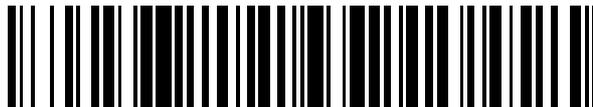


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 629 953**

51 Int. Cl.:

C07D 309/10 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **18.12.2013 PCT/FR2013/053160**

87 Fecha y número de publicación internacional: **26.06.2014 WO14096699**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.12.2013 E 13818341 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **17.05.2017 EP 2935231**

54 Título: **Compuestos C-xilósidos, composiciones y su utilización para despigmentar la piel**

30 Prioridad:

21.12.2012 FR 1262731

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

16.08.2017

73 Titular/es:

**L'OREAL (100.0%)
14, rue Royale
75008 Paris, FR**

72 Inventor/es:

**DALKO, MARIA;
MARAT, XAVIER;
BERNERD, FRANÇOISE y
COHEN, CATHERINE**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 629 953 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

Compuestos C-xilósidos, composiciones y su utilización para despigmentar la piel

5 La presente invención se refiere a la utilización cosmética o farmacéutica, en particular dermatológica, de al menos un compuesto C-xilósido para blanquear la piel y para despigmentarla, así como algunos compuestos nuevos C-xilósidos, las composiciones que los contienen y su utilización para blanquear la piel y/o para despigmentarla.

10 El color de la piel humana depende de diferentes factores y en particular de las temporadas del año, de la raza y del sexo; está principalmente determinado por la naturaleza y la concentración de melanina producida por los melanocitos. Los melanocitos son las células especializadas que, por medio de orgánulos particulares, los melanosomas, sintetizan la melanina. Además, en diferentes periodos de su vida, algunas personas ven aparecer sobre la piel, y más especialmente sobre las manos, unas manchas oscuras y/o más coloreadas, que confieren a la piel una heterogeneidad. Estas manchas se deben también a una concentración importante de melanina en los queratocitos situados en la superficie de la piel.

15 Se desea muy particularmente la utilización de sustancias despigmentantes tópicas inofensivas que presentan una buena eficacia para tratar las hiperpigmentaciones regionales por hiperactividad melanocitaria, tales como los melasmas idiopáticos, que aparecen durante el embarazo ("máscara de embarazo" o cloasma) o durante una contracepción estro-progestativa, las hiperpigmentaciones localizadas por hiperactividad y proliferación melanocitaria benigna, tales como las manchas pigmentarias seniles denominadas lentigo actínico, las hiperpigmentaciones accidentales, debidas eventualmente a la fotosensibilización o a la cicatrización post-lesional. Para estas últimas (pudiendo las cicatrizaciones dar lugar a una cicatriz que da a la piel un aspecto más blanco), a falta de poder repigmentar la piel lesionada, se acaba por despigmentar las zonas de la piel normal residual para dar al conjunto de la piel un color blanco homogéneo.

El mecanismo de formación de la pigmentación de la piel, es decir de la formación de la melanina, es particularmente complejo y hace intervenir esquemáticamente las principales etapas siguientes:

30 Tirosina → Dopa → Dopaquinona → Dopacroma → Melanina

La tirosina (monofenoldihidroxiifenilalanina: oxígeno oxido-reductasa EC 1.14.18.1) es la enzima esencial que interviene en esta serie de reacciones. Cataliza en particular la reacción de transformación de la tirosina en Dopa (dihidroxiifenilalanina) gracias a su actividad hidroxilasa, y la reacción de transformación de la Dopa en dopaquinona gracias a su actividad oxidasa. Esta tirosinasa actúa sólo cuando está en el estado de maduración bajo la acción de ciertos factores biológicos.

40 Una sustancia es reconocida como despigmentante si actúa directamente sobre la vitalidad de los melanocitos epidérmicos en los que se desarrolla la melanogénesis, y/o si interfiere con una de las etapas de biosíntesis de la melanina ya sea inhibiendo una de las enzimas implicadas en la melanogénesis, o bien intercalándose como análogo estructural de uno de los compuestos químicos de la cadena de síntesis de la melanina, cadena que puede entonces ser bloqueada y así asegurar la despigmentación.

