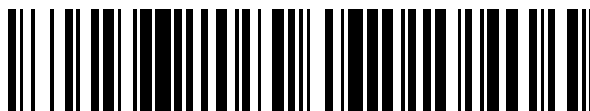


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 547 649**

51 Int. Cl.:

A61K 8/35 (2006.01)

A61K 8/37 (2006.01)

A61K 8/40 (2006.01)

A61Q 5/00 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **22.02.2008 E 08711842 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **09.09.2015 EP 2127634**

54 Título: **Composición para la piel o el cabello**

30 Prioridad:

23.02.2007 JP 2007044764

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
07.10.2015

73 Titular/es:

**SHISEIDO COMPANY, LIMITED (100.0%)
5-5, GINZA 7-CHOME
CHUO-KU, TOKYO 104-8010, JP**

72 Inventor/es:

**OGUCHI, NOZOMI;
YODA, YUKIE y
KAKOKI, HIROYUKI**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

Observaciones :

Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 547 649 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Composición para la piel o el cabello

Solicitudes relacionadas

Esta solicitud reivindica la prioridad de la solicitud de patente japonesa N° 2007-44764, presentada el 23 de febrero de 2007, que se incorpora en la presente memoria por referencia.

Campo de la invención

La presente invención se refiere a una composición para uso externo sobre la piel o el cabello. Particularmente, la presente invención se refiere a una composición para la piel o el cabello que consigue una estabilidad (fotoestabilidad) sumamente excelente y una absorción UV excelente sobre un amplio intervalo de longitudes de onda UV de UV-A a UV-B. La presente invención se aplica preferiblemente a cosméticos de filtro solar.

Antecedentes de la invención

En los cosméticos, se mezclan absorbentes UV para proteger la piel humana de la radiación UV o impedir la degradación de componentes debido a los rayos UV.

El intervalo de longitudes de onda UV puede ser dividido en UV-A (320 a 400 nm), UV-B (290 a 320 nm), y UV-C (hasta 290 nm). Entre ellos, el rayo UV-C generalmente no alcanza la superficie terrestre.

No se creía que el rayo UV-A (320 a 400 nm) acelerase el envejecimiento de la piel causando quemaduras solares tal como el rayo UV-B (290 a 320 nm), aunque oscureciera la piel. Recientemente, sin embargo, se ha revelado que el rayo UV-A penetra profundamente en la piel y no sólo causa envejecimiento de la piel sino que también promueve la formación de cáncer de piel, mientras que el rayo UV-B sólo alcanza capas relativamente superficiales de la piel.

Cuando se clasifican según su estructura molecular, los absorbentes UV convencionales para cosméticos se pueden clasificar en (1) derivado del ácido benzoico, (2) derivado de cinamato, (3) derivado de benzofenona, (4) derivado de dibenzoilmetano, (5) derivado de ácido salicílico, (6) derivado de alcanfor, (7) derivado de fenilbencimidazol, (8) derivado de fenilbenzotriazol, (9) derivado de triazina, (10) derivado de acrilato de fenilo, etcétera.

Entre los absorbentes mencionados anteriormente, el (4), derivado de dibenzoilmetano, es uno de los absorbentes UV más ampliamente usados en el campo de los cosméticos en los últimos años, porque es excelente en seguridad y capacidad absorbente de UV (especialmente capacidad absorbente de UV-A). Uno de los ejemplos representativos de los derivados de dibenzoilmetano es el 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano, que es el absorbente UV-A más usado, porque tiene un máximo de absorción alrededor de 360 nm, así como una gran absorbancia, y es excelente en absorber el rayo UV-A.

Sin embargo, el derivado de dibenzoilmetano tiene una baja fotoestabilidad. Por lo tanto, una preparación que contiene derivado de dibenzoilmetano ha tenido el problema de que su efecto protector contra los UV se deteriora con el tiempo por exposición a los rayos UV o la luz del sol. Por tanto, para ejercer un efecto protector de la piel constante durante muchas horas bajo la luz, era necesario aplicar la preparación que contiene el derivado de dibenzoilmetano a la piel o el cabello de manera constante o repetida en un corto periodo de tiempo.

Para intentar resolver el problema mencionado anteriormente, los documentos de patente 1 y 2 describen que ciertos tipos de β,β -difenilacrilato y α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo, que se usan como absorbentes UV, mejoran la fotoestabilidad del derivado de dibenzoilmetano. Para más detalles, el documento de patente 1 describe una composición cosmética bloqueante de la luz que estabiliza el agente bloqueante de UV-A mezclando el agente bloqueante de UV-A (tal como derivado de dibenzoilmetano) con un β,β -difenilacrilato y α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo en una proporción específica. El documento de patente 2 describe una composición cosmética bloqueante de la luz con fotoestabilidad, que se prepara mezclando un agente bloqueante de UV-A de tipo benzoilmetano con un estabilizante de α -ciano- β,β -difenilacrilato en una proporción específica para estabilizar el agente bloqueante de UV-A de tipo benzoilmetano, y añadir arbitrariamente al menos un tipo de filtro UV-B general. En el documento de patente 2, se especifica un pigmento en partículas (p.ej. un micropigmento de un óxido metálico general) como el filtro de UV-B mencionado anteriormente.

Sin embargo, ha habido un problema en que el efecto del β,β -difenilacrilato y α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo para estabilizar un derivado de dibenzoilmetano es inhibido al mezclar un derivado de cinamato (tal como metoxicinamato de octilo), que es uno de los absorbentes UV más ampliamente usados en cosmética, especialmente como absorbente de UV-B, en un sistema que usa un derivado de dibenzoilmetano descrito en los documentos de patente en combinación con β,β -difenilacrilato o α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo.

Si es posible mezclar un absorbente de UV-B que tiene una excelente absorción UV (especialmente para rayo UV-B) en un sistema que contiene un derivado de dibenzoilmetano (es decir, agente UV-A) y un β,β -difenilacrilato de alquilo, α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo y estabilizantes similares (es decir, estabilizantes capaces de aumentar la fotoestabilidad del derivado de dibenzoilmetano) sin deteriorar el efecto del β,β -difenilacrilato de alquilo y

estabilizantes similares para fotoestabilizar el derivado de dibenzoilmetano, se puede conseguir de manera estable una absorción UV para un amplio intervalo de longitudes de onda UV, desde los rayos UV-A hasta los rayos UV-B. Se ha deseado el desarrollo de tales productos.

- 5 Hasta donde saben los inventores de la presente invención, no ha habido ningún documento que describa específicamente la manera de resolver el problema de que el uso de derivados de cinamato inhibe el efecto del β,β -difencilacrilato y α -ciano- β,β -difencilacrilato de alquilo sobre la estabilización de derivados de dibenzoilmetano.

[Documento de patente 1] Patente japonesa N° 2975682

[Documento de patente 2] Publicación de patente japonesa no examinada H09-175974

Descripción de la invención

- 10 Problema a ser resuelto por la invención

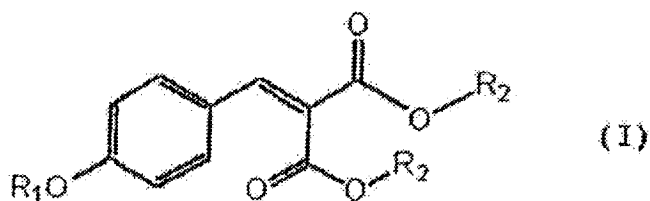
La presente invención ha sido concebida a la luz de los problemas descritos anteriormente, y su propósito es proporcionar una composición para la piel o el cabello que pueda mezclar de manera estable varios tipos de absorbentes UV escasamente solubles para proporcionar una alta solubilidad y conseguir una excelente absorción UV en un amplio intervalo de longitudes de onda UV, desde los UV-A hasta los UV-B, sin inhibir el efecto del β,β -difencilacrilato y/o α -ciano- β,β -difencilacrilato de alquilo que sirven para mejorar la fotoestabilidad del derivado de dibenzoilmetano.

