

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 584 204**

51 Int. Cl.:

**C07F 7/08** (2006.01)

**A61Q 17/04** (2006.01)

**A61K 8/58** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.02.2007 E 07726317 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **27.04.2016 EP 1981895**

54 Título: **Derivados de hidroxibenzofenona**

30 Prioridad:

**09.02.2006 EP 06101454**

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

**26.09.2016**

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**HAASE, JÜRGE;  
MÜLLER, STEFAN y  
EHLIS, THOMAS**

74 Agente/Representante:

**CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel**

Observaciones :

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

**ES 2 584 204 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 hidroxibenzofenona

5 La presente invención se relaciona con amortiguadores UV de hidroxibenzofenona UV, con la preparación de estos componentes, con el uso de estos componentes para protección de piel humana y animal y cabello de los efectos dañinos de la radiación UV, y con su uso en formulaciones cosméticas y farmacéuticas.

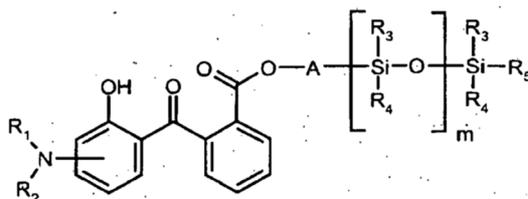
Se conoce que ciertos filtros UV orgánicos, tales como, por ejemplo, derivados de benzofenona poco solubles, tienen propiedades pronunciadas de filtro UV. Sin embargo, la solubilidad de tales filtros UV orgánicos en solventes como ciclometicona (ciclopentasiloxano) que son adecuados para formulaciones cosméticas específicas como aerosoles en los que el activo está disuelto en ciclometicona y aceites de silicio, es usualmente inadecuada.

10 Existe un interés fuerte en los filtros protectores de luz orgánicos que pueden ser incorporados rápidamente en formulaciones cosméticas, que se puede decir que tienen buena solubilidad en aceite. El documento WO03086340 divulga hidroxibenzofenonas útiles como filtros UV.

El problema de la presente invención es por lo tanto encontrar filtros UV orgánicos o mezclas de filtros UV que tienen buena solubilidad en solventes que son adecuados para formulaciones cosméticas.

15 Se ha encontrado ahora sorprendentemente que composiciones de amortiguador de UV que comprenden derivados de benzofenona sililada seleccionados, tienen tales propiedades.

La presente invención por lo tanto se refiere a derivados de hidroxifenilbenzofenona de la fórmula (1)

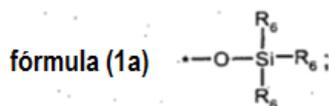


20 en la que

R<sub>1</sub> R<sub>2</sub> son independientemente uno de otro hidrógeno; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>; alquenido C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>; cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>; cicloalquenido C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>; o

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> juntos con el átomo de nitrógeno que los une forman un anillo heterocíclico de 5- 6 miembros;

25 R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y R<sub>5</sub> son independientemente uno del otro alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> un radical de



R<sub>6</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

A es alquileno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o (alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-O-(CO)-(alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>); y

m es 0

30 Alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub> denota un grupo alquilo lineal o ramificado, no sustituidos o sustituido tal como, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, n-butilo, n-hexilo, ciclohexilo, n-decilo, n-dodecilo, n-octadecilo, eicosilo, metoxietilo, etoxipropilo, 2-etilhexilo, hidroxietilo, cloropropilo, N,N-dietilaminopropilo, cianoetilo, fenetilo, bencilo, p-tert-butilfenetilo, p-tert-octilfenoxietilo, 3-(2,4-di-tert-amilfenoxi)-propilo, etoxicarbonilmetil-2-(2-hidroxietoxi)etil o 2-furiletilo.

35 Alquenido C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub> es por ejemplo alilo, metalilo, isopropenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, isobutenilo, n-penta-2,4-dienilo, 3-metil-but-2-enilo, n-oct-2-enilo, n-dodec-2-enilo, iso-dodecenilo, n-dodec-2-enil o n-octadec-4-enilo.

Cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> es por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo o ciclodecilo y preferiblemente ciclohexilo. Estos radicales pueden ser sustituidos, por ejemplo por uno o más o iguales o diferentes

radicales alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, preferiblemente por metilo, y/o hidroxilo. Si los radicales cicloalquilo son sustituidos por uno o más radicales, estos son sustituidos por uno, dos o, preferiblemente por uno o dos iguales o radicales.

5 Cicloalqueno C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> es por ejemplo ciclopropeno, ciclobuteno, ciclopenteno, ciclohepteno, cicloocteno, ciclodeceno o ciclohexeno and preferiblemente ciclohexeno. Estos radicales pueden ser sustituidos, por ejemplo por uno o más o iguales o diferentes radicales alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, preferiblemente por metilo, y/o hidroxilo. Si los radicales cicloalqueno son sustituidos por uno o más radicales, estos son sustituidos por uno, dos o, preferiblemente por uno o dos iguales o radicales.

Los sustituidos de hidroxilo con grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> son por ejemplo hidroximetilo, hidroxietilo, hidroxipropilo, hidroxibutilo o hidroxipentilo.

10 Alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> es por ejemplo metileno, etileno, propileno, butileno o hexileno.

Los radicales de alqueno pueden ser sustituidos por uno o más radicales alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>.

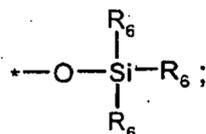
15 Si R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son radicales heterocíclicos, estos comprenden uno, dos, tres o cuatro iguales o diferentes anillos de heteroátomos. Se da preferencia especial a heterociclos que contienen uno, dos o tres, especialmente uno o dos, heteroátomos idénticos o diferentes. Los heterociclos pueden ser mono o policíclicos, bi o tricíclicos. Éstos son preferiblemente mono o bicíclicos, especialmente monocíclicos. Estos anillos preferiblemente contienen 5, 6 o 7 miembros del anillo. Ejemplos de sistemas monocíclicos y bicíclicos heterocíclicos de los cuales los radicales que se presentan en los compuestos de la fórmula (1) puede ser derivados son, por ejemplo, pirrol, furano, tiofeno, imidazol, pirazol, 1,2,3-triazol, 1,2,4-triazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, pirano, tiopirano, 1,4-dioxano, 1,2-oxazina, 1,3-oxazina, 1,4-oxazina, indol, benzotiofeno, benzofurano, pirrolidina, piperidina, piperazina, morfolina y tiomorfolina.

20 En los compuestos de la fórmula (1) R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son preferiblemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>, más preferiblemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> y lo más preferiblemente, R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> en la fórmula (1) tienen la misma definición.

En los compuestos de la fórmula (1) A es alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o (alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-O-(CO)- alqueno (C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>).

En la fórmula (1) m es 0.

R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> en la fórmula (1) son preferiblemente un radical de la fórmula (1 a)



25

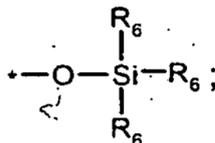
en la que

R<sub>6</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

Son más preferidos los compuestos de la fórmula (1), en la que

30 R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>;

R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son un radical de la fórmula (1a)



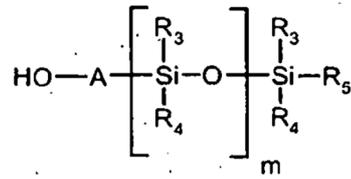
R<sub>6</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>;

35 A es alqueno C<sub>3</sub>; y

m es 0.

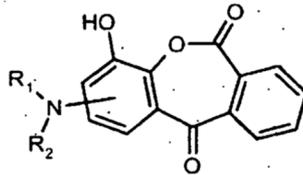
Los compuestos de la fórmula (1) pueden ser preparados por una forma conocida per se.