45 Las sustancias más utilizadas como despigmentantes son más particularmente la hidroquinona y sus derivados, en particular sus éteres tales como el monometiléter y el monoetiléter de hidroquinona. Estos compuestos, a pesar de que presentan una cierta eficacia, desafortunadamente no están libres de efectos secundarios debido a su toxicidad, lo que puede hacer su uso delicado, incluso peligroso. Esta toxicidad proviene del hecho de que intervienen en unos mecanismos fundamentales de la melanogénesis, matando unas células, corriendo el riesgo entonces de perturbar su entorno biológico y, por consiguiente, obligando a la piel a evacuarlos produciendo unas toxinas.

50 Por tanto, la hidroquinona es un compuesto particularmente irritante y citotóxico para el melanocito, cuya sustitución, total o parcial ha sido considerada por numerosos autores.

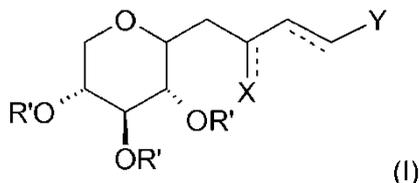
55 Se han buscado, por tanto, unas sustancias que no intervengan en el mecanismo de la melanogénesis pero que actúen aguas arriba sobre la tirosinasa impidiendo su activación y que son, debido a esto, mucho menos tóxicas. Se utiliza habitualmente como inhibidor de la activación de la tirosina el ácido kójico que compleja el cobre presente en el sitio activo de esta enzima. Desafortunadamente, este compuesto es inestable en disolución, lo que complica un poco la fabricación de la composición.

60 Ya se han descrito unos C-glicósidos en el documento EP 1774990 para desmigmentar la piel.

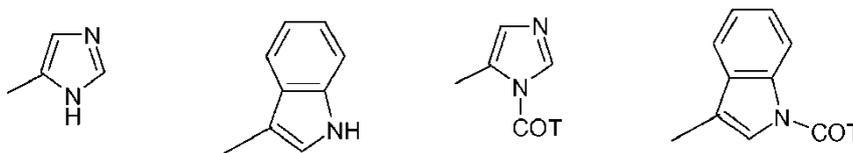
65 No obstante, subsiste la necesidad de un nuevo agente blanqueante, en particular de la piel humana de acción tan eficaz como los conocidos, pero que no tengan sus inconvenientes, es decir que no sea irritante, no tóxico y/o no alergénico para la piel, estando al mismo tiempo estable en una composición, o bien alternativamente que posea una acción reforzada con el fin de poder utilizarse en cantidad más baja, lo que disminuye considerablemente los efectos secundarios observados.

A este respecto, la solicitante ha descubierto, de manera sorprendente e inesperada, que algunos compuestos C-xilósidos presentaban una buena actividad despigmentante, incluso a baja concentración, sin mostrar citotoxicidad.

- 5 De manera más precisa, la invención tiene por lo tanto por objeto un procedimiento cosmético de despigmentación, de aclarado y/o de blanqueamiento de la piel, del pelo o del cabello que comprenda la aplicación sobre la piel, el pelo o el cabello de una composición que comprenda, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un compuesto de fórmula (I) siguiente



- 10 en la que,
- 15 - los compuestos de fórmula (I) son unos derivados de xilosa
 - Y designa un radical fenilo o un heterociclo, eventualmente sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)
 - X = -OR' ; (=O) ; NR_bR_c ; NHOR_d
 - 20 - R' designa:
 - * un átomo de hidrógeno,
 - * un radical alquilo lineal y saturado de C1-C18,
 - 25 * un radical alquilo lineal e insaturado C2-C18
 - * un radical alquilo ramificado, saturado o insaturado, de C3-C18
 - 30 * un radical cíclico saturado o insaturado de C5 o C6
 - * un radical acilo, lineal o ramificado, saturado o insaturado, de C2-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6.
 - 35 R_a designa:
 - un átomo de hidrógeno
 - un radical alquilo lineal o ramificado, de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado, lineal o ramificado de C3-C4
 - 40 - un radical acilo lineal o ramificado de C2-C18 o alcenilcarbonilo lineal o ramificado de C2-C18
 - 45 Cuando Y designa un radical fenilo o un heterociclo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente -O-CH₂-O
 - con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH.
 - 50 R_b designa:
 - un átomo de hidrógeno
 - un radical alquilo lineal de C2-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o
 - 55 ramificado de C3-C4 o un radical -CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que
 - Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico de C3-C6,

5 y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

R_c designa:

10 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo.

