

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 505 316**

51 Int. Cl.:

**C07C 255/31** (2006.01)

**C07C 317/32** (2006.01)

**A61K 8/41** (2006.01)

**A61Q 17/04** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **11.12.2006 E 06841328 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **23.07.2014 EP 1963257**

54 Título: **Derivados de merocianina**

30 Prioridad:

**20.12.2005 EP 05112477**

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

**09.10.2014**

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)  
Carl Bosch Strasse 38  
67056 Ludwigshafen, DE**

72 Inventor/es:

**WAGNER, BARBARA;  
WALTHER, ASTRID y  
HERZOG, BERND**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 505 316 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).

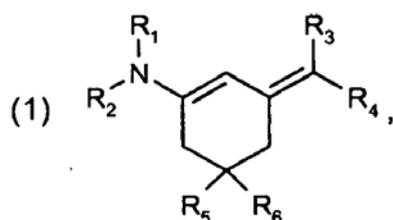
## DESCRIPCIÓN

Derivados de merocianina.

5 El documento US 2005/0255055 divulga el uso de derivados de merocianina específicos como absorbentes de UV para una aplicación cosmética. Se divulgan compuestos en los que el grupo amino acíclico está unido a un núcleo de (ciclohex-2-enilideno) que también posee un átomo de hidrógeno como sustituyente.

El documento WO 2005/058269 describe el uso de derivados de merocianina di-, tri- o tetrámeros como absorbentes de UV para una aplicación cosmética.

La presente invención se refiere a los compuestos de fórmula:



en la que

10  $R_1$  y  $R_2$  son idénticos y son alquilo  $C_4-C_{22}$  ramificado; o alquenilo  $C_4-C_{12}$  ramificado;

$R_3$  y  $R_4$ , independientemente entre sí, son ciano;  $COR_7$ ,  $COOR_7$ ;  $CONR_7R_8$ ;  $SO_2$ (arilo  $C_6-C_{12}$ );  $alq(C_2-C_{12})-1-enilo$ ;  $cicloalq(C_3-C_{12})-1-enilo$ ;  $alq(C_2-C_{12})-1-inilo$ ; heteroalquilo  $C_2-C_{12}$ ; heterocicloalquilo  $C_3-C_5$ ; arilo  $C_6-C_{10}$ ; o heteroarilo  $C_1-C_9$ ; en la que al menos uno de  $R_3$  y  $R_4$  es ciano;

$R_5$  y  $R_6$ , independientemente entre sí, son hidrógeno; o alquilo  $C_1-C_6$ ; y

15  $R_7$  y  $R_8$ , independientemente entre sí, son hidrógeno; alquilo  $C_1-C_{22}$ ; alquenilo  $C_2-C_{12}$ ; alquinilo  $C_2-C_{12}$ ; cicloalquilo  $C_3-C_{12}$ ; cicloalquenilo  $C_3-C_{12}$ ;  $-(CH_2)_tCOOH$ ; aralquilo  $C_7-C_{12}$ ; heteroalquilo  $C_1-C_{12}$ ; heteroaralquilo  $C_2-C_{11}$ ; arilo  $C_6-C_{10}$ ; heteroarilo  $C_1-C_9$ .

El alquilo (para las definiciones de  $R_5$ ,  $R_6$ ,  $R_7$  y  $R_8$ ), cicloalquilo, alquenilo o cicloalquenilo pueden ser de cadena lineal o ramificada, monocíclicos o policíclicos.

20 Alquilo es, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, 2-pentilo, 3-pentilo, 2,2-dimetilpropilo, n-hexilo, n-octilo, 1,1,3,3-tetrametilbutilo, 2-etilhexilo, nonilo, decilo, n-octadecilo, eicosilo o dodecilo.

Los ejemplos de alquilo ramificado (para las definiciones de  $R_1$  y  $R_2$ ) son 1-metilpropilo; 1,3-dimetilbutilo; 2-metilbutilo; 1,1,3,3-tetrametilbutilo; 3-metilbutilo; 7-metiloctilo; 2-etilhexilo; o 4-metilciclohexilo.

25 Alquenilo es, por ejemplo, alquenilo  $C_2-C_{12}$  de cadena lineal, o preferiblemente alquenilo  $C_3-C_{12}$  ramificado, tal como vinilo, alilo, 2-propen-2-ilo, 2-buten-1-ilo, 3-buten-1-ilo, 1,3-butadien-2-ilo, 2-ciclobuten-1-ilo, 2-penten-1-ilo, 3-penten-2-ilo, 2-metil-1-buten-3-ilo, 2-metil-3-buten-2-ilo, 3-metil-2-buten-1-ilo, 1,4-pentadien-3-ilo, 2-ciclopenten-1-ilo, 2-ciclohexen-1-ilo, 3-ciclohexen-1-ilo, 2,4-ciclohexadien-1-ilo, 1-p-menten-8-ilo, 4(10)-tujen-10-ilo, 2-norbornen-1-ilo.

30 Alquenilo es, por ejemplo, alquenilo  $C_2-C_{12}$  de cadena lineal, o preferiblemente alquenilo  $C_3-C_{12}$  ramificado, tal como vinilo, alilo, 2-propen-2-ilo, 2-buten-1-ilo, 3-buten-1-ilo, 1,3-butadien-2-ilo, 2-ciclobuten-1-ilo, 2-penten-1-ilo, 3-penten-2-ilo, 2-metil-1-buten-3-ilo, 2-metil-3-buten-2-ilo, 3-metil-2-buten-1-ilo, 1,4-pentadien-3-ilo, 2-ciclopenten-1-ilo, 2-ciclohexen-1-ilo, 3-ciclohexen-1-ilo, 2,4-ciclohexadien-1-ilo, 1-p-menten-8-ilo, 4(10)-tujen-10-ilo, 2-norbornen-1-ilo, 2,5-norbornadien-1-ilo, 7,7-dimetil-2,4-norcaradien-3-ilo o los diferentes isómeros de hexenilo, octenilo, nonenilo, decenilo o dodecenilo.

35 Cicloalquilo  $C_5-C_8$  es, por ejemplo, ciclopentilo, trimetilciclohexilo, ciclooctilo o, preferiblemente, ciclohexilo.

Heteroarilo  $C_1-C_9$  es un radical insaturado o aromático que tiene  $4n+2$   $\pi$ -electrones conjugados, por ejemplo, 2-tienilo, 2-furilo, 2-piridilo, 2-tiazolilo, 2-oxazolilo, 2-imidazolilo, isotiazolilo, triazolilo, tetrazolilo u otro sistema de anillos seleccionado de anillos tiofeno, furano, piridina, tiazol, oxazol, imidazol, isotiazol, triazol, piridina y benceno, que no están sustituidos o están sustituidos con 1 a 6 etilos, metilos, etilenos y/o metilenos, tales como benzotriazolilo, y en el caso de N-heterociclos, opcionalmente en la forma de sus N-óxidos.

Se prefieren los compuestos de fórmula (1), en la que:

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son idénticos y son alquilo C<sub>4</sub>-C<sub>22</sub> ramificado; o alqueno C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> ramificado;

R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub>, independientemente entre sí, son ciano; COR<sub>7</sub>, COOR<sub>7</sub>; CONR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>; SO<sub>2</sub>(arilo C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>);

R<sub>5</sub> y R<sub>6</sub>, independientemente entre sí, son hidrógeno; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; cicloalquilo C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub> que puede estar sustituido con uno o más de un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

5 R<sub>7</sub> y R<sub>8</sub>, independientemente entre sí, son hidrógeno; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>22</sub>.

Los compuestos más preferidos de fórmula (1) son los compuestos en los que:

R<sub>3</sub> es ciano;

R<sub>4</sub> es ciano; COR<sub>7</sub>, COOR<sub>7</sub>; CONR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>; SO<sub>2</sub>(arilo C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>); y

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub> y R<sub>8</sub> son como se definió en la fórmula (1).

10 Lo más preferido son los compuestos de fórmula (1), en la que:

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> se seleccionan de 1-metilpropilo; 1,3-dimetilbutilo; 2-metilbutilo; 1,1,3,3-tetrametilbutilo; 3-metilbutilo; 7-metiloctilo; 2-etilhexilo; 4-metilciclohexilo; y 2-metil-2-propeno.

