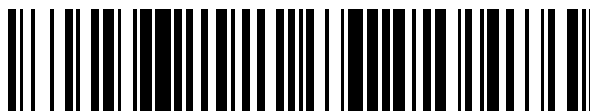


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 432 365**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/18**

(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **08.02.2005 E 05701376 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.07.2013 EP 1720510**

54 Título: **Filtros UV en forma de polvo**

30 Prioridad:

**03.03.2004 DE 102004010313**

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

**03.12.2013**

73 Titular/es:

**MERCK PATENT GMBH (100.0%)  
FRANKFURTER STRASSE 250  
64293 DARMSTADT, DE**

72 Inventor/es:

**PFLÜCKER, FRANK;  
BECK, JÖRN y  
DRILLER, HANSJÜRGEN**

74 Agente/Representante:

**CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel**

**ES 2 432 365 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**

Filtros UV en forma de polvo

5 La presente invención se refiere a filtros UV en forma de polvo que se obtienen mediante atomización de una dispersión de filtros UV orgánicos encapsulados, siendo las paredes de las cápsulas inorgánicas, procedimientos para la elaboración de filtros UV en forma de polvo, así como preparaciones que contienen filtros UV en forma de polvo.

10 Los filtros UV tienen gran importancia en una serie de aplicaciones, particularmente en cosmética. Así, cada vez se exige más en cuanto a la tolerancia dérmica y a las propiedades de aplicación de los filtros UV. En el caso de los filtros UV orgánicos, se debe evitar, por ejemplo, la penetración en la piel de los filtros UV para que la carga de sustancias orgánicas en la piel sea la mínima posible. Para evitarlo, en los documentos EP 1382328, WO 00/09652, WO 00/72806 y WO 00/71084, por ejemplo, se propone encapsular, y con ello, inmovilizar, filtros UV orgánicos. Los filtros UV encapsulados de este modo están disponibles en forma de dispersiones.

15 Las dispersiones resultan ser desfavorables en una serie de aplicaciones. El verdadero filtro UV no puede añadirse en forma de sustancia pura, sino solamente en combinación con los aditivos, por ejemplo agua, medios auxiliares de dispersión o conservantes. Muy en especial, evitar conservantes y agua incrementa la calidad y la flexibilidad de las formulaciones. Particularmente en cosmética, la presencia de aditivos resulta problemática, puesto que con frecuencia las preparaciones cosméticas presentan una proporción exactamente ajustada de sólido respecto a fase líquida, por ejemplo en forma de un agente aglutinante.

20 Para proveer, por ejemplo, mezclas de polvo compacto con una protección UV, por lo general se sustituye una parte del agente aglutinante por filtros UV líquidos o por la dispersión de filtro UV y entonces se añade al sólido base del polvo. Con ello, se limita la flexibilidad del aglutinante y al añadir el agente aglutinante al polvo se modifican las proporciones de mezcla entre sólido y agente aglutinante. Sin embargo, esto puede conllevar consecuencias desfavorables en cuanto a las propiedades de aplicación, como, por ejemplo, cambios de color o empeoramiento de la sensación dérmica en el caso de aplicación tópica, lo cual los usuarios no desean.

25 Por tanto, el objetivo fue preparar filtros UV, en particular filtros UV líquidos encapsulados de forma que sea posible el uso directo de los filtros UV sin influir negativamente en las propiedades de los filtros UV, en particular en su estabilidad. Esto último es válido en particular para filtros UV líquidos en forma encapsulada, cuyo encapsulamiento, a la vez, idealmente se mantiene para evitar la liberación no deseada de los filtros UV contenidos en las cápsulas. Para la mejora de las propiedades de aplicación, los filtros UV deben estar presentes en forma sólida, esto se requiere particularmente para filtros UV encapsulados. Con ello, filtros UV líquidos encapsulados en forma sólida estarían a disposición para la incorporación en formulaciones cosméticas. Sorprendentemente, se ha descubierto que estos requisitos se cumplen con la presente invención.

En la técnica actual se sabe lo siguiente:

35 En el documento US 2003/143166 A1 se describen los filtros UV en forma de polvo no encapsulados que se obtienen mediante atomización.

El documento US 6337089 B presenta filtros UV encapsulados, así como un procedimiento para su elaboración, en los que las paredes de las cápsulas consisten de organopolisiloxanos.

En el documento US 6238650 B se describen filtros UV encapsulados y un procedimiento para su elaboración, los cuales se obtienen mediante liofilización.

40 Objeto de la invención son los filtros UV correspondientes en forma de polvo que se obtienen mediante atomización de una dispersión que contiene filtros UV siendo los filtros UV orgánicos encapsulados, y las paredes de las cápsulas inorgánicas. Otro objeto de la presente invención son los procedimientos para la elaboración de los filtros UV en forma de polvo en los que las dispersiones que contienen filtros UV se atomizan o se secan por congelación. Además, las preparaciones que contienen filtros UV en forma de polvo son asimismo objeto de la presente invención.

45 Según la invención, los filtros UV en forma de polvo tienen la ventaja de ser más manejables y procesables que las dispersiones. Así, conforme a la invención, los polvos pueden integrarse sin problemas tanto en fases acuosas como no acuosas, lo cual no es posible con una dispersión. Asimismo, en el caso de los filtros UV en forma de polvo, se presenta la posibilidad de modificar selectivamente la superficie, por ejemplo, en forma de una hidrofobización o hidrofiliación, para volver a mejorar las propiedades específicas para una aplicación. Puesto que los polvos de la invención son secos, no es necesario añadir conservantes, lo cual en el caso de las dispersiones es muy necesario para evitar una contaminación de la misma. En la dispersión también es absolutamente habitual la obtención de la esterilidad ajustando un valor de pH bajo, aunque, en particular en la cosmética, resulta problemático puesto que aquí el valor de pH de la aplicación final tiene una especial importancia. En el caso de los filtros UV de la invención esto se evita, dado que el polvo se puede utilizar directamente. Otra ventaja del polvo de la invención es la mejor compactación respecto a una dispersión, lo cual reduce considerablemente los costes de transporte. Con la eliminación del medio de dispersión, por ejemplo, agua o etanol, se reduce considerablemente el volumen y el peso del filtro UV que se debe transportar, lo cual ejerce un efecto considerablemente positivo en los

costes de transporte y almacenamiento. Asimismo, en el caso de utilizar filtros UV en forma de polvo, estos pueden añadirse a mezclas de polvos compactos, pudiéndose optimizar al mismo tiempo el aglutinante en cuanto a su sensación dérmica sin tener que tener en cuenta una parte adicional de filtros UV líquidos.

5 Son objeto de la invención filtros UV en forma de polvo que se obtienen mediante atomización de una dispersión que contiene filtros UV, siendo el filtro UV un filtro UV orgánico encapsulado. Preferentemente se trata de filtros UV en forma de partícula, donde el encapsulado es inorgánico. Hasta ahora este tipo de filtros UV se obtiene sólo en forma de dispersiones, lo cual limita el ámbito de aplicación y dificulta la elaboración de preparaciones, dado que el medio de dispersión y sus propiedades siempre deben tenerse en cuenta en la elaboración de las preparaciones. Este inconveniente desaparece en el caso de los filtros UV en forma de polvo de la invención.

10 El tamaño de los filtros UV en forma de partícula se encuentra en el rango de 10 nm a 100 µm, preferentemente en el rango de 10 nm a 30 µm ( $d_{50} \leq 30 \mu\text{m}$ , medido mediante difracción láser en agua, por ejemplo, con un Malvern Particle Sizer), en particular en el rango de 0,1 µm a 20 µm.

Según la invención se utilizan filtros UV orgánicos encapsulados. En particular, mediante el encapsulamiento se obtienen las siguientes ventajas:

15 - La hidrofilia de la pared de la cápsula se puede regular independientemente de la solubilidad del filtro UV. Así, por ejemplo, también se pueden integrar filtros UV hidrófobos en preparaciones puramente acuosas. Además, se contrarresta la sensación aceitosa al ponerse la preparación que contiene el filtro hidrófobo, a menudo considerada desagradable.

20 - Determinados filtros UV, en particular los derivados de dibenzoilmetano, muestran una fotoestabilidad muy reducida en las preparaciones cosméticas. Mediante el encapsulamiento de estos filtros o de compuestos que afectan a la fotoestabilidad de estos filtros, como por ejemplo los derivados del ácido cinámico, se puede incrementar la fotoestabilidad de toda la preparación.

25 - En la bibliografía siempre se discute la penetración dérmica de los filtros UV orgánicos y el potencial de irritación relacionado con ésta en la aplicación directa sobre la piel humana. Este efecto se contrarresta con el encapsulamiento aquí propuesto de las sustancias correspondientes, se contrarresta este efecto.

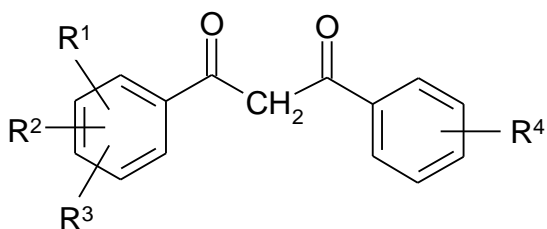
- En general, mediante el encapsulamiento de filtros UV individuales o de otros componentes, se pueden evitar los problemas que surgen en las preparaciones por la interacción recíproca de componentes individuales de la preparación, como procesos de cristalización, precipitaciones y formación de aglomerados, puesto que se previene esta interacción.

30 Por eso, según la invención puede preferirse que uno o varios de los filtros UV anteriormente mencionados se encuentren en forma encapsulada. Además, es ventajoso que las cápsulas sean tan pequeñas que no se las pueda observar a simple vista. Para lograr los efectos antes mencionados, también es necesario que las cápsulas sean suficientemente estables y que el principio activo encapsulado (filtro UV) no salga al exterior o lo haga en poca cantidad.

35 Las cápsulas adecuadas presentan paredes de polímeros inorgánicos. Según la invención, las cápsulas a utilizar presentan paredes que se pueden obtener mediante un proceso sol-gel, como se describe en las solicitudes EP 1 382 328, WO 00/09652, WO 00/72806 y WO 00/71084. Por otra parte, aquí se prefieren cápsulas cuyas paredes se preparen a partir de gel de sílice (sílica, óxido-hidróxido de silicio no definido) o dióxido de silicio. La preparación de las cápsulas correspondientes es conocida por el especialista, por ejemplo, a partir de las solicitudes de patente mencionadas, cuyo contenido también pertenece explícitamente al objeto de la presente solicitud.

Para el encapsulamiento de los filtros UV adecuados son, por ejemplo, los derivados de dibenzoilmetano.

Los derivados de dibenzoilmetano que deben usarse según la invención pueden seleccionarse en especial entre los derivados de dibenzoilmetano de la siguiente fórmula:



45 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $R^4$ , son idénticos o diferentes entre sí, representan agua, un grupo alquilo  $C_{1-8}$  de cadena lineal o ramificada o un grupo alcoxi  $C_{1-8}$  de cadena lineal o ramificada. Según la presente invención se puede utilizar evidentemente un derivado de dibenzoilmetano o varios derivados de dibenzoilmetano. De los derivados de dibenzoilmetano a los la presente invención hace especial referencia pueden mencionarse en particular:

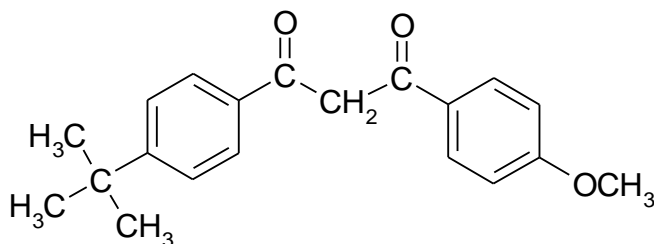
- 2-metildibenzoilmetano,
- 4-metildibenzoilmetano,
- 4-isopropildibenzoilmetano,
- 4-terc-butildibenzoilmetano,
- 5 - 2,4-dimetildibenzoilmetano,
- 2,5-dimetildibenzoilmetano,
- 4,4'-diisopropildibenzoilmetano,
- 4,4'-metoxi-terc-butildibenzoilmetano,
- 2-metil-5-isopropil-4'-metoxidibenzoilmetano,
- 10 - 2-metil-5-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano,
- 2,4-dimetil-4'-metoxidibenzoilmetano

y

- 2,6-dimetil-4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano,

pero esta lista no es restrictiva.

- 15 De los derivados de dibenzoilmetano previamente mencionados, según la invención se prefiere en particular el 4,4'-metoxi-terc-butildibenzoilmetano y en particular el 4,4'-metoxi-terc-butildibenzoilmetano disponible en el mercado bajo el nombre comercial Eusolex<sup>®</sup> 9020 de la empresa Merck KGaA, correspondiéndose este filtro con la siguiente fórmula estructural:



- 20 Otro derivado de dibenzoilmetano preferido según la invención es el 4-isopropildibenzoilmetano.

Las cápsulas pueden contener evidentemente también uno o varios filtros de protección solar eficaces (absorbentes) en el espectro UVA y/o UVB y/o en el espectro IR y/o VIS. Estos filtros pueden seleccionarse en particular entre derivados de ácido cinámico, derivados de ácido salicílico, derivados de alcanfor, derivados de triazina, derivados de β,β-difenilacrilato, derivados de ácido p-aminobenzoico, así como filtros poliméricos o filtros de silicona que se describen en la solicitud WO-93/04665. En la solicitud de patente EP-A 0 487 404 se especifican otros ejemplos de filtros orgánicos.

En principio, todos los filtros UV entran en consideración para un encapsulamiento. En especial se prefieren los filtros UV cuya inocuidad fisiológica ya haya sido probada. En la bibliografía especializada existen muchas sustancias conocidas y probadas como filtros UVA y UVB, por ejemplo, derivados de bencilidenalcanfor como 3-(4'-metilbenciliden)-dl-alcanfor (p. ej.: Eusolex<sup>®</sup> 6300), 3-bencilidenalcanfor (p. ej.: Mexoryl<sup>®</sup> SD), polímeros de N-((2 y 4)-[(2-oxoborn-3-iliden)metil]bencil)-acrilamida (p. ej.: Mexoryl<sup>®</sup> SW), metilsulfato de N,N,N-trimetil-4-(2-oxoborn-3-ilidenmetil)anilinio (p. ej.: Mexoryl<sup>®</sup> SK) o ácido (2-oxoborn-3-iliden)toluol-4-sulfónico (p. ej.: Mexoryl<sup>®</sup> SL), metoxicinamatos como metoxicinamato de octilo (p. ej.: Eusolex<sup>®</sup> 2292), 4-metoxicinamato de isopentilo, p. ej. como mezcla de isómeros (p. ej. Neo Heliopan<sup>®</sup> E 1000), derivados de salicilato como 2-etilhexilsalicilato (p. ej.: Eusolex<sup>®</sup> OS), 4-isopropilbencilsalicilato (p. ej.: Megasol<sup>®</sup>) o 3,3,5-trimetilciclohexilsalicilato (p. ej.: Eusolex<sup>®</sup> HMS), ácido 4-aminobenzoico y derivados como ácido 4-aminobenzoico, 4-(dimetilamino)benzoato de 2-etilhexilo (p. ej.: Eusolex<sup>®</sup> 6007), 4-aminobenzoato de etilo etoxilado (p. ej.: Uvinul<sup>®</sup> P25), ácidos fenilbencimidazolsulfónicos, como ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico, así como sus sales de potasio, sodio y trietanolamina (p. ej.: Eusolex<sup>®</sup> 232), ácido 2,2-(1,4-fenilen)-bisbencimidazol-4,6-disulfónico o sus sales (p. ej.: Neoheliopan<sup>®</sup> AP) o ácido 2,2-(1,4-fenilen)-bisbencimidazol-6-sulfónico, y otras sustancias como

- 2-ciano-3,3-difenilacrilato de 2-etilhexilo (p.ej. Eusolex<sup>®</sup> OCR),
- ácido 3,3'-(1,4-fenilendimetilen)-bis-7,7-dimetil-2-oxobiciclo-[2.2.1]hept-1-ilmetanosulfónico así como sus sales (p.ej. Mexoryl<sup>®</sup> SX) y

- 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina (p.ej. Uvinul® T 150)
- 2-(4-dietilamino-2-hidroxi-benzoil)-benzoato de hexilo (p.ej. Uvinul®UVA Plus, empresa BASF).

Los compuestos que se exponen en la lista solo se deben considerar como ejemplos. Desde luego también se pueden utilizar otros filtros UV.

5 Otros filtros UV adecuados son,

- 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-(2-metil-3-(1,3,3,3-tetrametil-1-(trimetilsililoxi)disiloxanil)propil)fenol (p.ej. Silatrizole®),
- 4,4'-[6-[4-((1,1-dimetiletil)aminocarbonil)fenilamino]-1,3,5-triazin-2,4-diil]diimino]bis(benzoato de 2-etilhexilo) (p.ej. Uvasorb® HEB),

10 -  $\alpha$ -(trimetilsilil)- $\omega$ -[trimetilsilil]oxi]poli[oxi(dimetil) [y aprox. 6% metil[2-[p-[2,2-bis(etoxicarbonil)vinil]fenoxi]-1-metilenetil] y aprox. 1,5% metil[3-[p-[2,2-bis(etoxicarbonil)vinil]fenoxi]-propenil] y de 0,1 hasta 0,4% (metilhidrogen]sililen]] (n  $\approx$  60) (Nº CAS: 207 574-74-1)

- 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)fenol) (Nº CAS: 103 597-45-1)
- ácido 2,2'-(1,4-fenilen)bis-(1H-bencimidazol-4,6-disulfónico, sal monosódica) (Nº CAS: 180 898-37-7) y

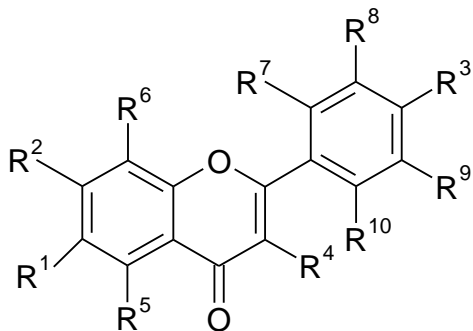
15 - 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxil]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (Nº CAS: 103 597-45-, 187 393-00-6).

- 4,4'-[6-[4-((1,1-dimetiletil)aminocarbonil)fenilamino]-1,3,5-triazin-2,4-diil]diimino]bis(benzoato de 2-etilhexilo) (p.ej. Uvasorb® HEB),

Los compuestos preferidos con características de filtración de UV son 3-(4'-metilbenciliden)-dl-alcanfor, 1-(4-terc-butilfenil)-3-(4-metoxifenil)-propan-1,3-diona, 4-isopropildibenzoilmetano, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, metoxicinamato de octilo, 3,3,5-trimetil-ciclohexilsalicilato, 4-(dimetilamino)benzoato de 2-etilhexilo, 2-ciano-3,3-difenil-acrilato de 2-etilhexilo, ácido 2-fenil-bencimidazol-5-sulfónico, así como sus sales de potasio, sodio y trietanolamina.