15 R_d designa:

- un átomo de hidrógeno

20 - un radical alquilo lineal de C1-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C18, estando dicho radical eventualmente sustituido por un grupo fenilo,

así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos y sus estereoisómeros.

25 En el sentido de la presente invención, heterociclo designa un radical hidrocarbonado cíclico de 5 a 10 miembros, saturado o insaturado, incluso aromático, que comprende al menos un heteroátomo seleccionado entre O, S o N. Preferentemente, heterociclo designa un radical piridina, pirimidina, indol y más preferiblemente piridina o indol.

30 Los compuestos de fórmula (I) según la invención permiten despigmentar y/o aclarar eficazmente la piel de seres humanos. Están destinados en particular a ser aplicados sobre la piel de individuos que presentan manchas de pigmentación oscuras, unas manchas de senectud, o sobre la piel de individuos que desean combatir la aparición de un color oscuro que proviene de la melanogénesis, por ejemplo tras una exposición a los rayos ultravioletas.

Pueden también permitir despigmentar y/o aclarar el pelo, las pestañas, el cabello, así como los labios y/o las uñas.

35 La invención tiene por lo tanto también por objeto un procedimiento cosmético de despigmentación, de aclarado y/o de blanqueamiento de la piel humana, del pelo y/o del cabello, que comprende la aplicación sobre la piel de una composición tal como se ha descrito anteriormente. El procedimiento conviene en particular para eliminar las manchas pigmentarias oscuras y/o las manchas de senectud, y/o para aclarar la piel bronceada.

40 La invención tiene también por objeto la utilización cosmética de un compuesto de fórmula (I) tal como se ha descrito anteriormente, como agente blanqueante y/o despigmentante de la piel, del pelo, de las pestañas, del cabello, así como de los labios y/o de las uñas, y preferentemente la piel, en particular para eliminar las manchas pigmentarias, las manchas de senectud y/o como agentes anti-bronceado.

45 Entre los compuestos de fórmula (I), algunos son conocidos en el estado de la técnica.

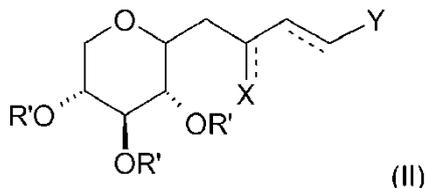
El documento "Separation of α,β -anomers of C-glycosides by medium-pressure liquid chromatography"; Sepu 1988, 6(5), páginas 301-3 describe los compuestos 2-desoxi-2-(2-(4-metoxi-fenil)-etil)-D-glucosa (CAS 121285-89-0) y 2-desoxi-2-(2-(4-metoxi-fenil)-etil)-L-glucosa (CAS 121285-90-3).

50 El documento "Reaction of unsubstituted aldoses with p-metoxibenzoylmetilene phosphorane"; Zhurnal Obshchei Khimii 1968, 38(5), páginas 1046-8 describe los compuestos 2-desoxi-2-(2-oxo-2-(4-metoxi-fenil)-etil)-L-fucosa (CAS 20880-40-4), 2-desoxi-2-(2-oxo-2-(4-metoxi-fenil)-etil)-D-xilosa (CAS 20869-22-1) y 2-desoxi-2-(2-oxo-2-(4-metoxi-fenil)-etil)-L-xilosa (CAS 20869-24-3).

55 El documento "Interaction of partially screened aldoses with p-metoxibenzoylmetilene phosphorane"; Zhurnal Obshchei Khimii 1969, 39(1), páginas 119-22 describe los compuestos 2-desoxi-2-(2-oxo-2-(4-metoxi-fenil)-etil)-D-maltosa (CAS 24461-52-7) y 2-desoxi-2-(2-oxo-2-(4-metoxi-fenil)-etil)-L-maltosa (CAS 24461-51-6).