Se prefieren más los compuestos de fórmula (1), en la que:

R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son -C≡N.

15 También se prefieren los compuestos de fórmula (1), en la que:

R<sub>3</sub> es -C≡N;

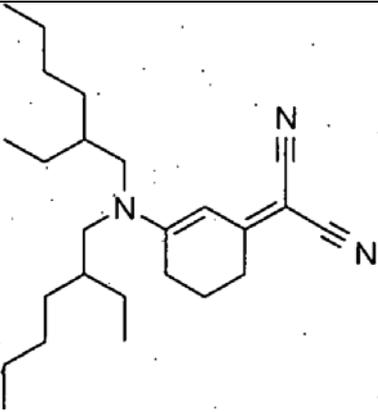
R<sub>4</sub> es COR<sub>7</sub>, COOR<sub>7</sub>; CONR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>; o SO<sub>2</sub>(arilo C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>); y

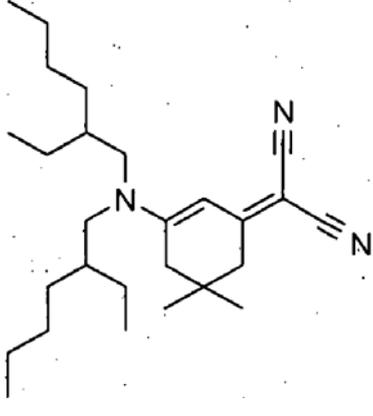
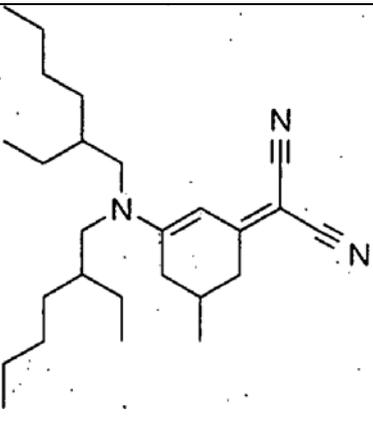
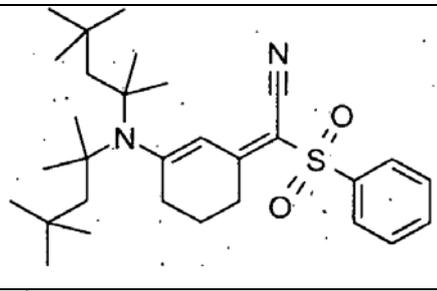
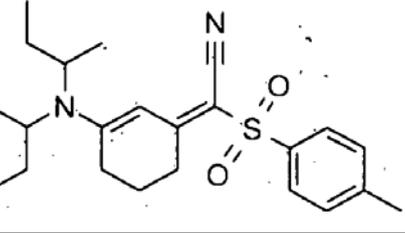
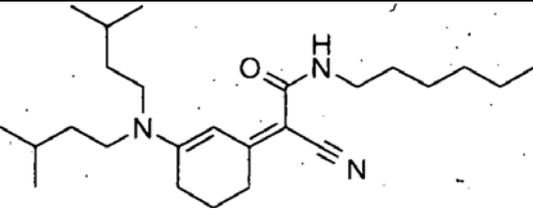
R<sub>7</sub> y R<sub>8</sub> son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

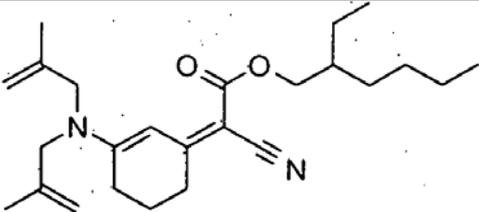
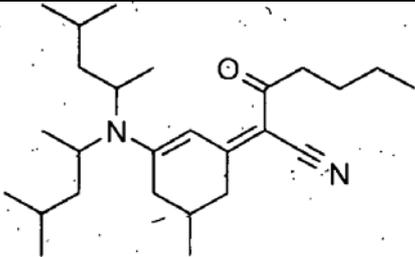
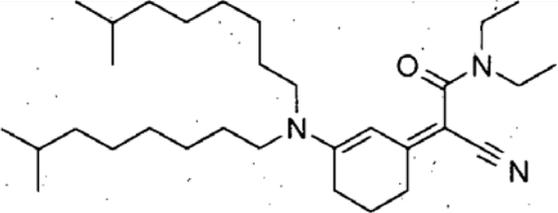
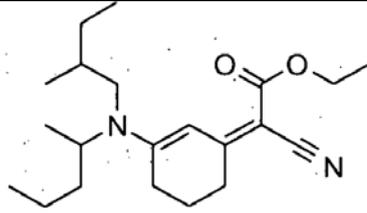
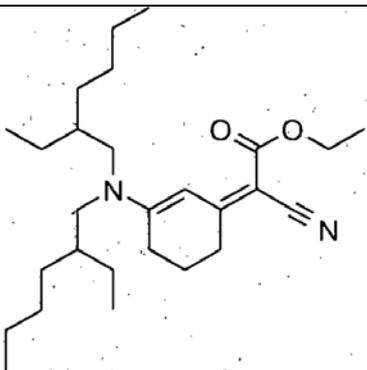
Los ejemplos de derivados de merocianina cíclicos según la presente invención se listan en la tabla 1.

20

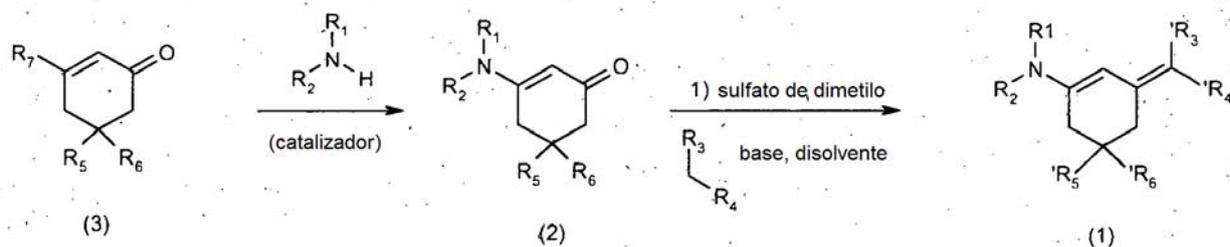
Tabla 1

MC 01	
-------	--

<p>MC 02</p>	
<p>MC 03</p>	
<p>MC 04</p>	
<p>MC 05</p>	
<p>MC 06</p>	

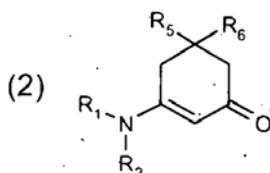
MC 07	
MC 08	
MC 09	
MC 10	
MC 11	

La preparación de los compuestos de fórmula (1) puede realizarse según procedimientos conocidos de la técnica anterior tal como se describe, por ejemplo, en el documento US-A-4.749.643 en la columna 13, línea 66-columna 15, línea 13, y en las referencias citadas en el mismo.



R<sub>7</sub> = OH, OTs, OMs, Cl, F, Br

Los compuestos de fórmula (1) pueden prepararse comenzando a partir de la 1-aminociclohexanona-3 de fórmula:



que está alquilada con sulfato de dimetilo o con otro agente alquilante, tal como sulfato de dietilo o yoduro de metilo.

5 En una segunda etapa, la mezcla de reacción se trata con el compuesto activo de metileno CH<sub>2</sub>R<sub>3</sub>R<sub>4</sub> en presencia de una base. El compuesto de fórmula (2), el agente alquilante, CH<sub>2</sub>R<sub>3</sub>R<sub>4</sub>, y la base se hacen reaccionar en proporciones aproximadamente equimolares.

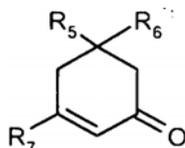
A veces se prefiere un exceso del agente alquilante, CH<sub>2</sub>R<sub>3</sub>R<sub>4</sub> y la base con relación al compuesto de fórmula (2).