20

Las cápsulas preferidas también pueden contener compuestos de fórmula I:



25 donde R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> se seleccionan entre

- H
- y OR<sup>11</sup>, donde OR<sup>11</sup>, independientemente entre sí, representa
- OH
- grupos alquiloxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada,

30 - grupos alqueniloxi de C<sub>3</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada,

- grupos hidroxialcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, donde el/los grupo(s) hidroxilo puede/n estar unidos a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena de alquilo también puede estar interrumpida por oxígeno, y/o

35 - grupos cicloalquiloxi de C<sub>3</sub> hasta C<sub>10</sub> y/o grupos cicloalqueniloxi de C<sub>3</sub> hasta C<sub>12</sub> donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>- con n = 1 a 3 y/o,

- restos mono- y/u oligoglicosílicos,

con la condición de que al menos un resto de entre R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> sea OR<sup>11</sup>,

y  $R^3$  sea un resto  $OR^{11}$  y

de  $R^4$  a  $R^7$  y  $R^{10}$  pueden ser iguales o distintos, e, independientemente entre sí, representan

- H
- grupos alquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

5 - grupos alqueno de  $C_3$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

- grupos hidroxialquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, donde el grupo hidroxilo puede estar unido a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena alquílica también puede estar interrumpida por oxígeno y/o

10 - grupos cicloalquilo de  $C_3$  hasta  $C_{10}$  y/o grupos cicloalqueno de  $C_3$  hasta  $C_{12}$  donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos  $-(CH_2)_n-$  con  $n = 1$  a  $3$  y

$R^8$  y  $R^9$  pueden ser iguales o distintos, e, independientemente entre sí, representan

- H
- $OR^{11}$
- grupos alquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

15 - grupos alqueno de  $C_3$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

- grupos hidroxialquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, donde el grupo hidroxilo puede estar unido a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena alquílica también puede estar interrumpida por oxígeno y/o

20 - grupos cicloalquilo de  $C_3$  hasta  $C_{10}$  y/o grupos cicloalqueno de  $C_3$  hasta  $C_{12}$  donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos  $-(CH_2)_n-$  con  $n = 1$  a  $3$ .

Bajo los flavonoides de fórmula I para su uso según la invención se incluyen filtros UV de amplio espectro, otros compuestos de fórmula I igualmente preferidos muestran un máximo de absorción en el límite entre la radiación UVB y UVA. Por eso, como filtros UVA-II complementan preferentemente el espectro de absorción de los filtros comerciales UVB-I o UVA-I. Las cápsulas preferidas según la invención contienen al menos un compuesto de

25 fórmula I, donde  $R^3$  representa

- OH o
- grupos alcoxi de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi o
- restos mono- y/u oligoglicosílicos, preferentemente restos glicosílicos y

$R^1$  y/o  $R^2$  representan preferentemente

- 30 - OH o
- grupos alcoxi de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi o
- restos mono- y/u oligoglicosílicos, preferentemente restos glicosílicos.

Los compuestos preferidos destacan por una absorción UV especialmente intensa. Se ha demostrado que la intensidad de absorción UV es especialmente elevada cuando  $R^3$  representa grupos alcoxi de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de

35 cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi, y  $R^8$  y  $R^9$  son iguales y representan H o grupos alcoxi de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi.

Evidentemente, las cápsulas pueden contener los filtros UV previamente mencionados solos, pero también pueden encontrarse mezclas de varios de los filtros UV mencionados en las cápsulas. Asimismo, en las cápsulas los filtros UV también pueden encontrarse combinados con otras sustancias, como, por ejemplo, fotoestabilizadores, aceites

40 cosméticos y/o antioxidantes, para conseguir un aumento de la estabilidad de los filtros UV mencionados. Ejemplos y compuestos preferidos para las sustancias adicionales arriba mencionadas, en especial para los fotoestabilizadores, se encuentran a continuación en esta solicitud en la descripción general de estas sustancias.

45 Como aceites cosméticos son típicos, por ejemplo, aceites minerales, ceras minerales, aceites, como los triglicéridos del ácido cáprico o del ácido caprílico, otros aceites naturales como, por ejemplo, aceite de ricino; grasas, ceras y otros cuerpos grasos naturales y sintéticos, preferentemente ésteres de ácidos grasos con alcoholes con pocos C, por ejemplo con isopropanol, propilenglicol o glicerina, o ésteres de alcoholes grasos con ácidos alcanóicos con pocos C o con ácidos grasos, aceites de silicona como dimetilpolisiloxanos, dietilpolisiloxanos, difenilpolisiloxanos así como mezclas de éstos.

Para los filtros UV encapsulados mencionados previamente, la forma de polvo es de un interés especial, puesto que los filtros UV en forma encapsulada la mayoría de las veces sólo pueden ofrecerse como dispersión, las cuales presentan los inconvenientes previamente mencionados en las aplicaciones. Además, los filtros UV encapsulados se presentan con frecuencia como dispersiones con etanol, lo cual limita más los ámbitos de aplicación, puesto que el etanol no es un componente deseado en muchas aplicaciones, particularmente en cosmética. Los filtros UV en forma de polvo según la invención preferentemente no van acompañados de disolventes o presentan una proporción de disolvente que no afecta a la aplicación correspondiente y, por consiguiente, pueden emplearse de forma universal. Por esta razón, los filtros UV en forma de polvo según la invención resultan ser especialmente ventajosos.

Los polvos según la invención pueden someterse adicionalmente a un tratamiento posterior en otra forma de realización de la presente invención para modificar la superficie de las partículas individuales del polvo. De esta forma, mediante la aplicación de compuestos correspondientes puede conseguirse una hidrofobización o hidrofiliación de las superficies de las partículas. Para una modificación hidrófoba, es adecuado, por ejemplo, un recubrimiento con ácidos orgánicos, como por ejemplo, ácido esteárico o ácido láurico, con polímeros LCST, fosfatos fluoroalcohólicos o un recubrimiento de silicona o silano.

Como es sabido, las siliconas son polímeros u oligómeros orgánicos de silicio con una estructura de cadena lineal o cíclica, ramificada o entrelazada con pesos moleculares distintos, que se obtienen mediante polimerización y/o policondensación con silanos funcionalizados adecuadamente y fundamentalmente están formados por unidades principales que se pueden volver a modificar, en las que los átomos de silicio están unidos entre sí mediante átomos de oxígeno (enlace siloxano), enlazándose dado el caso los grupos hidrocarbonados directamente en los átomos de silicio mediante un átomo de carbono. Los grupos hidrocarbonados más comunes son grupos alquilo y, en particular, grupos metilo, grupos fluoroalquilo, grupos arilo y, en particular, grupos fenilo, así como grupos alquenilo y, en particular, grupos vinilo. Otros tipos de grupos que pueden enlazarse en la cadena de siloxano directamente o mediante un grupo hidrocarbonado son en particular hidrógeno, los halógenos y, en particular, cloro, bromo o flúor, los tioles, grupos alcoxi, grupos polioxialquileo (o poliéter) y, en particular, polioxietileno y/o polioxipropileno, grupos hidroxilo o grupos hidroxialquilo, dado el caso grupos amino, grupos amido, grupos aciloxi o grupos aciloxialquilo sustituidos, grupos hidroxialquilamino o grupos aminoalquilo, grupos amonio cuaternario, grupos anfóteros o grupos betaína, grupos aniónicos, como carboxilatos, tioglicolatos, sulfosuccinatos, tiosulfatos, fosfatos y sulfatos, siendo esta lista no limitante de ninguna forma (las llamadas siliconas "organomodificadas").

En el sentido de la presente invención, en el término "silicona" se incluyen y se cubren también los silanos y, en particular, los alquilsilanos necesarios para su elaboración.

Las siliconas adecuadas para la presente invención que pueden utilizarse para cubrir el protector UV se seleccionan preferentemente entre los alquilsilanos, los polialquilsiloxanos y los polialquilhidrogenosiloxanos. Aún más preferidas son las siliconas seleccionadas entre octilmetilsilano, los polidimetilsiloxanos y los polimetilhidrogenosiloxanos.

Además, son objeto de la presente invención procedimientos para la elaboración de los filtros UV en forma de polvo como se ha descrito previamente, en los que las dispersiones que contienen filtros UV orgánicos encapsulados se atomizan. Aparte de la variante de atomización descrita, también puede utilizarse la fluidización (granulación en lecho fluidizado). Además, pueden utilizarse todos los procedimientos descritos según la técnica actual para el secado protector de suspensiones. Según la invención se utiliza la atomización. Los tipos adecuados de filtros UV ya se han mencionado en la descripción de los polvos según la invención.

Los procedimientos según la invención tienen la ventaja de que pueden elaborarse de forma protectora los filtros UV en forma de polvo a partir de las correspondientes dispersiones. En particular, en el caso de los filtros UV orgánicos encapsulados, la atomización resulta el procedimiento especialmente adecuado para la elaboración del polvo correspondiente. Las cápsulas son sensibles a una carga mecánica y térmica considerable, lo cual pueden provocar la apertura del encapsulamiento y la liberación de las sustancias ahí contenidas. Esto no es deseable, puesto que precisamente en aplicaciones tópicas de filtros UV debería evitarse un contacto directo del filtro UV con la piel. Por consiguiente, el mantenimiento de la estructura del encapsulamiento es de una importancia fundamental y representa una exigencia esencial para estos sistemas. Mediante la técnica utilizada preferentemente en la presente invención de la atomización pueden satisfacerse sorprendentemente estas exigencias también para estos sistemas, de forma que con ello se consigue preparar filtros UV de cualquier tipo en forma de polvo, lo cual representa una ventaja fundamental en particular en el caso de sistemas encapsulados.

Los filtros UV correspondientes se incorporan en forma de dispersiones en la atomización. Así, en general son adecuados todos los disolventes como medio de dispersión, como por ejemplo, agua o disolvente orgánico. Preferentemente se trata de dispersiones acuosas, puesto que aquí no quedan residuos no deseados de disolvente en el polvo que puedan dificultar o impedir completamente el uso de los polvos en cosmética. Además, en el caso de dispersiones acuosas no existen restricciones relevantes de seguridad como, por ejemplo, la inflamabilidad o el peligro de explosión.

Para la atomización o liofilización son adecuados todas las variantes de proceso conocidas por el especialista y todos los aparatos adecuados para ello, especialmente se utiliza la atomización. En principio el proceso de atomización incluye siempre cuatro etapas básicas, en particular, la generación de gotas, la mezcla gotas/gas, la

disgregación de los aglomerados y el vaciado del producto fino. De aquí surgen variantes de proceso en las subetapas individuales. La generación de gotas puede efectuarse, por ejemplo, mediante pulverización centrífuga, pulverización por inyección de un fluido o pulverización por inyección de dos fluidos, para la conducción del producto/gas se puede tratar de una conducción en corriente paralela o en contracorriente. En la presente invención preferentemente se utilizan la pulverización centrífuga y la pulverización por inyección de dos fluidos, pudiéndose tratar de una conducción en corriente paralela o en contracorriente. En especial, se prefiere el uso de la pulverización por inyección de dos fluidos en contracorriente o la pulverización centrífuga en corriente paralela. Igualmente, la salida de producto puede efectuarse según las variantes de proceso conocidas por el especialista, preferentemente se trata de un vaciado en dos puntos, es decir, se utiliza, por ejemplo, un cono secador y un ciclón.

La temperatura de entrada de las dispersiones acuosas puede encontrarse en el intervalo de 110°C a 200°C, preferentemente en el intervalo de 130°C a 160°C, y en especial en el intervalo de 140°C a 150°C. La temperatura de salida del polvo puede encontrarse en el intervalo de 40 a 90°C, preferentemente en el intervalo de 50 a 80°C. Si se emplean dispersiones con disolvente, las temperaturas de entrada y salida pueden ser debidamente inferiores y adaptarse así individualmente al disolvente. La proporción de carga de sustancia pulverizada a flujo de aire de secado puede encontrarse en el intervalo de 0,5 kg/h a 200 m<sup>3</sup>/h hasta 5 kg/h a 50 m<sup>3</sup>/h, preferentemente la relación se encuentra entre 0,8 kg/h a 70 m<sup>3</sup>/h y 1,5 kg/h a 75 m<sup>3</sup>/h.

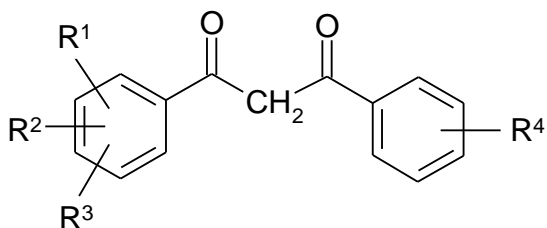
En los procedimientos según la invención pueden introducirse antes o durante la atomización o liofilización aditivos correspondientes para modificar las características del producto, así como para modificar las características de atomización, por ejemplo, como aditivo en las dispersiones utilizadas o directamente como aditivo durante el procedimiento. En este caso, pueden aplicarse los más variados coadyuvantes conocidos por los especialistas como polialcoholes, polioles, fécula de maíz, ciclodextrinas, emulsionantes, tensioactivos, derivados de celulosa, goma de xantano y PVP. La cantidad de los aditivos utilizados puede ser de 0,01 a 20% en peso, preferentemente de 0,1 a 10% en peso.

En otra forma de realización los filtros UV en forma de polvo se someten a un tratamiento posterior. El tratamiento posterior puede efectuarse según todas las maneras conocidas por el especialista como, por ejemplo, mediante procesos de precipitación polimérica en medios acuosos u orgánicos, mediante procesos de solvólisis, mediante procesos de dispersión o mediante mezclas sencillas.

Los filtros UV en forma de polvo según la invención en principio son adecuados para su uso en cualquier forma de preparaciones como, por ejemplo, preparaciones cosméticas, y también en preparaciones que pueden emplearse en el sector de la técnica como, por ejemplo, tintes o lacas. Preferentemente, los filtros UV en forma de polvo según la invención se utilizan en preparaciones cosméticas, en particular en cosmética decorativa. Los filtros UV en forma de polvo según la invención permiten la elaboración de preparaciones con propiedades de protección frente la luz para una multitud de variantes y medios de aplicación que son difíciles de elaborar con las dispersiones conocidas de la técnica actual, puesto que los medios de dispersión modifican considerablemente la composición de las preparaciones. Así, mediante los procedimientos según la invención pueden elaborarse filtros UV que son adecuados para la incorporación en polvos compactos sin modificar ni limitar la sensación dérmica o las posibilidades de preparación. La proporción de los filtros UV en forma de polvo en estas preparaciones puede ser de 0,1 a 30% en peso y preferentemente de 0,5 a 15% en peso, respecto a la preparación. Los filtros UV en forma de polvo según la invención pueden introducirse tanto en la fase acuosa como en la oleosa de una preparación.

Las preparaciones preferidas con propiedades de protección frente la luz contienen al mismo tiempo al menos otro filtro UV orgánico, preferentemente un derivado de dibenzoilmetano. Los derivados de dibenzoilmetano utilizados en el marco de la presente invención son productos ya completamente conocidos que se describen en particular en los impresos FR-A-2326405, FR-A-2440933 y EP-A-0114607.

Los derivados de dibenzoilmetano de uso según la invención pueden seleccionarse en especial entre los derivados de dibenzoilmetano de la siguiente fórmula:



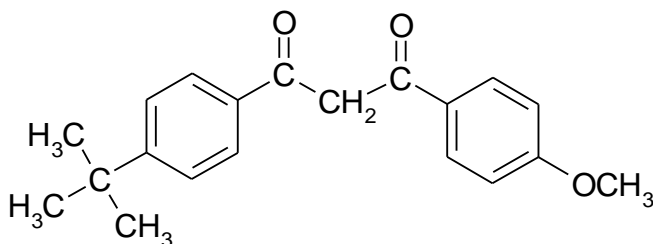
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup>, los cuales son idénticos o diferentes entre sí, representan agua, un grupo alquilo C<sub>1-8</sub> de cadena lineal o ramificada o un grupo alcoxi C<sub>1-8</sub> de cadena lineal o ramificada. Según la presente invención se puede utilizar evidentemente un derivado de dibenzoilmetano o varios derivados de dibenzoilmetano. De los derivados de dibenzoilmetano a los que se refiere en especial la presente invención pueden mencionarse en particular:

- 2-metildibenzoilmetano,



- 4-metildibenzoilmetano,
  - 4-isopropildibenzoilmetano,
  - 4-terc-butildibenzoilmetano,
  - 2,4-dimetildibenzoilmetano,
  - 5 - 2,5-dimetildibenzoilmetano,
  - 4,4'-diisopropildibenzoilmetano,
  - 4,4'-metoxi-terc-butildibenzoilmetano,
  - 2-metil-5-isopropil-4'-metoxidibenzoilmetano,
  - 2-metil-5-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano,
  - 10 - 2,4-dimetil-4'-metoxidibenzoilmetano
- y
- 2,6-dimetil-4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano,
- siendo esta lista no limitante.

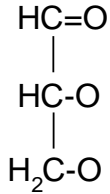
- 15 De los derivados de dibenzoilmetano mencionados previamente, según la invención se prefiere en particular el 4,4'-metoxi-terc-butildibenzoilmetano y en particular el 4,4'-metoxi-terc-butildibenzoilmetano disponible en el mercado bajo el nombre comercial Eusolex<sup>®</sup> 9020 de la empresa Merck KGaA, correspondiéndose este filtro con la siguiente fórmula estructural:



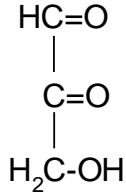
- Otro derivado de dibenzoilmetano preferido según la invención es el 4-isopropildibenzoilmetano.
- 20 Otras preparaciones preferidas con propiedades de protección frente la luz contienen al mismo tiempo al menos una benzofenona o un derivado de benzofenona, como la especialmente preferida 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona (p. ej.: Eusolex<sup>®</sup> 4360) o ácido 2-hidroxi-4-metoxibenzofenon-5-sulfónico y su sal de sodio (p. ej.: Uvinul<sup>®</sup> MS-40).
- El/los derivado(s) de dibenzoilmetano o el/los derivado(s) de benzofenona pueden encontrarse en las preparaciones según la invención en proporciones que en general se encuentran en el intervalo de 0,1 a 10% en peso y preferentemente en proporciones que se encuentran en el intervalo de 0,3 a 5% en peso, en las que estas proporciones son respecto al peso total de la preparación.
- A causa de las ventajas mencionadas previamente, otro objeto de la presente invención también es el uso de un filtro UV en forma de polvo para prevenir la desestabilización de los demás filtros UV, en particular de dibenzoilmetano y derivados de dibenzoilmetano o benzofenona y derivados de benzofenona.
- 30 También puede ser preferible según la invención que las preparaciones contengan otros filtros UV inorgánicos. En este caso se prefieren tanto los del grupo de dióxidos de titanio, como p.ej. dióxido de titanio recubierto (p.ej. Eusolex<sup>®</sup> T-2000, Eusolex<sup>®</sup> T-AQUA), óxidos de cinc (p.ej. Sachtotec<sup>®</sup>), óxidos de hierro, como también óxidos de cerio. Normalmente estos filtros UV inorgánicos se introducen en las formulaciones cosméticas en cantidades de 0,5 hasta 20 por ciento en peso, preferentemente de 2-10%. En particular, puede preferirse que en las emulsiones
- 35 se introduzca en una fase un filtro UV en forma de polvo según la invención y en la otra fase otro filtro UV inorgánico.
- Según la invención, los filtros UV mencionados previamente también pueden proveerse de un tratamiento superficial que intensifique las propiedades hidrófilas o hidrófobas. Ya se han mencionado ejemplos de este tipo de tratamiento superficial.
- 40 Los protectores UV pueden encontrarse en las preparaciones según la invención en proporciones que en general se encuentran en el intervalo de 0,1 a 50% en peso y preferentemente en proporciones que se encuentran en el intervalo de 0,5 a 20% en peso, en las que estas proporciones son respecto al peso total de la preparación.

En otra forma de realización también preferida de la presente invención, la preparación según la invención contiene como mínimo un autobronceador.

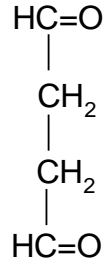
Como autobronceadores ventajosos se pueden utilizar, entre otros, los siguientes:



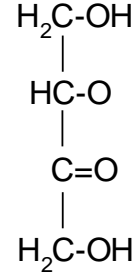
5 Glicerolaldehído



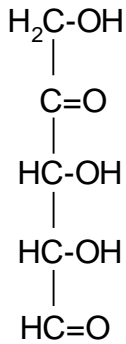
Hidroximetilglioxal



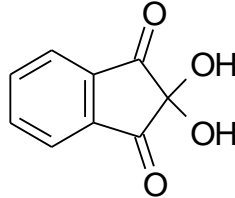
$\gamma$ -Dialdehído



Eritrulosa

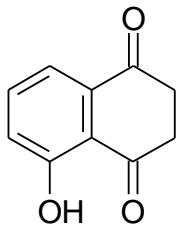


6-Aldo-D-fructosa



Ninhydrina

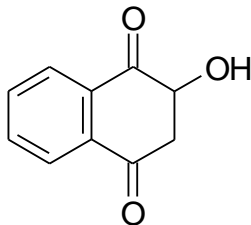
Además, se debe mencionar la 5-hidroxi-1,4-naftoquinona (juglón), que se extrae de la cáscara de nueces frescas.