60 La invención tiene por lo tanto también por objeto los compuestos de fórmula (II) a (V) siguientes:

Compuestos de fórmulas (II)



5 en la que,

- los compuestos de fórmula (II) son unos derivados de xilosa

- Y designa un heterociclo, eventualmente sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)

10

- X = -OR'; (=O); NR_bR_c; NHOR_d

R' designa

15

* un átomo de hidrógeno,

* un radical alquilo lineal y saturado de C1-C18,

* un radical alquilo lineal e insaturado C2-C18

20

* un radical alquilo ramificado, saturado o insaturado, de C3-C18

* un radical cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

25

* un radical acilo, lineal o ramificado, saturado o insaturado, de C2-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6.

R_a designa:

30

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal o ramificado, de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4

35

- un radical acilo lineal o ramificado de C2-C18 o alcenilcarbonilo lineal o ramificado de C2-C18,

R_b designa:

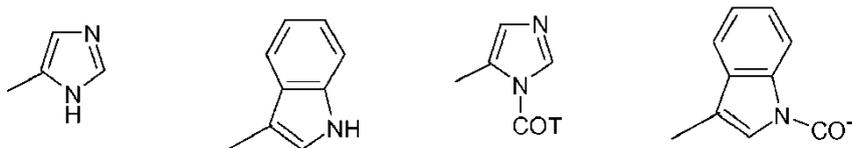
40

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C2-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4 o un radical -CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que

45

Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



50

y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico de C3-C6.

y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

55

R_c designa:

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo.

5

Rd designa:

- un átomo de hidrógeno

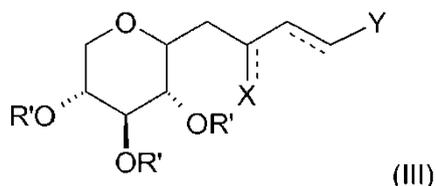
10 - un radical alquilo lineal de C1-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C18, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos y sus estereoisómeros.

15 En el sentido de la presente invención, heterociclo designa un radical hidrocarbonado cíclico 5 a 10 miembros, saturado o insaturado, incluso aromático, que comprende al menos un heteroátomo seleccionado entre O, S o N. Preferentemente, heterociclo designa un radical piridina, pirimidina, indol y más preferiblemente piridina o indol.

Nuevos compuestos de fórmula (III):

20



en la que,

25 - los compuestos de fórmula (III) son unos derivados de xilosa

- Y designa un radical fenilo eventualmente sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)

- X = -OR^{''}; NR_bR_c; NHOR_d

30

R' designa:

* un átomo de hidrógeno,

35 * un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

* un radical acilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6.

40

R^{''} designa:

* un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

45

* un radical acilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6.

R_a designa:

50

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4

55 - un radical acilo lineal o ramificado de C1-C18 o alencilcarbonilo lineal o ramificado de C2-C18

Cuando Y designa un radical fenilo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente-O-CH₂-O,

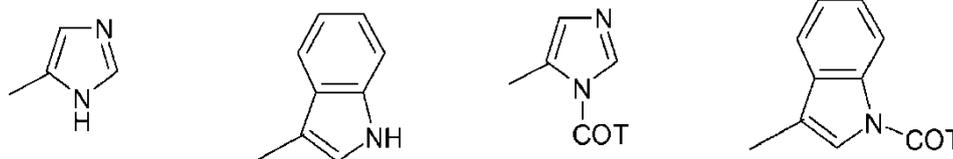
60 R_b designa:

- un átomo de hidrógeno

5 - un radical alquilo lineal de C2-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4 o un radical -CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que

- Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,

10



y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico de C3-C6.

15

y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

R_c designa:

20

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo.

25

R_d designa:

- un átomo de hidrógeno

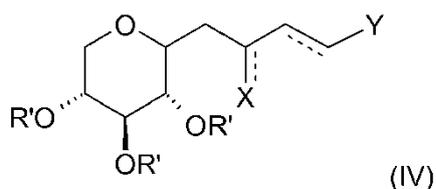
30

- un radical alquilo lineal de C1-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C18, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo

así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos, y sus estereoisómeros.