Usualmente estos son preparados por reacción de un compuesto de siloxanol de la fórmula (1b)



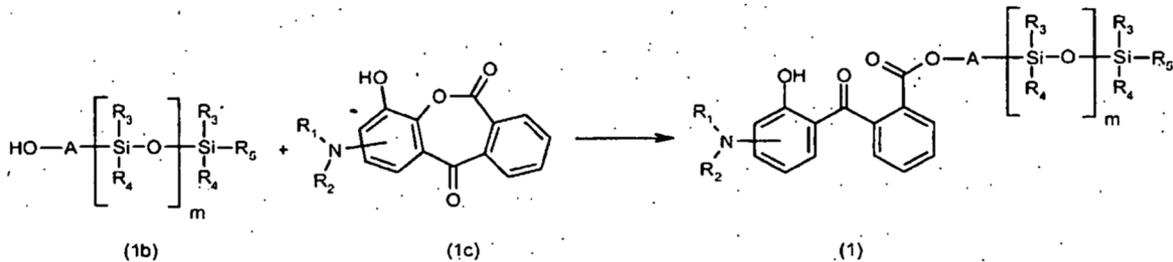
con un ácido carboxílico de benzofenona o anhídrido de la fórmula (1c)

5



de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:

10



Están definidos R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y R<sub>5</sub>, A y m como en la fórmula (1).

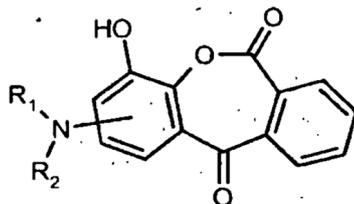
Otra ruta de reparación comprende hidrosililación del éster insaturado de ácido carboxílico de benzofenona por ejemplo alilésteres que usan un catalizador conocido (Pt, Cu) hidrosiloxano correspondiente.

15

La reacción es usualmente llevada a cabo a una temperatura desde 25 hasta 200°C. Generalmente no es necesario un solvente para esta reacción. Sin embargo si se usa un solvente, preferiblemente son preferidos los solventes como se usan en los ejemplos de trabajo.

El tiempo de reacción esta usualmente desde 0.5 a 20 h.

20 Los compuestos de inicio de la fórmula (1c)



son conocidos en la técnica anterior, por ejemplo el documento WO 2004/052837.

Estos son preparados de una forma conocida per se por deshidratación del compuesto de la fórmula (1 d) a los compuestos de la fórmula (1 c)

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son definidos como la fórmula (1).

5 Los compuestos de la fórmula (1) de acuerdo con la presente invención son particularmente adecuados como filtros UV, es decir para proteger materiales orgánicos sensibles a ultravioleta, en particular la piel y cabello de humanos y animales, de los efectos dañinos de la radiación UV. Éstos compuestos son por lo tanto adecuados como pantallas solares en preparaciones médicas cosméticas, farmacéuticas y veterinarias. Éstos compuestos son preferiblemente usados en forma disuelta.

10 Las formulaciones cosméticas o composiciones farmacéuticas de acuerdo con la presente invención pueden contener adicionalmente uno o más que uno filtro UV convencional adicional.

Las preparaciones cosméticas o farmacéuticas pueden ser, por ejemplo, cremas, geles, lociones, alcohólicas y acuosas/alcohólicas, emulsiones, soluciones de cera/grasa, preparaciones en barra, polvos o ungüentos. Adicionalmente a los filtros UV mencionados anteriormente, las preparaciones cosméticas o farmacéuticas pueden contener adyuvantes adicionales como se describe anteriormente.

15 Como emulsiones que contienen agua o aceite (por ejemplo emulsiones o microemulsiones W/O, O/W, O/W/O y W/O/W) las preparaciones contienen, por ejemplo, de 0.1 a 30 % en peso, preferiblemente de 0.1 a 15 % en peso especialmente de 0.5 a 10 % en peso, basado en el peso total de la composición, de uno o más amortiguadores de UV, de 1 a 60 % en peso, especialmente de 5 a 50 % en peso y preferiblemente de 10 a 35 % en peso, basado en el peso total de la composición, de al menos un componente de aceite, de 0 a 30 % en peso, especialmente de 1 a 30 % en peso y preferiblemente de 4 a 20 % en peso, basado en el peso total de la composición, de al menos un emulsificante, de 10 a 90 % en peso, especialmente de 30 a 90 % en peso, basado en el peso total de la composición, de agua y de 0 a 88.9 % en peso, especialmente de 1 a 50 % en peso, de adyuvantes aceptables cosméticamente adicionales.