10

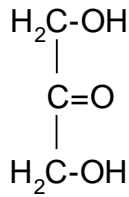
5-Hidroxi-1,4-naftoquinona (juglón)

así como la 2-hidroxi-1,4-naftoquinona (lawsóna) que proviene de las hojas de henna.



2-Hidroxi-1,4-naftoquinona (lawsóna)

15 En particular, se prefiere completamente la 1,3-dihidroxiacetona (DHA), un azúcar trivalente que se encuentra en el cuerpo humano, y sus derivados.



1,3-Dihidroxiacetona (DHA)

El uso de un filtro UV en forma de polvo según la invención en la estabilización de autobronceadores, en particular de dihidroxiacetona o derivados de dihidroxiacetona es otro objeto de la presente invención.

- 5 Además, las preparaciones según la invención con propiedades de protección frente la luz también pueden contener colorantes y pigmentos. Los colorantes y pigmentos se pueden escoger de la correspondiente lista positiva del reglamento sobre cosmética o de la lista de la UE sobre colorantes cosméticos. En la mayoría de los casos, son idénticos a los colorantes alimentarios permitidos. Los pigmentos ventajosos son, por ejemplo, dióxido de titanio, mica, óxidos de hierro (p.ej. Fe<sub>2</sub>O<sub>3</sub>, Fe<sub>3</sub>O<sub>4</sub>, FeO(OH)) y/u óxido de estaño. Los colorantes ventajosos son, por ejemplo, el carmín, el azul de Prusia, el verde óxido de cromo, el azul marino y/o el violeta de manganeso. En particular es ventajoso escoger los colorantes y/o pigmentos de la siguiente lista. Los códigos CIN (del inglés, *Colour Index Number*) se han tomado de la publicación Rowe Colour Index, 3<sup>a</sup> Ed, Society of Dyers and Colourists, Bradford, Inglaterra, 1971.
- 10

| Denominación química u otra                          | CIN   | Color    |
|--|-------|----------|
| Pigment Green  | 10006 | verde    |
| Acid Green 1   | 10020 | verde    |
| Ácido 2,4-dinitrohidroxinaftalin-7-sulfónico         | 10316 | amarillo |
| Pigment Yellow 1                                     | 11680 | amarillo |
| Pigment Yellow 3                                     | 11710 | amarillo |
| Pigment Orange 1                                     | 11725 | naranja  |
| 2,4-Dihidroxiázobenzol                               | 11920 | naranja  |
| Solvent Red 3  | 12010 | rojo     |
| 1-(2'-Cloro-4'-nitro-1'-fenilazo)-2-hidroxinaftalina | 12085 | rojo     |

ES 2 432 365 T3

(continuación)

| Denominación química u otra  | CIN   | Color    |
|--|-------|----------|
| Pigment Red 3  | 12120 | rojo     |
| Rojo Ceres, rojo Sudán, rojo graso G   | 12150 | rojo     |
| Pigment Red 112  | 12370 | rojo     |
| Pigment Red 7  | 12420 | rojo     |
| Pigment Brown 1  | 12480 | marrón   |
| Anilida del ácido 4-(ácido 2'-metoxi-5'sulfónicodietilamida-1'-fenilazo)-3-hidroxi-5"-cloro-2",4"-dimetoxi-2-naftólico | 12490 | rojo     |
| Disperse Yellow 16   | 12700 | amarillo |
| Ácido 1-(4-sulfo-1-fenilazo)-4-amino-benzol-5-sulfónico  | 13015 | amarillo |
| Ácido 2,4-dihidroxi-azobenzol-4'-sulfónico   | 14270 | naranja  |
| Ácido 2-(ácido 2,4-dimetilfenilazo-5-sulfónico)-1-hidroxinaftalin-4-sulfónico  | 14700 | rojo     |
| Ácido 2-(4-sulfo-1-naftilazo)-1-naftol-4-sulfónico   | 14720 | rojo     |
| Ácido 2-(6-sulfo-2,4-xililazo)-1-naftol-5-sulfónico  | 14815 | rojo     |
| 1-(4'-Sulfofenilazo)-2-hidroxinaftalina  | 15510 | naranja  |
| 1-(Ácido 2-sulfónico-4-cloro-5-carboxílico-1-fenilazo)-2-hidroxinaftalina  | 15525 | rojo     |
| 1-(Ácido 3-metil-fenilazo-4-sulfónico)-2-hidroxinaftalina  | 15580 | rojo     |
| 1-(4',Ácido (8')-sulfónico-naftilazo)-2-hidroxinaftalina   | 15620 | rojo     |
| Ácido 2-hidroxi-1,2'-azonaftalin-1'-sulfónico  | 15630 | rojo     |
| Ácido 3-hidroxi-4-fenilazo-2-naftalincarboxílico   | 15800 | rojo     |
| Ácido 1-(2-sulfo-4-metil-1-fenilazo)-2-naftalincarboxílico   | 15850 | rojo     |
| Ácido 1-(2-sulfo-4-metil-5-cloro-1-fenilazo)-2-hidroxi-naftalin-3-carboxílico  | 15865 | rojo     |
| Ácido 1-(2-sulfo-1-naftilazo)-2-hidroxinaftalin-3-carboxílico  | 15880 | rojo     |
| Ácido 1-(3-sulfo-1-fenilazo)-2-naftol-6-sulfónico  | 15980 | naranja  |
| Ácido 1-(4-sulfo-1-fenilazo)-2-naftol-6-sulfónico  | 15985 | amarillo |
| Allura Red   | 16035 | rojo     |
| Ácido 1-(4-sulfo-1-naftilazo)-2-naftol-3,6-disulfónico   | 16185 | rojo     |
| Acid Orange 10   | 16230 | naranja  |
| Ácido 1-(4-sulfo-1-naftilazo)-2-naftol-6,8-disulfónico   | 16255 | rojo     |
| Ácido 1-(4-sulfo-1-naftilazo)-2-naftol-3,6,8-trisulfónico  | 16290 | rojo     |

ES 2 432 365 T3

(continuación)

| Denominación química u otra   | CIN   | Color    |
|---|-------|----------|
| Ácido 8-amino-2-fenilazo-1-naftol-3,6-disulfónico   | 17200 | rojo     |
| Acid Red 1  | 18050 | rojo     |
| Acid Red 155  | 18130 | rojo     |
| Acid Yellow 121   | 18690 | amarillo |
| Acid Red 180  | 18736 | rojo     |
| Acid Yellow 11  | 18820 | amarillo |
| Acid Yellow 17  | 18965 | amarillo |
| Ácido 4-(4-sulfo-1-fenilazo)-1-(4-sulfofenil)-5-hidroxipirazolon-3-carboxílico  | 19140 | amarillo |
| Pigment Yellow 16   | 20040 | amarillo |
| 2,6-(4'-sulfo-2'',4''-dimetil)-bis-fenilazo)1,3-dihidroxibenzol   | 20170 | naranja  |
| Acid Black 1  | 20470 | negro    |
| Pigment Yellow 13   | 21100 | amarillo |
| Pigment Yellow 83   | 21108 | amarillo |
| Solvent Yellow  | 21230 | amarillo |
| Acid Red 163  | 24790 | rojo     |
| Acid Red 73   | 27290 | rojo     |
| Ácido 2-[4'-(4"-sulfo-1"-fenilazo)-7'-sulfo-1'-naftilazo]-1-hidroxi-7-aminonaftalin-3,6-disulfónico                           | 27755 | negro    |
| Ácido 4-[4"-sulfo-1"-fenilazo)-7'-sulfo-1'-naftilazo]-1-hidroxi-8-acetilaminonaftalin-3,5-disulfónico                         | 28440 | negro    |
| Direct Orange 34, 39, 44, 46, 60  | 40215 | naranja  |
| Food Yellow   | 40800 | naranja  |
| Aldehído trans-β-apo-8'-caroténico (C <sub>30</sub> )   | 40820 | naranja  |
| trans-Apo-8'-carotenato (C <sub>30</sub> ) de etilo   | 40850 | naranja  |
| Cantaxantina  | 40850 | naranja  |
| Acid Blue 1   | 42045 | azul     |
| 2,4-Disulfo-5-hidroxi-4'-4"-bis-(dietilamino)trifenil-carbinol  | 42051 | azul     |
| 4-[-(4-N-Etil-p-sulfobencilamino)-fenil-(4-hidroxi-2-sulfofenil)-(metilen)-1-(N-etil-N-p-sulfobencil)-2,5-ciclohexadienimina] | 42053 | verde    |
| Acid Blue 7   | 42080 | azul     |

ES 2 432 365 T3

(continuación)

| Denominación química u otra   | CIN   | Color    |
|---|-------|----------|
| (N-Etil-p-sulfobencil-amino)-fenil-(2-sulfofenil)-metilen-(N-Etil-N-p-sulfobencil) $\Delta^{2,5}$ -ciclohexadienimina | 42090 | azul     |
| Acid Green 9  | 42100 | verde    |
| Dietil-di-sulfobencil-di-4-amino-2-cloro-di-2-metil-fucsonimonio  | 42170 | verde    |
| Basic Violet 14   | 42510 | violeta  |
| Basic Violet 2  | 42520 | violeta  |
| 2'-Metil-4'-(N-etil-N-m-sulfobencil)-amino-4''-(N-dietil)-amino-2-metil-N-etil-N-m-sulfobencil-fucsonimonio           | 42735 | azul     |
| 4'-(N-Dimetil)-amino-4''-(N-fenil)-aminonafto-N-dimetilfucsonimonio   | 44045 | azul     |
| 2-Hidroxi-3,6-disulfo-4,4'-bis-dimetilaminonaftofucsonimonio  | 44090 | verde    |
| Acid Red 52   | 45100 | rojo     |
| Sal de 3-(2'-metilfenilamino)-6-(2'-metil-4'-sulfofenilamino)-9-(2''-carboxifenil)-xantenio                           | 45190 | violeta  |
| Acid Red 50   | 45220 | rojo     |
| Ácido fenil-2-oxifluoro-2-carboxílico   | 45350 | amarillo |
| 4,5-Dibromofluoresceína   | 45370 | naranja  |
| 2,4,5,7-Tetrabromofluoresceína  | 45380 | rojo     |
| Solvent Dye   | 45396 | naranja  |
| Acid Red 98   | 45405 | rojo     |
| 3',4',5',6'-Tetracloro-2,4,5,7-tetrabromofluoresceína   | 45410 | rojo     |
| 4,5-Diyodofluoresceína  | 45425 | rojo     |
| 2,4,5,7-Tetrayodofluoresceína   | 45430 | rojo     |
| Quinofalona   | 47000 | amarillo |
| Ácido quinofalona-disulfónico   | 47005 | amarillo |
| Acid Violet 50  | 50325 | violeta  |
| Acid Black 2  | 50420 | negro    |
| Pigment Violet 23   | 51319 | violeta  |
| 1,2-Dioxiantraquinona, complejo de calcio y aluminio  | 58000 | rojo     |
| Ácido 3-oxipiren-5,8,10-trisulfónico  | 59040 | verde    |
| 1-Hidroxi-4-N-fenil-aminoantraquinona   | 60724 | violeta  |

ES 2 432 365 T3

(continuación)

| Denominación química u otra                                       | CIN   | Color    |
|---|-------|----------|
| 1-Hidroxi-4-(4'-metilfenilamino)-antraquinona                     | 60725 | violeta  |
| Acid Violet 23  | 60730 | violeta  |
| 1,4-Di(4'-metil-fenilamino)-antraquinona                          | 61565 | verde    |
| 1,4-Bis-(o-sulfo-p-toluidino)-antraquinona                        | 61570 | verde    |
| Acid Blue 80  | 61585 | azul     |
| Acid Blue 62  | 62045 | azul     |
| N,N'-Dihidro-1,2,1',2'-antraquinonazina                           | 69800 | azul     |
| Vat Blue 6; Pigment Blue 64                                       | 69825 | azul     |
| Vat Orange 7  | 71105 | naranja  |
| Índigo  | 73000 | azul     |
| Ácido indigosulfónico   | 73015 | azul     |
| 4,4'-Dimetil-6,6'-diclorotioíndigo                                | 73360 | rojo     |
| 5,5'-Dicloro-7,7'-dimetiltioíndigo                                | 73385 | violeta  |
| Quinacridona Violet 19  | 73900 | violeta  |
| Pigment Red 122   | 73915 | rojo     |
| Pigment Blue 16   | 74100 | azul     |
| Ftalocianina  | 74160 | azul     |
| Direct Blue 86  | 74180 | azul     |
| Ftalocianina clorada  | 74260 | verde    |
| Natural Yellow 6, 19; Natural Red 1                               | 75100 | amarillo |
| Bixina, norbixina   | 75120 | naranja  |
| Licopina  | 75125 | amarillo |
| trans-alfa-, beta- o gamma-Caroteno                               | 75130 | naranja  |
| Derivados ceto y/o hidroxilo de caroteno                          | 75135 | amarillo |
| Guanina o brillo de perla   | 75170 | blanco   |
| 1,7-Bis-(4-hidroxi-3-metoxifenil)1,6-heptadien-3,5-diona          | 75300 | amarillo |
| Sal compleja (Na, Al, Ca) del ácido carmínico                     | 75470 | rojo     |
| Clorofila a y b; compuestos de cobre de clorofilas y clorofilinas | 75810 | verde    |
| Aluminio  | 77000 | blanco   |

ES 2 432 365 T3

(continuación)

| Denominación química u otra                               | CIN   | Color    |
|---|-------|----------|
| Hidróxido de aluminio                                     | 77002 | blanco   |
| Silicato de aluminio hidratado                            | 77004 | blanco   |
| Ultramarin  | 77007 | azul     |
| Pigment Red 101 y 102                                     | 77015 | rojo     |
| Sulfato de bario  | 77120 | blanco   |
| Oxicloruro de bismuto y sus mezclas con mica              | 77163 | blanco   |
| Carbonato de calcio                                       | 77220 | blanco   |
| Sulfato de calcio   | 77231 | blanco   |
| Carbono   | 77266 | negro    |
| Pigment Black 9   | 77267 | negro    |
| Carbo medicinalis vegetabilis                             | 77268 | negro    |
|   | :1    |          |
| Óxido de cromo  | 77288 | verde    |
| Óxido de cromo, hidratado                                 | 77278 | verde    |
| Pigment Blue 28, Pigment Green 14                         | 77346 | verde    |
| Pigment Metal 2   | 77400 | marrón   |
| Oro   | 77480 | marrón   |
| Óxidos e hidróxidos de hierro                             | 77489 | naranja  |
| Óxido de hierro   | 77491 | rojo     |
| Óxido de hierro hidratado                                 | 77492 | amarillo |
| Óxido de hierro   | 77499 | negro    |
| Mezclas de hexacianoferrato de hierro (II) y hierro (III) | 77510 | azul     |
| Pigment White 18  | 77713 | blanco   |
| Mangananimoniodifosfato                                   | 77742 | violeta  |
| Fosfato de manganeso, $Mn_3(PO_4)_2 \cdot 7 H_2O$         | 77745 | rojo     |
| Plata   | 77820 | blanco   |
| Dióxido de titanio y sus mezclas con mica                 | 77891 | blanco   |
| Óxido de cinc   | 77947 | blanco   |
| 6,7-Dimetil-9-(1'-D-ribitol)-isoaloxazina, lactoflavina   |       | amarillo |



(continuación)

| Denominación química u otra                    | CIN | Color   |
|--|-----|---------|
| Color caramelo                                 |     | marrón  |
| Capsantina, capsorrubina                       |     | naranja |
| Betanina                                       |     | rojo    |
| Sales de benzopirilio, antocianos              |     | rojo    |
| Estearato de aluminio, zinc, magnesio y calcio |     | blanco  |
| Azul de bromotimol                             |     | azul    |

Puede ser más favorable escoger como colorante una o varias de las sustancias del siguiente grupo:

5 2,4-dihidroxiazobenzol, 1-(2'-cloro-4'-nitro-1'fenilazo)-2-hidroxinaftalina, rojo Ceres, ácido 2-(4-sulfo-1-naftilazo)-1-naftol-4-sulfónico, sal de calcio del ácido 2-hidroxi-1,2'-azonaftalin-1'-sulfónico, sales de calcio y bario del ácido 1-(2-sulfo-4-metil-1-fenilazo)-2-naftilcarboxílico, sal de calcio del ácido 1-(2-sulfo-1-naftilazo)-2-hidroxinaftalin-3-carboxílico, sal de aluminio del ácido 1-(4-sulfo-1-fenilazo)-2-naftol-6-sulfónico, sal de aluminio del ácido 1-(4-sulfo-1-naftilazo)-2-naftol-3,6-disulfónico, ácido 1-(4-sulfo-1-naftilazo)-2-naftol-6,8-disulfónico, sal de aluminio del ácido 4-(4-sulfo-1-fenilazo)-2-(4-sulfofenil)-5-hidroxipirazolon-3-carboxílico, sales de aluminio y zirconio de 4,5-dibromofluoresceína, sales de aluminio y zirconio de 2,4,5,7-tetrabromofluoresceína, 3',4',5',6'-tetracloro-2,4,5,7-tetrabromofluoresceína y su sal de aluminio, sal de aluminio de la 2,4,5,7-tetrayodofluoresceína, sal de aluminio del ácido quinoftalon-disulfónico, sal de aluminio del ácido indigo-disulfónico, óxidos de hierro rojos y negros (CIN: 77 491 (rojo) y 77 499 (negro)), óxido de hierro hidratado (CIN: 77492), difosfato de manganeso-amonio y dióxido de titanio.

15 Más ventajosos son los colorantes naturales oleosolubles, como p.ej. extracto de pimienta,  $\beta$ -caroteno o cochinilla.

En el sentido de la presente invención son ventajosas otras cremas gel que contengan pigmentos con efectos. En particular, se prefieren los pigmentos con efectos de los tipos que aparecen en la siguiente lista:

1. Pigmentos naturales con efectos, como por ejemplo,  
a) "Fischsilber" (cristales mixtos de guanina/hipoxantina a partir de las escamas de peces) y

20 b) "Nácar" (caparazones de moluscos pulverizados)

2. Pigmentos monocristalinos con efectos, como p.ej. oxiclورو de bismuto (BiOCl)

3. Pigmentos de sustrato laminado: p.ej. mica / óxido metálico

25 La base de los pigmentos con efectos son, por ejemplo, pigmentos en forma de polvo o dispersiones de aceite de ricino de oxiclورو de bismuto y/o dióxido de titanio, así como oxiclورو de bismuto y/o dióxido de titanio sobre mica. Particularmente ventajoso es p.ej. el pigmento de brillo listado como CIN 77163.

Además, son ventajosos, por ejemplo, los siguientes tipos de pigmentos con efectos con bases de mica/óxido metálico:

| Grupo                                     | Distribución/espesor de capa                      | Color          |
|---|---|----------------|
| <b>Pigmentos con efectos blanco plata</b> | TiO <sub>2</sub> : 40-60 nm                       | plata          |
| <b>Pigmentos de interferencia</b>         | TiO <sub>2</sub> : 60-80 nm                       | amarillo       |
|   | TiO <sub>2</sub> : 80-100 nm                      | rojo           |
|   | TiO <sub>2</sub> : 100-140 nm                     | Azul           |
|   | TiO <sub>2</sub> : 120-160 nm                     | verde          |
| <b>Pigmentos de brillo de color</b>       | Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub>                    | bronce         |
|   | Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub>                    | cobre          |
|   | Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub>                    | rojo           |
|   | Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub>                    | violeta rojizo |
|   | Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub>                    | verde rojizo   |
|   | Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub>                    | negro          |
| <b>Pigmentos de combinación</b>           | TiO <sub>2</sub> / Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> | tonos dorados  |
|   | TiO <sub>2</sub> / Cr <sub>2</sub> O <sub>3</sub> | verde          |
|   | TiO <sub>2</sub> / azul de Prusia                 | azul oscuro    |

En particular se prefieren, por ejemplo, los pigmentos de brillo de perla comercializados por la empresa Merck bajo los nombres comerciales Timiron<sup>®</sup>, Colorona<sup>®</sup> o Dichrona<sup>®</sup>.

