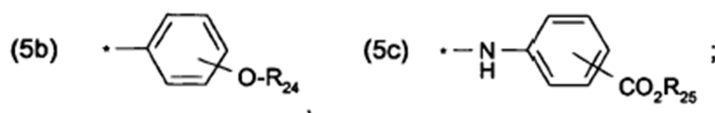
15 R₂₃ es alquilo C₁-C₅;

T₁ y T₂, independientemente uno del otro, son hidrógeno; o alquilo C₁-C₈;

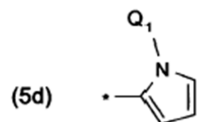
m₁, m₂ y m₃, independientemente uno del otro, son 1 a 4;

p₁ es 0; o un número de 1 a 5;

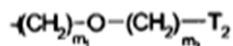
A₁ es un radical de la fórmula



o de la fórmula



R₂₄ es hidrógeno; alquilo C₁-C₁₀, -(CH₂CHR₂₆-O)_{n1}R₂₅; un -CH₂-CH(-OH)-CH₂-O-T₁; o radical de la fórmula



5

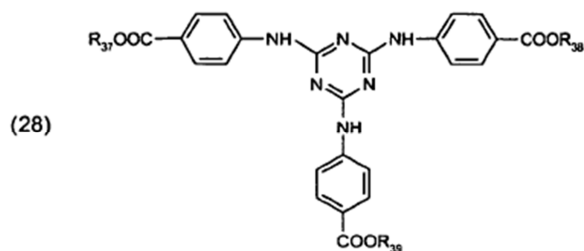
R₂₅ es hidrógeno; M; alquilo C₁-C₅; o un radical de la fórmula -(CH₂)_{m2}-O-T₁;

R₂₆ es hidrógeno; o metilo;

Q₁alquilo C₁-C₁₈; M es un catión de metal; y

n₁ es 1-16.

- 10 11. Una formulación de protección solar de acuerdo con la reivindicación 1 o 2 en donde el compuesto triazina de acuerdo con el componente (c₁) corresponde a la fórmula

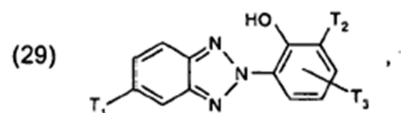


en donde

R₃₇, R₃₈ y R₃₉, independientemente uno del otro son hidrógeno; un metal alcalino; un grupo amonio N⁺(R₄₀)₄;

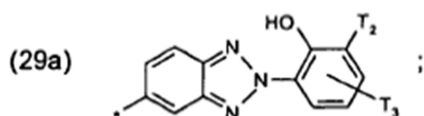
- 15 R₄₀ es hidrógeno; o un radical orgánico; alquilo C₁-C₃; o un radical polioxietileno que contienen de 1 a 10 unidades de óxido de etileno y el grupo terminal OH del cual se puede eterificar mediante un alcohol C₁-C₃.

12. Formulación de acuerdo con la reivindicación 1 o 2 en el que el absorbente UV orgánico de triazol tiene la fórmula



- 20 en donde

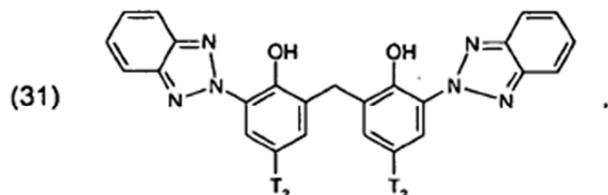
T₁ es alquilo C₁-C₃ o, preferiblemente, hidrógeno; o un radical de la fórmula



y

T₂ y T₃, independientemente uno del otro son alquilo C₁-C₁₂, preferiblemente i-octilo; o alquilo C₁-C₄ sustituido por fenilo, preferiblemente α,α-dimetilbencilo.

13. Formulación de acuerdo con la reivindicación 2 en la que el absorbente de UV orgánico de benzotriazol
5 corresponde a la fórmula



en donde

T₂ es hidrógeno; alquilo C₁-C₁₂; o alquilo C₁-C₄ sustituido por fenilo.

14. Formulación de acuerdo con la reivindicación 13 en donde

10 T₂ es iso-octilo.

15. Formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes en donde la formulación de protección solar adicionalmente comprende un absorbente UV orgánico soluble en aceite seleccionado de un derivado de ácido p-aminobenzoico; un derivado de ácido salicílico; un derivado de benzofenona; un derivado de dibenzoilmetano; un derivado de difenilacrilato; un derivado de benzofurano; un absorbente UV polimérico que
15 contiene uno o más residuos silico-orgánicos; un éster de cinamato; un derivado de canfor; un derivado de trianilino-s-triazina; ácido fenilbencimidazol sulfónico o una de sus sales; ácido urocánico (ácido 3-imidazol-4-ilacrílico) o su éster de etilo; mentilantranilato; un benzotriazol; un derivado de hidroxifeniltriazina; y una bis-resorcinol-dialquilaminotriazina.