Medios para solucionar el problema

- 20 Como resultado de una extensa investigación para solucionar los problemas descritos anteriormente, los inventores de la presente invención encontraron que mezclar un derivado de benzalmalonato específico en un sistema que contiene un derivado de dibenzoilmetano y un β,β -difencilacrilato y/o α -ciano- β,β -difencilacrilato de alquilo aumenta el efecto protector contra UV, y permite mezclar la composición con varios tipos de absorbentes UV escasamente solubles, y proporciona una alta solubilidad sin inhibir el efecto del β,β -difencilacrilato o α -ciano- β,β -difencilacrilato de alquilo para fotoestabilizar el derivado de dibenzoilmetano, lo que dio como resultado la consecución de la presente invención.

- 25 La presente invención proporciona una composición para la piel o el cabello, que comprende:

- (a) 0,01 a 10 % en masa de un derivado de dibenzoilmetano;
- (b) 0,01 a 10 % en masa de un β,β -difencilacrilato y/o α -ciano- β,β -difencilacrilato de alquilo, y
- (c) 0,1 % en masa o más de un derivado de benzalmalonato representado por la siguiente fórmula (I):



- 30 en donde R_1 y R_2 representan independientemente un grupo alquilo que tiene un número de carbonos de 1 a 20.

La presente invención proporciona la composición para la piel o el cabello, en donde R_1 en la fórmula (I) mencionada anteriormente es un grupo metilo.

La presente invención proporciona la composición para la piel o el cabello, en donde R_2 en la fórmula (I) mencionada anteriormente es un grupo 2-etilhexilo.

- 35 La presente invención proporciona la composición para la piel o el cabello, en donde el componente (a) es 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano.

La presente invención proporciona la composición para la piel o el cabello, en donde el componente (b) es octocrileno.

La presente invención proporciona la composición para la piel o el cabello, que es un cosmético de filtro solar.

- 40 **Efecto de la invención**

Según la presente invención, se puede obtener una composición que aumenta el efecto protector contra los UV y tiene una excelente sostenibilidad de la absorción UV del derivado de dibenzoilmetano y el derivado de

benzalmalonato, a la vez que conserva la fotoestabilidad del derivado de dibenzoilmetano mejorada por el β,β -difenilacrilato y/o el α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo, usando un derivado de benzalmalonato específico en combinación con el derivado de dibenzoilmetano y el β,β -difenilacrilato y/o el α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo.

Breve descripción de los dibujos

- 5 La Fig. 1 es un gráfico que muestra la absorbancia del compuesto obtenido en el Ejemplo de Síntesis 1, esto es, 4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo), representado en la fórmula (II).

Descripción de la realización preferida

La presente invención se detallará adicionalmente en lo que sigue.

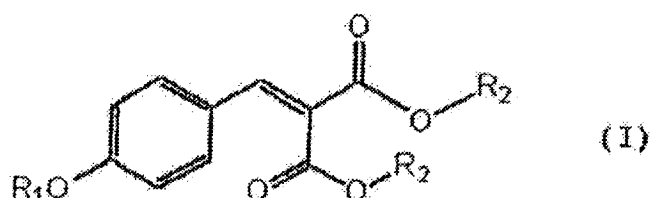
- 10 Para el componente (a), se usan una o más tipos de derivados de dibenzoilmetano conocidos como absorbentes UV. En la presente invención, se prefiere particularmente el 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano. El 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano está disponible en el mercado, por ejemplo, en DSM Nutritional Products, Inc., bajo el nombre comercial de "Parsol 1789", que se puede usar en la presente invención.

- 15 La cantidad de mezcla del componente (a) es de 0,01 a 10 % en masa con respecto a la composición de la presente invención, más preferiblemente de 0,3 a 5 % en masa. Si la cantidad de mezcla del componente (a) es menos que 0,01 % en masa, es difícil conseguir una absorción UV suficiente. Por el contrario, para cosméticos o preparaciones para uso externo sobre la piel, 10 % en masa del componente (a) es suficiente para conseguir una absorción UV suficiente. Si el componente (a) se mezcla en la cantidad de más que 10 % en masa, el efecto no es mejorado en proporción al aumento de cantidad de mezcla, lo que no es económico.

- 20 El componente (b) es un β,β -difenilacrilato y/o un α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo conocido como un absorbente UV. Entre ellos, se prefiere un α -ciano- β,β -difenilacrilato. En la presente invención, se prefiere particularmente el octocrileno (esto es, 2-ciano-3,3'-difenilacrilato de 2-etilhexilo). Por ejemplo, el octocrileno está disponible en el mercado bajo el nombre comercial de "Parsol 340" (DSM Nutritional Products, Inc.), "Uvinul N 539 T" (BASF Corporation), "Neo Helipan, Type 303" (Symrise), "Eusolex OCR" (EMD Chemicals, Inc.), "Escalol 597" (International Specialty Products), etcétera, los cuales se pueden usar en la presente invención.

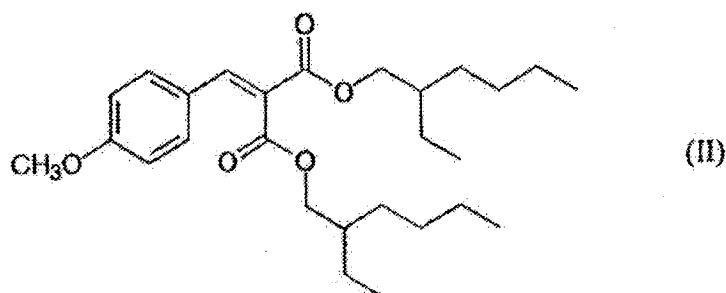
- 25 La cantidad de mezcla del componente (b) es de 0,01 a 10 % en masa con respecto a la composición de la presente invención, más preferiblemente de 0,3 a 5 % en masa. Si la cantidad de mezcla del componente (b) es menos que 0,01 % en masa, es difícil conseguir una absorción UV suficiente. Por el contrario, si excede de 10 % en masa, hay una tendencia a una sensación pegajosa en el uso.

El componente (c) es un derivado de benzalmalonato representado por la siguiente fórmula (I):



En la fórmula (I) anterior, R_1 y R_2 representan independientemente un grupo alquilo que tiene un número de carbonos de 1 a 20.

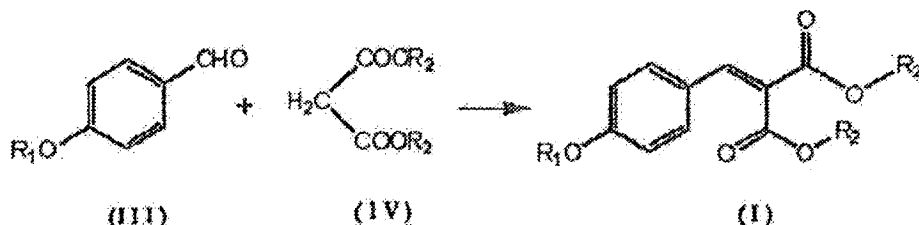
En la presente invención, se prefiere particularmente que R_1 sea un grupo metilo. Para R_2 , se prefiere 2-etilhexilo. Por tanto, para el componente (c) en la presente invención, se prefiere particularmente el 4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo).



Por ejemplo, el componente (c) puede ser sintetizado por condensación de Knoevenagel usando benzaldehído sustituido en para con alcoxi (fórmula (III)) y éster dialquílico de ácido malónico (fórmula (IV)) como se explica en el

siguiente Esquema (1). En el Esquema (1), R_1 y R_2 son como se definieron en la fórmula (I) mencionada anteriormente.

<Esquema (1)> :



5 Esta reacción se puede ejecutar en un disolvente tal como hidrocarburos aromáticos (p.ej., benceno, tolueno y xileno); tetrahidrofurano; dioxano; y alcohol; a una temperatura desde la temperatura ambiente hasta la temperatura de reflujo del disolvente en presencia de catalizador. Los ejemplos del catalizador incluyen bases tales como piperidina y piridina; ácidos tales como ácido acético, ácido benzoico, cloruro de cinc y tetracloruro de titanio; carboxilatos tales como acetato de sodio y acetato de amonio; y anhídridos de ácido tales como anhídrido acético.

10 <Esquema (2)> :

El éster dialquílico del ácido malónico (fórmula (IV)) se puede obtener, por ejemplo, por reacción de esterificación de ácido malónico con el alcohol correspondiente $R_2\text{OH}$.