25 Las composiciones/preparaciones cosméticas o farmacéuticas de acuerdo con la invención pueden también contener uno o uno más compuestos adicionales como alcoholes grasos, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos naturales o sintéticos que incluyen ésteres de glicerilo y derivados, ceras de brillo perlado, aceites de hidrocarburos, siliconas o siloxanos, agentes de reengrasado órgano sustituidos, reguladores surfactante de consistencia/espesantes y modificadores de reología, polímeros, ingredientes activos biogénicos, desodorantes de ingredientes activos, agentes anticaspa, antioxidantes, agentes hidrótopos, conservantes y agentes de inhibición bacteriana, aceites de perfume, colorantes, perlas poliméricas o esferas huecas como potenciadores SPF.

Preparaciones cosméticas y farmacéuticas

Las formulaciones cosméticas o farmacéuticas son ingredientes en una amplia variedad de preparaciones cosméticas. Las siguientes preparaciones son de especial interés:

35 -preparaciones de cuidado de piel, por ejemplo preparaciones para el lavado y limpieza de la piel en la forma de jabones líquidos o en forma de tableta, detergentes sin jabón o pastas de lavado; o emulsiones para la piel, multiemulsiones o aceites para la piel;

- preparaciones para el baño, por ejemplo líquidos (baños de espuma, leches, preparaciones para la ducha) o preparaciones para el baño sólidas, por ejemplo cubos de baño y sales de baño;

40 - preparaciones para el cuidado personal cosméticos, por ejemplo, maquillaje facial en forma de cremas de día o cremas en polvo, polvo de cara (suelto o compacto), colorete o crema de maquillaje, preparaciones para el cuidado de los ojos, por ejemplo, preparaciones de sombras de ojos, rímel, delineador de ojos, cremas de ojos o cremas de reparación de averías; preparaciones para el cuidado de los labios, por ejemplo coloretes, brillo de labios, lápices de contorno de labios, preparaciones para el cuidado de uñas, como el esmalte de uñas, quitaesmaltes, endurecedores de uñas o removedores de cutícula;

45 - preparaciones para el cuidado de los pies, por ejemplo baños de pies, polvos para los pies, cremas para pies o bálsamos para pies, desodorantes especiales y antitranspirantes o preparaciones para quitar callos;

- preparaciones de protección de luz, tales como leches solares, lociones, cremas o aceites, bloqueadores solares o tropicales, preparaciones antes del bronceado o preparaciones para después del sol;

- preparaciones de la piel para el bronceado, por ejemplo cremas autobronceadoras;

50 - preparaciones despigmentantes, por ejemplo, preparaciones para blanquear la piel o preparaciones para aclarar la piel;

- repelentes de insectos, por ejemplo, aceites repelentes de insectos, lociones, aerosoles o barras;

