

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 390 015**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/34** (2006.01)

**A61K 8/37** (2006.01)

**A61K 8/81** (2006.01)

**A61Q 19/00** (2006.01)

**A61K 8/49** (2006.01)

**A61K 8/86** (2006.01)

**A61K 8/90** (2006.01)

**A61K 8/06** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **10172461 .5**

96 Fecha de presentación: **11.08.2010**

97 Número de publicación de la solicitud: **2301518**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **30.03.2011**

54 Título: **Composición cosmética que comprende un derivado difenil-metano hidroxilado**

30 Prioridad:  
**28.08.2009 FR 0955877**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**05.11.2012**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**05.11.2012**

73 Titular/es:  
**L'ORÉAL (100.0%)**  
**14, rue Royale**  
**75008 Paris, FR**

72 Inventor/es:  
**MONELLO, ALDO y**  
**ACHRAM, MÉLANIE**

74 Agente/Representante:  
**LEHMANN NOVO, María Isabel**

ES 2 390 015 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**

Composición cosmética que comprende un derivado difenil-metano hidroxilado

La presente invención tiene por objeto una emulsión de aceite en agua cosmética que comprende un derivado difenil-metano hidroxilado y una mezcla particular de tensioactivo.

5 Se conoce utilizar unos principios activos en unas composiciones cosméticas y/o dermatológicas, por ejemplo para curar o tratar, o aportar unos efectos beneficiosos para la piel. Sin embargo, algunos de estos principios activos presentan el inconveniente de ser inestables en los disolventes cosméticos clásicos y/o degradarse fácilmente, en particular al contacto con el agua, en particular a causa de fenómenos de oxidación. Pierden así rápidamente su actividad a lo largo del tiempo y esta inestabilidad va en contra de la eficacia buscada.

10 Los derivados difenil-metano hidroxilados son conocidos por la solicitud US 2007/098655 en unas composiciones en forma de emulsión. Estos derivados difenil-metano hidroxilados están descritos en esta solicitud como inhibidores de tirosinasa, utilizables en particular en unas composiciones despigmentantes.

15 Estos derivados difenil-metano hidroxilados, debido en particular a su estructura aromática y a su carácter lipófilo, presentan el inconveniente de ser inestables y/o poco solubles en los disolventes clásicos utilizados en cosmética. Pueden, en particular, recrystalizarse. Pueden además degradarse fácilmente con la luz y/o con la temperatura, en particular a causa de fenómenos de oxidación.

Pierden así rápidamente su actividad a lo largo del tiempo y esta inestabilidad va en contra de la eficacia buscada.

20 Por otra parte, el uso de derivados difenil-metano hidroxilados tales como el 4-(1-feniletíl)-1,3-dihidroxibenceno en unas emulsiones, y en particular en unas emulsiones de aceite en agua, en particular cuando contienen un sistema tensioactivo que comprende un éster de ácido graso y de polietilenglicol; y un tensioactivo adicional seleccionado entre los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán, y los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de glicerilo, tiende a desestabilizar la emulsión que presenta entonces un desfase de aceite en superficie. Los glóbulos de aceite dispersos en la fase acuosa tienen un aspecto basto que hace a la emulsión no homogénea.

25 El documento EP 1847247 describe una emulsión de aceite en agua en el ejemplo 2c que comprende feniletílbencenodiol, un éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán y un éster de ácido graso etoxilado, que está estabilizado por la presencia de dimetilisorbida.

El documento US 2007/269390 describe una emulsión fina de aceite en agua que comprende un tensioactivo siliconado, un monoalcohol, un tensioactivo no iónico y un tensioactivo aniónico.

30 El documento DE 19935763 describe una emulsión de aceite en agua estable que comprende retinol o un éster de retinol, un sistema redox que comprende ácido ascórbico o derivados y un polifenol de tipo catecol, y un emulsionante estabilizante que se puede seleccionar, por ejemplo, entre la lista de las 11 familias de tensioactivos. El sistema tensioactivo según la invención no está divulgado ni sugerido.

35 El documento WO 02/19984 describe una emulsión que contiene ácido salicílico, un copolímero acrilato / alquil C<sub>10</sub>-C<sub>30</sub>-acrilato (Pemulen) y un tensioactivo no iónico seleccionado entre los éteres poliméricos tales como los bloques PEO-POP de tipo Poloxamer, y las mezclas de laurato éster de sorbitol, y los anhídridos sorbitol condensados por óxido de etileno. El sistema tensioactivo según la invención no está divulgado ni sugerido.

El objetivo de la presente invención es por lo tanto disponer de una emulsión que contiene un derivado difenil-metano hidroxilado y el sistema tensioactivo descrito anteriormente, que sea estable, en particular durante 24 horas a 55°C, incluso durante 2 meses a 45°C.

40 Los inventores han descubierto que la estabilidad de tal emulsión se puede obtener añadiendo un policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno.