La cantidad de mezcla del componente (c) no está restringida particularmente, siempre y cuando no deteriore el efecto de la composición en el que el componente (b) mejora la fotoestabilidad del componente (a) y esté presente en cantidades suficientes para mantener las propiedades de absorción UV del componente (c). La cantidad mínima de componente (c) para la fotoestabilización se puede determinar mediante un ensayo general de medida para fotoestabilidad, y es 0,1 % en masa o más con respecto a la composición, más preferiblemente 0,5 % en masa o más. La cantidad límite superior del componente (c) no está restringida particularmente, y se prefiere 10 % en masa con respecto a la composición. Si la cantidad de mezcla del componente (c) es menos que 0,1 % en masa, es difícil conseguir una absorción UV suficiente del componente (c). Por el contrario, para cosméticos o preparaciones para uso externo sobre la piel, 10 % en masa de componente (c) es suficiente para conseguir una absorción UV suficiente. Si el componente (c) se mezcla en la cantidad de más que 10 % en masa, el efecto no es mejorado en proporción al aumento de cantidad de mezcla, lo que no es económico.

En la composición de la presente invención, además de los componentes esenciales mencionados anteriormente, se pueden mezclar arbitrariamente además absorbentes UV solubles en agua o solubles en aceite, dentro del intervalo donde el efecto de la presente invención no se deteriore.

Los ejemplos de tal absorbente UV incluyen absorbentes UV de triazina (tales como bis(resorcinil)triazina, 2,4-bis[4-(2-etilhexiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina y octiltriazona, (2,4,6-tris[4-(2-etilhexiloxycarbonil)anilino]-1,3,5-triazina); absorbentes UV de ácido benzoico (tales como ácido p-aminobenzoico (abreviado en lo sucesivo como "PABA"), éster de monoglicerina de PABA, éster etílico de N,N-dipropoxi-PABA, éster etílico de N,N-dietoxi-PABA, éster etílico de N,N-dimetil-PABA, y éster butílico de N,N-dimetil-PABA); absorbentes UV de ácido antranílico (tales como antranilato de homomentil-N-acetilo); absorbentes UV de ácido salicílico (tales como salicilato de amilo, salicilato de mentilo, salicilato de homomentilo, salicilato de octilo, salicilato de fenilo, salicilato de bencilo, y fenilsalicilato de p-isopropanol); absorbentes UV de ácido cinámico (tales como cinamato de octilo, 4-isopropilcinamato de etilo, 2,5-diisopropilcinamato de metilo, 2,4-diisopropilcinamato de etilo, 2,4-diisopropilcinamato de metilo, p-metoxycinamato de propilo, p-metoxycinamato de isopropilo, p-metoxycinamato de isoamilo, p-metoxycinamato de 2-etilhexilo, p-metoxycinamato de 2-etoxietilo, p-metoxycinamato de ciclohexilo, α -ciano- β -fenilcinamato de etilo, α -ciano- β -fenilcinamato de 2-etilhexilo, mono-2-etilhexanoil-diparametoxycinamato de glicerilo, y etoxycinamato de etanolamina); absorbentes UV de benzofenona (tales como éster hexílico del ácido 2-[4-(dietilamino)-2-hidroxibenzoil]-benzoico, 2,4-dihidroxibenzofenona, 2,2'-dihidroxi-4-metoxibenzofenona, 2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetoxibenzofenona, 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, 5-sulfonato de 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, 4-fenilbenzofenona, 2-carboxilato de 2-etilhexil-4'-fenil-benzofenona, 2-hidroxi-4-n-octoxibenzofenona, y 4-hidroxi-3-carboxibenzofenona); 3-(4'-metilbenciliden)-d,l-alcanfor; 3-benciliden-d,l-alcanfor; 2-fenil-5-metilbenzoxazol; 2,2'-hidroxi-5-metilfenilbenzotriazol; 2-(2'-hidroxi-5'-t-octilfenil)benzotriazol; 2-(2'-hidroxi-5'-metilfenil)benzotriazol; dibenzaladina; dianisolemetano; 5-(3,3-dimetil-2-norbornilideno)-3-pentano-2-ona; absorbentes UV de acrilato de fenilo (tales como 2-ciano-3,3-difenilacrilato de 2-etilhexilo y 2-ciano-3,3-difenilacrilato de etilo; derivados de fenilbencimidazol (tales como ácido sulfónico de fenilbencimidazol y tetrasulfonato de disodio-fenildibencimidazol); derivados de alcanfor (tales como 4-metilbenciliden-alcanfor y ácido sulfónico de tereftaliliden-dialcanfor); derivados de fenilbenzotriazol (tales como hidroxi-(etilhexil)-fenoxibenzotriazol, y metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol); y derivados de benzalmalonato (tales como benzalmalonato de dimeticona).

Preferiblemente, entre los absorbentes UV mencionados anteriormente, la composición de la presente invención

comprende además uno o más seleccionados del grupo que consiste en derivados de cinamato, derivados de antranilato, derivados de ácido salicílico, derivados de alcanfor, derivados de benzalmalonato, derivados de bencimidazol, derivados de ácido p-aminobenzoico, derivados de metilen-bis(hidroxifenil)benzotriazol, y derivados de triazina; más preferiblemente, salicilato de etilhexilo, homosalato, p-metoxicinamato de 2-etilhexilo (p-metoxisilicato de 2-etilhexilo), octocrileno, ácido sulfónico de fenilbencimidazol, 4-etilbenciliden-alcanfor, metilen-bis-benzotriazolil-tetrametilbutilfenol, fenilbenzotriazol, éster hexílico del ácido dietilaminohidroxibenzoilbenzoico, hidroxil(etilhexil)fenoxibenzotriazol, bis-etilhexilfenol-metoxifeniltriagina, dietilbenzalmalonato de dimeticona, y tetrasulfonato de disodiofenildibencimidazol.

Adicionalmente, como sea necesario, se pueden mezclar arbitrariamente en la composición de la presente invención otros componentes usados generalmente en preparaciones externas, siempre y cuando el efecto de la presente invención no sea deteriorado; los ejemplos de otros componentes incluyen componentes en polvo, aceites líquidos, aceites sólidos, ceras, hidrocarburos, ácidos grasos superiores, alcoholes superiores, ésteres, siliconas, tensioactivos aniónicos, tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, humectantes, polímeros solubles en agua, espesantes, agentes de revestimiento, agentes secuestrantes de iones metálicos, alcoholes inferiores, alcoholes polihidroxilados, sacáridos, aminoácidos, aminas orgánicas, emulsiones poliméricas, ajustadores de pH, nutrientes de la piel, vitaminas, antioxidantes, auxiliares antioxidantes, perfumes y agua. La composición de la presente invención se puede preparar por métodos de preparación normales, dependiendo de una forma de producto deseada.

Los ejemplos de componentes en polvo incluyen polvos inorgánicos (tales como talco, caolín, mica, sericita, moscovita, flogopita, mica sintética, lepidolita, biotita, vermiculita, carbonato de magnesio, carbonato de calcio, silicato de aluminio, silicato de bario, silicato de calcio, silicato de magnesio, silicato de estroncio, sal metálica de ácido túngstico, magnesio, sílice, zeolita, sulfato de bario, sulfato de calcio calcinado (yeso calcinado), fosfato de calcio, apatita de flúor, hidroxiapatita, polvo cerámico, jabones metálicos (por ejemplo, miristato de cinc, palmitato de calcio y estearato de aluminio), y nitruro de boro); polvos orgánicos (tales como polvo de resina de poliamida (polvo de náilon), polvo de polietileno, polvo de poli(metacrilato de metilo), polvo de poliestireno, polvo de resina de copolímero de estireno/ácido acrílico, polvo de resina de benzoguanamina, polvo de politetrafluoroetileno, y polvo de celulosa); pigmentos inorgánicos blancos (tales como dióxido de titanio y óxido de cinc); pigmentos inorgánicos rojos (tales como óxido de hierro (óxido de hierro rojo) y titanato de hierro); pigmentos inorgánicos marrones (tales como óxido de hierro γ); pigmentos inorgánicos amarillos (tales como óxido de hierro y ocre); pigmentos inorgánicos negros (tales como óxido de hierro negro y óxidos inferiores de titanio); pigmentos inorgánicos púrpuras (tales como violeta de manganeso y violeta de cobalto); pigmentos inorgánicos verdes (tales como óxido de cromo, hidróxido de cromo y titanato de cobalto); pigmentos inorgánicos azules (tales como azul ultramar y azul Berlín); pigmento perla (tales como mica revestida de óxido de titanio, oxiclورو de bismuto revestido de óxido de titanio, talco revestido de óxido de titanio, mica revestida de óxido de titanio coloreada, oxiclورو de bismuto, y copos de escamas de pez); pigmentos de polvos metálicos (tales como polvo de aluminio y polvo de cobre); pigmentos orgánicos tales como laca de circonio, bario o aluminio (por ejemplo, pigmentos orgánicos tales como rojo 201, rojo 202, rojo 204, rojo 205, rojo 220, rojo 226, rojo 228, rojo 405, naranja 203, naranja 204, amarillo 205, amarillo 401 y azul 404, así como rojo 3, rojo 104, rojo 106, rojo 227, rojo 230, rojo 401, rojo 505, naranja 205, amarillo 4, amarillo 5, amarillo 202, amarillo 203, verde 3 y azul 1); y colores naturales (tales como clorofila y β -caroteno).