- desodorantes, tales como desodorantes en aerosol, atomizadores, desodorantes en gel, barras o aplicador en forma de bola;
  - antitranspirantes, por ejemplo, barras antitranspirantes, cremas o aplicadores en forma de bola;
- 5
- preparaciones para la limpieza y el cuidado de la piel manchada, por ejemplo, detergentes sintéticos (sólidos o líquidos), descamación o preparaciones de limpieza o las máscaras de pelado;
  - preparaciones de depilación en forma química (depilación), por ejemplo, polvos para depilar, preparaciones para depilar, preparaciones en forma líquida o de pasta para depilar, preparaciones para depilar en forma de gel o espumas en aerosol;
- 10
- preparaciones para el afeitado, por ejemplo jabón de afeitar, cremas de afeitar espumantes, cremas de afeitar no espumantes, espumas y geles, preparaciones para antes del afeitado para el afeitado en seco, después del afeitado o lociones para después del afeitado;
  - preparaciones de fragancias, por ejemplo fragancias (eau de Cologne, eau de toilette, eau de parfum, parfum de toilette, perfume), aceite de perfume o cremas de perfume;
- 15
- preparaciones de tratamiento cosmético para el cabello, por ejemplo, preparaciones de lavado de cabello en forma de champús y acondicionadores, preparaciones para el cuidado del cabello, por ejemplo preparaciones de pretratamiento, tónicos capilares, cremas de peinado, geles fijadores, pomadas, enjuagues para el cabello, paquetes de tratamiento, tratamientos intensivos para el cabello, preparaciones para el cabello de estructuración, por ejemplo, preparaciones para uso con secador para ondas permanentes (onda caliente, onda suave, onda fría), preparaciones para alisar el cabello, fijadores para el cabello de preparación líquida, espumas para el cabello, lacas para el cabello,
- 20
- preparaciones para blanquear, por ejemplo soluciones de peróxido de hidrógeno, champús aclaradores, cremas blanqueadoras, polvos decolorantes, pastas blanqueadoras o aceites, colorantes para el cabello, semipermanentes o permanentes temporales, preparaciones que contienen tintes autooxidantes, o colorantes naturales para el cabello, tales como henna o manzanilla.
- Formas de presentación
- 25
- Las formulaciones finales listadas pueden existir en una amplia variedad de formas de presentaciones, por ejemplo:
- en la forma de preparaciones líquidas como una emulsión de W/O, O/W, O/W/O, W/O/W o PIT y toda clase de microemulsiones,
  - en la forma de un gel,
  - en la forma de un aceite, una crema, leche o loción,
- 30
- en la forma de un polvo, una laca, una tableta maquillaje,
  - en la forma de una barra,
  - en la forma de un aerosol (rociar con gas propulsor o spray de bombeo) o un aerosol,
  - en la forma de un jabón, o
  - en la forma de una pasta.
- 35
- De especial importancia como preparaciones cosméticas para la piel son las preparaciones protectoras de la luz, tales como leches para el sol, lociones, cremas, aceites, bloqueadores solares o tropicales, preparaciones prebronceo o preparaciones para después del sol, también preparaciones de la piel para el bronceado. De particular interés son cremas de protección solar, lociones de protección solar, leche de protección solar y preparaciones de protección solar en la forma de un aerosol.
- 40
- De especial importancia como preparaciones cosméticas para el cabello son las preparaciones mencionadas anteriormente para el tratamiento del cabello, especialmente preparaciones de lavado del cabello en forma de champús, acondicionadores para el cabello, preparaciones para el cuidado del cabello, por ejemplo preparaciones de pretratamiento, tónicos capilares, cremas de peinado, geles de peinado, pomadas, enjuagues para el cabello, paquetes de tratamiento, tratamientos intensivos para el cabello, preparaciones para alisar el cabello, preparaciones de fijación del cabello líquidos, espumas para el cabello y lacas para el cabello. De especial interés son las preparaciones para el lavado del cabello en forma de champús.
- 45

Un champú tiene, por ejemplo, las siguientes composiciones: desde 0.01 a 5 % en peso amortiguador de UV de acuerdo con la invención, 12.0 % en peso de laureth-2-sulfato de sodio, 4.0 % en peso de cocamidopropil betaina, 3.0 % en peso cloruro de sodio, y agua hasta 100%.

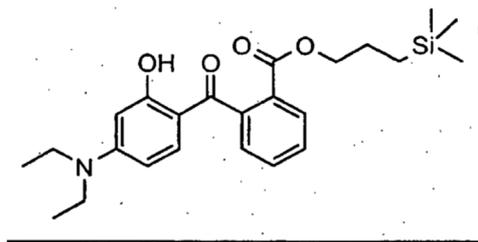
- 5 Otros ingredientes típicos en tales formulaciones son conservantes, bactericidas y agentes bacteriostáticos, perfumes, colorantes, pigmentos, agentes espesantes, agentes hidratantes, humectantes, grasas, aceites, ceras u otros ingredientes típicos de formulaciones cosméticas y de cuidado personal, tales como alcoholes, polialcoholes, polímeros, electrolitos, disolventes orgánicos, derivados de silicio, emolientes, emulsionantes o agentes surfactantes emulsionantes, agentes surfactantes, agentes dispersantes, antioxidantes, antiirritantes y agentes anti-inflamatorios, etc.

Las preparaciones cosméticas de acuerdo con la invención se distinguen por excelente protección de la piel humana contra el efecto dañino de luz del sol.