10 La reacción de alquilación del compuesto de partida de fórmula (2) con un agente alquilante adecuado, tal como sulfato de dimetilo, puede realizarse sin utilizar ningún disolvente o en un disolvente adecuado, preferiblemente en disolventes alifáticos o aromáticos, tales como hexano, tolueno, benceno o xileno. También son adecuados los disolventes próticos, tales como metanol, etanol, isobutanol, terc-butanol o isopropanol. La reacción también puede realizarse en sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona, dimetilformamida o dimetilacetamida. Los compuestos etéreos, tales como dietil éter y tetrahidrofano, o los disolventes halogenados, tales como cloroformo o diclorometano, también son disolventes adecuados, así como las mezclas de estos disolventes.

15 En el procedimiento de preparación de la presente invención, el compuesto CH<sub>2</sub>R<sub>3</sub>R<sub>4</sub> se hace reaccionar en presencia de una base inorgánica u orgánica. Los ejemplos típicos de una base orgánica son las aminas, tales como trietilamina, base de Hünig, DBU (1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno), DBN (1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno), p-dimetilaminopiridina y N,N,N',N'-tetrametilguanidina. También son bases adecuadas los alcóxidos (por ejemplo, metóxido de sodio, etóxido de sodio, t-butoxido de potasio). También son adecuadas las bases inorgánicas, tales como NaH, LiOH y carbonato de potasio.

La reacción puede realizarse a una temperatura entre -78 °C y el punto de ebullición de la mezcla de reacción, preferiblemente de 60 °C a 120 °C.

Los compuestos de fórmula (2) pueden prepararse comenzando a partir de la 1-aminociclohexanona-3 de fórmula

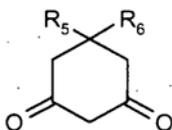


general:

25 en la que que R<sub>7</sub> es hidroxilo, etoxi, metoxi, cloro, bromo, flúor, OTs (Ts es tosilo, -SO<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>-CH<sub>3</sub>) u OMs (Ms es mesilo, -SO<sub>2</sub>Me), que se condensa con una amina secundaria R<sub>1</sub>R<sub>2</sub>NH.

30 Las reacciones de condensación de los compuestos de fórmula (2) con los compuestos de fórmula (3) pueden realizarse según procedimientos conocidos en la técnica anterior, tal como se describe, por ejemplo, en J. Org. Chem., 1981 (46) en las páginas 197-201; Synthesis, 1981, en las páginas 880-881; Acta Chemica Scandinavica, 1970 (24), en las páginas 2075-2083; o según se describe en la patente DE-614195 y las referencias citadas en ella.

Los compuestos de fórmula (2) se preparan preferiblemente mediante la reacción de una ciclohexan-1,3-diona de fórmula (4):



5 con una amina secundaria  $R_1R_2NH$  en proporciones aproximadamente equimolares. La reacción se realiza preferiblemente en un autoclave. La reacción puede realizarse en un disolvente adecuado, preferiblemente en disolventes alifáticos o aromáticos, tales como hexano, tolueno, benceno o xileno.

10 También son adecuados los disolventes próticos, tales como metanol, etanol, isobutanol, terc-butanol o isopropanol. La reacción también puede realizarse en sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona, dimetilformamida o dimetilacetamida. Los compuestos etéreos, tales como éter dietílico y tetrahidrofano, o los disolventes halogenados, tales como cloroformo o diclorometano, también son disolventes adecuados, así como las mezclas de estos disolventes.

La reacción puede realizarse a unas temperaturas entre 0 °C y 300 °C, preferiblemente entre 60 °C y 230 °C, y lo más preferiblemente entre 80 °C y 180 °C.

15 La reacción también puede realizarse en presencia de un catalizador ácido. El catalizador ácido puede ser un ácido de Lewis inorgánico u orgánico, o un ácido de Bronsted inorgánico u orgánico. Los ejemplos de catalizadores ácidos pueden ser el ácido fosfórico, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metansulfónico, ácido p-toluensulfónico, ácido trifluorometansulfónico, ácido bencensulfónico, ácido clorhídrico o ácido sulfúrico. También son catalizadores eficaces los anhídridos de ácido, tales como anhídrido del ácido trifluorometansulfónico, anhídrido del ácido metansulfónico, anhídrido acético. Los ejemplos de ácidos de Lewis son el cloruro de fosforilo,  $CuCl_2$ ,  $ZnCl_2$ ,  $LaCl_3$ ,  $CrCl_3$ ,  $FeCl_3$ ,  $AlCl_3$ ,  $HfCl_4$ ,  $TiCl_4$ , trifluorometansulfonato de escandio  $Sc(OTf)_3$ , así como sus hidratos. También son adecuados los intercambiadores de iones ácidos.

20 Los compuestos de fórmula (1) según la presente invención son particularmente adecuados como filtros de UV, es decir, para proteger a materiales orgánicos sensibles al ultravioleta, en particular la piel y el pelo de seres humanos y animales, frente a los efectos perjudiciales de la radiación UV. Por tanto, estos compuestos son adecuados como protectores solares en preparaciones médicas veterinarias, farmacéuticas y cosméticas. Estos compuestos pueden utilizarse en forma disuelta y en el estado micronizado.

Los absorbentes de UV según la presente invención se emplean preferiblemente en el estado disuelto (filtros orgánicos solubles, filtros orgánicos solubilizados).

Los compuestos de la presente invención muestran un excelente comportamiento de solubilidad en aceites cosméticos, según se lista en la siguiente tabla 2.

30 Tabla 2: Comportamiento de solubilidad [%] de los compuestos de la presente invención

Estructura	Disolvente							
	(agua)	ciclo- meticona	Finsolve TN	migliol	propilen- glicol	aceite mineral	poli- deceno	aceite de yoyoba
	0,000	0,540	> 50	> 50	0,766	1,514	0,734	> 50
	0,000	0,509	> 5	> 5	0,361	0,569	0,367	2,470

## ES 2 505 316 T3

Las formulaciones cosméticas o las composiciones farmacéuticas según la presente invención pueden contener también uno o más de uno de otros filtros de UV, según se lista en la tabla 3.

5

Tabla 3: Sustancias filtros de UV adecuadas que también pueden utilizarse con los absorbentes de UV según la presente invención

(Abreviaturas: T, tabla; R., fila; Comp., compuesto; Ej.; compuesto o compuestos del ejemplo de la patente; p., página; el alcance genérico de los absorbentes de UV se describe en la columna de la izquierda; los compuestos específicos se indican en la columna de la derecha)

DE 10013318	T1, pp. 8-9, todos los ejemplos, pp. 10-13, T2, pp. 13-14, todos los ejemplos, p. 14, Ej. A, B, C, D, E, F, pp. 19-20
DE 10206562 A1	Ej. 1-3, p. 10, Ej. 4-7, p. 11, Ej. 8-15, pp. 12-14
DE 10238144 A1	Ej. en p. 3-5
DE 10331804	T1, p. 4, T2 + 3, p. 5
DE 19704990 A1	Ej. 1-2 en pp. 6-7
EP 613 893	Ej. 1-5 + 15, T1, pp. 6-8
EP 0 998 900 A1	Ej. en pp. 4-11
EP 1 000 950	Comp. en la tabla 1, pp. 18-21
EP 1 005 855	T3, p. 13
EP 1 008 586	Ej. 1-3, pp. 13-15
EP 1 008 593	Ej. 1-8, pp. 4-5
EP 1 027 883	Compuesto VII, p. 3
EP 1 027 883	Comp. I-VI, p. 3
EP 1 028 120	Ej. 1-5, pp. 5-13
EP 1 059 082	Ej. 1; T1, pp. 9-11
EP 1 060 734	T 1-3, pp. 11-14
EP 1 064 922	Compuestos 1-34, pp. 6-14
EP 1 077 246 A2	Ej. 1-16 en pp. 5-11
EP 1 081 140	Ej. 1-9, pp. 11-16
EP 1 103 549	Compuestos 1-76, pp. 39-51
EP 1 108 712	4,5-dimorfolino-3-hidroxipiridazina
EP 1 123 934	T3, p. 10
EP 1 129 695	Ej. 1-7, pp. 13-14
EP 1 167 359	Ej. 1, p. 11 y Ej. 2, p. 12
EP 1 232 148 B1	Ej. 4-17 en pp. 3-5
EP 1 258 481	Ej. 1, pp. 7, 8
EP 1 310 492 A1	Ej. 1-16 en pp. 22-30