- 5 Es evidente que la lista de los pigmentos con efectos nombrados no debe ser limitante. En el sentido de la presente invención, los pigmentos con efectos ventajosos se pueden conseguir por vías numerosas y conocidas. Por ejemplo, se pueden recubrir también otros sustratos que no sean mica con otros óxidos metálicos, como p.ej. sílica y otros parecidos. Son ventajosas p.ej. las partículas de SiO<sub>2</sub> recubiertas con TiO<sub>2</sub> y Fe<sub>2</sub>O<sub>3</sub> ("Ronasphere") suministradas por la empresa Merck y que son adecuadas en particular para la reducción óptica de arrugas finas.
- 10 Además, puede ser una ventaja renunciar completamente a un sustrato como la mica. Se prefieren especialmente pigmentos con efectos que se preparan utilizando SiO<sub>2</sub>. Tales pigmentos, que además también pueden tener efectos goniocromáticos, se pueden obtener p.ej. bajo el nombre comercial Sicopearl Fantastico de la empresa BASF.
- 15 De forma ventajosa también pueden utilizarse los pigmentos de la empresa Engelhard que se basan en borosilicatos de calcio y sodio recubiertos de dióxido de titanio. Éstos se comercializan bajo el nombre Reflecks<sup>®</sup>. Presentan, además del color, un efecto de destello mediante su tamaño de partícula de 40-80 µm.
- 20 Particularmente ventajosos son también otros pigmentos con efectos que se comercializan bajo el nombre de Metasomes<sup>®</sup> Standard/Glitter en varios colores (amarillo, rojo, verde, azul) de la empresa Flora Tech. Las partículas destellantes se encuentran aquí mezcladas con varios colorantes y aditivos (como por ejemplo los colorantes con CIN 19140, 77007, 77289, 77491).
- 25 Los colorantes y los pigmentos pueden encontrarse solos o mezclados, así como recubiertos recíprocamente unos con otros, lo que en general provoca varios efectos de color mediante los diferentes espesores del recubrimiento. La cantidad global de colorantes y pigmentos colorantes se escoge de forma ventajosa del intervalo de p.ej. 0,1 hasta 30% en peso, preferentemente de 0,5 hasta 15% en peso, en particular de 1,0 hasta 10% en peso respecto al peso total de las preparaciones.
- Las preparaciones con protección frente la luz según la invención pueden contener evidentemente también uno o varios filtros de protección solar hidrófilos o lipófilos eficaces en el espectro UVA y/o UVB y/o en el espectro IR y/o VIS (absorbente). Estos filtros adicionales pueden seleccionarse en particular entre derivados de ácido cinámico, derivados de ácido salicílico, derivados de alcanfor, derivados de triazina, derivados de β,β-difenilacrilato, derivados

de ácido p-aminobenzoico, así como filtros poliméricos o filtros de silicona que se describen en la solicitud WO-93/04665. En la solicitud de patente EP-A0487404 se especifican otros ejemplos de filtros orgánicos.

En principio, todos los filtros UV entran en consideración para una combinación con protectores UV contenidos en los polvos según la invención. En especial, se prefieren los filtros UV cuya inocuidad fisiológica ya haya sido probada. En la literatura especializada existen muchas sustancias conocidas y probadas como filtros UVA y UVB, por ejemplo, derivados de bencilidenalcanfor como 3-(4'-metilbenciliden)-dl-alcanfor (p. ej.: Eusolex® 6300), 3-bencilidenalcanfor (p. ej.: Mexoryl® SD), polímeros de N-((2 y 4)-[(2-oxoborn-3-iliden)metil]bencil)-acrilamida (p. ej.: Mexoryl® SW), metilsulfato de N,N,N-trimetil-4-(2-oxoborn-3-ilidenmetil)anilinio (p. ej.: Mexoryl® SK) o ácido (2-oxoborn-3-iliden)toluol-4-sulfónico (p. ej.: Mexoryl® SL), metoxicinamatos como metoxicinamato de octilo (p. ej.: Eusolex® 2292), 4-metoxicinamato de isopentilo, p. ej. como mezcla de isómeros (p. ej. Neo Heliopan® E 1000), derivados de salicilato como 2-etilhexilsalicilato (p. ej.: Eusolex® OS), 4-isopropilbencilsalicilato (p. ej.: Megasol®) o 3,3,5-trimetilciclohexilsalicilato (p. ej.: Eusolex® HMS), ácido 4-aminobenzoico y derivados como ácido 4-aminobenzoico, 4-(dimetilamino)benzoato de 2-etilhexilo (p. ej.: Eusolex® 6007), 4-aminobenzoato de etilo etoxilado (p. ej.: Uvinul® P25), ácidos fenilbencimidazolsulfónicos, como ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico, así como sus sales de potasio, sodio y trietanolamina (p. ej.: Eusolex® 232), ácido 2,2-(1,4-fenilen)-bisbencimidazol-4,6-disulfónico o sus sales (p. ej.: Neoheliopan® AP) o ácido 2,2-(1,4-fenilen)-bisbencimidazol-6-sulfónico, y otras sustancias como

- 2-ciano-3,3-difenilacrilato de 2-etilhexilo (p.ej. Eusolex® OCR),
- ácido 3,3'-(1,4-fenilendimetilen)-bis-7,7-dimetil-2-oxobiciclo-[2.2.1]hept-1-ilmetanosulfónico así como sus sales (p.ej. Mexoryl® SX) y
- 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina (p.ej. Uvinul® T 150)
- 2-(4-dietilamino-2-hidroxi-benzoil)-benzoato de hexilo (p.ej. Uvinul®UVA Plus, empresa BASF).

Los compuestos que se exponen en la lista sólo se deben considerar como ejemplos. Evidentemente también se pueden utilizar otros filtros UV. En particular, también pueden combinarse de forma ventajosa filtros UV en forma de partícula, como se describen, por ejemplo, en la solicitud de patente WO 99/66896, con los polvos según la invención.

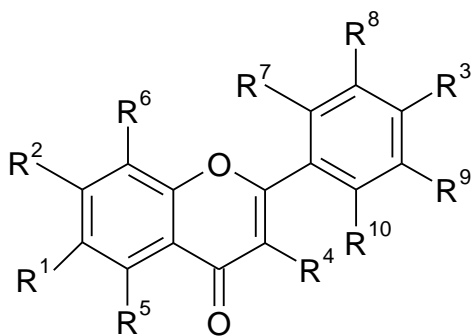
Normalmente estos filtros UV orgánicos se introducen en las formulaciones cosméticas en cantidades de 0,5 hasta 20 por ciento en peso, preferentemente de 1-10% en peso.

Otros filtros UV orgánicos adecuados son, por ejemplo,

- 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-(2-metil-3-(1,3,3,3-tetrametil-1-(trimetilsililoxi)disiloxanil)propil)fenol (p.ej. Silatrizole®),
- 4,4'-[(6-[4-((1,1-dimetiletil)aminocarbonil)fenilamino]-1,3,5-triazin-2,4-diil)diimino]bis(benzoato de 2-etilhexilo) (p.ej. Uvasorb® HEB),
- $\alpha$ -(trimetilsilil)- $\omega$ -[trimetilsilil]oxi]poli[oxi(dimetil) [y aprox. 6% metil[2-[p-[2,2-bis(etoxicarbonil)vinil]fenoxi]-1-metilenetil] y aprox. 1,5% metil[3-[p-[2,2-bis(etoxicarbonil)vinil]fenoxi]-propenil] y de 0,1 hasta 0,4% (metilhidrogen[sililil]] (n ≈ 60) (N° CAS: 207 574-74-1)
- 2,2'-metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)fenol) (N° CAS: 103 597-45-1)
- ácido 2,2'-(1,4-fenilen)bis-(1H-bencimidazol-4,6-disulfónico, sal monosódica) (N° CAS: 180 898-37-7) y
- 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxil]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (N° CAS: 103 597-45-, 187 393-00-6).
- 4,4'-[(6-[4-((1,1-dimetiletil)aminocarbonil)fenilamino]-1,3,5-triazin-2,4-diil)diimino]bis(benzoato de 2-etilhexilo) (p.ej. Uvasorb® HEB),

Los compuestos preferidos con propiedades de filtración de UV son 3-(4'-metilbenciliden)-dl-alcanfor, 1-(4-terc-butilfenil)-3-(4-metoxifenil)-propan-1,3-diona, 4-isopropildibenzoilmetano, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, metoxicinamato de octilo, 3,3,5-trimetil-ciclohexilsalicilato, 4-(dimetilamino)benzoato de 2-etilhexilo, 2-ciano-3,3-difenil-acrilato de 2-etilhexilo, ácido 2-fenil-bencimidazol-5-sulfónico, así como sus sales de potasio, sodio y trietanolamina.

Las preparaciones preferidas también pueden contener compuestos de fórmula I:



en la que  $R^1$  y  $R^2$  se seleccionan entre

- H
- y  $OR^{11}$ , donde  $OR^{11}$ , independientemente entre sí, representa

5 - OH

- grupos alquiloxi de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,
- grupos alqueniloxi de  $C_3$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,
- grupos hidroxialcoxi de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, donde el/los grupo(s) hidroxilo puede estar unidos a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena de alquilo también puede estar interrumpida por oxígeno, y/o

10 - grupos cicloalquiloxi de  $C_3$  hasta  $C_{10}$  y/o grupos cicloalqueniloxi de  $C_3$  hasta  $C_{12}$  donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos  $-(CH_2)_n-$  con  $n = 1$  a 3 y/o,

- restos mono- y/u oligoglicosílicos,

con la condición de que al menos un resto de entre  $R^1$  y  $R^2$  sea  $OR^{11}$ ,

15 y  $R^3$  sea un resto  $OR^{11}$  y

de  $R^4$  a  $R^7$  y  $R^{10}$  pueden ser iguales o distintos, e, independientemente entre sí, representan

- H
- grupos alquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,
- grupos alquenilo de  $C_3$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

20 - grupos hidroxialquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, donde el grupo hidroxilo puede estar unido a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena alquílica también puede estar interrumpida por oxígeno y/o

- grupos cicloalquilo de  $C_3$  hasta  $C_{10}$  y/o grupos cicloalquenilo de  $C_3$  hasta  $C_{12}$  donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos  $-(CH_2)_n-$  con  $n = 1$  a 3 y

25  $R^8$  y  $R^9$  pueden ser iguales o distintos, e, independientemente entre sí, representan

- H
- $OR^{11}$
- grupos alquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,
- grupos alquenilo de  $C_3$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

30 - grupos hidroxialquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, donde el grupo hidroxilo puede estar unido a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena alquílica también puede estar interrumpida por oxígeno y/o

- grupos cicloalquilo de  $C_3$  hasta  $C_{10}$  y/o grupos cicloalquenilo de  $C_3$  hasta  $C_{12}$  donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos  $-(CH_2)_n-$  con  $n = 1$  a 3.

Las ventajas de las composiciones según la invención incluyen en particular el efecto filtrante de la luz UV y la buena tolerancia dérmica. Además, los compuestos de fórmula I descritos aquí son incoloros o con coloración débil y no confieren, a diferencia de muchos flavonoides que existen en la naturaleza, coloración a las preparaciones.

5 Bajo los flavonoides de fórmula I para su uso según la invención se incluyen filtros UV de amplio espectro, otros compuestos de fórmula I igualmente preferidos muestran un máximo de absorción en el límite entre la radiación UVB y UVA. Por eso, como filtros UVA-II complementan preferentemente el espectro de absorción de los filtros comerciales UVB-I o UVA-I. Las preparaciones preferidas según la invención con propiedades de protección frente la luz contienen al menos un compuesto de fórmula I, donde R<sup>3</sup> representa

- OH o

10 - grupos alcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi o

- restos mono- y/u oligoglicosílicos, preferentemente restos glicosílicos y

R<sup>1</sup> y/o R<sup>2</sup> representan preferentemente

- OH o

- grupos alcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi o

15 - restos mono- y/u oligoglicosílicos, preferentemente restos glicosílicos.

Estos compuestos preferidos destacan por una absorción UV especialmente intensa.

Además, estos compuestos preferidos tienen ventajas en la introducción en las preparaciones:

- los restos mono- y/o oligoglicosílicos mejoran la solubilidad en agua de los compuestos a emplear según la invención;

20 - los grupos alcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, en particular las funciones alcoxi de cadena larga, como los grupos etilhexiloxi, aumentan la solubilidad en aceite de los compuestos;

es decir, mediante la elección adecuada de los sustituyentes se puede controlar la hidrofilia o lipofilia de los compuestos según la fórmula I. Los restos mono- u oligosacáridos preferidos son en este caso restos hexosilo, en particular restos ramosilo y restos glucosilo. Pero también otros restos hexosilo, por ejemplo, alosilo, altrosilo, galactosilo, gulosilo, idosilo, manosilo y talosilo, son, dado el caso, ventajosos de utilizar. También puede ser ventajoso utilizar restos pentosilo. Los restos glicosílicos pueden estar enlazados con el cuerpo principal α- o β-glucosídicamente. Un disacárido preferido es, por ejemplo, el 6-O-(6-desoxi-α-L-manopiranosil)-β-D-glucopiranosido.

30 Se ha demostrado que la intensidad de absorción UV es especialmente elevada cuando R<sup>3</sup> representa grupos alcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi, y R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> son iguales y representan H o grupos alcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi.

35 Por eso, se prefieren en especial según la invención preparaciones con propiedades de protección frente la luz que contienen al menos un compuesto de fórmula I caracterizado porque el resto R<sup>3</sup> representa grupos alcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi, y R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> son iguales y representan H o grupos alcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, preferentemente metoxi, etoxi o etilhexiloxi. En particular, en este caso se prefiere que R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representen H.

40 Los compuestos de fórmula I se utilizan según la invención típicamente en cantidades de 0,01 hasta 20% en peso, preferentemente en cantidades de 0,5 hasta 10% en peso y particularmente se prefieren cantidades de 1 hasta 8% en peso. Así, las cantidades correspondientes que se deben escoger según el factor de protección frente la luz previsto de la preparación no ofrecen dificultad alguna al especialista en la materia.

45 Mediante la combinación de uno o varios protectores UV en forma de nanopartícula en los polvos según la invención con otros filtros UV puede optimizarse el efecto protector contra los efectos perjudiciales de la radiación UV. Las composiciones optimizadas pueden contener, por ejemplo, la combinación de los filtros UV orgánicos 4'-metoxi-6-hidroxi-flavona con 1-(4-terc-butilfenil)-3-(4-metoxifenil)propan-1,3-diona y 3-(4'-metilbenciliden)-dl-alcanfor.

50 Todos los filtros UV mencionados, incluidos los compuestos de fórmula I, también pueden utilizarse en forma encapsulada. En particular es ventajoso utilizar los filtros UV orgánicos en forma encapsulada. Ya se han mencionado de antemano ejemplos de encapsulamiento en la descripción de los filtros UV en forma de polvo según la invención. Además, estas cápsulas pueden someterse a un tratamiento posterior, es decir se hidrofobiza o hidrofilita la superficie de la partícula. Ya se han mencionado ejemplos de este tipo de tratamiento posterior superficial.

Si las preparaciones según la invención presentan compuestos según la fórmula I con grupos hidroxilo libres, aparte de las propiedades descritas, muestran un efecto adicional como antioxidantes y/o captadores de radicales. Además, se prefieren preparaciones con propiedades de protección frente a la luz que contienen al menos un compuesto de fórmula I, caracterizadas porque al menos uno de los restos de R<sup>1</sup> a R<sup>3</sup> representa OH, siendo preferentemente al menos uno de los restos R<sup>1</sup> o R<sup>2</sup> OH.

Para que los compuestos de fórmula I puedan desarrollar especialmente bien su efecto positivo como captadores de radicales sobre la piel, puede ser ventajoso que los compuestos de fórmula I penetren en las capas profundas de la piel. Para ello existen varias posibilidades. Por un lado, los compuestos de fórmula I pueden presentar una lipofilia suficiente para poder penetrar en las capas epidérmicas a través de la capa dérmica externa. Otra posibilidad es que en la preparación también pueden preverse los correspondientes medios de transporte, por ejemplo liposomas, que permitan el transporte de los compuestos de fórmula I a través de las capas dérmicas externas. Por último, también puede pensarse en un transporte sistémico de los compuestos de fórmula I. Entonces, por ejemplo, la preparación se elabora de forma que sea adecuada para una administración oral.

En general, las sustancias de fórmula I actúan de captadores de radicales. Estos radicales no sólo se producen mediante la luz solar, sino que se forman en distintas condiciones.

Por ejemplo, anoxia que bloquea el flujo de electrones antes de las citocromoxidasas y produce la formación de iones radicalarios de superóxido; inflamaciones que van acompañadas, entre otras, de la formación de iones de superóxido mediante la NADPH-oxidasa de membrana de los leucocitos, pero que también van acompañadas de la formación (a través de la desproporción en presencia de iones de hierro (III)) de radicales hidroxilo y otras especies reactivas que normalmente participan en el fenómeno de una fagocitosis; así como autooxidación de lípidos que en general se inicia mediante un radical hidroxilo y genera radicales alcoxi e hidroperóxido lipídicos.

Se supone que los compuestos de fórmula I preferidos también actúan de inhibidores de enzimas. Supuestamente inhiben histidind Descarboxilasas, proteína cinasas, elastasas, aldosa reductasas así como hialuronidasas, y, por tanto, permiten mantener completamente la integridad de la sustancia fundamental de las cubiertas vasculares. Además, supuestamente no inhiben específicamente las catecol-O-metiltransferasas, con lo que aumenta la cantidad de catecolaminas disponibles y con ello la estabilidad de los vasos. Además, inhiben AMP-fosfodiesterasas, con lo que las sustancias presentan un potencial de inhibición de la agregación de trombocitos.

Debido a estas propiedades, las preparaciones según la invención son adecuadas, en general, para la inmunoprotección y para la protección del ADN y del ARN. En particular las preparaciones son adecuadas al mismo tiempo para la protección del ADN y ARN ante ataques oxidativos, ante radicales y ante daños por radiación, en particular radiación UV. Otra ventaja de las preparaciones según la invención es la protección celular, en particular la protección de células de Langerhans ante daños mediante los efectos previamente mencionados. Todas estas aplicaciones o el uso de los compuestos de fórmula I para la elaboración de preparaciones correspondientes que se pueden emplear también son explícitamente objeto de la presente invención.