### Ejemplos

#### 10 A. Ejemplos de reparación

##### Ejemplo A1: Preparación del compuesto de la fórmula (101)



- 6.8g 3-(trimetilsilil)-1-propanol,  
0.1g 4-dimetilaminopiridine y  
15 14.8g dietilamino-dibenzo-oxepin-6,11-diona que corresponden a la fórmula (101a)  
disuelta to en 70 ml de tolueno  
son agitados durante 7h a 75-85°C en un baño de ace ite.

La masa de reacción es separada después de la evaporación por cromatografía en columna (sílica gel 60/tolueno: etil éster de ácido acético).

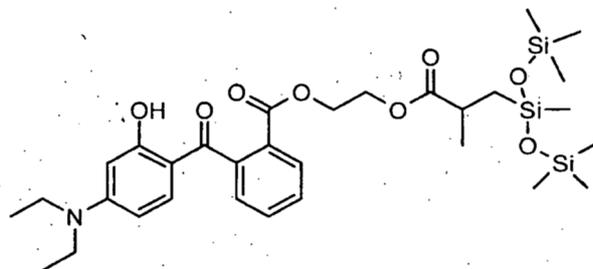
- 20 Se obtienen 8g de un producto puro (aceite amarillo brillante).

Análisis elemental: C =67.2 %, H=7.9 %, N=3.2 % (Th: C=67.4%, H=7.8 %, N=3.3%)  $\lambda_{\max}$  = 350 nm; E 1/1 = 822.

El compuesto obtenido es soluble en ciclometicona (solubilidad en ciclometicona es 1.8 % a RT).

##### Ejemplo A2: preparación del compuesto de la fórmula (102)

25



Se hacen reaccionar en tolueno y se separa como se describe en el Ejemplo 1 4.0 g 1,1,1,3,5,5,5-heptametil-trimetil-silil-propanol, preparados por hidrosililación de alilalcohol con 1,1,1,3,5,5,5-heptametil-trimetilsiloxano,

- 30 14.8g dietilamino-dibenzo-oxepina-6,11-diona y

0.1g 4-dimetilaminopiridina.

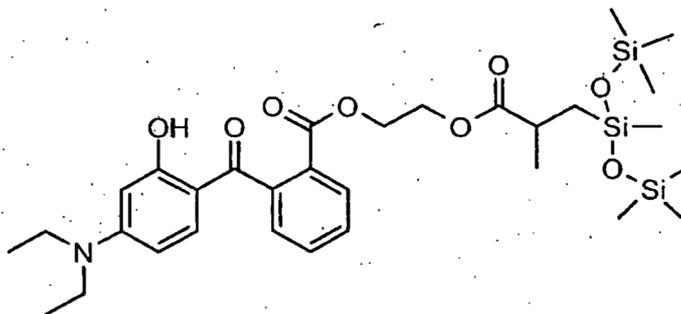
Se obtienen Aproximadamente 8g de un producto final puro de un aceite viscoso amarillo (por determinación a través de cromatografía en columna).

Análisis elemental: C, H, N de acuerdo con la teoría.

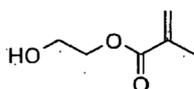
5  $\lambda_{\max} = 350 \text{ nm}$ ; E 1/1 = 571

La solubilidad en ciclometicona a temperatura ambiente es > 20 %.

**Ejemplo A3: Preparación del compuesto de la fórmula (103)**



10 26 g del compuesto de la fórmula

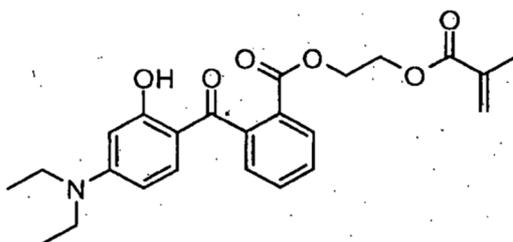


y 58.8 g del compuesto la fórmula (101a) son mezclados juntos con 200 ml de acetato de propilo.

0.4 g 4-(dimetilamino)-piridina y 1 g hidroquinona monometiléter son añadidos y calentados hasta 95°C durante 3 h.