Nuevos compuestos de fórmula (IV):

35



en la que,

40

- los compuestos de fórmula (IV) son unos derivados de xilosa

- Y designa un radical fenilo eventualmente sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)

45

- X = -OH; (=O)

R' designa:

* un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

50

* un radical acilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6.

R_a designa:

55

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4

5 - un radical acilo lineal o ramificado de C1-C18 o alencilarbonilo lineal o ramificado de C2-C18

Cuando Y designa un radical fenilo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente-O-CH₂-O

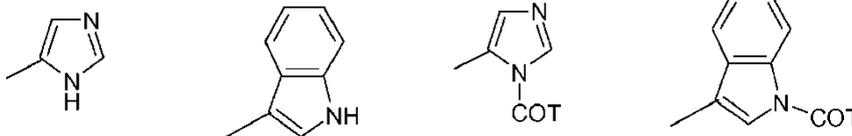
10 con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH.

R_b designa:

15 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C2-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado, lineal o ramificado, de C3-C4 o un radical -CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que

20 - Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



25 y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S- designando T un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico de C3-C6.

y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

30 R_c designa:

- un átomo de hidrógeno

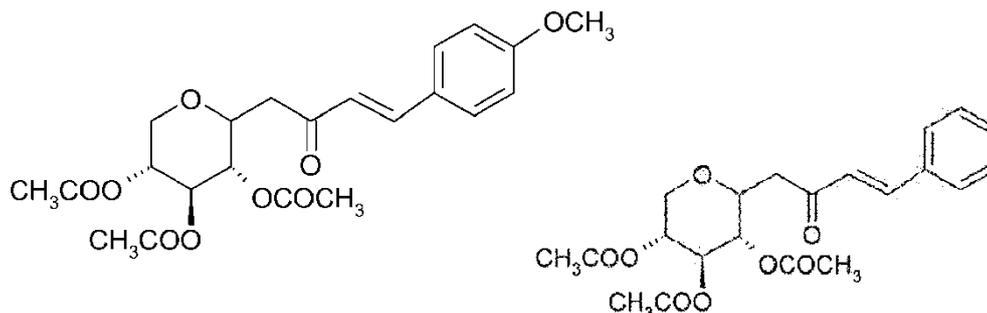
35 - un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo.

R_d designa:

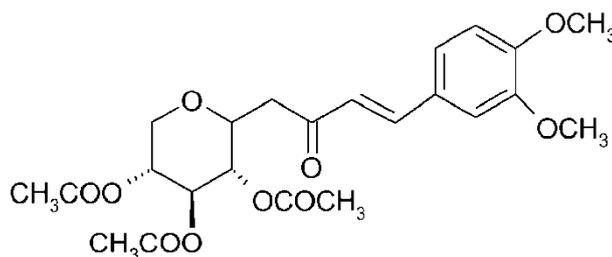
40 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C18, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo

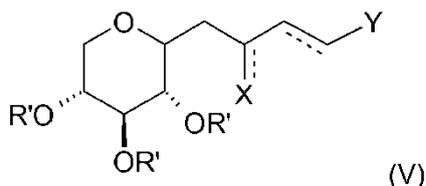
45 así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos, y sus estereoisómeros, con la excepción de los compuestos siguientes:



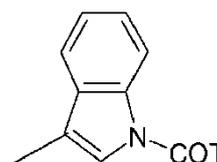
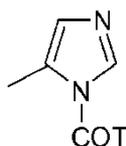
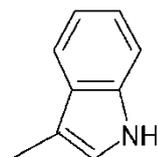
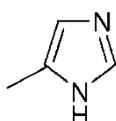
50



Nuevos compuestos de fórmula (V):



- 5 en la que,
- los compuestos de fórmula (V) son unos derivados de xilosa
 - 10 - Y designa un radical fenilo sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)
 - X = -OH; (=O)
 - R' designa un átomo de hidrógeno
 - 15 R_a designa
 - un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4
 - 20 - un radical acilo lineal de C1-C18 o ramificado de C3-C18 o alcenilcarbonilo lineal o ramificado de C2-C18
- con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH.
- 25 Cuando Y designa un radical fenilo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente-O-CH₂-O
- R_b designa:
- 30 - un átomo de hidrógeno
 - un radical alquilo lineal de C2-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4 o un radical -CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que
 - 35 Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



- 40 y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico de C3-C6.