En particular las preparaciones preferidas según la invención también son adecuadas para el tratamiento de enfermedades dérmicas que están relacionadas con una alteración de la queratinización, que afecta a la diferenciación y proliferación celular, en particular para el tratamiento del acné vulgar, el acné comedoniano, el acné polimorfo, el acné rosácea, el acné nodular, el acné conglobata, el acné relacionado con la edad, el acné que se presenta como efecto secundario, como el acné solar, el acné relacionado con medicamentos o el acné profesional, el tratamiento de otros daños de la queratinización, en particular la ictiosis, estados en forma de ictiosis, la enfermedad de Darier, la queratosis palmoplantar, la leucoplasia, estados en forma de leucoplasia, los herpes dérmicos y de mucosas (bucal) (liquen), para el tratamiento de otras enfermedades dérmicas que están relacionadas con una alteración de la queratinización y tienen un componente inflamatorio y/o inmunoalérgico y en particular todas las formas de psoriasis que afectan a la piel, las mucosas y los dedos de las manos y los pies, y de reuma psoriático y de dermatofia, como eccemas o atrofia respiratorias o también la hipertrofia de las encías, pudiéndose utilizar los compuestos también en algunas inflamaciones que no están relacionadas con una alteración de la queratinización, para el tratamiento de excrecencias benignas o malignas de la dermis o la epidermis que dado el caso son de origen vírico, como verruga vulgar, verruga plana, epidermodisplasia verruciforme, papilomatosis oral, papilomatosis florida, y las excrecencias que pueden provocarse por radiación UV, en particular el epiteloma basocelular y el epiteloma espinocelular, para el tratamiento de otras enfermedades dérmicas, como la dermatitis bullosa y las enfermedades que afectan al colágeno, para el tratamiento de determinadas enfermedades oculares, en particular enfermedades de la córnea, para la eliminación o lucha contra el envejecimiento dérmico relacionado con la luz y con el envejecimiento, para la disminución de las pigmentaciones y la queratosis actínica y para el tratamiento de todas las enfermedades relacionadas con el envejecimiento normal o el envejecimiento relacionado con la luz, para la prevención o la curación de heridas/cicatrices de las atrofia de la epidermis y/o dermis provocadas por corticosteroides utilizados local o sistémicamente y todos los demás tipos de dermatofias, para la prevención o el tratamiento de alteraciones de la curación de heridas, para la prevención o eliminación de estrías por embarazo o también para la promoción de la curación de heridas, para el tratamiento de alteraciones de la producción de sebo, como hiperseborrea en acné o la seborrea simple, para el tratamiento o la prevención de estados cancerosos, en particular la leucemia promielocítica, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias, como artritis, para el tratamiento de todas las enfermedades de la piel u otras zonas del cuerpo relacionadas con virus, para la prevención o el tratamiento de la alopecia, para el tratamiento de enfermedades

dérmicas o enfermedades de otras partes del cuerpo con un componente inmunológico, para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares, como arteriosclerosis o hipertensión arterial, así como la diabetes insulino dependiente, para el tratamiento de problemas dérmicos producidos por radiación UV.

5 El efecto protector de las preparaciones según la invención frente el estrés oxidativo o frente la acción de radicales también puede mejorarse si las preparaciones contienen uno o varios antioxidantes, en la que la selección de antioxidantes adecuados con un efecto rápido o retrasado no ofrece dificultad alguna al especialista en la materia.

10 Una forma de realización preferida de la presente invención para la preparación trata, por tanto, de una preparación para proteger las células corporales contra el estrés oxidativo, en particular para reducir el envejecimiento cutáneo, que se caracteriza porque además de contener uno o varios compuestos de fórmula I también contiene uno o varios antioxidantes.

15 Existen muchas sustancias probadas y conocidas a partir de la bibliografía especializada que pueden utilizarse como antioxidantes, p.ej. aminoácidos (p.ej. glicina, histidina, tirosina, triptófano) y sus derivados, imidazoles (p.ej. ácido urocánico) y sus derivados, péptidos como D,L-carnosina, D-carnosina, L-carnosina y sus derivados (p.ej. anserina), carotenoides, carotenos (p.ej.  $\alpha$ -caroteno,  $\beta$ -caroteno, licopina) y sus derivados, ácido clorogénico y sus derivados, ácido lipoico y sus derivados (p.ej. ácido dihidrolipoico), aurotioglucosa, propiltiouracilo y otros tioles (p.ej. tiorredoxina, glutatión, cisteína, cistamina y sus ésteres glicosílicos, N-acetilílicos, metílicos, etílicos, propílicos, amílicos, butílicos y laurílicos, palmitoílicos, oleílicos,  $\gamma$ -linoleílicos, colesterílicos y glicerílicos) así como sus sales, dilauriltiodipropionato, diesteariltiodipropionato, ácido tioidipropiónico y sus derivados (ésteres, éteres, péptidos, lípidos, nucleótidos, nucleósidos y sales) así como compuestos de sulfoximina (p.ej. butioninsulfoximina, homocisteinsulfoximina, butioninsulfona, penta-, hexa-, heptationinsulfoximina) en dosis tolerables muy bajas (p.ej. de pmol hasta  $\mu\text{mol/kg}$ ), además de (metal-)quelantes (p.ej. ácidos  $\alpha$ -hidroxigrasos, ácido palmítico, ácido fitínico, lactoferrina),  $\alpha$ -hidroxiácidos (p.ej. ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico), ácido húmico, ácido biliar, extracto biliar, bilirrubina, biliverdina, EDTA, EGTA y sus derivados, ácidos grasos insaturados y sus derivados, vitamina C y derivados (p.ej. ascorbilpalmitato, ascorbilfosfato de magnesio, ascorbilacetato), tocoferol y derivados (p.ej. acetato de vitamina E), vitamina A y derivados (p.ej. palmitato de vitamina A) así como el benzoato de coniferilo de benjuí, ácido rutínico y sus derivados,  $\alpha$ -glicosilrutina, ácido ferúlico, furfúridenglucitol, carnosina, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, ácido nordohidroguajárico, tri-hidroxibutirofenona, quercitina, ácido úrico y sus derivados, manosa y sus derivados, zinc y sus derivados (p.ej. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>), selenio y sus derivados (p.ej. selenmetionina), estilbeno y sus derivados (p.ej. óxido de estilbeno, óxido de trans-estilbeno).

20 30 Asimismo las mezclas de antioxidantes son adecuadas para su uso en preparaciones cosméticas según la invención. Las mezclas conocidas y comerciales son, por ejemplo, mezclas que contienen como componentes activos lecitina, L-(+)-ascorbilpalmitato y ácido cítrico (p.ej. Oxynex<sup>®</sup> AP), tocoferoles naturales, L-(+)-ascorbilpalmitato, ácido L-(+)-ascórbico y ácido cítrico (p. ej. Oxynex<sup>®</sup> K LIQUID), extractos de tocoferol de fuentes naturales, L-(+)-ascorbilpalmitato, ácido L-(+)-ascórbico y ácido cítrico (p. ej. Oxynex<sup>®</sup> L LIQUID), DL- $\alpha$ -tocoferol, L-(+)-ascorbilpalmitato, ácido cítrico y lecitina (p. ej. Oxynex<sup>®</sup> LM) o butilhidroxitolueno (BHT), L-(+)-ascorbilpalmitato y ácido cítrico (p. ej. Oxynex<sup>®</sup> 2004). Los antioxidantes de este tipo se suelen utilizar con compuestos de fórmula I en dichas preparaciones, generalmente en proporciones en el intervalo de 1000:1 hasta 1:1000, preferentemente en cantidades de 100:1 hasta 1:100.

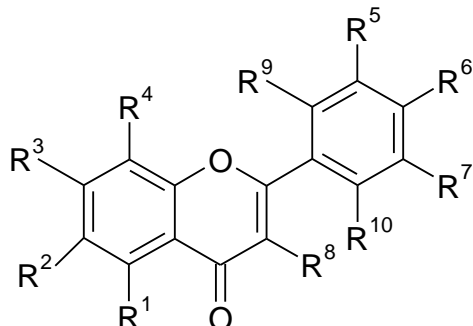
35 40 Las preparaciones según la invención pueden contener vitaminas como ingredientes adicionales. Las preparaciones cosméticas según la invención contienen preferentemente vitaminas y derivados de vitaminas escogidos entre vitamina A, propionato de vitamina A, palmitato de vitamina A, acetato de vitamina A, retinol, vitamina B, clorhidrato de tiamina (vitamina B<sub>1</sub>), riboflavina (vitamina B<sub>2</sub>), amida del ácido nicotínico, vitamina C (ácido ascórbico), vitamina D, ergocalciferol (vitamina D<sub>2</sub>), vitamina E, DL- $\alpha$ -tocoferol, acetato de tocoferol E, hidrogenosuccinato de tocoferol, vitamina K<sub>1</sub>, esculina (principio activo de la vitamina P), tiamina (vitamina B<sub>1</sub>), ácido nicotínico (niacina), piridoxina, piridoxal, piridoxamina, (vitamina B<sub>6</sub>), ácido pantoténico, biotina, ácido fólico y cobalamina (vitamina B<sub>12</sub>), en particular se prefieren palmitato de vitamina A, vitamina C y sus derivados, DL- $\alpha$ -tocoferol, acetato de tocoferol E, ácido nicotínico, ácido pantoténico y biotina. Así, las vitaminas se suelen utilizar con compuestos de fórmula I en proporciones en el intervalo de 1000:1 hasta 1:1000, preferentemente en cantidades de 100:1 hasta 1:100.

45 50 Entre los fenoles con efecto antioxidante, los polifenoles que provienen en parte de materias naturales son especialmente interesantes para su uso en el sector alimentario, cosmético o farmacéutico. Por ejemplo, los flavonoides o bioflavonoides, que se conocen principalmente como colorantes vegetales, a menudo tienen un potencial antioxidante. K. Lemanska, H. Szymusiak, B. Tyrakowska, R. Zielinski, I.M.C.M. Rietjens; Current Topics in Biophysics 2000, 24(2), 101-108, trabajan con efectos del patrón de sustitución de mono- y dihidroxiflavonas. Así, se ha observado que las dihidroxiflavonas con un grupo OH vecino a una función ceto o grupos OH en posición 3',4' o 6,7 o 7,8 presentan propiedades antioxidantes, mientras que otras mono- y dihidroxiflavonas no presentan en parte propiedades antioxidantes.

55 60 A menudo se menciona la quercetina (cianidanol, cyanidenolon 1522, meletina, soforetina, ericina, 3,3',4',5,7-pentahidroxiflavona) como un antioxidante especialmente efectivo (p. ej. C.A. Rice-Evans, N.J. Miller, G. Paganga, Trends in Plant Science 1997, 2(4), 152-159). K. Lemanska, H. Szymusiak, B. Tyrakowska, R. Zielinski, A.E.M.F.

Soffers, I.M.C.M. Rietjens; Free Radical Biology&Medicine 2001, 31(7), 869-881 investigan la dependencia del pH del efecto antioxidante de las hidroxiflavonas. En todo el intervalo de pH, la quercetina muestra la mayor actividad entre las estructuras investigadas.

Antioxidantes adecuados son además compuestos de fórmula II



II

- 5 donde R<sup>1</sup> hasta R<sup>10</sup> pueden ser iguales o diferentes y se escogen de entre
- H
  - OR<sup>11</sup>
  - grupos alquilo de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada,
  - grupos alquenoilo de C<sub>3</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada,
- 10 - grupos hidroxialquilo de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, donde el grupo hidroxilo puede estar unido a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena alquílica también puede estar interrumpida por oxígeno y/o
- grupos cicloalquilo de C<sub>3</sub> hasta C<sub>10</sub> y/o grupos cicloalquenoilo de C<sub>3</sub> hasta C<sub>12</sub> donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>- con n = 1 a 3,
- 15 - donde todos los OR<sup>11</sup> representan, independientemente entre sí,
- OH
  - grupos alquiloxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada,
  - grupos alquenoiloxi de C<sub>3</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada,
- 20 - grupos hidroxialcoxi de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, donde el/los grupo(s) hidroxilo puede estar unidos a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena de alquilo también puede estar interrumpida por oxígeno, y/o
- grupos cicloalquiloxi de C<sub>3</sub> hasta C<sub>10</sub> y/o grupos cicloalquenoiloxi de C<sub>3</sub> hasta C<sub>12</sub> donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>- con n = 1 a 3 y/o,
  - restos mono- y/u oligoglicosílicos,
- 25 con la condición de que como mínimo 4 restos desde R<sup>1</sup> hasta R<sup>7</sup> sean OH y que en la molécula haya como mínimo dos pares de grupos OH vecinos,
- o R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representen OH y los restos R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>7-10</sup> representen H,
- como se describen en la antigua solicitud de patente alemana DE 10244282,7.

- 30 Las ventajas de las preparaciones según la invención que contienen al menos un antioxidante son en particular, aparte de las ventajas mencionadas previamente, el efecto antioxidante y la buena tolerancia dérmica. Además, se prefieren los compuestos aquí descritos incoloros o con coloración débil y que no confieren, o sólo de forma muy tenue, coloración a las preparaciones. En particular, es una ventaja el perfil de eficacia especial de los compuestos de fórmula II, el cual muestra una elevada capacidad (EC<sub>50</sub>) de captura de radicales en el ensayo de DPPH, una acción retrasada en el tiempo (T<sub>EC50</sub> > 120 min) y por tanto una eficacia antirradicalaria (AE) de media a elevada.
- 35 Además, los compuestos según la fórmula II reúnen en la molécula propiedades antioxidantes con absorción UV en el intervalo UVA y/o UVB. Por eso, también se prefieren preparaciones que contienen al menos un compuesto de fórmula II caracterizados porque el menos dos restos vecinos de los restos R<sup>1</sup> hasta R<sup>4</sup> representan OH y al menos



dos restos vecinos de los restos  $R^5$  hasta  $R^7$  representan OH. Las preparaciones particularmente preferidas contienen al menos un compuesto de fórmula II caracterizado porque al menos tres restos vecinos de los restos  $R^1$  hasta  $R^4$  representan OH, donde preferentemente los restos  $R^1$  hasta  $R^3$  representan OH.

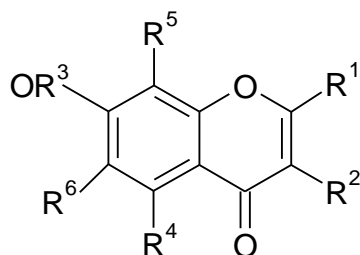
5 Como derivados de flavona, se entienden flavonoides según la invención y cumaranonas. Según la invención, como flavonoides se interpreta los glicósidos de flavanonas, flavonas, 3-hidroxi flavonas (= flavonolas), auronas, isoflavonas y rotenoides [Römpf Chemie Lexikon, tomo 9, 1993]. En el marco de la presente invención, no obstante, aquí también se incluyen las agliconas, es decir, los componentes no glucídicos, y los derivados de los flavonoides y las agliconas. Además, en el marco de la presente invención, el concepto flavonoide también incluye antocianidina (cianidina). En el marco de la presente invención, con cumaranonas también se entienden sus derivados.

Los flavonoides preferidos derivan de flavanonas, flavonas 3-hidroxi flavonas, auronas e isoflavonas, en particular de flavanonas, flavonas, 3-hidroxi flavonas y auronas.

15 Los flavonoides se seleccionan preferentemente entre los siguientes compuestos: 4,6,3',4'-tetrahidroxiaurona, quercetina, rutina, isoquercetina, eriodictiol, taxifolina, luteolina, trishidroxietilquercetina (troxequercetina), trishidroxietilrutina (troxerutina), trishidroxietilisoquercetina (troxeisoquercetina), trishidroxietilluteolina (troxeluteolina),  $\alpha$ -glicosilrutina, tilirosida así como sus sulfatos y fosfatos. Entre los flavonoides, se prefiere en particular como principios activos según la invención rutina, tilirosida,  $\alpha$ -glicosilrutina y troxerutina.

Entre las cumaranonas se prefiere 4,6,3',4'-tetrahidroxibencilcumaranona-3.

20 Como derivados de cromona se entiende preferentemente determinados derivados de 2-cromona que actúan de principios activos para el tratamiento preventivo de la piel humana y el pelo humano frente procesos de envejecimiento e influencias ambientales perjudiciales. Al mismo tiempo muestran un bajo potencial de irritación de la piel, influyen positivamente en la fijación del agua en la piel, mantienen o aumentan la elasticidad de la piel y con ello promueven el alisamiento de la piel. Estos compuestos corresponden preferentemente a la fórmula III



III

donde

25  $R^1$  y  $R^2$  pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre

- H,  $-C(=O)-R^7$ ,  $-C(=O)-OR^7$ ,

- grupos alquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

30 - grupos alquenoilo de  $C_3$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, grupos hidroxialquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  donde el grupo hidroxilo puede estar unido a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena de alquilo también puede estar interrumpida por oxígeno, y/o

- grupos cicloalquilo de  $C_3$  hasta  $C_{10}$  y/o grupos cicloalquenoilo de  $C_3$  hasta  $C_{12}$  donde los anillos, a su vez, también pueden presentar un puente mediante grupos  $-(CH_2)_n-$  con  $n = 1$  a 3,

$R^3$  representa H o grupos alquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

$R^4$  representa H u  $OR^8$ ,

35  $R^5$  y  $R^6$  pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre

- -H, -OH,

- grupos alquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

- grupos alquenoilo de  $C_3$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada,

40 - grupos hidroxialquilo de  $C_1$  hasta  $C_{20}$  de cadena lineal o ramificada, donde el grupo hidroxilo puede estar unido a un átomo de carbono primario o secundario de la cadena y además la cadena alquilo también puede estar interrumpida por oxígeno y

R<sup>7</sup> representa H, grupos alquilo de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada, un compuesto polihidroxi, como preferentemente un resto de ácido ascórbico o un resto glicosídico y

R<sup>8</sup> representa H o grupos alquilo de C<sub>1</sub> hasta C<sub>20</sub> de cadena lineal o ramificada,

5 donde al menos 2 de los sustituyentes R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>6</sup> son distintos de H o al menos un sustituyente de R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representa -C(=O)-R<sup>7</sup> o -C(=O)-OR<sup>7</sup>.

La proporción de uno o varios compuestos seleccionados entre flavonoides, derivados de cromona y cumaranonas en las preparaciones según la invención se encuentra preferentemente entre 0,001 y 5% en peso, con especial preferencia entre 0,01 y 2% en peso respecto a la preparación total.

10 Además, las preparaciones según la invención con propiedades de protección frente la luz pueden contener otros principios activos tradicionales que embellecen o cuidan la piel. Éstos pueden ser, en principio, todos los principios activos conocidos por el especialista.

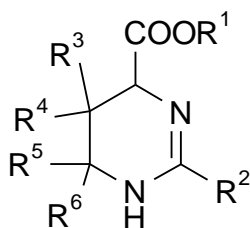
Los principios activos especialmente preferidos son ácidos pirimidincarboxílicos y/o ariloximas.

15 Los ácidos pirimidincarboxílicos se encuentran en microorganismos halófilos y participan en la regulación osmótica de estos organismos (*E. A. Galinski y col., Eur. J. Biochem., 149 (1985) páginas 135-139*). Además, entre los ácidos pirimidincarboxílicos se deben mencionar en especial la ectoína (ácido (S)-1,4,5,6-tetrahidro-2-metil-4-pirimidincarboxílico) y la hidroxiectoína (ácido (S,S)-1,4,5,6-tetrahidro-5-hidroxi-2-metil-4-pirimidincarboxílico) y sus derivados. Estos compuestos estabilizan enzimas y otras biomoléculas en soluciones acuosas y disolventes orgánicos. Además, estabilizan en particular enzimas en condiciones desnaturalizantes, como sales, valores de pH extremos, tensioactivos, urea, cloruro de guanidinio y otros compuestos.

20 La ectoína y los derivados de ectoína, como la hidroxiectoína, pueden utilizarse de forma ventajosa en medicamentos. En particular puede utilizarse la hidroxiectoína para la preparación de un medicamento para el tratamiento de enfermedades dérmicas. Otras áreas de aplicación de la hidroxiectoína y otros derivados de ectoína son normalmente áreas en las que se utiliza p.ej. trealosa como aditivo. Así, los derivados de ectoína, como la hidroxiectoína, pueden utilizarse como protectores en células secas de bacterias y levaduras. También los productos farmacéuticos, como péptidos y proteínas no glicolizados farmacéuticamente eficaces, p.ej. t-PA, pueden protegerse con ectoína o sus derivados.

25 Entre las aplicaciones cosméticas, debe nombrarse en particular el uso de la ectoína y los derivados de ectoína para el cuidado de la piel envejecida, seca o irritada. Así, en particular en la solicitud de patente europea EP-A-0 671 161, se describe que la ectoína y la hidroxiectoína se utilizan en preparaciones cosméticas como polvos, jabones, productos de limpieza con tensioactivos, lápices de labios, coloretes, maquillajes, cremas emolientes y preparados protectores del sol.