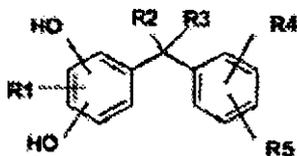
De manera más precisa, la invención tiene por objeto una composición en forma de emulsión de aceite en agua que comprende:

- un derivado difenil-metano hidroxilado tal como se describe a continuación;
- 45 - un éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> que comprende de 8 a 100 unidades de óxido de etileno.
- un tensioactivo adicional seleccionado entre los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán, y los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de glicerilo;
- un policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno.

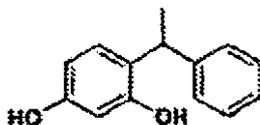
50 La invención tiene asimismo por objeto un procedimiento no terapéutico de cuidado o de maquillaje de las materias queratínicas que comprende la aplicación sobre las materias queratínicas de la composición definida anteriormente.

Los derivados difenil-metano hidroxilados utilizables en las composiciones de la invención son descritos en la solicitud WO 2004/105736.

Estos compuestos tienen la fórmula (I) siguiente:



- 5 en la que:
- R1 se selecciona entre un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, una cadena alquilo lineal o ramificada, saturada o insaturada, que tiene de 2 a 4 átomos de carbono, un grupo -OH y un halógeno,
  - R2 se selecciona entre un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, una cadena alquilo lineal o ramificada, saturada o insaturada, que tiene de 2 a 5 átomos de carbono,
- 10 - R3 se selecciona entre un grupo metilo o una cadena alquilo lineal o ramificada, saturada o insaturada, que tiene de 2 a 5 átomos de carbono,
- R4 y R5 se seleccionan, independientemente entre sí, entre un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, una cadena alquilo lineal o ramificada, saturada o insaturada, que tiene de 2 a 5 átomos de carbono, un grupo -OH o un halógeno.
- 15 Los grupos -OH, R1, R4 y R5 puede estar en posición orto, meta o para con respecto al enlace formado con el carbono que une entre sí los dos núcleos aromáticos.
- Están también incluidos en los compuestos de la invención que poseen los grupos fenilo sustituidos y para los cuales R2 y R3 son distintos, las formas enantioméricas de configuración S, los enantiómeros de configuración R o su mezcla racemato.
- 20 Según un modo preferido de la invención, se utiliza un compuesto de fórmula (I) en la que:
- R1, R2, R4 y R5 designan un átomo de hidrógeno;
  - R3 es un grupo metilo;
  - los grupos -OH están en posición orto y para con respecto al enlace formado con el carbono que une entre sí los dos núcleos aromáticos.
- 25 Este compuesto corresponde a la fórmula (II) siguiente



denominado 4-(1-feniletíl)-1,3-bencenodiol o 4-(1-feniletíl)-1,3-dihidroxibenceno o, denominado de otra manera, feniletílresorcinol, o feniletílbencenodiol, o estirilresorcinol. Este compuesto tiene un número CAS 85-27-8.

- 30 Tal compuesto está comercializado bajo la denominación de SYMWHITE 377<sup>®</sup> o BIO 377 por la compañía SYMRISE.
- El compuesto derivado difenil-metano hidroxilado tal como el descrito anteriormente puede estar presente en la emulsión según la invención en una cantidad que va del 0,01% al 5% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,01% al 2% en peso, y preferiblemente que va del 0,01% al 1% en peso.
- 35 La composición según la invención comprende, como tensioactivo emulsionante principal, al menos un éster de ácido graso y de polietilenglicol.
- El éster de ácido graso y de polietilenglicol presente en la composición según la invención es preferiblemente un éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> que tiene de 8 a 100 unidades de óxido de etileno.

## ES 2 390 015 T3

La cadena grasa de los ésteres se puede seleccionar, en particular, entre las unidades estearilo, behenilo, araquidilo, palmitilo, cetilo, y sus mezclas, tal como cetearilo, y preferiblemente una cadena estearilo.

El número de unidades de óxido de etileno puede ir de 8 a 100, preferiblemente de 10 a 80, y mejor de 10 a 50. Según un modo particular de realización de la invención, este número puede ir de 20 a 40.

5 A título de ejemplo de éster de ácido graso y de polietilenglicol, se pueden citar los ésteres de ácido esteárico, que comprenden respectivamente 20, 30, 40, 50, 100 unidades de óxido de etileno, tales como los productos comercializados respectivamente bajo la denominación de Myrj 49P (estearato de polietilenglicol 20 OE; nombre CTFA: PEG-20 estearato), Myrj 51, Myrj 52 P (estearato de polietilenglicol 40 OE; nombre CTFA: PEG-40 estearato), Myrj 53, Myrj 59P por la compañía CRODA.

10 El éster de ácido graso y de polietilenglicol puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 0,1% al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición, y preferiblemente que va del 0,1% al 5% en peso, y preferiblemente que va del 0,1% al 3% en peso.

La composición según la invención comprende también un tensioactivo emulsionante adicional seleccionado entre los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán, y los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de glicerilo.

15 Según un primer modo de realización de la invención, la composición comprende un éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán.

20 Los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán están formados por esterificación de al menos un ácido graso que comprende al menos una cadena alquilo lineal saturada o insaturada, que tiene respectivamente de 16 a 22 átomos de carbono, con el sorbitol. Estos ésteres se pueden seleccionar, en particular, entre los estearatos, los behenatos, los araquidatos, los palmitatos, los oleatos de sorbitán, y sus mezclas. Se utilizan preferiblemente unos estearatos y palmitatos de sorbitán, y preferiblemente los estearatos de sorbitán.

El éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán presente en la composición según la invención es ventajosamente sólido a una temperatura menor o igual que 45°C.

25 Se puede citar a título de ejemplo de éster de sorbitán utilizable en la composición según la invención, el monoestearato de sorbitán (nombre CTFA: sorbitán estearato) vendido por la compañía Croda bajo la denominación Span 60, el triestearato de sorbitán vendido por la compañía Croda bajo la denominación Span 65V, el monopalmitato de sorbitán (nombre CTFA: sorbitán palmitato) vendido por la compañía Croda bajo la denominación Span 40, el monoleato de sorbitán vendido por la compañía Croda bajo la denominación Span 80V, el trioleato de sorbitán vendido por la compañía Uniquema bajo la denominación Span 85V, preferiblemente el éster de sorbitán utilizado es el triestearato de sorbitán.

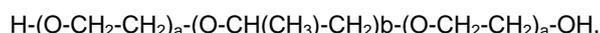
30 El éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán pueden estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 0,01% al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,01% al 5% en peso, y preferiblemente que va del 0,1% al 3% en peso.

35 El éster de glicerilo y de ácido graso se puede obtener en particular a partir de un ácido que comprende una cadena alquilo lineal saturada, que tiene de 16 a 22 átomos de carbono. Como éster de glicerilo y de ácido graso, se pueden citar en particular el estearato de glicerilo (mono-, di- y/o tri-estearato de glicerilo) (nombre CTFA: gliceril estearato), el ricinoleato de glicerilo, y sus mezclas. Preferiblemente, el éster de glicerilo y de ácido graso utilizado se selecciona entre los estearatos de glicerilo.

40 El éster de glicerilo y de ácido graso puede estar presente en una cantidad que va del 0,1 al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,1 al 5% en peso, y preferiblemente que va del 0,1% al 3% en peso.

La composición de la invención puede comprender en particular una mezcla de estearato de glicerilo y de monoestearato de polietilenglicol 100 OE, y en particular la que comprende tal mezcla en una proporción ponderal 50/50, comercializado bajo la denominación Arlacel 165 por la compañía Croda.

45 La composición según la invención comprende un policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno, y más particularmente un copolímero que consiste en unos bloques de polietilenglicol y de polipropilenglicol, como por ejemplo los policondensados tribloque polietilenglicol/polipropilenglicol/polietilenglicol. Estos policondensados tribloque tienen, por ejemplo, la estructura química siguiente:



50 fórmula en la que a va de 2 a 150, y b va de 1 a 100; preferiblemente a va de 10 a 130 y b va de 20 a 80.

El policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno tiene preferiblemente un peso molecular medio en peso que va de 1000 a 15000, y mejor que va de 1500 a 15000, y en particular que va de 1500 a 10000, y mejor aún que va de 1500 a 5000.

Ventajosamente, dicho policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno tiene una temperatura de enturbiamiento, para 10 g/l en agua destilada, mayor o igual que 20°C, preferiblemente mayor o igual que 60°C. La temperatura de enturbiamiento se mide según la norma ISO 1065.

5 Como policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno utilizable según la invención, se pueden citar los policondensados tribloque polietilenglicol/polipropilenglicol/polietilenglicol vendidos bajo las denominaciones "SYNPERONIC" como los «SYNPERONIC<sup>®</sup> PE/F32» (nombre INCI: POLOXAMER 108), «SYNPERONIC<sup>®</sup> PE/F108» (nombre INCI: POLOXAMER 338), "SYNPERONIC<sup>®</sup> PE/ L44" (nombre INCI: POLOXAMER 124), «SYNPERONIC<sup>®</sup> PE/L42 (nombre INCI: POLOXAMER 122), "SYNPERONIC<sup>®</sup> PE/F127" (nombre INCI: POLOXAMER 407), «SYNPERONIC<sup>®</sup> PE/F88» (nombre INCI: POLOXAMER 238), «SYNPERONIC<sup>®</sup> PE/L64»  
10 (nombre INCI: POLOXAMER 184) por la compañía CRODA, o también «LUTROL<sup>®</sup> F68» (nombre INCI: POLOXAMER 188) por la compañía BASF.

El policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 0,01% al 5% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,05% al 3% en peso, y preferiblemente que va del 0,05% al 1% en peso.

15 La composición según la invención puede comprender un alcohol graso que tiene de 12 a 22 átomos de carbono, en particular que tiene de 14 a 18 átomos de carbono. Tal alcohol graso se puede seleccionar, por ejemplo, entre el alcohol laurílico, el alcohol cetílico, el alcohol estearílico. Este alcohol graso puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 0,05% al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,1% al 5% en peso, y preferiblemente que va del 1% al 5% en peso.

20 La composición puede también comprender un ácido graso que tiene de 12 a 22 átomos de carbono, en particular de 14 a 18 átomos de carbono. Tal ácido graso se puede seleccionar entre el ácido laurico, el ácido mirístico, el ácido cetílico (o ácido palmítico), el ácido estearílico, el alcohol cetilestearílico.