- 45 y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

R_c designa:

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo.

5

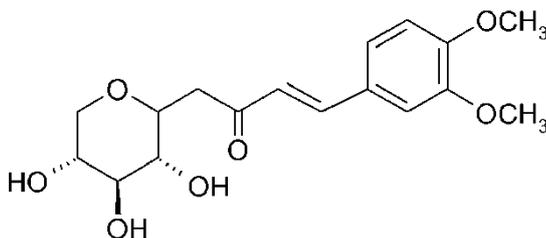
R_d designa:

- un átomo de hidrógeno

10 - un radical alquilo lineal de C1-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C18, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos, y sus estereoisómeros,

15 con la excepción del compuesto siguiente:



20 La invención tiene también por objeto unas composiciones, en particular cosméticas, que comprenden en particular, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un compuesto seleccionado entre los de fórmula (II) a (V).

El término alquilo, en el ámbito de la presente invención, significa una cadena hidrocarbonada saturada o insaturada. Entre los grupos alquilo que convienen a la realización de la invención, se pueden citar en particular los grupos metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, t-butilo, isobutilo, sec-butilo, pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-dodecilo, n-tetradecilo, n-hexadecilo, n-heptadecilo, n-octadecilo, alilo, oleilo.

25

El término radical alquilo cíclico, en el ámbito de la presente invención, designa un radical hidrocarbonado cíclico saturado o cicloalquilo, o un radical hidrocarbonado cíclico insaturado o cicloalqueno. Entre los radicales alquilo cíclicos que convienen a la realización de la invención, se pueden citar en particular los grupos ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo.

30

Las sales aceptables para el uso no terapéutico de los compuestos descritos en la presente invención comprenden unas sales no tóxicas convencionales de dichos compuestos tales como las formadas a partir de ácidos orgánicos o inorgánicos. A título de ejemplo, se pueden citar las sales de ácidos minerales, tales como el ácido sulfúrico, el ácido clorhídrico, el ácido bromhídrico, el ácido fosfórico. Se pueden citar también las sales de ácidos orgánicos, que pueden comprender uno o varios grupos ácido carboxílico, sulfónico, o fosfónico. Puede tratarse de ácidos alifáticos lineales, ramificados o cíclicos o también de ácidos aromáticos. Estos ácidos pueden comprender, además, uno o varios heteroátomos seleccionados entre O y N, por ejemplo en forma de grupos hidroxilo. Se puede citar en particular el ácido propiónico, el ácido acético, el ácido cítrico y el ácido tártrico, el ácido metanosulfónico, el ácido succínico.

35

40

Cuando los compuestos de fórmula (I) a (V) comprenden un grupo ácido, la neutralización del o de los grupos ácidos se puede efectuar por una base mineral, tal como LiOH, NaOH, KOH, Ca(OH)₂, NH₄OH, Mg(OH)₂ o Zn(OH)₂; o por una base orgánica tal como una alquilamina primaria, secundaria o terciaria, por ejemplo la trietilamina o la butilamina. Esta alquilamina primaria, secundaria o terciaria puede comprender uno o varios átomos de nitrógeno y/o de oxígeno y puede por lo tanto comprender por ejemplo una o varias funciones alcohol; se puede citar en particular el amino-2-metil-2-propanol, la trietanolamina, la dimetilamino-2-propanol, el 2-amino-2-(hidroximetil)-1,3-propanediol. Se puede también citar la lisina o la 3-(dimetilamino)propilamina.

45

Los solvatos aceptables para el uso no terapéutico de los compuestos descritos en la presente invención comprenden unos solvatos convencionales tales como los formados durante la última etapa de preparación de dichos compuestos debido a la presencia de disolventes. A título de ejemplo, se pueden citar los solvatos debidos a la presencia de agua o de alcoholes lineales o ramificados como el etanol o el isopropanol.