30 Además, se utiliza preferentemente un ácido pirimidincarboxílico según la fórmula IV que se presenta a continuación,



IV

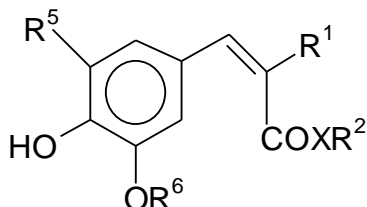
35 donde R<sup>1</sup> es un resto H o alquilo C<sub>1-8</sub>, R<sup>2</sup> un resto H o alquilo C<sub>1-4</sub> y R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> así como R<sup>6</sup> son, independientemente entre sí, un resto del grupo H, OH, NH<sub>2</sub> y alquilo C<sub>1-4</sub>. Preferentemente se utilizan ácidos pirimidincarboxílicos en los que R<sup>2</sup> es un grupo metilo o etilo y R<sup>1</sup> o R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> son H. En particular es preferible utilizar los ácidos pirimidincarboxílicos ectoína (ácido (S)-1,4,5,6-tetrahidro-2-metil-4-pirimidincarboxílico) e hidroxiectoína (ácido (S, S)-1,4,5,6-tetrahidro-5-hidroxi-2-metil-4-pirimidincarboxílico). Así, las preparaciones según la invención  
40 contienen ácidos pirimidincarboxílicos de este tipo, preferentemente en cantidades de hasta 15% en peso.

Entre las ariloximas preferentemente se utiliza la 2-hidroxi-5-metillaurofenonoxima, que también se conoce como HMLO, LPO o F5. Su idoneidad para el uso en cosméticos se conoce, por ejemplo, a partir de la publicación para información de solicitud de patente alemana DE-A-41 16 123. Las preparaciones que contienen 2-hidroxi-5-metillaurofenonoxima son adecuadas, por lo tanto, para el tratamiento de enfermedades dérmicas que van  
45 acompañadas de inflamaciones. Es conocido que las preparaciones de este tipo pueden utilizarse, por ejemplo, para la terapia de la psoriasis, diferentes formas de eccema, dermatitis irritante y tóxica, dermatitis por UV, así como otras enfermedades alérgicas y/o inflamatorias de la piel y los apéndices dérmicos. Las preparaciones según la invención que contienen ariloximas, preferentemente 2-hidroxi-5-metillaurofenonoxima, muestran una capacidad

antiinflamatoria sorprendente. Así, las preparaciones contienen preferentemente de 0,01 hasta 10% en peso de ariloxima, prefiriéndose en particular que la preparación contenga de 0,05 hasta 5% en peso de ariloxima.

Todos los compuestos o componentes aquí descritos que pueden utilizarse en las preparaciones o bien son conocidos y se pueden comprar o bien se pueden sintetizar según procedimientos conocidos.

- 5 Aparte de los compuestos aquí descritos, las preparaciones según la invención también pueden contener al menos un fotoestabilizador, preferentemente correspondiente a la fórmula V



V,

donde

R<sup>1</sup> se elige del grupo -C(O)CH<sub>3</sub>, -CO<sub>2</sub>R<sup>3</sup>, -C(O)NH<sub>2</sub> y -C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>,

- 10 X es O o NH;

R<sup>2</sup> representa un resto alquilo C<sub>1-30</sub> lineal o ramificado;

R<sup>3</sup> representa un resto alquilo C<sub>1-20</sub> lineal o ramificado;

todos los R<sup>4</sup> representan, independientemente entre sí, H o restos alquilo C<sub>1-8</sub> lineares o ramificados

R<sup>5</sup> representa H, un resto alquilo C<sub>1-8</sub> lineal o ramificado o un resto alquilo -O-C<sub>1-8</sub> lineal o ramificado y

- 15 R<sup>6</sup> representa un resto alquilo C<sub>1-8</sub>,

donde el fotoestabilizador especialmente preferido es 2-(4-hidroxi-3,5-dimetoxi-benciliden)-malonato de bis-(2-etilhexilo). Los fotoestabilizadores correspondientes, su elaboración y aplicación, se describen en la solicitud de patente internacional WO 03/007906, cuya revelación también se incluye explícitamente al objeto de la presente solicitud.

- 20 Las preparaciones según la invención pueden elaborarse según los procedimientos bien conocidos por el especialista, en particular según procedimientos que sirven para la elaboración de emulsiones aceite-en-agua o emulsiones agua-en-aceite.

- 25 Otros objetos de la presente invención son preparaciones con propiedades de protección frente la luz que contienen filtros UV en forma de polvo según la invención y uno o varios vehículos cosmética o dermatológicamente adecuados, un procedimiento para la elaboración de una preparación, el cual se caracteriza porque al menos se mezcla un polvo según la invención con un vehículo cosmética o dermatológicamente adecuado, y el uso de los filtros en forma de polvo según la invención para la elaboración de una preparación con propiedades de protección frente la luz.

- 30 Estas composiciones pueden presentarse en particular en forma de emulsiones sencillas o complicadas (O/W, W/O, O/W/O o W/O/W), como cremas, leches, geles o cremas gel, polvos y barras sólidas y, dado el caso, pueden prepararse como aerosoles y presentarse en forma de espumas o sprays. Preferentemente, estas composiciones se presentan en forma de una emulsión O/W.

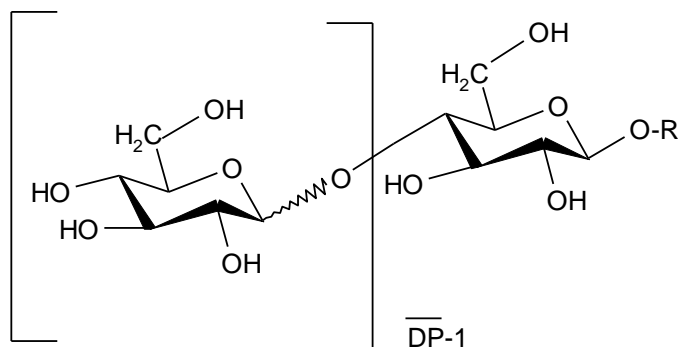
Las composiciones cosméticas según la invención pueden utilizarse como preparaciones para la protección de la epidermis o el pelo humanos frente la radicación UV, como protector solar o maquillaje.

- 35 Se debe indicar que en las formulaciones según la invención para la protección solar que presentan un vehículo del tipo de una emulsión aceite-en-agua, la fase acuosa (que en particular contiene el filtro hidrófilo) constituye en general de 50 hasta 90% en peso, y preferentemente de 70 hasta 90% en peso respecto a la formulación total, la fase oleosa (que en particular contiene el filtro lipófilo) de 5 hasta 50% en peso y preferentemente de 10 hasta 30% en peso respecto a la formulación total y el (co)emulsionante o los (co)emulsionantes de 0,5 hasta 20% y preferentemente de 2 hasta 10% en peso respecto a la formulación total.

- 40 Son adecuadas las preparaciones para uso externo, por ejemplo como crema, loción, gel o como disolución que se puede pulverizar sobre la piel. Para un uso interno son adecuadas formas de administración como cápsulas, grageas, polvos, disoluciones de comprimidos o disoluciones.

- 5 Como modo de aplicación de las preparaciones según la invención se mencionan p.ej.: disoluciones, suspensiones, emulsiones, emulsiones PIT, pastas, pomadas, geles, cremas, lociones, polvos, jabones, preparados de limpieza con tensioactivos, aceites, aerosoles y sprays. Otros modos de aplicación son p.ej. barras, champús y geles de ducha. En la preparación se puede añadir cualquier vehículo, coadyuvante y, dado el caso, otros principios activos convencionales.
- Los aditivos preferidos provienen del grupo de conservantes, antioxidantes, estabilizantes, solubilizantes, vitaminas, colorantes y aromatizantes.
- 10 Las pomadas, pastas, cremas y geles pueden contener vehículos convencionales, p.ej. grasas animales y vegetales, ceras, parafinas, almidón, tragacanto, derivados de celulosa, polietilenglicoles, silicona, bentonita, ácido silícico, talco y óxido de cinc o mezclas de estas sustancias.
- Los polvos y sprays pueden contener los vehículos convencionales, p. ej. lactosa, talco, ácido silícico, hidróxido de aluminio, silicato de calcio y polvo de poliamida o mezclas de estas sustancias. Además, los sprays pueden contener los propulsores convencionales, p. ej. clorofluorocarbonos, propano/butano o éter dimetilico.
- 15 Las disoluciones y emulsiones pueden contener los vehículos convencionales, como disolventes, solubilizantes y emulsionantes, p. ej. agua, etanol, isopropanol, carbonato de etilo, acetato de etilo, alcohol bencílico, benzoato de bencilo, propilenglicol, 1,3-butilglicol, aceites, en particular aceite de semillas de algodón, de cacahuete, de semillas de maíz, de oliva, de ricino y de sésamo, ésteres de ácidos grasos de glicerina, polietilenglicoles y ésteres de los ácidos grasos de sorbitán o mezclas de estas sustancias.
- 20 Las suspensiones pueden contener los vehículos convencionales como diluyentes, p.ej. agua, etanol o propilenglicol, agentes de suspensión, p. ej. alcoholes isoestearílicos etoxilados, éster de polioxietilensorbitol y éster de polioxietilensorbitán, celulosa microcristalina, metahidróxido de aluminio, bentonita, agar-agar y tragantano o mezclas de estas sustancias.
- 25 Los jabones pueden contener los vehículos convencionales como sales alcalinas de ácidos grasos, sales de hemiésteres de ácidos grasos, hidrolizados de ácidos grasos y proteínas, isotionatos, lanolina, alcohol graso, aceites vegetales, extractos vegetales, glicerina, azúcar o mezclas de estas sustancias.
- 30 Los productos de limpieza con tensioactivos pueden contener los vehículos convencionales como sales de sulfatos de alcoholes grasos, etersulfatos de alcoholes grasos, hemiésteres del ácido sulfosuccínico, hidrolizados de ácido graso-proteína, isotionatos, derivados de imidazolio, metiltauratos, sarcosinatos, etersulfatos de amidas grasas, alquilamidobetainas, alcoholes grasos, glicéridos de ácidos grasos, dietanolamidas de ácidos grasos, aceites naturales y sintéticos, derivados de lanolina, ésteres etoxilados de glicerina-ácidos grasos o mezclas de estas sustancias.
- 35 Los aceites faciales y corporales pueden contener los vehículos convencionales, como aceites sintéticos, como ésteres de ácidos grasos, alcoholes grasos, aceites de silicona, aceites naturales como aceites vegetales y extractos vegetales oleosos, aceites de parafina, aceites de lanolina o mezclas de estas sustancias.
- Otros modos de aplicación cosmética típicos son también los lápices de labios, los lápices de protección labial, mascarillas, lápices de ojos, sombras de ojos, colorete, maquillaje en polvo, emulsión y cera, así como preparados de protección solar, para antes y después del sol.
- En particular, las emulsiones pertenecen a las formas de preparación preferidas según la invención.
- 40 Las emulsiones según la invención son ventajosas y contienen p. ej. las grasas, aceites y ceras mencionados y otros cuerpos grasos, así como agua y un emulsionante como el que se utiliza preferentemente para una preparación de este tipo.
- La fase lipídica puede escogerse de forma ventajosa del siguiente grupo de sustancias:
- aceites minerales, ceras minerales
  - aceites, como triglicéridos del ácido cáprico o del ácido caprílico, otros aceites naturales como p.ej. el aceite de ricino;
  - grasas, ceras y otros cuerpos grasos naturales y sintéticos, preferentemente ésteres de ácidos grasos con alcoholes con pocos C, p. ej. con isopropanol, propilenglicol o glicerina, o ésteres de alcoholes grasos con ácidos alcanóicos con pocos C o con ácidos grasos;
  - aceites de silicona como, por ejemplo, dimetilpolisiloxanos, dietilpolisiloxanos, difenilpolisiloxanos así como mezclas de éstos.
- 50 La fase oleosa de las emulsiones, oleogeles o hidrodispersiones o lipodispersiones, en el sentido de la presente invención, se escoge de forma ventajosa del grupo de ésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 3 a 30 átomos de C y alcoholes saturados y/o

- insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 3 a 30 átomos de C, del grupo de ésteres de ácidos carboxílicos aromáticos y alcoholes saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 3 a 30 átomos de C. Entonces, tales aceites de éster pueden escogerse de forma ventajosa del grupo de isopropilmiristato, isopropilpalmitato, isopropilestearato, isopropiloleato, n-butilestearato, n-hexillaurato, n-deciloleato, isoocilestearato, isononilestearato, isononilisononanoato, 2-etilhexilpalmitato, 2-etilhexillaurato, 2-hexildecilestearato, 2-octildodecilpalmitato, oleiloleato, oleilerucato, eruciloleato, erucilerucato así como mezclas sintéticas, parcialmente sintéticas o naturales de tales ésteres, p.ej. aceite de jojoba.
- Además, la fase oleosa puede escogerse de forma ventajosa del grupo de hidrocarburos y ceras lineales o ramificadas, aceites de silicona, éteres dialquílicos, del grupo de alcoholes saturados o insaturados, lineales o ramificados, así como de triglicéridos de ácidos grasos, sobretodo el éster triglicérico de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 8 a 24, en particular de 12-18 átomos de C. Los triglicéridos de ácidos grasos pueden escogerse de forma ventajosa, por ejemplo, del grupo de aceites sintéticos, parcialmente sintéticos y naturales, p.ej. aceite de oliva, de girasol, de soja, de cacahuete, de colza, de almendra, de palma, de coco, de grano de palma y otros parecidos.
- También es ventajoso en el sentido de la presente invención utilizar cualquier mezcla de tales componentes de aceites y ceras. Dado el caso, también puede ser ventajoso incorporar ceras, por ejemplo, cetilpalmitato, como único componente lipídico de la fase oleosa.
- De forma ventajosa la fase oleosa se escoge del grupo de 2-etilhexilisoestearato, octildodecanol, isotridecilisononanoato, isoeicosano, 2-etilhexilcocoato, alquilbenzoato C<sub>12-15</sub>, triglicérido del ácido caprílico-cáprico, éter dicaprílico.
- En especial se prefieren mezclas de alquilbenzoato C<sub>12-15</sub> y 2-etilhexilisoestearato, mezclas de alquilbenzoato C<sub>12-15</sub> y isotridecilisononanoato así como mezclas de alquilbenzoato C<sub>12-15</sub>, 2-etilhexilisoestearato e isotridecilisononanoato.
- En el sentido de la presente invención es ventajoso utilizar hidrocarburos como aceite de parafina, escualano y escualeno.
- De forma ventajosa, la fase oleosa también puede presentar un contenido de aceites de silicona cíclicos o lineales o estar compuesta totalmente por tales aceites, prefiriéndose utilizar en particular, a parte del aceite o aceites de silicona, un contenido adicional de otros componentes de fase oleosa.
- De forma ventajosa se utiliza la ciclometicona (octametilciclotetrasiloxano) como aceite de silicona útil según la invención. Pero también se pueden utilizar de forma ventajosa en el sentido de la presente invención otros aceites de silicona, por ejemplo hexametilciclotrisiloxano, polidimetilsiloxano, poli(metilfenilsiloxano).
- Además, son ventajosas en particular otras mezclas de ciclometicona e isotridecilisononanoato, de ciclometicona y 2-etilhexilisoestearato.
- Las fases acuosas de las preparaciones según la invención contienen de forma ventajosa, dado el caso, alcoholes, dioles o polioles con pocos C, así como sus éteres, preferentemente etanol, isopropanol, propilenglicol, glicerina, etilenglicol, etilenglicolmonoetil- o -monobutiléter, propilenglicolmonometil-, -monoetil- o -monobutiléter, dietilenglicolmonometil- o -monoetiléter y productos análogos, también alcoholes con pocos C, p.ej. etanol, isopropanol, 1,2-propanodiol, glicerina, así como en particular uno o varios espesantes, que puede o pueden escogerse de forma ventajosa del grupo de dióxido de silicio, silicatos de aluminio, polisacáridos o sus derivados, p.ej. ácido hialurónico, goma de xantano, hidroxipropilmetilcelulosa, de forma particularmente ventajosa del grupo de poliacrilatos, preferentemente un poliacrilato del grupo de los llamados carbopoles de los tipos 980, 981, 1382, 2984, 5984, solos o combinados.
- En particular se utilizan mezclas de los disolventes anteriormente mencionados. En el caso de disolventes alcohólicos, el agua puede ser otro componente.
- Las emulsiones según la invención son ventajosas y contienen p. ej. las grasas, aceites y ceras mencionados y otros cuerpos grasos, así como agua y un emulsionante como el que se utiliza normalmente para una preparación de este tipo.
- En una forma de realización preferida, las preparaciones según la invención contienen tensioactivos hidrófilos.
- Los tensioactivos hidrófilos se escogen preferentemente del grupo de alquilglucósidos, acilactilatos, betaínas, así como cocoanfoacetatos.
- Por su parte, los alquilglucósidos se escogen de forma ventajosa del grupo de alquilglucósidos, que se representan mediante la fórmula estructural



donde R representa un resto alquílico lineal o ramificado con 4 a 24 átomos de carbono y donde  $\overline{DP}$  significa un grado medio de glucosilación de hasta 2.

- 5 El valor  $\overline{DP}$  representa el grado de glucosilación de los alquilglucósidos utilizados según la invención y se define como

$$\overline{DP} = \frac{p_1}{100} \cdot 1 + \frac{p_2}{100} \cdot 2 + \frac{p_3}{100} \cdot 3 + \dots = \sum \frac{p_i}{100} \cdot i$$

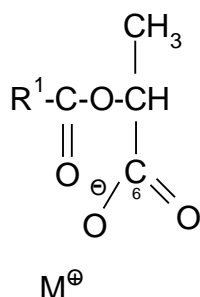
Donde  $p_1, p_2, p_3$  hasta  $p_i$  representa la proporción de productos glucosilados una, dos, tres hasta  $i$  veces en porcentaje en peso. De forma ventajosa se escogen productos con grados de glucosilación de 1-2, particularmente ventajoso de 1,1 a 1,5, totalmente ventajoso de 1,2-1,4, en particular de 1,3.

- 10 El valor  $\overline{DP}$  tiene en cuenta las condiciones que por regla general presentan las mezclas de mono y oligoglucósidos preparadas con determinados alquilglucósidos. Según la invención es ventajoso un contenido relativamente elevado de monoglucósidos, típicamente del orden de magnitud de 40-70% en peso.

- 15 Los alquilglucósidos utilizados de forma particularmente ventajosa según la invención se escogen entre el grupo de octilglucopiranosido, nonilglucopiranosido, decilglucopiranosido, undecilglucopiranosido, dodecilglucopiranosido, tetradecilglucopiranosido y hexadecilglucopiranosido.

Es igualmente ventajoso utilizar materias primas y coadyuvantes naturales o sintéticos o mezclas que destacan por un contenido eficaz de principios activos utilizados según la invención, por ejemplo Plantaren<sup>®</sup> 1200 (Henkel KGaA), Oramix<sup>®</sup> NS 10 (Seppic).

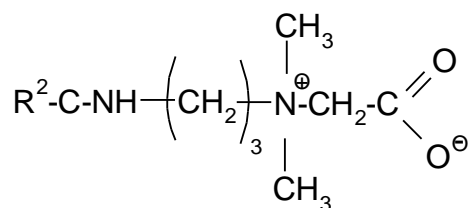
- 20 Por su parte, los acilactilatos se escogen de forma ventajosa del grupo de sustancias que se representan mediante la fórmula estructural



donde  $R^1$  representa un resto alquilo lineal o ramificado con 1 a 30 átomos de carbono y  $M^+$  se escoge del grupo de iones alcalinos así como del grupo de iones amonio sustituidos con uno o varios restos alquilo y/o con uno o varios restos hidroxialquilo o representa el semiequivalente de un ión alcalinotérreo.

- 25 Es ventajoso, por ejemplo, el isoestearillactilato de sodio, por ejemplo el producto Pathionic<sup>®</sup> ISL de la empresa American Ingredients Company.