25 Este ácido graso puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 0,05% al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,1 al 5% en peso, y preferiblemente que va del 1% al 5% en peso.

La composición según la invención puede comprender además un tensioactivo aniónico seleccionado entre las sales alcalinas de cetilfosfato. Las sales alcalinas son, por ejemplo, las sales de sodio, las sales de potasio. El tensioactivo iónico es preferiblemente el cetilfosfato de potasio.

30 Se puede utilizar en particular la sal monopotásica de fosfato de monocetilo (nombre INCI: potasio cetilfosfato) vendido bajo la denominación de "AMPHISOL K" por la compañía DSM Nutritional products.

Este tensioactivo aniónico permite mejorar la estabilidad de la composición a alta temperatura (45°C) durante 2 meses.

35 El tensioactivo aniónico puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 0,05% al 5% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,5 al 3% en peso, y preferiblemente que va del 0,1% al 3% en peso.

La composición según la invención puede comprender un gelificante hidrófilo que permite espesar la fase acuosa de la composición.

El gelificante hidrófilo se puede seleccionar por ejemplo entre:

40 (i) los polímeros carboxivinílicos (como los polímeros de ácido acrílico, eventualmente reticulado), tales como los productos comercializados bajo las denominaciones Carbopol (nombre INCI: Carbomer) por la compañía Goodrich;

45 (ii) las poli(acrilamidas y los polímeros y copolímeros de ácido 2-acrilamido 2-metilpropano sulfónico, eventualmente reticulados y/o neutralizados, como el poli(ácido 2-acrilamido 2-metilpropano sulfónico) comercializado por la compañía Hoechst bajo la denominación «Hostacerin AMPS» (nombre INCI: poli(acrilato-dimetiltaurato de amonio)); los copolímeros aniónicos reticulados de acrilamida y de AMPS, que se presentan en forma de una emulsión, tales como los comercializados bajo el nombre de SEPIGEL 305 (nombre C.T.F.A.: Poli(acrilamida / C<sub>13-14</sub> Isoparafina / Laureth-7) y bajo el nombre de SIMULGEL 600 (nombre C.T.F.A.: Acrilamida / Copolímero de acrilato-dimetiltaurato de sodio / Isohexadecano / Polisorbato 80) por la compañía SEPPIC; los copolímeros aniónicos reticulados de ácido acrílico y de AMPS, que se presentan en forma de una emulsión, tales como los comercializados bajo el nombre de SIMULGEL EG (nombre C.T.F.A.: Acrilato de sodio / Copolímero de acrilato-dimetiltaurato de sodio / Isohexadecano / Polisorbato 80); los copolímeros de ácido 2-acrilamido 2-metilpropano sulfónico / metacrilato de alcohol de C12-C14 etoxilado (ARISTOFLEX LNC de Clariant), los copolímeros de ácido 2-acrilamido 2-metilpropano sulfónico / metacrilato de estearilo etoxilado (ARISTOFLEX HMS y ARISTOFLEX SNC de Clariant);

(iii) los polisacáridos como las gomas de xantano, las gomas de guar, los alginatos, los polímeros de celulosas como la hidroxietilcelulosa, la hidroxipropilcelulosa, la carboximetilcelulosa;

(iv) los compuestos inorgánicos tales como las esmectitas, las hectoritas modificadas o no, tales como los productos BENTONE comercializados por la compañía Rheox, los productos LAPONITE comercializados por la compañía Southern Clay Products, el producto VEEGUM HS comercializado por la compañía R.T. Vanderbilt; y sus mezclas.

5 Entre estos gelificantes hidrófilos, se seleccionarán más particularmente los polisacáridos descritos anteriormente, y en particular la goma de xantano.

El gelificante hidrófilo puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 0,01% al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,1% al 5% en peso, y preferiblemente que va del 0,1% al 3% en peso.

La composición según la invención comprende una fase acuosa.

10 La composición puede comprender agua en una cantidad que va del 20% al 95% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 30% al 90% en peso, y preferiblemente que va del 40% al 70% en peso.

El agua puede ser un agua floral, tal como el agua de aciano y/o un agua mineral, tal como el agua de VITTEL, el agua de LUCAS o el agua de LA ROCHE POSAY, y/o un agua termal.

15 La composición puede comprender además un disolvente orgánico miscible en agua a temperatura ambiente (25°C) particularmente seleccionado entre los monoalcoholes que tienen de 2 a 6 átomos de carbono, tales como el etanol, o el isopropanol;

20 los polioles que tienen particularmente de 2 a 20 átomos de carbono, preferiblemente que tienen de 2 a 10 átomos de carbono, y preferiblemente que tienen de 2 a 6 átomos de carbono, tales como la glicerina, el propilenglicol, el butilenglicol, el pentilenglicol, el hexilenglicol, el dipropilenglicol, o el dietilenglicol;

los éteres de glicol (que tienen en particular de 3 a 16 átomos de carbono) tales como los alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)éter de mono-, di- o tripropilenglicol, o los alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)éteres de mono-, di- o trietilenglicol;

y sus mezclas.