## ES 2 505 316 T3

EP 1 371 654 A1	Ej. en pp. 5-7
EP 1 380 583 A2	Ej. 1, p. 6
EP 1 423 351 A2	Ej. 1-16 en pp. 31-37
EP 1 423 371 A1	T1 en pp. 4-8, Ej. en p. 9, Ej. 1-9 en pp. 36-42
EP 1 454 896 A1	Ej. 1-5 en pp. 10-13, ejemplos en pp. 4-5
EP 1 471 059 A1	Ej. 1-5 en pp. 4-5
EP 1 484 051 A2	Fórmula III-VII en pp. 18-19, Ej. 7-14 en pp. 7-9, Ej. 18-23 en pp. 11-12, Ej. 24-40 en pp. 14-17
EP 420 707 B1	Ej. 3, p. 13 (n.º de registro CAS 80142-49-0)
EP 503 338	T1, pp. 9-10
EP 517 103	Ej. 3,4,9,10, pp. 6-7
EP 517 104	Ej. 1, T1, pp. 4-5; Ej. 8, T2, pp. 6-8
EP 626 950	todos los compuestos
EP 669 323	Ej. 1-3, p. 5
EP 743 309 A1	Ej. 1-12 en pp. 18-24
EP 780 382	Ej. 1-11, pp. 5-7
EP 823 418	Ej. 1-4, pp. 7-8
EP 826 361	T1, pp. 5-6
EP 832 641	Ej. 5+6, p. 7; T2, p. 8
EP 832 642	Ej. 22, T3, pp. 10-15; T4, p. 16
EP 852 137	T2, pp. 41-46
EP 858 318	T1, p. 6
EP 863 145	Ej. 1-11, pp. 12-18
EP 878 469 A1	T1, pp. 5-7
EP 895 776	Comp. en las filas 48-58, p. 3, R. 25+33, p. 5
EP 911 020	T2, pp. 11-12
EP 916 335	T2-4, pp. 19-41
EP 924 246	T2, p. 9
EP 933 376	Ej. 1-15, pp. 10-21
EP 944 624	Ej. 1+2, pp. 13-15
EP 945 125	T3 a+b, pp. 14-15
EP 95 097	Ej. 1, p. 4
EP 967 200	Ej. 2; T3-5, pp. 17-20
EP 969 004	Ej. 5, T1, pp. 6-8

## ES 2 505 316 T3

FR 2842806 A1	Ej. I, p. 10, Ej. II, p. 12
FR 2861075 A1	Ej. 1-3 en pp. 12-14
FR 2862641	Fórmula 3 en p. 4; Ej. A-J en pp. 7-9
KR 2004025954	todos los derivados de benzoato de kojilo
JP 06135985 A2	Fórmula 1 en p. 2; Ej. 1-8 en pp. 7-8
JP 2000319629	n. <sup>os</sup> de registro CAS 80142-49-0, 137215-83-9, 307947-82-6
JP 2003081910 A	Ej. en p. 1
JP 3686911 B2	Todos los derivados de benciliden-gamma-butirolactona
US 2003/0053966 A1	Ej. en pp. 3-6
US 2004057912 A1	Ej. en p. 7-9, Ej. 1 en p. 10
US 2004057914 A1	Ej. en p. 8-12, Ej. 1 en p. 12
US 2004/0057911 A1	Fórmula I y II en p. 1; fórmula III y IV en p. 3; Ej. 1-3 en pp. 5-6
US 2004/0071640 A1	Ej. 1-12 en pp. 4-7
US 2004/0091433 A1	Ej. 1-6 en pp. 14-16
US 2004/0136931 A1	Ej. 1-3 en p. 7
US 2004/0258636 A1	Ej. 1-11 en pp. 9-15
US 2005/0019278A1	Ej. 1-9 en pp. 6-8
US 2005/0136012 A1	Fórmula 1 en p. 2
US 2005/0136014 A1	Fórmula a-c en p. 2; Ejemplos en p. 3
US 2005/0201957 A1	Fórmula, 1 en p. 1; Ej. A, B, C, D, E, F, G en pp. 2-3
US 2005/0249681 A1	Todos los compuestos en pp. 2-3, Ej. 1 en p. 6
US 5 635 343	Todos los compuestos en pp. 5-10
US 5 332 568	Ej. 1, p. 5, T1+2, pp. 6-8
US 5 338 539	Ej. 1-9, pp. 3+4
US 5 346 691	Ej. 40, p. 7; T5, p. 8
US 5 801 244	Ej. 1-5, pp. 6-7
US 6 613 340	Ej. I, II pp. 9-11, Ejemplos en las filas 28-53, p. 6
US 6 800 274 B2	Fórmulas I-VI y IX-XII en pp. 14-18
US 6 890 520 B2	Ej. 1-10 en pp. 6-9
US 6 926 887 B2	Ej. A en pp. 5/6; Fórmulas I-VIII en pp. 27-29
US 6 936 735 B2	Fórmula 1-2 en p. 2; fórmula 3-4 en p. 6
WO 0149686	Ej. 1-5, pp. 16-21
WO 0168047	Tablas en pp. 85-96
WO 0181297	Ej. 1-3, pp. 9-11

## ES 2 505 316 T3

WO 0191695	Fórmula I en p. 4, T en p. 8
WO 0202501 A1	Ej. la-c, p. 5
WO 02069926 A1	Ej. en p. 9, Ej. en pp. 17-23
WO 02072583	T en pp. 68-70
WO 02080876	Ej. 1 en pp. 7-9
WO 0238537	Todos los compuestos, p. 3, compuestos en las filas 1-10, p. 4
WO 03004557 A1	Ej. A1-A29 en pp. 36-57
WO 03007906	Ej. I-XXIII, pp. 42-48
WO 03086341 A2	Fórmula 2-21, pp. 4-6
WO 03092643 A1	T en pp. 34-35, compuestos listados en p. 16
WO 03097577 A1	Ej. en pp. 6-8; Ej. 1-3 en pp. 15-18
WO 03104183 A1	Fórmula I-IV en p. 1; Ej. 1-5 en pp. 27-28
WO 04000256 A1	Ej. 1-10 en pp. 18-24
WO 04020398 A1	Ej. 1-3 en pp. 14-17
WO 04020398 A1	Fórmulas I-VI en pp. 21-24, Fórmula IX en p. 25
WO 05009938 A2	Fórmula I en p. 1; Ej. 1-2 en pp. 14-15
WO 05065154 A2	Fórmula a-c en pp. 5-6
WO 05080341 A1	Fórmula 1 en p. 3; Ejemplos en pp. 9-13
WO 9217461	Ej. 1-22, pp. 10-20
WO 9220690	Comp. polimérico en los ejemplos 3-6
WO 9301164	T1+2, pp. 13-22
WO 9714680	Ej. 1-3, p. 10

5 Las preparaciones cosméticas o farmacéuticas pueden prepararse mezclando físicamente el absorbente o absorbentes de UV con el adyuvante utilizando procedimientos convencionales, por ejemplo, simplemente agitando juntos los componentes individuales, en especial aprovechando las propiedades de disolución de absorbentes de UV cosméticos que ya son conocidos, tales como metoxicinamato de octilo, éster isoocílico del ácido salicílico, etc. El absorbente de UV puede utilizarse, por ejemplo, sin más tratamiento, o en estado micronizado, o en forma de un polvo.

Las preparaciones cosméticas o farmacéuticas contienen del 0,05-40% en peso, basado en el peso total de la composición de un absorbente de UV o mezclas de absorbentes de UV.

10 Se da preferencia al uso de unas proporciones de mezclado del absorbente de UV de fórmula (1) según la presente invención y opcionalmente otros agentes fotoprotectores (según se describe en la tabla 2) de 1:99 a 99:1, preferiblemente de 1:95 a 95:1, y lo más preferiblemente de 10:90 a 90:10, basado en el peso. Tienen un interés especial las proporciones de mezclado de 20:80 a 80:20, preferiblemente de 40:60 a 60:40, y lo más preferiblemente de aproximadamente 50:50. Estas mezclas pueden utilizarse, entre otras utilidades, para mejorar la solubilidad o para aumentar la absorción de UV.