Las betaínas se escogen de forma ventajosa del grupo de sustancias que se representan mediante la fórmula estructural



donde R<sup>2</sup> representa un resto alquilo lineal o ramificado con 1 a 30 átomos de carbono.

De forma especialmente ventajosa R<sup>2</sup> representa un resto alquílico lineal o ramificado con 6 a 12 átomos de carbono.

- 5 Es ventajosa, por ejemplo la capramidopropilbetaina, por ejemplo el producto Tego<sup>®</sup> Betain 810 de la empresa Th. Goldschmidt AG.

Como cocoanfoacetato ventajoso según la invención, se escoge, por ejemplo, el cocoanfoacetato sódico comercializado bajo la denominación Miranol<sup>®</sup> Ultra C32 de la empresa Miranol Chemical Corp.

- 10 De forma ventajosa las preparaciones según la invención se caracterizan porque el/los tensioactivo(s) hidrófilo(s) se encuentra(n) en concentraciones de 0,01-20% en peso, preferentemente de 0,05-10% en peso, en especial de 0,1-5% en peso, respecto al peso total de la composición.

Para el uso, las preparaciones cosméticas y dermatológicas según la invención se aplican en cantidad suficiente sobre la piel y/o el pelo, de la forma convencional para los cosméticos.

- 15 Las preparaciones cosméticas y dermatológicas según la invención pueden presentarse en diversas formas. Así pueden representar, por ejemplo, una disolución, una preparación sin agua, una emulsión o microemulsión del tipo agua-en-aceite (W/O) o del tipo aceite-en-agua (O/W), una emulsión múltiple, por ejemplo del tipo agua-en-aceite-en-agua (W/O/W), un gel, una barra sólida, una pomada o incluso un aerosol. También es ventajoso incorporar ectoína encapsulada, p.ej. en matrices de colágeno y otros materiales de encapsulación convencionales, p.ej. como encapsulaciones de celulosa, encapsulada en gelatina, matrices de cera o liposomas. En particular han resultado favorables las matrices de cera como las que se describen en el documento DE-OS 43 08 282. Se prefieren las emulsiones. En especial se prefieren las emulsiones O/W. Las emulsiones, emulsiones W/O y O/W se obtienen de la forma habitual.
- 20

Como emulsionantes se pueden utilizar, por ejemplo, los emulsionantes W/O y O/W conocidos. Es ventajoso utilizar otros co-emulsionantes convencionales en las emulsiones O/W preferidas según la invención.

- 25 El producto comercial Ceralution C de la empresa Sasol ha resultado un emulsionante especialmente preferido según la invención para emulsiones O/W.

- De forma ventajosa según la invención se escogen como co-emulsionantes, por ejemplo, emulsionantes O/W preferentemente del grupo de sustancias con valores HLB de 11-16, se prefieren en particular las sustancias con valores HLB de 14,5-15,5, siempre y cuando los emulsionantes O/W presenten restos R y R' saturados. Si los emulsionantes O/W presentan restos R y/o R' insaturados o derivados isoalquílicos, el valor HLB preferente de tales emulsionantes puede ser también menor o mayor.
- 30

- Es ventajoso escoger etoxilatos de alcoholes grasos del grupo de estearilalcoholes, cetilalcoholes, cetilestearilalcoholes (cetearilalcoholes) etoxilados. En particular se prefieren: polietilenglicol(13)esteariléter (Steareth-13), polietilenglicol(14)esteariléter (Steareth-14), polietilenglicol(15)esteariléter (Steareth-15), polietilenglicol(16)esteariléter (Steareth-16), polietilenglicol(17)esteariléter (Steareth-17), polietilenglicol(18)esteariléter (Steareth-18), polietilenglicol(19)esteariléter (Steareth-19), polietilenglicol(20)esteariléter (Steareth-20), polietilenglicol(12)isoesteariléter (Isosteareth-12), polietilenglicol(13)isoesteariléter (Isosteareth-13), polietilenglicol(14)isoesteariléter (Isosteareth-14), polietilenglicol(15)isoesteariléter (Isosteareth-15), polietilenglicol(16)isoesteariléter (Isosteareth-16), polietilenglicol(17)isoesteariléter (Isosteareth-17), polietilenglicol(18)isoesteariléter (Isosteareth-18), polietilenglicol(19)isoesteariléter (Isosteareth-19), polietilenglicol(20)isoesteariléter (Isosteareth-20), polietilenglicol(13)cetiléter (Ceteth-13), polietilenglicol(14)cetiléter (Ceteth-14), polietilenglicol(15)cetiléter (Ceteth-15), polietilenglicol(16)cetiléter (Ceteth-16), polietilenglicol(17)cetiléter (Ceteth-17), polietilenglicol(18)cetiléter (Ceteth-18), polietilenglicol(19)cetiléter (Ceteth-19), polietilenglicol(20)cetiléter (Ceteth-20), polietilenglicol(13)isocetiléter (Isoceteth-13), polietilenglicol(14)isocetiléter (Isoceteth-14), polietilenglicol(15)isocetiléter (Isoceteth-15), polietilenglicol(16)isocetiléter (Isoceteth-16), polietilenglicol(17)isocetiléter (Isoceteth-17), polietilenglicol(18)isocetiléter (Isoceteth-18), polietilenglicol(19)isocetiléter (Isoceteth-19), polietilenglicol(20)isocetiléter (Isoceteth-20), polietilenglicol(12)oleiléter (Oleth-12), polietilenglicol(13)oleiléter (Oleth-13), polietilenglicol(14)oleiléter (Oleth-14), polietilenglicol(15)oleiléter (Oleth-15), polietilenglicol(12)lauriléter (Laureth-12), polietilenglicol(12)isolauriléter (Isolaureth-12), polietilenglicol(13)cetilesteariléter (Cetareth-13), polietilenglicol(14)cetilesteariléter (Cetareth-14), polietilenglicol(15)cetilesteariléter (Cetareth-15), polietilenglicol(16)cetilesteariléter (Cetareth-16), polietilenglicol(17)cetilesteariléter (Cetareth-17),
- 35
- 40
- 45
- 50

polietilenglicol(18)cetilesteariléter (Cetareth-18), polietilenglicol(19)cetilesteariléter (Cetareth-19), polietilenglicol(20)cetilesteariléter (Cetareth-20).

Además es ventajoso escoger los etoxilatos de ácidos grasos del siguiente grupo:

5 polietilenglicol(20)estearato, polietilenglicol(21)estearato, polietilenglicol(22)estearato, polietilenglicol(23)estearato, polietilenglicol(24)estearato, polietilenglicol(25)estearato, polietilenglicol(12)isoestearato, polietilenglicol(13)isoestearato, polietilenglicol(14)isoestearato, polietilenglicol(15)isoestearato, polietilenglicol(16)isoestearato, polietilenglicol(17)isoestearato, polietilenglicol(18)isoestearato, polietilenglicol(19)isoestearato, polietilenglicol(20)isoestearato, polietilenglicol(21)isoestearato, polietilenglicol(22)isoestearato, polietilenglicol(23)isoestearato, polietilenglicol(24)isoestearato, polietilenglicol(25)isoestearato,  
10 polietilenglicol(12)oleolato, polietilenglicol(13)oleolato, polietilenglicol(14)oleolato, polietilenglicol(15)oleolato, polietilenglicol(16)oleolato, polietilenglicol(17)oleolato, polietilenglicol(18)oleolato, polietilenglicol(19)oleolato, polietilenglicol(20)oleolato.

De forma ventajosa, como ácido alquiletercarboxílico o sus sales se puede utilizar el lauret-11-carboxilato sódico. De forma ventajosa, como ácido alquiletersulfato se puede utilizar el lauret-14-sulfato sódico. De forma ventajosa, como derivado de colesterol etoxilado se puede utilizar el polietilenglicol(30)colesteriléter. También ha dado buen resultado el polietilenglicol(25)sojaesterol. De forma ventajosa, como triglicérido etoxilado se puede utilizar el glicérido polietilenglicol(60) Evening Primrose (Evening Primrose = onagra o prímula).

Además, es ventajoso escoger los ésteres de ácidos grasos de polietilenglicolglicerina del grupo de polietilenglicol(20)glicerilaurato, polietilenglicol(21)glicerilaurato, polietilenglicol(22)glicerilaurato, polietilenglicol(23)glicerilaurato, polietilenglicol(6)glicerilcaprato/caprinato, polietilenglicol(20)gliceriloleato, polietilenglicol(20)glicerilisoestearato, polietilenglicol(18)gliceriloleato/cocato.

Asimismo, es favorable escoger los ésteres de sorbitán del grupo de polietilenglicol(20)sorbitanmonolaurato, polietilenglicol(20)sorbitanmonoestearato, polietilenglicol(20)sorbitanmonoisoestearato, polietilenglicol(20)sorbitanmonopalmitato, polietilenglicol(20)sorbitanmonooleato.

25 Como emulsionantes W/O opcionales, aunque ventajosos dado el caso según la invención, se pueden utilizar:

alcoholes grasos con 8 a 30 átomos de carbono, monoglicerinésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 8 a 24, en particular de 12-18 átomos de C, diglicerinésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 8 a 24, en particular de 12-18 átomos de C, monoglicerinésteres de alcoholes saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 8 a 24, en particular de 12-18 átomos de C, propilenglicolésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 8 a 24, en particular de 12-18 átomos de C, así como sorbitanésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados con una longitud de cadena de 8 a 24, en particular de 12-18 átomos de C.

Los emulsionantes W/O especialmente ventajosos son glicerilmonoestearato, glicerilmonoisoestearato, glicerilmonomiristato, glicerilmonooleato, diglicerilmonoestearato, diglicerilmonoisoestearato, propilenglicolmonoestearato, propilenglicolmonoisoestearato, propilenglicolmonocaprilato, propilenglicolmonolaurato, sorbitanmonoisoestearato, sorbitanmonolaurato, sorbitanmonocaprilato, sorbitanmonoisooleato, sacarosadiestearato, cetilalcohol, estearilalcohol, araquidilalcohol, behenilalcohol, isobehenilalcohol, selaquilalcohol, quimilalcohol, polietilenglicol(2)esteariléter (Steareth-2), glicerilmonolaurato, glicerilmonocaprinato, glicerilmonocaprilato.

Las preparaciones preferidas según la invención son adecuadas en especial para la protección de la piel humana contra los procesos de envejecimiento inducidos por UV, así como el estrés oxidativo, es decir, contra daños provocados por radicales, como los que se producen p. ej. por la radiación solar, el calor u otros efectos. Así existen diferentes formas de presentación utilizadas habitualmente para esta aplicación. Así, en particular, pueden existir como loción o emulsión, o como crema o leche (O/W, W/O, O/W/O, W/O/W), en forma de geles o disoluciones oleoalcohólicas, oleoacuosas o acuoalcohólicas, como barras sólidas o se pueden preparar como aerosoles.

Las preparaciones pueden contener adyuvantes cosméticos, los cuales se utilizan habitualmente en este tipo de preparaciones como p. ej. espesantes, plastificantes, hidratantes, tensioactivos, emulsionantes, conservantes, agentes antiespumantes, perfumes, ceras, lanolina, portadores, colorantes y/o pigmentos que colorean el propio medio o la piel y otros ingredientes utilizados habitualmente en cosmética.

Como medio de dispersión o solubilización se puede utilizar un aceite, cera u otros cuerpos grasos, un monoalcohol o un poliol pequeño o mezclas de éstos. Como monoalcoholes o polioles especialmente preferidos se encuentran el etanol, i-propanol, propilenglicol, glicerina y sorbitol.

Una forma de realización preferida de la invención es una emulsión en forma de crema o leche protectora y que, además del/ de los compuesto(s) de fórmula I, contiene, por ejemplo, alcoholes grasos, ácidos grasos, ésteres de



ácidos grasos, en particular triglicéridos de ácidos grasos, lanolina, aceites o ceras naturales y sintéticos y emulsionantes en presencia de agua.

5 Otras formas de realización preferidas presentan lociones oleosas con una base de aceites y ceras naturales o sintéticas, lanolina, ésteres de ácidos grasos, en particular triglicéridos de ácidos grasos, o lociones oleoalcohólicas con una base de alcohol pequeño, como etanol, o un glicerol, como propilenglicol, y/o un poliol, como glicerina, y aceites, ceras y ésteres de ácidos grasos, como triglicéridos de ácidos grasos.

La preparación según la invención también puede presentarse como un gel alcohólico, el cual contiene uno o varios alcoholes o polioles pequeños, como etanol, propilenglicol o glicerina, y un espesante, como sílica. Los geles con aceite y alcohol contienen, además, aceite o cera natural o sintética.

10 Las barras sólidas se componen de ceras y aceites naturales o sintéticos, alcoholes grasos, ácidos grasos, ésteres de ácidos grasos, lanolina y otros cuerpos grasos.

Si se confecciona una preparación en forma de aerosol, normalmente se utilizan los agentes de expansión convencionales, como alcanos, fluoroalcanos y clorofluoroalcanos.

15 La preparación cosmética también puede utilizarse para proteger el pelo contra daños fotoquímicos, para evitar los cambios de tono de color, la decoloración o los daños de tipo mecánico. En este caso, es adecuada la preparación en forma de champú, loción, gel o emulsión para enjuagar, aplicándose cada preparación antes o después del champú, antes o después del tinte o decoloración o antes o después de la permanente. También se puede escoger una preparación en forma de loción o gel para peinar o tratar, una loción o gel para cepillar o aplicar un marcado, como laca de pelo, agente para permanente, agente de tinte o decoloración del pelo. La preparación con propiedades de protección frente la luz puede contener distintos adyuvantes utilizados en este tipo de medio, como 20 tensioactivos, espesantes, polímeros, plastificantes, conservantes, estabilizadores de espuma, electrolitos, disolventes orgánicos, derivados de silicona, aceites, ceras, agentes antigrasa, colorantes y/o pigmentos que colorean el propio medio o el pelo, u otros ingredientes utilizados habitualmente para el cuidado del pelo.

Los siguientes ejemplos ilustran la invención sin limitarla.

## 25 Ejemplos:

### Ejemplo 1: Atomización con inyección de dos fluidos

El atomizador con inyección de dos fluidos (tipo Mobile Miono 2000 D de la empresa Niro) se calienta a una temperatura de entrada de 150°C y una temperatura de salida de 75°C. Para la estabilización del sistema se rocía agua durante un periodo de 10 minutos, a continuación se pulverizan 5 kg de una dispersión de Eusolex® UV-Pearls OMC (empresa Merck) en agua (contenido de sólidos 40% en peso). Tras 30 minutos se toma la salida de producto, tras 3,5 horas se ha pulverizado toda la dispersión. Se enjuaga con agua durante aprox. 15 minutos. Se obtienen 1640 g de producto pulverizado.

Parámetros de proceso:

Inyección de dos fluidos (flujo aire de pulverización 5kg/h (0,3 bar)

35 Funcionamiento a contracorriente

Salida de producto: vaciado en dos puntos (cono secador y ciclón)

Flujo de aire de secado: 85 kg/h

Temperatura de gas residual: 50°C

Flujo de alimentación dispersión: 1,2 kg/h (transporte mediante bomba peristáltica)

### 40 Ejemplo 2: Variante con rueda de atomización

El atomizador con rueda de atomización (presión de trabajo 4,6 bar, 25000 rpm) se calienta a una temperatura de entrada de 150°C y una temperatura de salida de 70°C. Para la estabilización del sistema se rocía agua durante un periodo de 10 minutos, a continuación se pulverizan 5 kg de una dispersión de Eusolex® UV-Pearls OMC (empresa Merck) en agua (contenido de sólidos 40% en peso). Tras 30 minutos se toma la salida de producto, tras 3,5 horas se ha pulverizado toda la dispersión. Se enjuaga con agua durante aprox. 15 minutos. Se obtienen 1960 g de producto pulverizado.

Parámetros de proceso:

Rueda de atomización

Funcionamiento en corriente paralela

Salida de producto: vaciado en dos puntos (cono secador y ciclón)  
 Flujo de aire de secado: 85 kg/h  
 Temperatura de gas residual: 40°C  
 Flujo de alimentación dispersión: 1,2 kg/h (transporte mediante bomba peristáltica)

5 **Ejemplo de preparación polvos faciales:**

|    | <b>Materia prima</b>       | <b>INCI</b>  | <b>[%]</b> |
|----|----------------------------|--|------------|
|    | <b>A</b>                   |  |            |
|    | Producto del ejemplo 1 o 2 | ETHYLHEXYL METHOXYCINNAMATE, SILICA, PVP,<br>CHLORPHENESIN BHT, AQUA | 5,00       |
| 10 | Microna® Matte Yellow      | MICA, CI 77492 (IRON OXIDES)   | 2,60       |
|    | Microna® Matte Red         | MICA, CI 77491 (IRON OXIDES)   | 0,70       |
|    | Microna® Matte Orange      | MICA, CI 77491 (IRON OXIDES)   | 0,80       |
|    | Microna® Matte Black       | MICA, CI 77499 (IRON OXIDES)   | 0,30       |
|    | Estearato de magnesio      | MAGNESIUM STEARATE   | 2,00       |
| 15 | Satin Mica                 | MICA   | 15,00      |
|    | Talco                      | TALC   | 69,60      |
|    | <b>B</b>                   |  |            |
|    | Ceraphyl 368               | ETHYLHEXYL PALMITATE   | 3,92       |
|    | Propil-4-hidroxibenzoato   | PROPYLPARABEN  | 0,08       |

20 **Fabricación:**

Los componentes de la base del polvo se introducen en el mezclador (La Moulinette de Moulinex) y se mezclan 2 veces 10 segundos. La mezcla se vierte en un vaso de precipitados, se añade gota a gota el aglutinante y se mezcla con la espátula. La mezcla se vuelve a introducir en el mezclador y se mezcla 3 veces 10 segundos. El polvo se inyecta a 20 bares.

25 **Ejemplo de comparación polvos faciales:**

|    | <b>Materia prima</b>     | <b>INCI</b>                      | <b>[%]</b> |
|----|--------------------------|----------------------------------|------------|
|    | <b>A</b>                 |                                  |            |
|    | Microna® Matte Yellow    | MICA, CI 77492 (IRON OXIDES)     | 2,60       |
|    | Microna® Matte Red       | MICA, CI 77491 (IRON OXIDES)     | 0,70       |
| 30 | Microna® Matte Orange    | MICA, CI 77491 (IRON OXIDES)     | 0,80       |
|    | Microna® Matte Black     | MICA, CI 77499 (IRON OXIDES)     | 0,30       |
|    | Estearato de magnesio    | MAGNESIUM STEARATE               | 2,00       |
|    | Satin Mica               | MICA                             | 15,00      |
|    | Talco                    | TALC                             | 74,60      |
| 35 | <b>B</b>                 |                                  |            |
|    | Eusolex® 2292            | ETHYLHEXYL METHOXYCINNAMATE, BHT | 2,40       |
|    | Ceraphyl 368             | ETHYLHEXYL PALMITATE             | 1,52       |
|    | Propil-4-hidroxibenzoato | PROPYLPARABEN                    | 0,08       |

**Fabricación:**

5 Los componentes de la base del polvo se introducen en el mezclador (La Moulinette de Moulinex) y se mezclan 2 veces 10 segundos. La mezcla se vierte en un vaso de precipitados, se añade gota a gota el aglutinante y se mezcla con la espátula. La mezcla se vuelve a introducir en el mezclador y se mezcla 3 veces 10 segundos. El polvo se inyecta a 20 bares.

En la aplicación del polvo según la invención se origina una capacidad de formulación más libre frente a la del ejemplo de comparación, en la que debe sustituirse una parte del aglutinante por el filtro UV líquido. Por esto, puede producirse una limitación en la formulación, por ejemplo, en cuanto a la sensación dérmica.