50

55 Los compuestos de fórmula (I) preferidos son aquellos para los cuales:

- los compuestos de fórmula (I) son unos derivados de xilosa

- Y designa un radical fenilo o un heterociclo, eventualmente sustituidos por 1 a 5 grupos (OR_a)

- X = -OR'; (=O); NR_bR_c ; $NHOR_d$

5 - R' designa:

* un átomo de hidrógeno,

* un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C12, o cíclico saturé de C5 o C6

10

* un radical acilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C6, o cíclico saturé de C5 o C6.

R_a designa:

15 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal o ramificado, de C1-C4,

- un radical acilo lineal o ramificado de C1-C6

20

Cuando Y designa un radical fenilo o un heterociclo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente -O-CH₂-O

25 con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH.

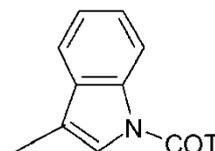
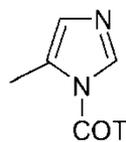
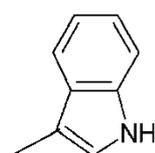
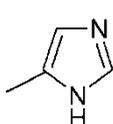
R_b designa:

30 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C2-C12, o ramificado de C3-C12, o un radical-CH(Z_1)-CO₂Z₂ en el que

- Z_1 designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,

35



40 y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S- designando T un radical alquilo lineal de C1-C6, cíclico de C5-C6.

y Z_2 designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

45 R_c designa:

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo.

50

R_d designa:

- un átomo de hidrógeno

55 - un radical alquilo lineal de C1-C12, o ramificado de C3-C12, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos y sus estereoisómeros,

60

En el sentido de la presente invención, heterociclo designa un radical hidrocarbonado cíclico 5 a 10 miembros, saturado o insaturado, incluso aromático, que comprende al menos un heteroátomo seleccionado entre O, S o N. Preferentemente, heterociclo designa un radical piridina, pirimidina, indol y más preferiblemente piridina o indol.

5 Los compuestos de fórmula (I) particularmente preferidos son aquellos para los cuales:

- los compuestos de fórmula (I) son unos derivados de xilosa

10

- Y designa un radical fenilo o un heterociclo, eventualmente sustituido con 1 a 3 grupos (OR_a)

- X = -OR'; (=O); NR_bR_c; NHOR_d

- R' designa:

15

* un átomo de hidrógeno,

* un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C4,

* un radical acilo lineal o ramificado de C1-C6.

20

R_a designa:

- un átomo de hidrógeno

25

- un radical alquilo lineal o ramificado, de C1-C4,

- un radical acilo lineal o ramificado de C1-C6

30

Cuando Y designa un radical fenilo o un heterociclo sustituido con 2 o 3 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente -O-CH₂-O

con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH.

35

R_b designa:

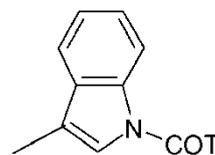
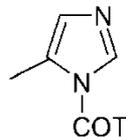
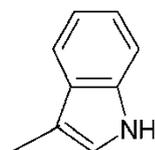
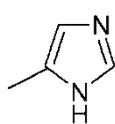
- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C2-C8, o ramificado de C3-C8, o un radical-CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que

40

Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,

45



y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal de C1-C6, cíclico de C5-C6.

50

y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

R_c designa:

- un átomo de hidrógeno

55

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, eventualmente sustituido con un grupo fenilo.

R_d designa:

60

- un átomo de hidrógeno

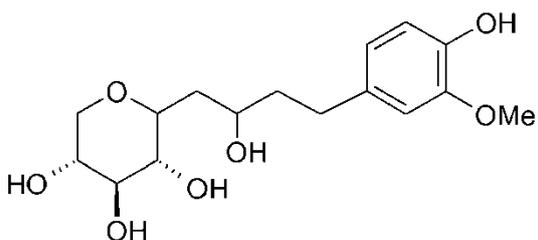
- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos y sus estereoisómeros,

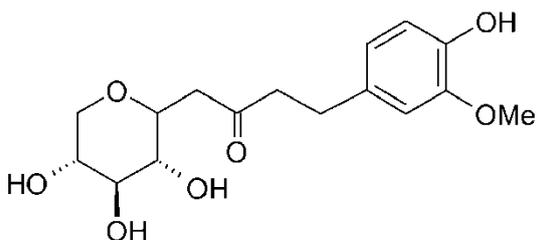
5 En el sentido de la presente invención, heterociclo designa un radical hidrocarbonado cíclico 5 a 10 miembros, saturado o insaturado, incluso aromático, que comprende al menos un heteroátomo seleccionado entre O, S o N. Preferentemente, heterociclo designa un radical piridina, pirimidina, indol y más preferiblemente piridina o indol.