Los ejemplos de aceite líquido incluyen aceite de aguacate, aceite de camelia, aceite de tortuga, aceite de nuez de macadamia, aceite de maíz, aceite de visón, aceite de oliva, aceite de colza, aceite de huevo, aceite de sésamo, aceite pérsico, aceite de germen de trigo, aceite de sasanqua, aceite de ricino, aceite de semilla de linaza, aceite de cártamo, aceite de semilla de algodón, aceite de perilla, aceite de soja, aceite de cacahuete, aceite de semilla de té, aceite de kaya, aceite de salvado de arroz, aceite de paulownia, aceite de tung japonés, aceite de jojoba, aceite de germen y triglicerina.

Los ejemplos de aceite sólido incluyen manteca de cacao, aceite de coco, grasa de caballo, aceite de coco endurecido, aceite de palma, sebo de vacuno, sebo de cordero, sebo de vacuno endurecido, aceite de palmiste, sebo de porcino, sebo de hueso de vacuno, aceite de grano de cera de Japón, aceite endurecido, aceite de pie de buey, cera de Japón, y aceite de ricino endurecido.

Los ejemplos de ceras incluyen cera de abejas, cera de candelilla, cera de algodón, cera carnauba, cera de arrayán, cera china, esperma de ballena, cera de lignita, cera de salvado de arroz, lanolina, cera kapok, acetato de lanolina, lanolina líquida, cera de caña de azúcar, lanolato de isopropilo, laurato de hexilo, lanolina reducida, cera de jojoba, lanolina dura, cera de goma laca, éter de alcohol de POE lanolina, acetato de alcohol de POE lanolina, éter de POE colesterol, polietilenglicol de ácido graso de lanolina, y éter de alcohol de POE lanolina hidrogenada.

Los ejemplos de aceites hidrocarbonados incluyen parafina líquida, ozokerita, escualano, pristano, parafina, ceresina, escualeno, vaselina y cera microcristalina.

Los ejemplos de ácidos grasos superiores incluyen ácido láurico, ácido mirístico, ácido palmítico, ácido esteárico, ácido behénico, ácido oleico, ácido undecilénico, ácido tólico, ácido isoesteárico, ácido linoleico, ácido linolénico, ácido eicosapentaenoico (EPA) y ácido docosahexaenoico (DHA).

Los ejemplos de alcoholes superiores incluyen alcohol lineal (tales como alcohol laurílico, alcohol cetílico, alcohol estearílico, alcohol behenílico, alcohol miristílico, alcohol oleílico y alcohol cetoestearílico); alcohol de cadena ramificada (éter de monoestearilglicerina (alcohol batílico), 2-deciltetradecinol, alcohol de lanolina, colesterol, fitosterol, hexildodecanol, alcohol isoestearílico y octildodecanol).

- 5 Los ejemplos de aceites de éster sintético incluyen dineopentanoato de tripropilenglicol, isononato de isononilo, miristato de isopropilo, octanoato de cetilo, miristato de octildodecilo, palmitato de isopropilo, estearato de butilo, laurato de hexilo, miristato de miristilo, oleato de decilo, dimetiloctanoato de hexildecilo, lactato de cetilo, lactato de miristilo, acetato de lanolina, estearato de isocetilo, isoestearato de isocetilo, 12-hidroxiestearato de colesterilo, di-2-etilhexanoato de etilenglicol, éster de ácido graso de dipentaeritritol, monoisoestearato de N-alquilglicol, dicaprato de neopentilglicol, malato de diisoestearilo, di-2-heptilundecanoato de glicerilo, tri-2-etilhexanoato de trimetilolpropano, triisoestearato de trimetilolpropano, tetra-2-etilhexanoato de pentaeritritol, tri(2-etilhexanoato) de glicerilo, trioctanoato de glicerilo, triisopalmitato de glicerilo, triisoestearato de trimetilolpropano, 2-etilhexanoato de cetilo, palmitato de 2-etilhexilo, trimiristato de glicerilo, tri-2-heptilundecanoato de glicerilo, éster metílico de ácido graso de aceite de ricino, oleato de oleílo, acetoglicérido, palmitato de 2-heptilundecilo, adipato de diisobutilo, N-lauroil-L-glutamato de éster de 2-octildodecilo, adipato de di-2-heptilundecilo, laurato de etilo, sebacato de di-2-etilhexilo, miristato de 2-hexildecilo, palmitato de 2-hexildecilo, adipato de 2-hexildecilo, sebacato de diisopropilo, succinato de 2-etilhexilo y citrato de trietilo.

- 20 Los ejemplos de aceite de silicona incluyen polisiloxanos lineales (tales como dimetilpolisiloxano, metilfenilpolisiloxano y difenilpolisiloxano), polisiloxanos cíclicos (tales como octametilciclotetrasiloxano, decametilciclopentasiloxano y dodecametilciclohexasiloxano); resina de silicona que forma una estructura de red tridimensional; caucho de silicona; y diversos tipos de polisiloxano modificado (tales como polisiloxano modificado con amina, polisiloxano modificado con poliéter, polisiloxano modificado con alquilo y polisiloxano modificado con flúor).

- 25 Los ejemplos de tensioactivo aniónico incluyen jabón de ácido graso (tal como laurato de sodio y palmitato de sodio); sales de ésteres alquilsulfúricos superiores (tales como Laurilsulfato de sodio y Laurilsulfato de potasio); sales de ésteres sulfúricos de ésteres alquílicos (tales como POE Laurilsulfato de trietanolamina y POE Laurilsulfato de sodio); ácidos N-acilsarcosínicos (tales como lauroilsarcosinato de sodio); amidasulfonato de ácido graso superior (tales como N-miristoil-N-metilaurina de sodio, metilaurida de ácido graso de aceite de coco de sodio y Laurilmethylaurida de sodio); sales de ésteres fosfóricos (tales como fosfato de éter de POE oleílo de sodio y fosfato de éter de POE estearilo); sulfosuccinatos (tales como di-2-etilhexilsulfosuccinato de sodio, monolauroilmonoetanolamida-polioxi-etileno-sulfosuccinato de sodio y Lauril-polipropilenglicol-sulfosuccinato de sodio); alquilbencenosulfonatos (tales como dodecilbencenosulfonato lineal de sodio, dodecilbencenosulfonato lineal de trietanolamina y ácido dodecilbencenosulfónico lineal); sales de ésteres de sulfato de ésteres de ácidos grasos de aceite de coco endurecido (tales como sulfato de glicerol de ácidos grasos de aceite de coco endurecido de sodio); N-acilglutamatos (tales como N-lauroilglutamato de monosodio, N-estearoilglutamato de disodio y N-miristoil-L-glutamato de monosodio); aceites sulfatados (tales como aceite rojo de Turquía); ácidos carboxílicos de éter de POE-alquilo; carboxilatos de éter de POE alquil-arilo; sulfonatos de α -olefina; estersulfonatos de ácidos grasos superiores; sales de ésteres de ácido sulfúrico de alcoholes secundarios; sales de ésteres de ácido sulfúrico de alquilolamidas de ácidos grasos superiores; lauroilmonoetanolamidasuccinato de sodio; N-palmitoilaspartato de ditrietanolamina; y caseína de sodio.