**Ejemplo de preparación hidrogel:****10 Cuidado de día para piel grasa****Sin aceites, FPS (DIFFEY) 7, FP UVA 3**

| Materia prima                     | INCI                                   | [%]   |
|-----------------------------------|--|-------|
| <b>A</b>                          |  |       |
| <b>Producto del ejemplo 1 o 2</b> | ETHYLHEXYL METHOXYCINNAMATE,           | 8,00  |
| 15                                | SILICA, PVP, CHLORPHENESIN, BHT, AQUA, |       |
| Hispagel 200                      | GLYCERIN, GLYCERYL POLYACRYLATE        | 25,00 |
| Ectoína RonaCare®                 | ECTOIN                                 | 0,50  |
| Agua desmineralizada              | AQUA                                   | 65,80 |
| 20                                | Germaben II                            |       |
|                                   | PROPYLENE GLYCOL, DIAZOLIDINYL UREA,   | 0,70  |
|                                   | METHYLPARABEN, PROPYLPARABEN           |       |

**Fabricación:**

Introducir Hispagel. Disolver ectoína en agua, añadir el resto de componentes y añadirlos al Hispagel bajo agitación.

Agitar hasta que se produzca una mezcla homogénea.

**25 Observaciones:**

pH (25°C) = 5,5

Viscosidad (Brookfield RVD II, Helipath huso C, 10 rpm, 25°C) = 45.900 cps

**Ejemplo de preparación O/W (introducción en la fase acuosa):****Loción de protección solar O/W****30 FPS (*in vitro*, método Diffey) 22 ± 4, PF UVA 13 ± 3**

## ES 2 432 365 T3

|    | <b>Materia prima</b>       | <b>INCI</b>  | <b>[%]</b> |
|----|----------------------------|--|------------|
|    | <b>A</b>                   |  |            |
|    | Eusolex® 6300              | 4-METHYLBENZYLIDENE CAMPHOR  | 4,00       |
|    | Eusolex® 9020              | BUTYL METHOXYDIBENZOYLMETHANE  | 5,00       |
| 5  | Hostacerin DGI             | POLYGLYCERYL-2 SESQUIISOSTEARATE   | 4,00       |
|    | Cetiol B                   | DIBUTYL ADIPATE  | 4,00       |
|    | Crodamol DOA               | DIOCTYL ADIPATE  | 2,00       |
|    | Tegosoft TN                | C12-15 ALKYL BENZOATE  | 4,00       |
|    | Eutanol G                  | OCTYLDODECANOL   | 4,50       |
| 10 | <b>B</b>                   |  |            |
|    | Aristoflex AVC             | AMMONIUM ACRYLOYLDIMETYLTAURATE/VP<br>COPOLYMER                                | 0,50       |
|    | <b>C</b>                   |  |            |
|    | Agua desmineralizada       | AQUA   | 40,00      |
| 15 | <b>D</b>                   |  |            |
|    | Producto del ejemplo 1 o 2 | ETHYLHEXYL METHOXYCINNAMATE,<br>SILICA, PVP, CHLORPHENESIN, BHT, AQUA,         | 8,40       |
|    | Hostapon KCG               | SODIUM COCOYL GLUTAMATE  | 1,50       |
|    | D-Pantenol                 | PANTHENOL  | 0,50       |
| 20 | Glicerina, anhidra         | GLYCERIN   | 3,00       |
|    | Agua desmineralizada       | AQUA   | 17,40      |
|    | <b>E</b>                   |  |            |
|    | Phenonip                   | PHENOXYETHANOL, BUTYLPARABEN,<br>ETHYLPARABEN, PROPYLPARABEN,<br>METHYLPARABEN | 0,70       |
| 25 | Tocoferolacetato RonaCare® | TOCOPHERYL ACETATE   | 0,50       |
|    | Aceite de perfume (q.s.)   | PARFUM   | 0,00       |

### **Fabricación:**

- Calentar A a 80°C
- 30 Mezclar B con A
- Calentar C a 80°C
- Elaboración de la emulsión W/O intermedia:
- Mezclar C con A/B con una elevada velocidad de cizalladura (Ultra Thurrax) durante aprox. 2 minutos
- Añadir la fase D fría gota a gota muy lentamente, hasta producirse inversión de fases, agitar en frío al menos 2 h
- 35 Añadir E y agitar una hora más
- Homogeneizar.

**Observaciones:**

pH (25°C) = 6,0

Viscosidad (Brookfield RVD II, Helipath huso B, 50 rpm, 25°C) = 1.120 cps

**Ejemplo de preparación W/O (introducción en la fase oleosa):**

5 **Complete Sun Protection (W/O)**

**FPS *in vitro* (Diffey, Transpore, SPF290) = 40+/-9, Lambda(c) (DGK) = 373nm**

|    | <b>Materia prima</b>       | <b>INCI</b>   | <b>[%]</b> |
|----|----------------------------|---|------------|
|    | <b>A</b>                   |   |            |
|    | Producto del ejemplo 1 o 2 | ETHYLHEXYL METHOXYCINNAMATE   | 4,00       |
| 10 | Eusolex® 6300              | SILICA, PVP, CHLORPHENESIN, BHT, AQUA,<br>4-METHYLBENZYLIDENE CAMPHOR | 1,00       |
|    | Eusolex® 9020              | BUTYL METHOXYDIBENZOYLMETHANE   | 1,00       |
|    | Cremophor WO 7             | PEG-7 HYDROGENATED CASTOR OIL   | 6,00       |
|    | Elfacos ST 9               | PEG-45 DODECYL GLYCOL COPOLYMER                                       | 2,00       |
| 15 | Aceite de jojoba           | BUXUS CHINENSIS (JOJOBA OIL)  | 9,00       |
|    | Isopropilmiristato         | ISOPROPYL MYRISTATE   | 3,50       |
|    | Abil 350                   | DIMETHICONE   | 1,00       |
|    | <b>B</b>                   |   |            |
|    | Eusolex® T-AVO             | TITANIUM DIOXIDE, SILICA  | 5,00       |
| 20 | <b>C</b>                   |   |            |
|    | Glicerina (87% purísima)   | GLYCERIN  | 5,00       |
|    | Titriplex® III             | DISODIUM EDTA   | 0,20       |
|    | Agua desmineralizada       | AQUA  | 61,50      |
|    | Germall 115                | IMIDAZOLIDINYL UREA   | 0,30       |
| 25 |                            |   |            |

(continuación)

**D**

|   |                          |  |      |
|---|--------------------------|--|------|
| 5 | Phenonip                 | PHENOXYETHANOL, BUTYLPARABEN,<br>ETHYLPARABEN, PROPYLPARABEN,<br>METHYLPARABEN | 0,50 |
|   | Aceite de perfume (q.s.) | PARFUM   | 0,00 |

**Fabricación:**

Calentar fase A a 80°C, añadir fase B bajo agitación y homogeneizar 3 minutos (Zauberstab nivel 1).

Calentar fase C a 80°C y homogeneizar con fase A/B (1 minuto Zauberstab nivel 1 y 30 s nivel 2).

- 10 Enfriar a 40°C con agitación, añadir fase D y volver a homogeneizar (agitador MFR 1200 rpm 1 minuto).

**Observaciones:**

Viscosidad (Brookfield RVT-DV II, Helipath C, 10 rpm, 24°C) = 11700 mPa s

**Ejemplo de preparación O/W (introducción en la fase oleosa):**

- 15 **Loción de protección solar, resistente al agua (O/W)**

**FPS esperado aprox. 25**

|    | <b>Materia prima</b>                                | <b>INCI</b>                            | <b>[%]</b> |
|----|---|--|------------|
|    | <b>A</b>  |  |            |
| 20 | Producto del ejemplo 1 o 2                          | ETHYLHEXYL METHOXYCINNAMATE, BHT       | 6.00       |
|    |   | SILICA, PVP, CHLORPHENESIN, BHT, AQUA, |            |
|    | Eusolex <sup>®</sup> 6300                           | 4-METHYLBENZYLIDENE CAMPHOR            | 1.00       |
|    | Eusolex <sup>®</sup> 9020                           | BUTYL METHOXYDIBENZOYLMETHANE          | 3.00       |
|    | Amphisol A  | CETYL PHOSPHATE                        | 2.00       |
|    | Lanette O   | CETEARYL ALCOHOL                       | 0.50       |
| 25 | Cutina GMS  | GLYCERYL STEARATE                      | 4.00       |
|    | Dow Corning 200 (100cs)                             | DIMETHICONE                            | 0.50       |
|    | Crodamol AB   | C12-15 ALKYL BENZOATE                  | 9.00       |
|    | Antaron WP-660                                      | TRICONTANYL PVP                        | 3.00       |
|    | <b>B</b>  |  |            |
| 30 | Eusolex <sup>®</sup> 232                            | PHENYLBENZIMIDAZOLE SULFONIC ACID      | 2.00       |
|    | Tris(hidroxitometil)-aminometano                    | TROMETHAMINE                           | 0.90       |
|    | (continuación)                                      |  |            |
|    | Agua desmineralizada                                | AQUA                                   | 62.20      |
| 35 | Carbopol 980, disolución 2%,<br>neutralizado a pH 7 | AQUA, CARBOMER                         | 5.00       |

## ES 2 432 365 T3

### C

|   |                                     |  |      |
|---|-------------------------------------|--|------|
|   | Perfume (q.s.)                      | PARFUM   | 0.20 |
|   | Germaben II                         | PROPYLENE GLYCOL, DIAZOLIDINYL UREA,<br>METHYLPARABEN, PROPYLPARABEN | 0.70 |
| 5 | Hidróxido sódico,<br>disolución 10% | SODIUM HYDROXIDE   | 0.00 |

### **Fabricación:**

10 Para neutralizar Eusolex<sup>®</sup> 232 se disuelve tris(hidroximetil)-aminometano en agua de la fase B y se mezcla con Eusolex<sup>®</sup> 232 bajo agitación. Los ingredientes restantes de la fase B se añaden igual y se calienta a 80°C. Se calienta la fase A a 75°C. La fase B se añade lentamente sobre la fase A bajo ligera agitación y se homogeneiza. Se enfría a 40°C bajo agitación, se añade la fase C y se ajusta el pH a 7.

### **Observaciones:**

pH (25°C) = 6,9

Viscosidad (Brookfield RVT-DV II, Helipath C, 10 rpm, 25°C) = 55.000 mPa s

### 15 **Ejemplo de preparación W/O (introducción en la fase acuosa):**

#### **Loción de protección solar en spray (W/O)**

|    | <b>Materia prima</b>          | <b>INCI</b>  | <b>[%]</b> |
|----|-------------------------------|--|------------|
|    | <b>A</b>                      |  |            |
|    | Arlacel P135                  | PEG-30 DIPOLYHYDROXYSTEARATE   | 3.00       |
| 20 | Cetiol A                      | HEXYL LAURATE  | 5.50       |
|    | Arlamol HD                    | ISOHEXADECANE  | 8.00       |
|    | Miglyol 812 N                 | CAPRYLIC/CAPRIC TRIGLYCERIDE   | 4.00       |
|    | Arlamol DOA                   | DIOCTYL ADIPATE  | 4.00       |
|    | <b>B</b>                      |  |            |
| 25 | Producto del ejemplo 1 o 2    | ETHYLHEXYL METHOXYCINNAMATE,<br>SILICA, PVP, CHLORPHENESIN, BHT, AQUA, | 8.00       |
|    | Ectoína RonaCare <sup>®</sup> | ECTOIN   | 0.10       |

## ES 2 432 365 T3

(continuación)

|    |                                      |  |       |
|----|--------------------------------------|--|-------|
|    | Sulfato de magnesio<br>eptahidratado | MAGNESIUM SULFATE  | 0.70  |
|    | Glicerol (aprox. 87%)                | GLYCERIN   | 3.00  |
| 5  | Titriplex <sup>®</sup> III           | DISODIUM EDTA  | 0.05  |
|    | Agua desmineralizada                 | AQUA   | 57.65 |
|    | <b>C</b>                             |  |       |
|    | Eusolex <sup>®</sup> T-S             | TITANIUM DIOXIDE, ALUMINA, STEARIC ACID  | 5.00  |
|    | <b>D</b>                             |  |       |
| 10 | Phenonip                             | PHENOXYETHANOL, BUTYLPARABEN,<br>ETHYLPARABEN, PROPYLPARABEN,<br>METHYLPARABEN | 0.70  |
|    | Fragancia L'EAU<br>D'ETE +D12921CT   | PARFUM   | 0.30  |

15 **Fabricación:**

La fase A y B se combinan por separado y se calientan a 80°C. La fase B se añade lentamente a la fase A en fuerte agitación y se homogeneiza. Se enfría a 40°C bajo agitación, añadir fase C. Añadir fase D tras dispersión homogénea de Eusolex<sup>®</sup> T-S y enfriar bajo agitación.

**Observaciones:**

20 Viscosidad 5.000 mPas (Brookfield LV, huso 4; 12 rpm).

**Loción de cuidado de protección solar:**

| <b>Materia prima</b>                   | <b>INCI</b>                        | <b>[%]</b> |
|--|------------------------------------|------------|
| <b>A</b>                               |                                    |            |
| Parafina espesa                        | PARAFFINUM LIQUIDUM                | 6,50       |
| Pelemol BIP                            | ISOPROPYLPHTALIMIDE, BUTYLPHTALIDE | 6,00       |
| Isopropilpalmitato                     | ISOPROPYL PALMITATE                | 7,50       |
| Aceite de soja                         | GLYCINE SOJA                       | 5,00       |
| Tocoferolacetato RonaCare <sup>®</sup> | TOCOPHEROL ACETAT                  | 1,00       |
| Carbopol Ultrez 10                     | CARBOMER                           | 0,30       |



# ES 2 432 365 T3

(continuación)

## B

|                            |   |       |
|----------------------------|---|-------|
| Producto del ejemplo 1 o 2 | ETHYLHEXYL METHOXYCINNAMATE, SILICA,5,60<br>PVP, CHLORPHENESIN, BHT AQUA  |       |
| Producto del ejemplo 1 o 2 | HOMOSALATE, BUTYLMETHOXY5,60<br>DIBENZOYLMETHANE,DIETHYLHEXYL<br>SYRINGYLIDENE MALONATE<br><br>SILICA, PVP, CHLORPHENESIN, BHT AQUA |       |
| Agua desmineralizada       | AQUA  | 54,20 |
| Sistema L70-C              | SUCROSE LAURATE, AQUA, ALCOHOL  | 6,00  |
| Phenonip                   | PHENOXYETHANOL, BUTYLPARABENE,1,00<br>METHYLPARABENE, PROPYLPARABENE,<br>ETHYLPARABENE  |       |

## C

|                      |                        |      |
|----------------------|------------------------|------|
| Sosa cáustica al 10% | SODIUM HYDROXIDE, AQUA | 1,20 |
|----------------------|------------------------|------|

## D

|                          |                    |      |
|--------------------------|--------------------|------|
| Aceite de perfume (q.s.) | PARFUME, FRAGRANCE | 0,30 |
|--------------------------|--------------------|------|

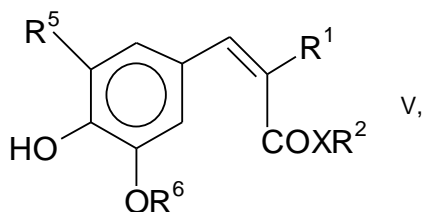
### **Fabricación:**

Añadir conjuntamente fase A hasta Carbopol. En caso necesario, calentar a aprox. 50°C. Añadir Carbopol y emulsionar bajo agitación la fase B previamente disuelta. Homogeneizar. Tras la adición de la fase C volver a homogeneizar brevemente. Añadir fase D

5

**REIVINDICACIONES**

1. Filtros UV en forma de polvo que se obtienen mediante atomización de una dispersión que contiene filtros UV, caracterizados porque los filtros UV son filtros UV orgánicos encapsulados siendo las paredes de las cápsulas inorgánicas.
- 5 2. Filtros UV en forma de polvo según la reivindicación 1, caracterizados porque la dispersión es acuosa.
3. Filtros UV en forma de polvo según la reivindicación 1, caracterizados porque las paredes de las cápsulas están formadas por gel de sílice o dióxido de silicio.
4. Filtros UV según la reivindicación 1, caracterizados porque las cápsulas contienen otras sustancias.
- 10 5. Filtros UV según la reivindicación 4, caracterizados porque las sustancias son fotoestabilizadores, aceites cosméticos y/o antioxidantes.
6. Filtros UV en forma de polvo según una de las reivindicaciones de la 1 a la 5, caracterizados porque el polvo se somete a un tratamiento posterior adicional.
7. Procedimiento para la elaboración de filtros UV en forma de polvo según la reivindicación 1, caracterizado porque las dispersiones de filtros UV orgánicos encapsulados se atomizan.
- 15 8. Procedimiento según la reivindicación 7, caracterizado porque los filtros UV se encuentran en forma de partícula.
9. Procedimiento según la reivindicación 8, caracterizado porque el tamaño de los filtros UV en forma de partícula es de 10 nm hasta 100 μm.
10. Procedimiento según una de las reivindicaciones de la 7 a la 9, caracterizado porque antes o después del procedimiento se incorporan aditivos.
- 20 11. Procedimiento según una de las reivindicaciones de la 7 a la 10, caracterizado porque los filtros UV en forma de polvo se someten a un tratamiento posterior.
12. Preparaciones con propiedades de protección frente la luz que contienen filtros UV en forma de polvo según la reivindicación 1.
- 25 13. Preparación según la reivindicación 12, caracterizada porque se trata de una preparación para la aplicación tópica.
14. Preparación según la reivindicación 12, caracterizada porque se trata de una preparación para la cosmética decorativa.
15. Preparación con propiedades de protección frente la luz según al menos una de las anteriores reivindicaciones, caracterizada porque la preparación contiene adicionalmente al menos un filtro orgánico y/o inorgánico.
- 30 16. Preparación con propiedades de protección frente la luz según al menos una de las anteriores reivindicaciones, caracterizada porque la preparación contiene al menos un autobronceador.
17. Preparación con propiedades de protección frente la luz según al menos una de las anteriores reivindicaciones, caracterizada porque la preparación contiene al menos un fotoestabilizador.
- 35 18. Preparación según la reivindicación 17, caracterizada porque el fotoestabilizador se selecciona entre los compuestos correspondientes de fórmula V



donde

R<sup>1</sup> se elige del grupo -C(O)CH<sub>3</sub>, -CO<sub>2</sub>R<sup>3</sup>, -C(O)NH<sub>2</sub> y -C(O)N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>,

40 X es O o NH;

R<sup>2</sup> representa un resto alquilo C<sub>1-30</sub> lineal o ramificado;

R<sup>3</sup> representa un resto alquilo C<sub>1-20</sub> lineal o ramificado;

todos los R<sup>4</sup> representan, independientemente entre sí, H o restos alquilo C<sub>1-8</sub> lineares o ramificados

R<sup>5</sup> representa H, un resto alquilo C<sub>1-8</sub> lineal o ramificado o un resto alquilo -O-C<sub>1-8</sub> lineal o ramificado y

5 R<sup>6</sup> representa un resto alquilo C<sub>1-8</sub>.

10 **19.** Preparación con propiedades de protección frente la luz según al menos una de las anteriores reivindicaciones, caracterizada porque la preparación contiene uno o varios filtros UV adicionales que se seleccionan entre el grupo compuesto por 3-(4'-metilbenciliden)-dl-alcanfor, metoxicinamato de octilo, 3,3,5-trimetil-ciclohexilsalicilato, 4-(dimetilamino)benzoato de 2-etilhexilo, 2-ciano-3,3-difenil-acrilato de 2-etilhexilo, ácido 2-fenil-bencimidazol-5-sulfónico, así como sus sales de potasio, sodio y trietanolamina.

**20.** Preparación con propiedades de protección frente la luz según al menos una de las anteriores reivindicaciones adecuadas para la protección de células corporales frente el estrés oxidativo, caracterizada porque preferentemente contiene uno o varios antioxidantes.

15 **21.** Preparación con propiedades de protección frente la luz según al menos una de las anteriores reivindicaciones, caracterizada porque se trata de una emulsión sin emulsionante.

**22.** Procedimiento para la elaboración de una preparación, caracterizado porque un filtro UV según la reivindicación 1 se mezcla con un vehículo cosmética o dermatológicamente adecuado y, en caso necesario, otros ingredientes.