15 La mezcla se concentra a un volumen de aproximadamente 100 ml con el evaporado rotativo y se añade 600 ml de metanol.

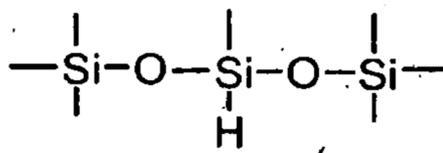
Cristales sin color del compuesto de la fórmula (103a)



20 se forman durante la noche.

12.8 g del compuesto de la fórmula (103a) se añaden a 50 ml de 1-butanol y calentados hasta aproximadamente 80°C (bajo gas inerte).

9.0 g del compuesto de la fórmula (103b)



y 5 gotas de un catalizador Karstedt (Aldrich) son disueltos en 10 ml 1-butanol y se añadieron gota a gota durante 30 min.

- 5 La solución es agitada a 80°C por 8 h.

Después de la concentración, el producto en bruto es purificado través de cromatografía de columna para obtener el compuesto de la fórmula (103).

$\lambda_{\max} = 357 \text{ nm}$  ;  $E_{1/1} = 606$

### B. Ejemplos de Aplicaciones

#### 10 Ejemplos B1 - B6

Se preparan seis formulaciones de tipo de silicona de agua. Todas las formulaciones muestran alta eficiencia y una extraordinaria sensación de suavidad en la piel.

Los Ejemplos B1 a B3 son formulaciones de silicona de agua en las que el compuesto de la fórmula (102) es usado como un filtro UV-A de silicona soluble.

- 15 Ejemplos B4 a B6 son formulaciones de silicona de agua en las que el compuesto de la fórmula (103) es usado como un filtro UV-A de silicona soluble.

Los valores altos de FPS y protección de alta UVA se obtienen como se muestra en la Tabla B1.

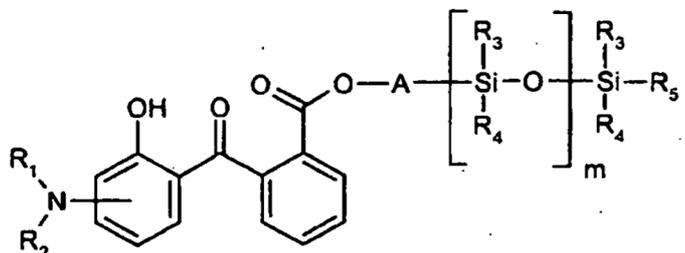
Tabla B1: formulaciones de silicona de agua							
Parte	Nombre INCI/Nombre Químico	% p/p (como se suministra)					
		Ex. B1	Ex. B2	Ex. B3	Ex. B4	Ex. B5	Ex. B6
A	Cetil PEG/PPG-10/1 Dimeticona						
	Isononil Isononanoato	2.80	2.80	2.80	2.80	2.80	2.80
	Cetil dimeticona	4.00	4.00	4.00	4.00	4.00	4.00
	Silica Dimetil Sililato	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00
	Etilhexil metoxicinamato	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30	0.30
	Octocrileno	6.00	6.00	8.00	6.00	6.00	8.00
	Compuesto de la fórmula (102) preparado de acuerdo con el Ejemplo A2	3.00	3.00	3.00			
	Compuesto de la fórmula (103) preparado de acuerdo con el Ejemplo A3				3.00	3.50	3.50
	Bis-Etilhexiloxifenol metoxifenil Triazina	3.00	3.50	3.50	3.00	3.50	3.50
B	Ciclometicona		1.00	1.50		1.00	1.50
	Dimeticona	12.00	12.00	12.00	12.00	12.00	12.00
	Dimeticona (y) polímero cruzado de dimeticona/vinil dimeticona	5.00	5.00	5.00	5.00	5.00	5.00

ES 2 584 204 T3

Parte C	Dióxido de titanio (y) hidróxido de aluminio (y) copolímero de Dimeticona/- Meticona (y) sílica hidratada	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00
Parte D	Agua			1.50			1.50
	Butilen Glicol	qs a 100					
	Cloruro de sodio	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00	3.00
Parte E	Alcohol	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00	1.00
		5.00	5.00	5.00	5.00	5.00	5.00
<b>Resultados:</b>							
	Medición SPF In-vitro	15	19	30			
	Balance de UVA (de acuerdo con DIN 67502)	21	26	20			