- 45 Los ejemplos de tensioactivo catiónico incluyen sales de alquiltrimetilamonio (tales como cloruro de esteariltrimetilamonio y cloruro de Lauriltrimetilamonio); sales de alquilpiridinio (tales como cloruro de cetilpiridinio); cloruro de diestearilmetilamonio; sales de dialquildimetilamonio; cloruro de poli(N,N'-dimetil-3,5-metilenpiperidinio); sales de amonio cuaternario de alquilo; sales de alquildimetilbencilamonio; sales de alquilisoquinolinio; sales de dialquilmorfolinio; POE-alquilaminas; sales de alquilamina; derivados de ácidos grasos de poliamina; derivados de ácidos grasos de alcohol amílico; cloruro de benzalconio; y cloruro de bencetonio.

- 50 Los ejemplos de tensioactivo anfótero incluyen tensioactivos anfóteros de imidazolina (tales como 2-undecil-N,N,N-(hidroxietilcarboximetil)-2-imidazolina de sodio y 2-cocoil-2-imidazolinio-hidróxido-1-carboxietiloxi) de disodio; y tensioactivos de betaína (tales como betaínas de 2-heptadecil-N-carboximetil-N-hidroxi-etilimidazolinio, betaínas de ácido Laurildimetilaminoacético, betaínas de alquilo, betaínas de amida y sulfobetaínas).

- 55 Los ejemplos de tensioactivo no iónico lipófilo incluyen ésteres de ácidos grasos de sorbitán (tales como monooleato de sorbitán, monoisoestearato de sorbitán, monolaurato de sorbitán, monopalmitato de sorbitán, monoestearato de sorbitán, sesquiolato de sorbitán, trioleato de sorbitán, penta-2-etilhexilato de diglicerol-sorbitán, y tetra-2-etilhexilato de diglicerol-sorbitán); ésteres de ácidos grasos de glicerol o poliglicerol (tales como éster de mono-ácido graso de aceite de semilla de algodón de glicerol, monoerucato de glicerol, sesquioleato de glicerol, monoestearato de glicerol, α,α' -oleatopiroglutamato de glicerol y monoestearato-malato de glicerol); ésteres de ácidos grasos de propilenglicol (tales como monoestearato de propilenglicol); derivados de aceite de ricino endurecido; y alquiléteres de glicerol.

- 60 Los ejemplos de tensioactivo no iónico hidrófilo incluyen ésteres de ácidos grasos de POE-sorbitán (tales como monooleato de POE-sorbitán, monoestearato de POE-sorbitán y tetraoleato de POE-sorbitán); ésteres de ácidos

grasos de POE-sorbitol (tales como monolaurato de POE-sorbitol, monooleato de POE-sorbitol, pentaoleato de POE-sorbitol y monoestearato de POE-sorbitol); ésteres de ácidos grasos de POE-glicerol (p.ej. POE-monooleatos tales como monoestearato de POE-glicerol, monoisoestearato de POE-glicerol y triisoestearato de POE-glicerol); ésteres de POE-ácidos grasos (tales como POE-diestearato, POE-monodoleato y diestearato de etilenglicol); éteres de POE-alquilo (tales como éter de POE-laurilo, éter de POE-oleilo, éter de POE-estearilo, éter de POE-behenilo, éter de POE-2-octildodecilo y éter de POE-colestanol); tensioactivos de tipo Pluronic (tales como Pluronic); ésteres de POE/POP-alquilo (tales como éter de POE/POP-cetilo, éter de POE/POP-2-deciltetradecilo, éter de POE/POP-monobutilo, POE/POP-lanolina hidrogenada, y éter de POE/POP-glicerol); condensados de tetraPOE/tetraPOP-etilendiamina (tales como Tetronic); derivados de POE-aceite de ricino o aceite de ricino endurecido (tales como POE-aceite de ricino, POE-aceite de ricino endurecido, monoisoestearato de POE-aceite de ricino endurecido, triisoestearato de POE-aceite de ricino endurecido, diéster de monopiroglutamato monoisoestearato de POE-aceite de ricino endurecido y maleato de POE-aceite de ricino endurecido); derivados de lanolina de POE-cera de abejas (tales como POE-sorbitol cera de abejas); alcanolamidas (tales como dietanolamida de ácido graso de aceite de coco, e isopropanolamida de ácido graso); ésteres de ácidos grasos de POE-propilenglicol; POE-alquilaminas; POE-amidas de ácido graso; ésteres de ácidos grasos de sacarosa; óxidos de alquiletoxidimetilamina; y fosfato de trioleilo.

Los ejemplos de humectante incluyen polietilenglicol, propilenglicol, glicerina, 1,3-butilenglicol, xilitol, sorbitol, maltitol, sulfato de condroitina, ácido hialurónico, sulfato de mucoitina, ácido de caronina, atelocolágeno, 12-hidroxiestearato de colesterilo, lactato de sodio, sales de ácidos biliares, sales de ácido dl-pirrolidonacarboxílico, colágeno soluble de cadena corta, aductos de (EO) PO de diglicerol, extracto de rosa castaña (roxburghii plena), extracto de milenrama (*Achillea millefolium*) y extracto de trébol de olor.

Los ejemplos de polímero natural soluble en agua incluyen polímeros derivados de plantas (tales como goma arábica, goma tragacanto, galactano, goma guar, goma carob, goma karaya, carragenina, pectina, agar, semilla de membrillo (membrillo), coloide de algas (extracto de algas marrones), almidón (arroz, maíz, patata y trigo), y glicirizinato); polímeros derivados de microorganismos (tales como goma xantana, dextrano, succinoglucano y pululano); y polímeros derivados de animales (tales como colágeno, caseína, albúmina y gelatina).

Los ejemplos de polímeros semisintéticos solubles en agua incluyen polímeros de almidón (tales como carboximetilalmidón y metilhidroxipropilalmidón); polímeros de celulosa (tales como metilcelulosa, etilcelulosa, metilhidroxipropilcelulosa, hidroxietilcelulosa, sulfato de celulosa de sodio, hidroxipropilcelulosa, carboximetilcelulosa, carboximetilcelulosa de sodio, celulosa cristalina y polvo de celulosa); y polímeros de alginato (tales como alginato de sodio y alginato de propilenglicol).

Los ejemplos de polímeros sintéticos solubles en agua incluyen polímeros vinílicos (tales como poli(alcohol vinílico), poli(éter vinilmetílico), polivinilpirrolidona y polímero de carboxivinilo); polímeros de polioxi-etileno (tales como copolímeros de polioxi-etileno/polioxi-propileno, por ejemplo polietilenglicol 20.000, 40.000 ó 60.000); polímeros acrílicos (tales como poli(acrilato de sodio), poli(acrilato de etilo) y poli(acrilamida); polietilenimina; y polímeros catiónicos.

Los ejemplos de espesante incluyen goma arábica, carragenina, goma karaya, goma tragacanto, goma carob, semilla de membrillo (membrillo), caseína, dextrina, gelatina, pectato de sodio, alginato de sodio, metilcelulosa, etilcelulosa, CMC, hidroxietilcelulosa, hidroxipropilcelulosa, PVA, PVM, PVP, poli(acrilato de sodio), polímero de carboxivinilo, goma de garrafin, goma guar, goma tamarindo, sulfato de dialquildimetilamonio-celulosa, goma xantana, silicato de magnesio y aluminio, bentonita, hectorita, silicato de magnesio y aluminio (goma de abeja), laponita y anhídrido silícico.

Los ejemplos de agente secuestrante incluyen ácido 1-hidroxietano-1,1-difosfónico, 1-hidroxietano-1,1-difosfonato de tetrasodio, edetato de disodio, edetato de trisodio, edetato de tetrasodio, citrato de sodio, polifosfato de sodio, metafosfato de sodio, ácido glucónico, ácido fosfórico, ácido cítrico, ácido ascórbico, ácido succínico, ácido edético y hidroxietilendiaminatriacetato de trisodio.

Los ejemplos de alcohol inferior incluyen etanol, propanol, isopropanol, alcohol isobutílico y alcohol t-butílico.