15 Los absorbentes de UV de fórmula (1) según la presente invención o las combinaciones de filtros de UV son útiles para proteger la piel, el cabello y/o el color del pelo natural o artificial.

Las preparaciones cosméticas o farmacéuticas pueden ser, por ejemplo, cremas, geles, lociones, disoluciones alcohólicas y acuosas/alcohólicas, emulsiones, composiciones de cera/grasa, preparaciones en barra, polvos o ungüentos. Además de los filtros de UV mencionados anteriormente, las preparaciones cosméticas o farmacéuticas pueden contener otros adyuvantes, según se describe a continuación.

- 5 Como emulsiones que contienen agua y aceite (por ejemplo, emulsiones o microemulsiones de agua en aceite, de aceite en agua, de aceite en agua en aceite y de agua en aceite en agua), las preparaciones contienen, por ejemplo, del 0,1 al 30% en peso, preferiblemente del 0,1 al 15% en peso, y en especial del 0,5 al 10% en peso, basado en el peso total de la composición, de uno o más absorbentes de UV, del 1 al 60% en peso, en especial del 5 al 50% en peso, y preferiblemente del 10 al 35% en peso, basado en el peso total de la composición, de al menos un componente de aceite, del 0 al 30% en peso, en especial del 1 al 30% en peso, y preferiblemente del 4 al 20% en peso, basado en el peso total de la composición, de al menos un emulgente, del 10 al 90% en peso, en especial del 30 al 90% en peso, basado en el peso total de la composición, de agua, y del 0 al 88,9% en peso, en especial del 1 al 50% en peso, de otros adyuvantes cosméticamente aceptables.

- 15 Las composiciones/preparaciones cosméticas o farmacéuticas según la invención también pueden contener uno o más compuestos adicionales, tales como alcoholes grasos, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos naturales o sintéticos, que incluyen ésteres de glicerilo y derivados, ceras perlescentes, aceites de hidrocarburos, siliconas o siloxanos (polisiloxanos organosustituídos), aceites fluorados o perfluorados, emulgentes, agentes supergrasos, tensioactivos, reguladores de la consistencia/espesantes y modificadores de la reología, polímeros, ingredientes activos biogénicos, ingredientes activos desodorantes, agentes anticaspa, antioxidantes, agentes hidrotrópicos, conservantes y agentes inhibidores de bacterias, aceites de perfume, colorantes, esferas poliméricas o esferas huecas como potenciadores de SPF.

#### Preparaciones cosméticas o farmacéuticas

Las formulaciones cosméticas o farmacéuticas están contenidas en una amplia variedad de preparaciones cosméticas. Se toman en consideración, por ejemplo, en especial las siguientes preparaciones:

- 25 - preparaciones para el cuidado de la piel, por ejemplo, preparaciones de lavado y limpieza de la piel en forma de comprimidos o jabones líquidos, detergentes sin jabón o pastas de lavado;
- preparaciones para el baño, por ejemplo, preparaciones para el baño líquidas (espumas de baño, leches, preparaciones para la ducha) o sólidas, por ejemplo, cubitos para el baño y sales de baño;
- 30 - preparaciones para el cuidado de la piel, por ejemplo, emulsiones para la piel, multiemulsiones o aceites para la piel;
- preparaciones para el cuidado personal cosméticas, por ejemplo, maquillaje facial en forma de cremas para día o cremas en polvo, polvos faciales (suelos o comprimidos), colorete o maquillaje en crema, preparaciones para el cuidado de los ojos, por ejemplo, preparaciones de sombra de ojos, máscaras, lápiz delineador, cremas para los ojos, o cremas de fijado para los ojos; preparaciones para el cuidado de los labios, por ejemplo, barras de labios, brillo de labios, lápices de contorno de labios, preparaciones para el cuidado de las uñas, tales como barniz de uñas, eliminadores del barniz de uñas, endurecedores de uñas o eliminadores de cutículas;
- 35 - preparaciones para el cuidado de los pies, por ejemplo, baños para pies, polvos para pies, cremas para pies o bálsamos para pies, desodorantes y antiperspirantes especiales o preparaciones para eliminar los callos;
- 40 - preparaciones fotoprotectoras, tales como leches solares, lociones, cremas o aceites, pantallas solares o tropicales, preparaciones de prebronceado o preparaciones para después del sol;
- preparaciones para el bronceado de la piel, por ejemplo, cremas autobronceadoras;
- preparaciones de despigmentación, por ejemplo, preparaciones para blanquear la piel o preparaciones para aclarar la piel;
- repelentes de insectos, por ejemplo, aceites, lociones, pulverizados o barras repelentes de insectos;
- 45 - desodorantes, tales como pulverizados desodorantes, pulverizados de acción de bomba, geles, barras o aplicadores con tapón de bola desodorantes;
- antiperspirantes, por ejemplo, barras, cremas o aplicadores con tapón de bola antiperspirantes;
- preparaciones para limpiar y cuidar pieles estropeadas, por ejemplo, detergentes sintéticos (sólidos o líquidos), preparaciones para exfoliar o suavizar, o mascarillas exfoliantes;

- preparaciones para eliminar el vello de forma química (depilación), por ejemplo, polvos para eliminar el vello, preparaciones para eliminar el vello líquidas, preparaciones para eliminar el vello en forma de crema o pasta, preparaciones para eliminar el vello en forma de gel o espumas en aerosol;

5 - preparaciones para el afeitado, por ejemplo, jabón para el afeitado, cremas para el afeitado formadoras de espuma, cremas, espumas y geles para el afeitado que no forman espuma, preparaciones para antes del afeitado para un afeitado en seco, cremas para después del afeitado o lociones para después del afeitado;

- preparaciones de fragancias, por ejemplo, fragancias (agua de colonia, eau de toilette, eau de parfum, parfum de toilette, perfume), aceites de perfume o cremas de perfume;

10 - preparaciones para el tratamiento del cabello cosméticas, por ejemplo, preparaciones para el lavado del cabello en forma de champús y acondicionadores, preparaciones para el cuidado del cabello, por ejemplo, preparaciones de pretratamiento, tónicos para el cabello, cremas para modelar el cabello, geles para modelar el cabello, pomadas, enjuagues para el cabello, paquetes de tratamiento, tratamientos intensivos para el cabello, preparaciones para estructurar el cabello, por ejemplo, preparaciones para formar ondas en el cabello para ondas de permanente (ondas en caliente, formación suave de ondas, ondas en frío), preparaciones para alisar el cabello, preparaciones para fijar el cabello líquidas, espumas para el cabello, lacas de pelo, preparaciones para aclarar el cabello, por ejemplo, disoluciones de peróxido de hidrógeno, champús para aclarar el cabello, cremas para aclarar el cabello, polvos para aclarar el cabello, aceites o pastas para aclarar el cabello, colorantes para el cabello temporales, semipermanentes o permanentes, preparaciones que contienen tintes autooxidantes, o colorantes para el cabello naturales, tales como henna o camomila.

20 Formas de presentación

Las formulaciones finales listadas pueden existir en una amplia diversidad de formas de presentación, por ejemplo:

- en forma de preparaciones líquidas, como una emulsión de agua en aceite, de aceite en agua, de aceite en agua en aceite, de agua en aceite en agua o PIT y todos los tipos de microemulsiones;

- en forma de un gel;

25 - en forma de un aceite, una crema, leche o loción;

- en forma de un polvo, una laca, un comprimido o maquillaje;

- en forma de una barra;

- en forma de un pulverizado (pulverizado con un gas propelente o un pulverizado de acción de bomba) o un aerosol;

- en forma de una espuma; o

30 - en forma de una pasta.