Ventajosamente, la fase acuosa puede comprender etanol.

25 La composición según la invención puede comprender un disolvente orgánico miscible en agua a temperatura ambiente, en particular un poliol, en una cantidad que va del 1% al 20% en peso, con respecto al peso total de la composición, y preferiblemente que va del 3% al 15% en peso.

Ventajosamente, la composición según la invención tiene un pH que va de 3,0 a 8,0, preferiblemente que va de 3,5 a 7,0, preferiblemente que va de 3,5 a 6,0, y más preferiblemente que va de 3,5 a 5,5.

30 La emulsión según la invención comprende igualmente una fase oleosa.

Como aceites más particularmente utilizables en la composición de la invención, se puede citar, por ejemplo:

- los aceites hidrocarbonados de origen animal, tales como el perhidroescualeno (o escualano);

35 - los ésteres y los éteres de síntesis, en particular de ácidos grasos, como los aceites de fórmulas R<sup>1</sup>COOR<sup>2</sup> y R<sup>1</sup>OR<sup>2</sup> en las que R<sup>1</sup> representa el resto de un ácido graso que tiene de 8 a 29 átomos de carbono, y R<sup>2</sup> representa una cadena hidrocarbonada, ramificada o no, que contiene de 3 a 30 átomos de carbono, como por ejemplo el aceite de Purcelina, el isononanoato de isononilo, el miristato de isopropilo, el palmitato de etil-2-hexilo, el estearato de octil-2-dodecilo, el erucato de octil-2-dodecilo, el isoestearato de isoestearilo; los ésteres hidroxilados como el isoestearil-lactato, el octilhidroxiestearato, el hidroxiestearato de octildodecilo, el diisoestearil-malato, el citrato de triisocetilo, los heptanoatos, octanoatos, decanoatos de alcoholes grasos; los ésteres de poliol, como el dioctanoato de propilenglicol, el diheptanoato de neopentilglicol y el diisononanoato de dietilenglicol; los ésteres de pentaeritritol como el tetraisoestearato de pentaeritritilo; los derivados lipófilos de aminoácidos, tales como el lauroilsarcosinato de isopropilo (nombre INCI: isopropil lauroil sarcosinato) comercializado bajo la denominación Eldew SL 205 por la compañía Ajinomoto;

45 - los hidrocarburos lineales o ramificados, de origen mineral o sintético, tales como los aceites minerales (mezcla de aceites hidrocarbonados derivados del petróleo; nombre INCI: aceite mineral), los aceites de parafina, volátiles o no, y sus derivados, la vaselina, los polidecenos, el isohexadecano, el isododecano, la isoparafina hidrogenada, tal como el aceite de Parleam<sup>®</sup> comercializado por la compañía NOF Corporation (nombre INCI: poliisobuteno hidrogenado);

50 - los aceites de silicona como los polidimetilsiloxanos (PDMS) volátiles o no, de cadena siliconada lineal o cíclica, líquidos o pastosos a temperatura ambiente, en particular los ciclopolidimetilsiloxanos (ciclometiconas) tales como el ciclopentasiloxano y el ciclohexadimetilsiloxano; los polidimetilsiloxanos que comprenden unos grupos alquilo, alcoxi

o fenilo, colgante o en el extremo de la cadena siliconada, grupos que tienen de 2 a 24 átomos de carbono; las siliconas feniladas como las feniltrimeticonas, las fenildimeticonas, los feniltrimetilsiloxidifenilsiloxanos, las difenildimeticonas, los difenilmetildifeniltrisiloxanos, los 2-fenilettrimetilsiloxisilicatos y los polimetilfenilsiloxanos;

5 - los aceites fluorados, tales como los parcialmente hidrocarbonados y/o siliconados, como los descritos en el documento JP-A-2-295912;

- los éteres, tales como el éter dicaprílico (nombre CFTA: dicaprilil éter); y los benzoatos de alcoholes grasos de C<sub>12</sub>-C<sub>15</sub> (Finsolv TN de FINETEX);

- sus mezclas.

10 El aceite puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 1% al 50% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 5% al 40% en peso, y preferiblemente que va del 5% al 30% en peso.

La fase oleosa de la emulsión puede comprender otros cuerpos grasos tales como las ceras; las gomas, tales como las gomas de silicona (dimeticonol); las resinas de silicona, y sus mezclas.

15 La composición según la invención puede comprender al menos un agente fotoprotector orgánico activo en los UVA y/o los UVB (absorbedores), hidrosolubles o liposolubles, o bien insolubles en los disolventes cosméticos habitualmente utilizados.

Ya que la composición según la invención presenta una buena estabilidad, es apropiada para la formulación de filtros UV orgánicos: Los filtros UV incorporados en la composición no se degradan en presencia de compuesto de ácido ascórbico.