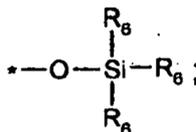
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula (1)



5 en la que

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> independientemente el uno del otro son hidrógeno; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>; alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>; cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>; cicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>; o R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> junto con el átomo de nitrógeno que los une forman un anillo heterocíclico de 5-6 miembros; R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sub>5</sub> independientemente el uno del otro son hidrógeno alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; o un radical de la fórmula a radical of formula (1 a)



10

R<sub>6</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

A es alquilenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o (alquilenilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-O-(CO)- alquilenilo (C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>); y

m es 0.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

15 R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en los que

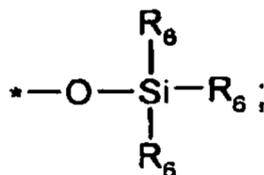
R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> independientemente el uno del otro alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>.

4. Compuestos de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en los que

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> en la fórmula (1) tienen la misma definición

20 5. Compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en los que

R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son radicales de la fórmula (1a)



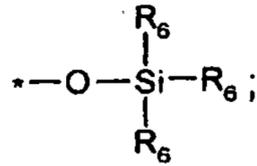
en los que

25 R<sub>6</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

6. Compuestos de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en los que

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>;

R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son un radical de la fórmula (1a)

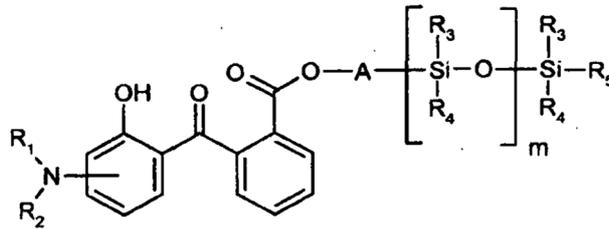


R<sub>6</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>;

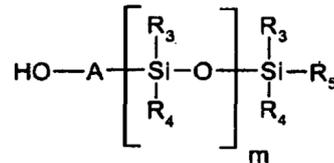
A es alquileno C<sub>3</sub>; y

5 m es 0.

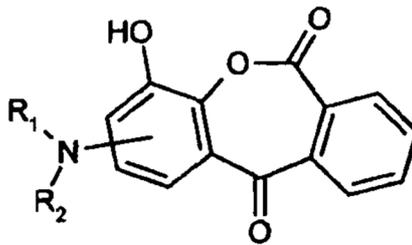
7. Procesos para la preparación de derivados de hidroxifenilbenzofenona de la fórmula (1)



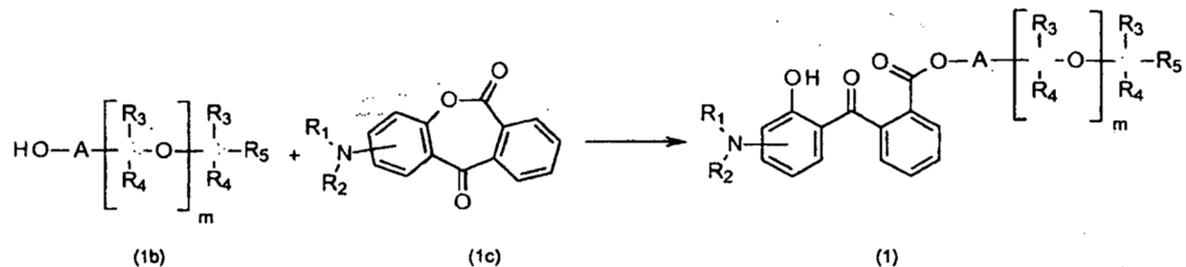
que comprende la reacción de un compuesto de siloxanol de la fórmula (1b)



10 con un ácido carboxílico de benzofenona o anhídrido de la fórmula (1c)



de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



15 en el que R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y R<sub>5</sub>, A y m están definidos como en la reivindicación 1.

8. Una preparación cosmética que comprende al menos uno o más compuestos de la fórmula (1) de acuerdo con la reivindicación 1 con vehículos o adyuvantes cosméticamente aceptables.