Los ejemplos de alcohol polihidroxilado incluyen alcoholes dihidroxilados (tales como etilenglicol, propilenglicol, trimetilenglicol, 1,2-butilenglicol, 1,3-butilenglicol, tetrametilenglicol, 2,3-butilenglicol, pentametilenglicol, 2-buten-1,4-diol, hexilenglicol y octilenglicol); alcoholes trihidroxilados (tales como glicerina y trimetilolpropano); alcoholes tetrahidroxilados (tales como pentaeritritol, por ejemplo, 1,2,6-hexanotriol); alcoholes pentahidroxilados (tales como xilitol); alcoholes hexahidroxilados (tales como sorbitol y manitol); polímeros de alcoholes polihidroxilados (tales como dietilenglicol, dipropilenglicol, trietilenglicol, polipropilenglicol, tetraetilenglicol, diglicerina, polietilenglicol, triglicerina, tetraglicerina y poliglicerina); éteres alquídicos de alcoholes dihidroxilados (tales como éter monometílico de etilenglicol, éter monoetilico de etilenglicol, éter monobutílico de etilenglicol, éter monofenílico de etilenglicol, éter monohexílico de etilenglicol, éter mono-2-metilhexílico de etilenglicol, éter isoamílico de etilenglicol, éter bencílico de etilenglicol, éter isopropílico de etilenglicol, éter dimetílico de etilenglicol, éter dietílico de etilenglicol y éter dibutílico); éteres alquídicos de alcoholes dihidroxilados (tales como éter monometílico de dietilenglicol, éter monoetilico de dietilenglicol, éter monobutílico de dietilenglicol, éter dimetílico de dietilenglicol, éter dietílico de dietilenglicol, éter

- dibutílico de dietilenglicol, éter metiletilílico de dietilenglicol, éter monometílico de trietilenglicol, éter monoetilílico de trietilenglicol, éter monometílico de propilenglicol, éter monoetilílico de propilenglicol, éter monobutílico de propilenglicol, éter isopropílico de propilenglicol, éter metílico de dipropilenglicol, éter etílico de dipropilenglicol y éter butílico de dipropilenglicol); ésteres de éteres de alcoholes dihidroxilados (tales como acetato de éter monometílico de etilenglicol, acetato de éter monoetilílico de etilenglicol, acetato de éter monobutílico de etilenglicol, acetato de éter monofenílico de etilenglicol, diadipato de etilenglicol, disuccinato de etilenglicol, acetato de éter monoetilílico de dietilenglicol, acetato de éter monobutílico de dietilenglicol, acetato de éter monometílico de propilenglicol, acetato de éter monoetilílico de propilenglicol, acetato de éter monopropílico de propilenglicol y acetato de éter monofenílico de propilenglicol); éteres monoalquílicos de glicerol (tales como alcohol chimílico, alcohol selachílico y alcohol batílico);
- 10 alcoholes de azúcar (tales como sorbitol, maltitol, maltotriosa, manitol, sacarosa, eritritol, glucosa, fructosa, azúcares degradados de almidón, maltosa, xilitosa y alcoholes de reducción de azúcares degradados de almidón); glicolida; alcohol tetrahidrofurfurílico; alcohol POE-tetrafurfurílico; éter POP-butílico; éter POP/POE-butílico; éter de tripolioxipropilen-glicerina; éter de POP-glicerol; fosfato de éter de POP-glicerina; éter de POP/POE-pentaeritritol; y poliglicerol.
- 15 Los ejemplos de monosacáridos incluyen triosas (tales como D-glicerilaldehído y dihidroxiacetona); tetrasas (tales como D-eritrosa, D-eritrosa, D-treosa y eritritol); pentosas (tales como L-arabinosa, D-xilosa, L-lixosa, D-arabinosa, D-ribosa, D-riburosa, D-xilulosa y L-xilulosa); hexosas (tales como D-glucosa, D-talosa, D-psicosa, D-galactosa, D-fructosa, L-galactosa, L-manosa y D-pagatosa); heptosa (tales como aldohexosa y heptulosa); octosas (tales como octulosa); desoxiazúcares (tales como 2-desoxi-D-ribosa, 6-desoxi-L-galactosa y 6-desoxi-L-manosa);
- 20 aminoazúcares (tales como D-glucosamina, D-galactosamina, ácido siálico, ácido aminourónico y ácido murámico); y ácidos urónicos (tales como ácido D-glucurónico, ácido D-manulónico, ácido L-gulurónico, ácido D-galacturónico y ácido L-idurónico).
- Los ejemplos de oligosacáridos incluyen sacarosa, gentianosa, umbelífera, lactosa, planteosa, isolícnos, α , α -trehalosa, rafinosa, lícnos, umbilicina, estaquiosa y verbascosas.
- 25 Los ejemplos de polisacáridos incluyen celulosa, semilla de membrillo, sulfato de condroitina, almidón, galactano, sulfato de dermatano, glicógeno, goma arábiga, sulfato de heparano, ácido hialurónico, goma tragacanto, sulfato de keratano, condroitina, goma xantana, sulfato de mucoítina, goma guar, dextrano, keratosulfato, goma garrofín, succinoglucano y ácido carónico.
- Los ejemplos de aminoácido incluyen aminoácidos neutros (tales como treonina y cisteína); aminoácidos ácidos (tales como hidroxilisina). Además, los ejemplos de derivado de aminoácido incluyen acilsarcosinatos de sodio (lauroilsarcosinato de sodio), sales de ácido acilglutámico, acil- β -alanina de sodio, glutatión y ácido pirrolidonacarboxílico.
- 30 Los ejemplos de amina orgánica incluyen monoetanolamina, dietanolamina, trietanolamina, morfolina, triisopropanolamina, 2-amino-2-metil-1,3-propanodiol y 2-amino-2-metil-1-propanol.
- 35 Los ejemplos de emulsión polimérica incluyen emulsiones de resina acrílica, emulsiones de poli(acrilato de etilo), disoluciones de resina acrílica, emulsiones de poli(acrilato-éster alquílico), emulsiones de resina de poli(acetato de vinilo) y látex de caucho natural.
- Los ejemplos de vitamina incluyen vitaminas A, B₁, B₂, B₆, C, E y sus derivados, ácido pantoténico y sus derivados, y biotina.
- 40 Los ejemplos de antioxidantes incluyen tocoferoles, dibutilhidroxitolueno, butilhidroxianisol y ésteres de ácido gálico.
- Los ejemplos de auxiliar de antioxidante incluyen ácido fosfórico, ácido cítrico, ácido ascórbico, ácido maleico, ácido malónico, ácido succínico, ácido fumárico, cefalina, hexametáfosfatos, ácido fítico y ácido etilendiaminotetraacético.
- 45 Los ejemplos de otros posibles componentes a ser mezclados incluyen antiséptico (tales como etilparabeno y butilparabeno); antiflogístico (tales como derivados de ácido glicirrízico, derivados de ácido glicirretínico, derivados de ácido salicílico, hinokitiol, óxido de cinc y alantoína); agente blanqueante (tal como extracto de placenta, extracto de saxifraga sarmentosa y arbutina); diversos extractos (tales como corteza de phellodendron, coptis, raíz de lithospermum, paeonia albiflora, swertia japonica, abedul, salvia, níspero, zanahoria, áloe, malva sylvestris (malva), iris, vitis vinífera (uva), coix lacruma jobi (lágrimas de San Pedro), luffa cylindrica, lirio, azafrán, enidium officinale, jengibre, hypericum perforatum, ononis spinosa, allium sativum (ajo), capsicum frutescens, piel de citrus unshiu, angelica acutiloba y alga marina); agente activador (por ejemplo, jalea real, fotosensibilizantes y derivados de colesterol); acelerador de la circulación sanguínea (tales como vanililamida del ácido nonílico, ésteres bencílicos del ácido nicotínico, ésteres β -butixoetílicos del ácido nicotínico, capsaicina, zingerona, tintura de cantáridas, ictamol, ácido tánico, α -borneol, nicotinato de tocoferol, hexanicotinato de inositol, ciclandelato, cinarizina, tolazolina, acetilcolina, verapamilo, cefarantina y γ -orizanol); agente antiseborreico (tales como azufre y tiantol); y agente antiinflamatorio (tal como ácido tranexámico, tiotaurina e hipotaurina).
- 55

Además, la composición para uso externo de la presente invención se puede usar en cualquier producto, incluyendo preparaciones externas para uso facial tales como lociones, emulsiones, cremas y mascarillas; preparaciones

externas para uso en maquillaje tales como bases, lápices de labios y sombras de ojos; preparaciones externas para uso corporal; composiciones aromáticas; preparaciones para limpieza de la piel tales como desmaquilladores y champú corporal; pomadas; preparaciones externas para el cabello tales como champú para el cabello, tintes para el cabello, tratamientos para el cabello, acondicionadores para el cabello, agentes estilistas para el cabello y agentes para el crecimiento del cabello.