20 Los filtros orgánicos se seleccionan en particular entre los antranilatos; los derivados cinámicos; los derivados de dibenzoilmetano; los derivados ascórbicos, los derivados del alcanfor; los derivados de triazina distintos de los de la invención tales como los descritos en las solicitudes de patente US 4367390, EP863145, EP517104, EP570838, EP796851, EP775698, EP878469, EP933376, EP507691, EP507692, EP790243, y EP944624; los derivados de la benzofenona; los derivados de β,β-difenilacrilato; los derivados de benzotriazol; los derivados de benzalmalonato; los derivados de bencimidazol; las imidazolinias; los derivados bis-benzoazolilo tales como los descritos en las patentes EP669323 y US 2,463,264; los derivados del ácido p-aminobenzoico (PABA); los derivados de metilen-bis-(hidroxifenilbenzotriazol) tales como los descritos en las solicitudes US 5,237,071, US 5,166,355, GB2303549, DE 197 26 184 y EP893119; los polímeros filtro y siliconas filtro tales como los descritos particularmente en la solicitud WO-93/04665; los dímeros derivados de α-alkilestireno tales como los descritos en la solicitud de patente DE19855649; los 4,4-diarilbutadienos tales como los descritos en las solicitudes EP0967200, DE19746654, DE 19755649, EP-A-1008586, EP1133980 y EP133981, y sus mezclas.

Ventajosamente, se utiliza un filtro protector orgánico no iónico.

35 El agente fotoprotector puede estar presente en la composición según la invención en una cantidad que va del 0,01% al 30% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,1 al 25% en peso, y preferiblemente que va del 0,1% al 20% en peso.

La composición según la invención puede comprender además unas cargas.

Por cargas, se debe entender unas partículas de cualquier forma, incoloras o blancas, minerales u orgánicas, insolubles en el medio de la composición sea cual sea la temperatura a la que se fabrica la composición, y que no colorean la composición.

40 Las cargas pueden ser de cualquier forma, plaquetarias, esféricas u oblongas, sea cual sea la forma cristalográfica (por ejemplo laminar, cúbica, hexagonal, ortorrómbica, etc.). Se puede citar el talco, la mica, la sílice, el caolín, de poli-β-alanina y de polietileno, los polvos de polímeros de tetrafluoroetileno (Teflon<sup>®</sup>), la lauroil-lisina, el almidón, el nitrato de boro, las microesferas huecas poliméricas tales como las de cloruro de polivinilideno/acrilonitrilo, como el Expancel<sup>®</sup> (Nobel Industrie), de copolímeros de ácido acrílico, las microperlas de resina de silicona (Tospearls<sup>®</sup> de Toshiba, por ejemplo), las partículas de poliorganosiloxanos elastoméricos, el carbonato de calcio precipitado, el carbonato y el hidrocarbonato de magnesio, el hidroxipatito, el sulfato de bario, los óxidos de aluminio, los polvos de poliuretanos, las cargas compuestas, las microesferas de sílice huecas y las microcápsulas de vidrio o de cerámica.

50 Las cargas pueden estar presentes en la composición en una cantidad que va del 0,1% al 15% en peso, preferiblemente que va del 0,1% al 10% en peso, y preferiblemente del 0,1% al 5% en peso, con respecto al peso total de la composición.

La composición según la invención puede comprender además un principio activo seleccionado entre los agentes descamantes capaces de actuar bien favoreciendo la exfoliación o bien sobre las enzimas implicadas en la

5 descamación o la degradación de los corneodesmosomas, los agentes hidratantes, los agentes despigmentantes o pro-pigmentantes, los agentes anti-glicación, los inhibidores de la NO-sintasa, los inhibidores de la 5 $\alpha$ -reductasa, los inhibidores de lisil- y/o prolil-hidroxilasa, los agentes estimulantes de la síntesis de macromoléculas dérmicas o epidérmicas y/o que impiden su degradación, los agentes estimulantes de la proliferación de los fibroblastos o de los queratinocitos y/o la diferenciación de los queratinocitos, los agentes miorrelajantes, los agentes antimicrobianos, los agentes tensores, los agentes anti-polución o anti-radicalarios, los agentes antiinflamatorios, los principios activos lipolíticos o que tienen una actividad favorable, directa o indirecta, sobre la disminución del tejido adiposo, los agentes que actúan sobre la microcirculación y los agentes que actúan sobre el metabolismo energético de las células.

10 La composición según la invención está particularmente destinada a un uso tópico, particularmente cosmético o dermatológico.

15 De manera conocida, la composición cosmética o dermatológica de la invención puede contener también unos adyuvantes habituales en el campo cosmético o dermatológico, tales como los conservantes, los perfumes, los bactericidas, los absorbedores de olor, las materias colorantes, las sales, los tensioactivos, los espesantes, las bases. Las cantidades de estos diferentes adyuvantes son las clásicamente utilizadas en el campo considerado, y por ejemplo del 0,01% al 20% del peso total de la composición. Estos adyuvantes, según su naturaleza, pueden ser introducidos en la fase grasa o en la fase acuosa.

20 La composición según la invención se puede aplicar sobre la piel o los labios, según el uso al que está destinada. Puede así ser utilizada en un procedimiento de tratamiento cosmético de la piel, que comprende la aplicación de la composición según la invención sobre la piel, por ejemplo para tonificarla, regenerarla, alisar las pequeñas arrugas de la piel, y/o para luchar contra el envejecimiento cutáneo, contra los perjuicios de las irradiaciones UV y/o para reforzar los tejidos cutáneos contra las agresiones ambientales.