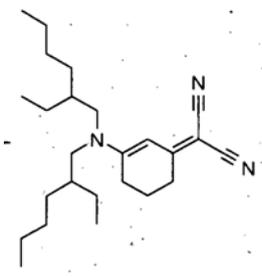
De especial importancia como preparaciones cosméticas para la piel son las preparaciones fotoprotectoras, tales como leches solares, lociones, cremas, aceites, pantallas solares o tropicales, preparaciones de prebronceado o preparaciones para después del sol, y también preparaciones para broncear la piel, por ejemplo, cremas autobronceadoras. De particular interés son las cremas de protección solar, lociones de protección solar, leche de protección solar y preparaciones de protección solar en forma de un pulverizado.

35 De especial importancia como preparaciones cosméticas para el cabello son las preparaciones mencionadas anteriormente para el tratamiento del cabello, en especial preparaciones para el lavado del cabello en forma de champús, acondicionadores para el cabello, preparaciones para el cuidado del cabello, por ejemplo, preparaciones de pretratamiento, tónicos para el cabello, cremas para modelar el cabello, geles para modelar el cabello, pomadas, enjuagues para el cabello, paquetes de tratamiento, tratamientos intensivos para el cabello, preparaciones para alisar el cabello, preparaciones para fijar el cabello líquidas, espumas para el cabello y lacas de pelo. De especial interés son las preparaciones para el lavado del cabello en forma de champús.

40 Un champú tiene, por ejemplo, la siguiente composición: del 0,01 al 5% en peso de un absorbente de UV según la invención, 12,0% en peso de laureth-2-sulfato de sodio, 4,0% en peso de cocamidopropilbetaína, 3,0% en peso de cloruro de sodio, y agua hasta 100%.

45 La preparación cosmética según la invención se distingue por una excelente protección de la piel humana frente al efecto perjudicial de la luz solar.

## Ejemplos de preparación



## Ejemplo 1: Preparación del compuesto de fórmula (101)

## Primera etapa:

5 Se disolvieron 9,25 g (0,08 mol) de ciclohexan-1,3-diona en 30 ml de tolueno. La mezcla se enfrió hasta 0 °C y después se añadieron 19,71 g (0,08 mol) de bis-2-etilhexilamina con agitación. La mezcla se calentó hasta 180 °C durante 4 horas en un autoclave. Después de destilar el disolvente y la amina sin reaccionar a 150 °C bajo una presión de  $1 \times 10^{-3}$  mbar se obtiene N,N-bis-2-etilhexilaminociclohexen-3-ona como un aceite marrónáceo oscuro con un rendimiento de 74%, p.e. = 180 °C (0,1 mbar).

## Segunda etapa:

10 Se añaden 3,65 g (0,028 mol) de sulfato de dimetilo gota a gota a 8,39 g (0,025 mol) de N,N-bis-2-etilhexilaminociclohexen-3-ona. La mezcla se agita durante 40 minutos a 100 °C. Después de enfriar hasta 60 °C se añade una mezcla de 1,70 g (0,0252 mol) de malononitrilo y 2,76 g (0,0271 mol) de trietilamina en 12 ml de isopropanol en 10 minutos. La mezcla resultante después se calienta a aproximadamente 90 °C durante 60 minutos. Después se aísla 2-{3-[bis-(2-etilhexil)amino]ciclohex-2-eniliden}malononitrilo mediante una destilación a 230 °C bajo una presión de 0,1 mbar para producir un aceite naranja (78%).

15

## Ejemplos de aplicación

## Ejemplo 2: Loción de protección frente a UV-A/UV-B para un uso diario de aceite en agua

	Nombre INCI	% en p/p (según se suministran)
Parte A	Dilaurato de glicerilo	2,00
	Palmitato de etilhexilo	6,00
	Alcohol cetílico	1,00
	Estearato de glicerilo	2,00
	Laureth-23	1,00
	Palmitato de isopropilo	2,00
	Tribehenina	0,80
	Cera de abeja	1,50
	Aceite de lanolina	1,00
Parte B	Agua	cs hasta 100
	Propilenglicol	4,00
	Agua (y) dióxido de titanio (y) alúmina (y) metasfosfato de sodio (y) fenoxietanol (y) metilparabeno de sodio	4,00
Parte C	Copolímero de esteareth-10 alil éter/acrilatos	1,00

Parte D	Fenoxietanol (y) metilparabeno (y) etilparabeno (y) butilparabeno (y) propilparabeno (e) isobutilparabeno	1,00
	Absorbente de UV de fórmula (101)	8,00
Parte E	Agua (e) hidróxido de sodio	cs

*Instrucciones de fabricación:*

5 La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 80 °C. La parte A se vierte en la parte B mientras se agita y se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 30 sg. Después de enfriar hasta 60 °C se incorpora la parte C. A 40 °C se añade la parte D lentamente con agitación continua. El pH se ajusta con la parte E a un valor entre 6,50-7,00.

**Ejemplo 3: Loción para la protección solar de UVA/UVB de tipo aceite en agua**

	Nombre INCI	% en p/p (según se suministran)
Parte A	Cetilfosfato de potasio	2,00
	Tricontanil PVP	1,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	5,00
	Benzoato de alquilo C12-15	5,00
	Isononanoato de cetearilo	5,00
	Estearato de glicerilo	3,00
	Alcohol cetílico	1,00
	Dimeticona	0,10
	Metoxicinamato de etilhexilo	5,00
Parte B	Agua	cs hasta 100
	Glicerina	3,00
Parte C	Copolímero de esteareth-10 alil éter/acrilatos	0,50
Parte D	Absorbente de UV de fórmula (101)	8,00
Parte E	Fenoxietanol (y) metilparabeno (y) etilparabeno (y) butilparabeno (y) propilparabeno (e) isobutilparabeno	1,00
Parte F	Agua (e) hidróxido de sodio	cs hasta pH 7,00
Parte G	Fragancia	cs

*Instrucciones de fabricación:*

10 La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 80 °C. La parte B se vierte en la parte A mientras se agita moderadamente. La mezcla se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 1 minuto. Después de enfriar hasta 70 °C se añade la parte C con agitación. Después de enfriar aún más hasta 50 °C se incorpora la parte D muy lentamente. A 40 °C se añade la parte E. A temperatura ambiente se ajusta el pH con la parte F a 7,00, y se añade la parte G.

15 **Ejemplo 4: Loción para la protección solar de UVA/UVB de tipo aceite en agua**

	Nombre INCI	% en p/p (según se suministran)
--	-------------	---------------------------------

## ES 2 505 316 T3

Parte A	Cetilfosfato de potasio	2,00
	Tricontanil PVP	1,00
	Triglicérido caprílico/cáprico	5,00
	Benzoato de alquilo C12-15	5,00
	Isononanoato de cetearilo	5,00
	Estearato de glicerilo	3,00
	Alcohol cetílico	1,00
	Dimeticona	0,10
	Metoxicinamato de etilhexilo	5,00
Parte B	Agua	cs hasta 100
	Glicerina	3,00
Parte C	Copolímero de esteareth-10 alil éter/acrilatos	0,50
Parte D	Absorbente de UV de fórmula (101)	20,00
Parte E	Fenoxietanol (y) metilparabeno (y) etilparabeno (y) butilparabeno (y) propilparabeno (e) isobutilparabeno	1,00
Parte F	Agua (e) hidróxido de sodio	cs hasta pH 7,00
Parte G	Fragancia	cs

### *Instrucciones de fabricación:*

5 La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 80 °C. La parte B se vierte en la parte A mientras se agita moderadamente. La mezcla se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 1 minuto. Después de enfriar hasta 70 °C se añade la parte C con agitación. Después de enfriar aún más hasta 50 °C se incorpora la parte D muy lentamente. A 40 °C se añade la parte E. A temperatura ambiente se ajusta el pH con la parte F a 7,00, y se añade la parte G.