Ejemplos

La presente invención será ilustrada adicionalmente en los siguientes ejemplos. Sin embargo, es de entender que estos ejemplos no se deben usar para limitar el alcance de la presente invención de ninguna manera. A menos que se indique lo contrario, la cantidad de mezcla de cada componente se expresa en % en masa con respecto a un sistema en el que está mezclado el componente.

Ejemplo de síntesis 1: 4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo) (es decir, el compuesto representado por la fórmula (II) mencionada anteriormente)

Se disolvieron 0,02 moles de malonato de di-2-etilhexilo en 5 ml de piridina, y se añadieron a ello 0,02 moles de 4-metoxibenzaldehído y 0,15 ml de piperidina. La mezcla se llevó a reflujo a 70 a 75 °C durante 4,5 horas, y después se enfrió. La disolución resultante se lavó con 10 ml de agua por dos veces, 10 ml de ácido clorhídrico 1N por dos veces, y 10 ml de bicarbonato de sodio saturado. La capa orgánica se secó con sulfato de sodio anhidro, y el disolvente se retiró por destilación para obtener el compuesto mencionado anteriormente, 4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo), en el estado de un líquido oleoso amarillo (rendimiento: 64 %). La longitud de onda de absorción máxima del compuesto fue 310 nm y la absorbancia fue 0,56 (etanol, 10 ppm). El espectro de absorción se muestra en la Fig. 1.

Como es obvio a partir del espectro de absorción en la Fig. 1, el componente (c) de la presente invención tiene un máximo de absorción en los UV-B. Además, puede ser mezclado preferiblemente en cosméticos porque tiene una buena solubilidad en bases cosméticas tales como alcoholes, aceites de éster y aceites de silicona. Particularmente, el compuesto representado por la fórmula (II) mencionada anteriormente es un material oleoso y es excelente para uso en cosméticos.

Ejemplo de ensayo 1: Efecto fotoestabilizante

Lo que sigue describirá cómo probar que el efecto del componente (b) para fotoestabilizar el componente (a) no es inhibido por el uso combinado del componente (c).

Se prepararon composiciones de filtro solar de tipo agua en aceite (W/O) por un método normal según las composiciones en la Tabla 1 a continuación, y se usaron como disoluciones de muestra (a saber, Muestras 1 a 5). Las Muestras 1 a 5 se aplicaron a cada membrana en un grosor de 2 mg/cm² uniformemente, y las membranas fueron irradiadas por 280 a 800 nm de longitud de onda a 40 °C durante 2,5 horas usando la fuente de luz (Suntest™ Atlas Material Testing Technology LLC), que simula la luz del sol.

Las muestras de pre-irradiación y post-irradiación fueron empapadas individualmente en 100 ml de tetrahidrofurano para extraer el absorbente UV, y la cantidad de componente (a) en cada muestra se determinó por HPLC. Una proporción residual de componente (a) en cada muestra de post-irradiación se calculó considerando la cantidad de componente (a) en su muestra de pre-irradiación como 100%. El resultado se muestra en la Tabla 1.

Ejemplo de ensayo 2: Efecto fotoprotector en el cuerpo humano

El efecto fotoprotector en el cuerpo humano se evaluó con el uso de las disoluciones de muestra (Muestras 1 a 5) preparadas en el Ejemplo de Ensayo 1. El SPF in vivo (es decir, Factor de Protección Solar in vivo) y el PFA in vivo (es decir, el Factor de Protección de UVA in vivo) de cada disolución de muestra se midió por un método de medida de acuerdo con el método COLIPA. El resultado se muestra en la Tabla 1.

Tabla 1

Componentes	Muestra 1	Muestra 2	Muestra 3	Muestra 4	Muestra 5
4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano [componente (a)]	2	2	2	2	2
p-metoxicinamato de 2-etilhexilo	-	-	-	5	5
Octocrileno [componente (b)]	-	5	5	5	-
4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo) [componente (c)]	-	-	3	-	-

Edetato de trisodio	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05
Etanol	3	3	3	3	3
Metilglucósido de polioxietileno	1	1	1	1	1
Decametilciclopentasiloxano	30	30	30	30	30
Dimetilpolisiloxano	5	5	5	5	5
Montmorillonita modificada con orgánicos	0,2	0,2	0,2	0,2	0,2
Copolímero de polioxietileno/metilpolisiloxano	1,5	1,5	1,5	1,5	1,5
Succinato de octilo	5	5	5	5	5
Antiséptico	0,55	0,55	0,55	0,55	0,55
Dióxido de titanio hidrofobizado	10	10	10	10	10
Agua purificada	residuo	residuo	residuo	residuo	residuo
PFA in vivo	3,0	10,2	10,2	5,7	5,7
SPF in vivo	10,0	23,6	44,5	37,0	20,0
Proporción residual de componente (a) después de la irradiación (%) (calculada considerando la cantidad de componente (a) antes de la irradiación como 100%)	8,8	67,5	85,0	33,6	27,2

Como es obvio a partir de los resultados en la Tabla 1, la Muestra 3, que contenía los componentes (a), (b) y (c), que es la composición de la presente invención, consigue un excelente y mejorado efecto fotoprotector sobre el cuerpo humano y un efecto fotoestabilizante en comparación con las Muestras 1, 2, 4 y 5, que son las comparaciones.

5 Ejemplo de ensayo 3: Solubilidad de absorbentes UV escasamente solubles

Se usó un derivado de triazina y un derivado de dibenzoilmetano (es decir, componente (a)) como ejemplos representativos de absorbentes UV escasamente solubles, y se examinó la solubilidad de cada compuesto en los aceites mostrados en la Tabla 2 a continuación.

(Método experimental)

- 10 Cada uno del derivado de triazina y el derivado de dibenzoilmetano se calentó y se disolvió en cada aceite mostrado en la Tabla 2, y después cada mezcla se enfrió hasta la temperatura ambiente. Después de añadir núcleos cristalinos, se enfriaron a 0 °C. Se midió una solubilidad de saturación de cada fluido sobrenadante. El resultado se muestra en la Tabla 2.

Se usó 4-bis[[4-(4-etilhexiloxi)-2-hidroxifenil]-6-(4-metoxifenil)1,3,5-triazina como derivado de triazina.

- 15 Se usó 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano como derivado de dibenzoilmetano (es decir, componente (a)).

Tabla 2

Aceite	Solubilidad de saturación del derivado de triazina	Solubilidad de saturación del derivado de dibenzoilmetano
4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo) [componente (c)]	8,8 %	10
Benzoato de alquilo (que tiene un número de carbonos de 12 a 15)	8 %	8,8 %
Succinato de dioctilo	4 %	9,7 %
Tetraoctanoato de pentaeritritol	4 %	6 %

Como es obvio a partir de los resultados en la Tabla 2, el componente (c) usado en la presente invención tiene una solubilidad similar o mejorada en absorbentes UV escasamente solubles, en comparación con los otros aceites que tienen alta solubilidad en absorbentes UV escasamente solubles.

Los ejemplos de formulación de la composición de la presente invención se describirán a continuación.

5 Ejemplo 1: Emulsión de filtro solar (W/O)

(Componentes)	(% en masa)
A. Fase oleosa	
Silicona cíclica volátil	27
Copoliol de dimeticona	0,9
Polioxibutilen-polioxipropilenglicol ("UNIOL PB-700", producido por NOF CORPORATION)	0,8
Dióxido de titanio (Hidrofobizado)	10
Óxido de cinc (Hidrofobizado)	10
Talco (Hidrofobizado)	4
Benzoato de fenetilo	10
p-metoxicinamato de 2-etilhexilo	3
4-metoxi-4'-t-butildibenzoilmetano	1
2,4-bis[[4-(2-etilhexilo)-2-hidroxifenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina	1
Octocrileno	2
Éster hexílico del ácido 2-[4-(dietilamino)-2-hidroxibenzoil]-benzoico	1
4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo)	1
Montmorillonita modificada con orgánicos	0,5
Antiséptico	c.s.
Perfume	c.s.
B. Fase acuosa	
Ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico	2
Dipropilenglicol	7
Trietanolamina	1,1
Agua purificada	Resto

(Método de preparación)

Los componentes de la fase oleosa y los de la fase acuosa se mezclaron y disolvieron individualmente. En la fase oleosa, se dispersó bien el dióxido de titanio, y después se añadió a la misma la fase acuosa. La mezcla de la fase oleosa y de la fase acuosa fue emulsionada con un homogeneizador. La emulsión de filtro solar obtenida tenía una fotoestabilidad extremadamente alta.