En una variante, la composición según la invención se puede utilizar para la fabricación de una preparación dermatológica.

25 La composición puede ser una composición de cuidado, en particular un producto de cuidado de la piel tal como una base de cuidado para la piel, una crema de cuidado (crema de día, de noche, anti-arrugas), una base de maquillaje; una composición de cuidado para los labios (bálsamo de labios); una composición de protección solar o autobronceadora.

30 La composición puede ser también una composición de maquillaje, particularmente de maquillaje de la piel o de los labios. En particular, la composición de maquillaje puede ser una base de maquillaje, un colorete, una sombra de ojos, un producto anti-ojeras, un producto de maquillaje del cuerpo.

Ventajosamente, la composición es una composición sin aclarado.

35 La emulsión según la invención se puede preparar según el modo operativo general siguiente: mezclar los constituyentes de la fase acuosa calentando a una temperatura de aproximadamente 70°C. Mezclar por otra parte los aceites, el principio activo de fórmula (I) y los tensioactivos calentando a una temperatura de aproximadamente 80°C. Verter la fase grasa en la fase acuosa, a una temperatura de aproximadamente 70°C y después agitar durante 10 minutos con la ayuda de una turbina a gran velocidad. Enfriar la emulsión obtenida a aproximadamente 60°C. Añadir después los espesantes, y agitar nuevamente durante 10 minutos. Introducir después eventualmente los otros principios activos.

40 La invención se ilustrará ahora con la ayuda de los ejemplos no limitativos siguientes.

Ejemplo 1 comparativo:

Se ha preparado una composición de cuidado facial en forma de emulsión de aceite en agua según la invención (ejemplo 1), que tiene la composición siguiente:

- Mezcla de monoestearato de glicerilo y de estearato de polietilenglicol (100 OE) (ARLACEL 165 FL de la casa CRODA)	1,6 g
- Monoestearato de sorbitán oxiethileno (20 OE) (TWEEN 60 de la casa Croda)	0,7 g
- Alcohol cetílico	1 g
- Ácido esteárico	0,5 g
- Aceite de semilla de albaricoque	5 g
- Polidimetilsiloxano 10 cst	7,0 g

## ES 2 390 015 T3

- Isoparafina hidrogenada (Parleam de la casa NOF Corporation)	2,0 g
- 4-(1-feniletíl)-1,3-dihidroxibenceno	0,3 g
- Ácido poliacrilamidometilpropanosulfónico neutralizado parcialmente con amoníaco y altamente reticulado (Hostacerin AMPS de la casa Clariant)	1,0 g
- Goma de xantano	0,3 g
- Microesferas de sílice (SB700 de la casa Myoshi Kasei)	3,0 g
- Copolímero bloque OE-OP-OE (128 EO/54 OP/128 OE) (Synperonic® PE/F108 de la casa CRODA)	0,4 g
- Glicerol	5g
- Sal disódica del ácido etilendiaminotetraacético	0,2 g
- Conservantes	cs
- Agua	csp 100 g

Se preparó también una composición similar a la composición 1 pero que contenía además 1,5 g de cetil-fosfato de potasio (composición 1a según la invención) (cantidad añadida suprimiendo el mismo peso de agua).

5 Se preparó igualmente una composición similar a la composición 1, pero que no contenía ningún copolímero bloque OE-OP-OE (Synperonic® PE/F108 de la casa CRODA) (composición 1b que no forma parte de la invención) (cantidades suprimidas reemplazadas por el mismo peso de agua).

Las emulsiones de los ejemplos 1 y 1a presentan una buena estabilidad después de 24 horas a 55°C y también después de 2 meses a 45°C. En observación con el microscopio, la emulsión obtenida es fina y tupida.

La composición se aplica sobre la cara en utilización diaria de día.

10 La emulsión comparativa del ejemplo 1b es inestable después de 24 horas a 55°C y después de la conservación durante 2 meses a 45°C: la emulsión, observada con el microscopio, es más basta, más degradada. A simple vista, se observa un desfase con liberación en superficie de la fase oleosa.

Ejemplo 2 comparativo:

Se ha preparado una composición de cuidado facial en forma de emulsión de aceite-en-agua que tiene la composición siguiente:

- Mezcla de monoestearato de glicerilo y de estearato de polietilenglicol (100 OE) (ARLACEL 165 FL de la casa CRODA)	0,5 g
- Ácido esteárico	1 g
- Alcohol cetílico	0,5 g
- Estearato de isocetilo	5g
- 4-(1-feniletíl)-1,3-dihidroxibenceno	0,5 g
- Drometrisol trisiloxano (Silitrisole de la casa Rhodia)	1g
- Triglicéridos de ácido caprílico/cáprico (60/40)	3g
- Ácido n-octanoil-5-salicílico	0,3 g
- Acetato de tocoferol	1 g
- Ascorbil-glucósido	0,05 g
- Goma de xantano (Rhodicare XC de la casa Rhodia)	0,15 g
- copolímero acrilamida/acrilamido 2-metilpropanosulfonato de sodio en emulsión inversa al 40% en isoparafina/agua (Sepigel 305 de la casa Seppic)	1,8 g
- Hexametafosfato de sodio	0,05 g