### **Ejemplo 5: Loción de protección solar de agua en aceite**

	Nombre INCI	% en p/p (según se suministran)
Parte A	Aceite de ricinio hidrogenado PEG-7	3,00
	Diisoestearato de poliglicerilo-3	4,00
	Cera microcristalina	1,00
	Estearato de magnesio	1,50
	Propilparabeno	0,10
	Aceite mineral	15,00
	Octildodecanol	8,00
	Etilhexiltriazona	1,00
	Metoxicinamato de etilhexilo	2,00
Parte B	Agua	cs hasta 100

	Agua (y) ácido cítrico	0,05
	Metilparabeno	0,15
	Sulfato de magnesio	0,50
Parte C	Absorbente de UV de fórmula (101)	9,00
	Fragancia	cs

*Instrucciones de fabricación:*

La parte A se calienta hasta 80 °C con agitación. La parte B se añade a la parte A y se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 1 minuto. Después de enfriar hasta 30 °C se incorpora la parte C.

5 **Ejemplo 6: Loción de protección solar para la protección de la piel de agua en aceite**

	Nombre INCI	% en p/p (según se suministran)
Parte A	Dipoli-hidroxiestearato de poliglicerilo-2	3,00
	Oleato de glicerilo	3,00
	Isononanoato de cetearilo	7,00
	Laurato de hexilo	600
	Dicaprilil éter	6,00
	Propilparabeno	0,10
	Hexildecanol	3,00
	Estearato de magnesio	1,00
	Cera de abeja	1,00
	Metoxicinamato de etilhexilo	4,00
Parte B	Agua	cs hasta 100
	Metilparabeno	0,15
	Sulfato de magnesio	1,00
Parte C	Absorbente de UV de fórmula (101)	6,00

*Instrucciones de fabricación:*

La parte A se calienta por separado hasta 80 °C con agitación suave. La parte B se añade a la parte A y se homogeneiza durante un minuto a 11000 rpm. Después de enfriar hasta 30 °C se añade la parte C con agitación continua.

10

**Ejemplo 7: Emulsión de aceite en agua**

	Nombre INCI	% en p/p (según se suministran)
Parte A	Absorbente de UV de fórmula (101)	3 g
	Aceite de sésamo	10 g
	Estearato de glicerilo	4 g

## ES 2 505 316 T3

	Ácido esteárico	1 g
	Alcohol cetílico	0,5 g
	Polisorbato 20	0,2 g
Parte B	Propilenglicol	4 g
	Propilparabeno	0,05 g
	Metilparabeno	0,15 g
	Trietanolamina	0,1 g
	Carbómero 934	0,1 g
	Agua	hasta 100 ml

*Preparación de la emulsión:*

*Fase (A)*

- 5 En primer lugar, el absorbente de UV se disuelve en aceite de sésamo. Los otros componentes de (A) se añaden y se combinan.

*Fase (B)*

Se disuelven propilparabeno y metilparabeno en propilenglicol. Entonces se añaden 60 ml de agua, se calienta hasta 70 °C y después se emulsiona el carbómero 934.

*Emulsión*

- 10 (A) se añade lentamente a (B) con la aplicación vigorosa de energía mecánica. El volumen se ajusta a 100 ml mediante la adición de agua.

### **Ejemplo 8: Crema para el cuidado diario de tipo aceite en agua**

	Nombre INCI	% en p/p (según se emplean)
Parte A	Estearato de glicerilo (y) alcohol cetearílico (y) palmitato de cetilo (y) cocoglicéridos	4,0
	Cetareth-12	4,0
	Alcohol cetearílico	2,0
	Éter dicaprilílico	4,5
	Estearato de etilhexilo	4,0
	Laurato de hexilo	3,5
	Etilhexiltriazona	1,0
	Polisiloxano de malonato de bencilideno	2,0
	Polímero reticulado de HDI/trimetilol hexil-lactona (y) sílice	5,0
	Estearil dimeticona	1,0
	Dimeticona	2,0
	Alcohol cetílico	0,8
	Absorbente de UV de fórmula (101)	2,0

## ES 2 505 316 T3

Parte B	Agua	cs hasta 100
	Agua (y) escleroglucano (y) fenoxietanol	2,0
	Glicerol	2,0
Parte C	Copolímero de esteareth-10 alil éter/acrilato	0,45
	Fenoxietanol (y) metilparabeno (y) etilparabeno (y) butilparabeno (y) propilparabeno (e) isobutilparabeno	0,7
Parte D	Agua (y) acetato de tocoferilo (y) triglicérico caprílico/cáprico (y) polisorbato 80 (y) lecitina	4,0
Parte E	Agua (e) hidróxido de sodio	cs
	Fragancia	cs

### *Procedimiento de preparación:*

5 La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 80 °C. La parte A se vierte en la parte B mientras se agita continuamente. Después la mezcla se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 20 seg. La mezcla se enfría hasta 60 °C y se añade la parte C. A una temperatura menor que 30 °C se añade la parte D y el valor del pH se ajusta con hidróxido de sodio a un valor entre 6,5 y 7,0. Por último se añade la fragancia.

### **Ejemplo 9: Crema de protección solar, de tipo aceite en agua**

	Nombre INCI	% en p/p (según se emplean)
Parte A	Diestearato de poligliceril-3-metilglucosa	2,0
	Oleato de decilo	5,7
	Palmitato de isopropilo	5,8
	Triglicérido caprílico/cáprico	6,5
	Absorbente de UV de fórmula (101)	2,0
	Metoxicinamato de etilhexilo	5,0
	Alcohol cetílico	0,7
Parte B	Glicerol	3,0
	Carbómero	0,3
	Agua	cs hasta 100
Parte C	Fenoxietanol (y) metilparabeno (y) etilparabeno (y) butilparabeno (y) propilparabeno (e) isobutilparabeno	0,5
Parte D	Metilen-bis-benzotriazolotetrametilbutilfenol (y) agua (y) decil glucósido (y) propilenglicol (y) goma de xantano	8,0
	Agua	200
Parte E	Agua (e) hidróxido de sodio	cs
	Fragancia	cs

### *Procedimiento de preparación:*

## ES 2 505 316 T3

5 La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 75 °C. La parte A se vierte en la parte B con agitación. La mezcla se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 15 seg. La mezcla se enfría hasta 60 °C y se incorporan la parte C y la parte D. La mezcla se homogeneiza de nuevo durante un corto periodo de tiempo (5 seg/11000 rpm) y se vuelve a enfriar, con agitación moderada. El pH se ajusta a temperatura ambiente con una disolución de hidróxido de sodio a un valor de entre 5,5 y 6,0. Por último se añade la fragancia.

### Ejemplo 10: Loción de protección frente a UV para el cuidado diario

	Nombre INCI	% en p/p (según se emplean)
Parte A	Oleth-3 fosfato	0,6
	Esteareth-21	2,5
	Esteareth-2	1,0
	Alcohol cetílico	0,8
	Alcohol estearílico	1,5
	Tribehenina	0,8
	Isohexadecano	8,0
	Absorbente de UV de fórmula (101)	5,0
Parte B	Agua	cs hasta 100
	Glicerol	2,0
	Metilen-bis-benzotriazolotetrametilbutilfenol (y) agua (y) decil glucósido (y) propilenglicol (y) goma de xantano	3,0
	EDTA disodio	0,1
Parte C	Agua	20,0
	Diazolidinilurea (y) butilcarbamato de yodopropinilo	0,15
	Propilenglicol	4,0
Parte D	Copolímero de acrilato de sodio (y) parafina líquida (y) PPG-1 trideceth-6	1,5
	Ciclopentasiloxano	4,5
	PEG-12 dimeticona	20
	Acetato de tocoferilo	0,45
	Agua (y) ácido cítrico	cs
Parte E	Fragancia	cs

#### *Procedimiento de preparación:*

10 La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 75 °C. La parte A se vierte en la parte B con agitación continua. Inmediatamente después de la emulsificación se incorpora en la mezcla SF 1202 y SF 1288 de la parte D. Después se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 30 seg. Se deja enfriar hasta 65 °C y se incorpora SALCARE® SC91. A una temperatura menor que 50 °C se añade la parte C. A 35 °C o menor se incorpora acetato de vitamina E y después se ajusta el pH con ácido cítrico. A temperatura ambiente se añade la parte E.