10

Ejemplo 2 Emulsión de filtro solar (W/O)

(Componentes)	(% en masa)
A. Fase oleosa	
Dimetilpolisiloxano	1
Decametilciclopentasiloxano	25

Trimetilsiloxisilicato	5
Copolímero de polioxietileno/metilpolisiloxano	1
Lauril PEG-9 polidimetilsiloxietil-dimeticona	1
Isononato de isononilo	5
p-metoxicinamato de 2-etilhexilo	3
Hectoria de dimetildiestearilamonio	0,5
Polvo de poli(acrilato de alquilo) esférico	5
Butiletilpropanodiol	0,5
2,4,6-tris[p-(2'-etilhexil-1'-oxicarbonil)anilino]1,3,5-triazina	1
Hidroxi-etilhexilfenoxibenzotriazol	1
4-metoxi-4'-t-butildibenzoilmetano	1
2,4-bis[[4-(2-etilhexiloxi)-2-hidroxi]fenil]-6-(4-metoxifenil)1,3,5-triazina	2
Octocrileno	2
Éster hexílico del ácido 2-[4-(dietilamino)-2-hidroxibenzoil]-benzoico	1
ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico	1
4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo)	3
Silicona de alquil-aril-1,3-propanodiona	5
Benzoato de fenetilo	5
Óxido de cinc hidrofobizado	7
Dióxido de titanio hidrofobizado	8
B. Fase acuosa	
Hidróxido de sodio	0,15
Dipropilenglicol	5
Glicirricinato de dipotasio	0,02
Glutación	1
Tiotaurina	0,05
Extracto de sophora angustifolia	1
Parabeno	c.s.
Fenoxietanol	c.s.
Agua purificada	Resto

(Método de preparación)

La fase acuosa se añadió gradualmente a la fase oleosa. Después de completar la adición, se preparó una emulsión de filtro solar con una mezcladora que proporcionaba una distribución emulsionada uniforme de las partículas. La emulsión de filtro solar obtenida tenía una fotoestabilidad extremadamente alta.

5 Ejemplo 3: Crema de filtro solar (O/W)

(Componentes)

(% en masa)

A. Fase oleosa

Ácido esteárico	10
Alcohol estearílico	4
Estearato de butilo	8
Monoéster de ácido esteárico de glicerina	2
Polioxibutilen-polioxipropilenglicol ("UNIOL PB-700", producido por NOF CORPORATION)	2
Acetato de vitamina E	0,5
Palmitato de vitamina A	0,1
Benzoato de fenetilo	5
4-metoxi-4'-t-butildibenzoilmetano	2
2,4-bis[[4-(2-etilhexiloxi)-2-hidroxifenil]-6-(4-metoxifenil)1,3,5-triazina	3
Octocrileno	3
p-metoxicinamato de 2-etilhexilo	3
4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo)	3
Aceite de nuez de macadamia	1
Aceite de semilla de té	3
Perfume	0,4
Antiséptico	c.s.
B. Fase acuosa	
Glicerina	4
1,2-pentadiol	3
Hialuronato de sodio	1
Hidróxido de potasio	2
Ascorbilfosfato de magnesio	0,1
Hidrocloruro de L-arginina	0,01
Edetato de trisodio	0,05
Agua purificada	Resto

(Método de preparación)

Los componentes de la fase oleosa A y los de la fase acuosa B se calentaron individualmente a 70 °C y se disolvieron completamente. La fase oleosa A se añadió a la fase acuosa B, y la mezcla se emulsionó con un equipo de emulsificación. El producto se enfrió con un intercambiador de calor para obtener crema. La crema de filtro solar obtenida tenía una fotoestabilidad extremadamente alta.

5

Ejemplo 4: Crema (O/W)

(Componentes)	(% en masa)
A. Fase oleosa	
Cetanol	4
Vaselina	7
Miristato de isopropilo	8

Escualano	10
Octiltriazone	2
4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo)	1
p-metoxicinamato de 2-etilhexilo	1
Octocrileno	0,5
Butilmetoxidibenzoilmetano	2
Monoéster de ácido esteárico de glicerina	2,2
Monoestearato de POE(20) sorbitán	2,8
Benzoato de fenetilo	5
Nicotinato de vitamina E	2
Perfume	0,3
Antioxidantes	c.s.
Antiséptico	c.s.
B. Fase acuosa	
Glicerina	10
Hialuronato de sodio	0,02
Dipropilenglicol	4
Pirrolidonacarboxilato de sodio	1
Edetato de disodio	0,01
Agua purificada	Resto

(Método de preparación)

Los componentes de la fase oleosa y los de la fase acuosa se mezclaron individualmente y se disolvieron. La fase acuosa se añadió a la fase oleosa, y la mezcla se emulsionó con un homogeneizador para obtener crema. La crema obtenida tenía una fotoestabilidad extremadamente alta. Adicionalmente, la crema consiguió una excelente suavidad y una sensación no pegajosa, a la vez que conservó un efecto humectante.

5

Ejemplo 5: Emulsión de filtro solar (O/W)

(Componentes)	(% en masa)
A. Fase oleosa	
Copoliol de dimeticona	0,5
Decametilciclopentasiloxano	15
Ácido isoesteárico	0,5
Feniltrimeticona	1
Óxido de titanio hidrofobizado	5
2,4,6-tris[p-(2'-etilhexil-1'-oxicarbonil)anilino]1,3,5-triazina	3
p-metoxicinamato de 2-etilhexilo	5
Derivado de silicona de alquil-aril-1,3-propanodiona	5
4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano	2

ES 2 547 649 T3

Octocrileno	0,5
4-metoxibenzalmalonato de di-(2-etilhexilo)	2
Sílice	1
Fenoxietanol	c.s.
Glicerina	1
Succinoglicano	0,2
Goma de celulosa	1
Benzoato de fenetilo	5
B. Fase acuosa	
Aceite de ricino endurecido con polioxietileno	1
Ácido cítrico	0,01
Citrato de sodio	0,09
Parabeno	c.s.
Etanol	5
Agua de intercambio iónico	Resto

(Método de preparación)

Los componentes de la fase oleosa y los de la fase acuosa se mezclaron individualmente y se disolvieron. La fase oleosa se añadió a la fase acuosa, y la mezcla se emulsionó con un homogeneizador para obtener una emulsión de filtro solar. La emulsión de filtro solar obtenida tenía una fotoestabilidad extremadamente alta.

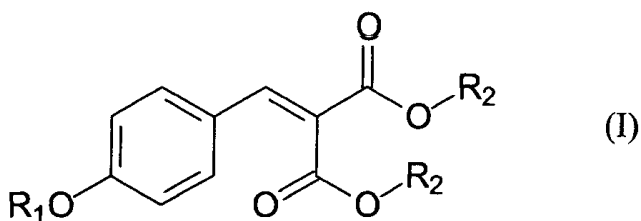
REIVINDICACIONES

1. Composición para la piel o el cabello, que comprende:

(a) 0,01 a 10 % en masa de un derivado de dibenzoilmetano;

(b) 0,01 a 10 % en masa de un β,β -difenilacrilato y/o α -ciano- β,β -difenilacrilato de alquilo, y

5 (c) 0,1 % en masa o más de un derivado de benzalmalonato representado por la siguiente fórmula (I):



en donde R_1 y R_2 representan independientemente un grupo alquilo que tiene un número de carbonos de 1 a 20.

2. La composición para la piel o el cabello según la reivindicación 1, en donde R_1 es un grupo metilo.

3. La composición para la piel o el cabello según la reivindicación 1 o 2, en donde R_2 es un grupo 2-etilhexilo.

10 4. La composición para la piel o el cabello según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el componente (a) es 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano.

5. La composición para la piel o el cabello según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde el componente (b) es octocrileno.

15 6. La composición para la piel o el cabello según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, que es un cosmético de filtro solar.

FIG.1