## ES 2 390 015 T3

- Sal disódica del ácido etilendiaminotetraacético		0,05 g
- Copolímero bloque OE-OP-OE (Synperonic® PE/F108 de la casa CRODA)		0,4 g
- Glicerol		7g
- Butilenglicol		3g
- Conservantes	Cs	
- Perfume	Cs	
- Agua	Csp	100 g

Se preparó también una composición similar a la composición 3 pero que contenía además 1,5 g de cetil-fosfato de potasio (composición 3a según la invención) (cantidad añadida suprimiendo el mismo peso de agua).

5 Se preparó igualmente una composición similar a la composición 3, pero que no contiene ningún copolímero bloque OE-OP-OE (Synperonic® PE/F108 de la casa CRODA) y de cetil-fosfato de potasio (composición 3b que no forma parte de la invención) (cantidades suprimidas reemplazadas por el mismo peso de agua).

Las emulsiones de los ejemplos 3 y 3a presentan una buena estabilidad después de 24 horas a 55°C. En observación con el microscopio, la emulsión obtenida es fina y tupida. La emulsión 3a presenta además una buena estabilidad después de 2 meses a 45°C.

La composición se aplica sobre la cara en utilización diaria de día.

10 La emulsión comparativa del ejemplo 3b es inestable después de la conservación durante 2 meses a 45°C: la emulsión, observada con el microscopio, es más basta, más degradada. A simple vista, se observa un desfase con liberación en superficie de la fase oleosa.

**REIVINDICACIONES**

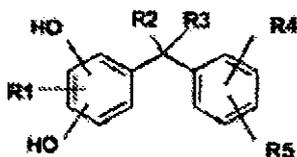
1. Composición en forma de emulsión de aceite-en-agua que comprende:

- un éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> que comprende de 8 a 100 unidades de óxido de etileno.

5 - un tensioactivo adicional seleccionado entre los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán, y los ésteres de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de glicerilo;

- un policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno que consiste en unos bloques de polietilenglicol y de polipropilenglicol;

- un derivado difenil-metano hidroxilado de fórmula (I):



10 en la que:

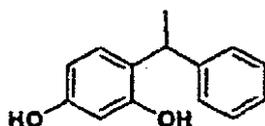
- R1 se selecciona entre un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, una cadena alquilo lineal o ramificada, saturada o insaturada, que tiene de 2 a 4 átomos de carbono, un grupo -OH y un halógeno,

- R2 se selecciona entre un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, una cadena alquilo lineal o ramificada, saturada o insaturada, que tiene de 2 a 5 átomos de carbono,

15 - R3 se selecciona entre un grupo metilo o una cadena alquilo lineal o ramificada, saturada o insaturada, que tiene de 2 a 5 átomos de carbono,

- R4 y R5 se seleccionan, independientemente entre sí, entre un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, una cadena alquilo lineal o ramificada, saturada o insaturada, que tiene de 2 a 5 átomos de carbono, un grupo -OH o un halógeno.

20 2. Composición según la reivindicación anterior, caracterizada porque el derivado difenil-metano hidroxilado tiene la fórmula (II) siguiente:



25 3. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque el derivado difenil-metano hidroxilado de fórmula (I) o (II) está presente en una cantidad que va del 0,01% al 5% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,01% al 2% en peso, y preferiblemente que va del 0,01% al 1% en peso.

4. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque el éster de ácido graso y de polietilenglicol se selecciona entre los estearatos de polietilenglicol, que comprenden de 10 a 80 unidades de óxido de etileno.

30 5. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque el éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de polietilenglicol comprende de 20 a 40 unidades de óxido de etileno.

6. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque comprende un éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de sorbitán seleccionado entre los estearatos de sorbitán.

35 7. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque comprende un éster de ácido graso de C<sub>16</sub>-C<sub>22</sub> y de glicerilo seleccionado entre los estearatos de glicerilo.

8. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque comprende una mezcla de estearato de glicerilo y de monoestearato de polietilenglicol 100 OE.

9. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque comprende un policondensado tribloque polietilenglicol/polipropilenglicol/polietilenglicol.
- 5 10. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque el policondensado de óxido de etileno y de óxido de propileno tiene un peso molecular medio en peso que va de 1000 a 15000, y mejor que va de 2000 a 13000.
11. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque comprende un gelificante hidrófilo.
12. Composición según la reivindicación anterior, caracterizada porque el gelificante hidrófilo es un polisacárido.
- 10 13. Composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque comprende al menos un adyuvante cosmético o dermatológico seleccionado entre los filtros UV, las cargas, los conservantes, los perfumes, los bactericidas, los absorbedores de olor, las materias colorantes, las sales, los tensioactivos, los espesantes, y las bases.
14. Procedimiento no terapéutico de cuidado o de maquillaje de las materias queratínicas que comprende la aplicación sobre las materias queratínicas de una composición según cualquiera de las reivindicaciones anteriores.