### Ejemplo 11: Crema de protección solar de tipo aceite en agua

	Nombre INCI	% en p/p (según se emplean)
Parte A	Diestearato de poligliceril-3-metilglucosa	20
	Oleato de decilo	57
	Palmitato de isopropilo	5,8
	Triglicérido caprílico/cáprico	6,5
	Absorbente de UV de fórmula (101)	2,0
	Metoxicinamato de etilhexilo	5,0
	Alcohol cetílico	0,7
Parte B	Glicerol	3,0
	Carbómero	0,3
	Agua	cs hasta 100
Parte C	Fenoxietanol (y) metilparabeno (y) etilparabeno (y) butilparabeno (y) propilparabeno (e) isobutilparabeno	0,5
Parte D	Metilen-bis-benzotriazolotetrametilbutilfenol (y) agua (y) decil glucósido (y) propilenglicol (y) goma de xantano	8,0
	Agua	20,0
Parte E	Agua (e) hidróxido de sodio	cs
	Fragancia	cs

*Procedimiento de preparación:*

5 La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 75 °C. La parte A se vierte en la parte B con agitación. La mezcla se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 15 seg. La mezcla se enfría hasta 60 °C y se incorporan la parte C y la parte D. La mezcla se homogeneiza de nuevo durante un corto periodo de tiempo (5 seg/11000 rpm). Después de otro enfriamiento con agitación moderada, el pH se ajusta con hidróxido de sodio a temperatura ambiente. Se obtiene una disolución con un pH de entre 5,5 y 6,0. Por último se añade la fragancia.

**Ejemplo 12: Crema de protección solar de tipo aceite en agua**

	Nombre INCI	% en p/p (según se emplean)
Parte A	Diestearato de poligliceril-3-metilglucosa	2,0
	Oleato de decilo	5,7
	Palmitato de isopropilo	5,8
	Triglicérido caprílico/cáprico	65
	Mezcla del compuesto absorbente de UV de fórmula (101) (50%) y Uvinul A Plus n.º de registro CAS 302776-68-7 (50%)	2,0
	Metoxicinamato de etilhexilo	5,0
	Alcohol cetílico	0,7
Parte B	Glicerol	3,0
	Carbómero	0,3

## ES 2 505 316 T3

	Agua	cs hasta 100
Parte C	Fenoxietanol (y) metilparabeno (y) etilparabeno (y) butilparabeno (y) propilparabeno (e) isobutilparabeno	0,5
Parte D	Metilen-bis-benzotriazolotetrametilbutilfenol (y) agua (y) decil glucósido (y) propilenglicol (y) goma de xantano	80
	Agua	20,0
Parte E	Agua (e) hidróxido de sodio	cs
	Fragancia	cs

### *Procedimiento de preparación:*

5 La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 75 °C. La parte A se vierte en la parte B con agitación. La mezcla se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 15 seg. Después de enfriar hasta 60 °C se incorporan la parte C y la parte D. La mezcla se homogeneiza de nuevo durante un corto periodo de tiempo (5 seg/11000 rpm). Después de otro enfriamiento con agitación moderada, el pH se ajusta a temperatura ambiente con hidróxido de sodio a un valor entre 5,50 y 6,00. Por último se añade la fragancia.

### **Ejemplo 13: Crema de protección solar de tipo aceite en agua**

	Nombre INCI	% en p/p (según se emplean)
Parte A	Diestearato de poligliceril-3-metilglucosa	20
	Oleato de decilo	5,7
	Palmitato de isopropilo	5,8
	Triglicérido caprílico/cáprico	65
	Mezcla del compuesto absorbente de UV de fórmula (101) (50%) y benciliden-alcanfor n.º de registro CAS 36861-47-9 (50%)	2,0
	Metoxicinamato de etilhexilo	5,0
	Alcohol cetílico	0,7
Parte B	Glicerol	3,0
	Carbómero	0,3
	Agua	cs hasta 100
Parte C	Fenoxietanol (y) metilparabeno (y) etilparabeno (y) butilparabeno (y) propilparabeno (e) isobutilparabeno	0,5
Parte D	Metilen-bis-benzotriazolotetrametilbutilfenol (y) agua (y) decil glucósido (y) propilenglicol (y) goma de xantano	8,0
	Agua	20,0
Parte E	Agua (e) hidróxido de sodio	cs
	Fragancia	cs

### 10 *Procedimiento de preparación:*

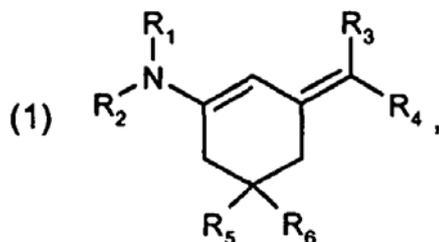
La parte A y la parte B se calientan por separado hasta 75 °C. La parte A se vierte en la parte B con agitación. La mezcla se homogeneiza con un Ultra Turrax con 11000 rpm durante 15 seg. Después de enfriar hasta 60 °C se

## ES 2 505 316 T3

incorporan la parte C y la parte D. La mezcla se homogeneiza de nuevo durante un corto periodo de tiempo (5 seg/11000 rpm). Después de otro enfriamiento con agitación moderada, el pH se ajusta a temperatura ambiente con hidróxido de sodio. Se obtiene una disolución con un pH de entre 5,50 y 6,00. Por último se añade la fragancia.

REIVINDICACIONES

1.- Un compuesto de fórmula



en la que

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son idénticos y son alquilo C<sub>4</sub>-C<sub>22</sub> ramificado; o alquenilo C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> ramificado;

5 R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub>, independientemente entre sí, son ciano; COR<sub>7</sub>; COOR<sub>7</sub>; CONR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>; SO<sub>2</sub>(arilo C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>); alq(C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-1-enilo; cicloalq(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-1-enilo; alq(C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-1-inilo; heteroalquilo C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>; heterocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>; arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>; o heteroarilo C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>; en la que al menos uno de R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> es ciano;

R<sub>5</sub> y R<sub>6</sub>, independientemente entre sí, son hidrógeno; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; cicloalquilo C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub> que puede estar sustituido con uno o más de un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

10 R<sub>7</sub> y R<sub>8</sub>, independientemente entre sí, son hidrógeno; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>22</sub>; alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>; alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>; cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>; cicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>; -(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>COOH; aralquilo C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>; heteroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>; heteroaralquilo C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub>; arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>; heteroarilo C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>.

2.- Un compuesto según la reivindicación 1, en el que, en la fórmula (1):

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub>, independientemente entre sí, son idénticos y alquilo C<sub>4</sub>-C<sub>22</sub> ramificado; o alquenilo C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> ramificado;

15 R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub>, independientemente entre sí, son ciano; COR<sub>7</sub>; COOR<sub>7</sub>; CONR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>; SO<sub>2</sub>(arilo C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>);

R<sub>5</sub> y R<sub>6</sub>, independientemente entre sí, son hidrógeno; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; cicloalquilo C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub> que puede estar sustituido con uno o más de un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

R<sub>7</sub> y R<sub>8</sub>, independientemente entre sí, son hidrógeno; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>22</sub>.

3.- Un compuesto según la reivindicación 1 o 2, en el que:

20 R<sub>3</sub> es ciano;

R<sub>4</sub> es ciano; COR<sub>7</sub>; COOR<sub>7</sub>; CONR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>; SO<sub>2</sub>(arilo C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>); y

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub> y R<sub>8</sub> son como se definió en la reivindicación 1.

4.- Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que, en la fórmula (1):

25 R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> se seleccionan de 1-metilpropilo; 1,3-dimetilbutilo; 2-metilbutilo; 1,1,3,3-tetrametilbutilo; 3-metilbutilo; 7-metiloctilo; 2-etilhexilo; 4-metilciclohexilo; y 2-metil-2-propeno.

5.- Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que, en la fórmula (1), R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son -C≡N.

6.- Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que, en la fórmula (1):

R<sub>3</sub> es -C≡N;

R<sub>4</sub> es COR<sub>7</sub>; COOR<sub>7</sub>; CONR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>; SO<sub>2</sub>(arilo C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>); y

30 R<sub>7</sub> y R<sub>8</sub> son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

7.- El uso de los compuestos de fórmula (1) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, como modificador para la percepción antiarrugas.

8.- Una preparación cosmética que comprende al menos un compuesto de fórmula (1) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, junto con vehículos o adyuvantes cosméticamente tolerables.