10 Los compuestos de fórmula (I) más particularmente preferidos son los siguientes:

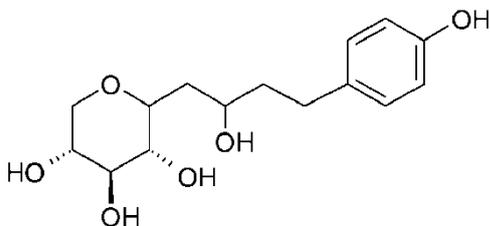
Compuesto 1.: (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(4-hidroxi-3-metoxifenil)butil]tetrahydro-2H-piran-3,4,5-triol



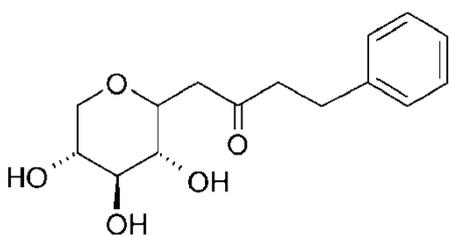
15 Compuesto 2. 4-(4-hidroxi-3-metoxifenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahydro-2H-piran-2-il]butan-2-ona



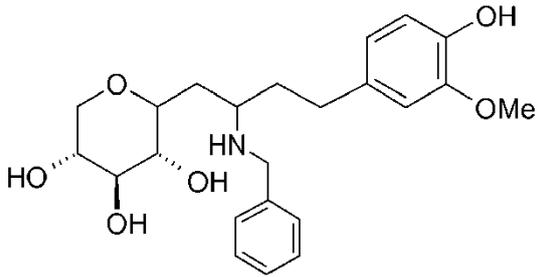
20 Compuesto 3. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(4-hidroxi-fenil)butil]tetrahydro-2H-piran-3,4,5-triol



25 Compuesto 4. 4-(4-hidroxi-fenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahydro-2H-piran-2-il]butan-2-ona

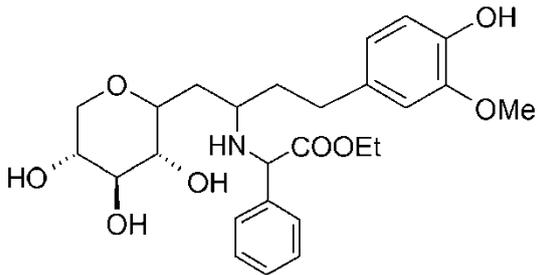


Compuesto 5. (3R,4S,5R)-2-[2-(bencilamino)-4-(4-hidroxi-3-metoxifenil)butil]tetrahydro-2H-piran-3,4,5-triol

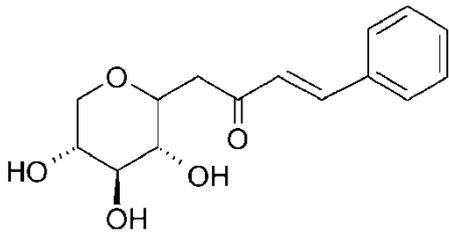


Compuesto 6. {[3-(4-hidroxi-3-metoxifenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahidro-2H-piran-2-il]metil]propil]amino}(fenil)acetato de etilo

5

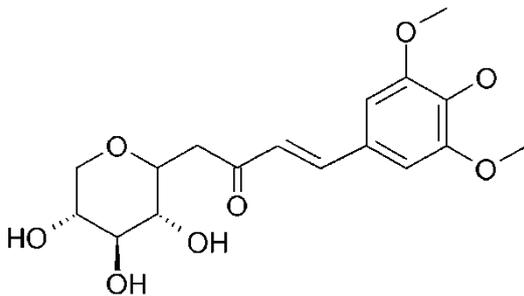


Compuesto 7. (3E)-4-fenil-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahidro-2H-piran-2-il]but-3-en-2-ona



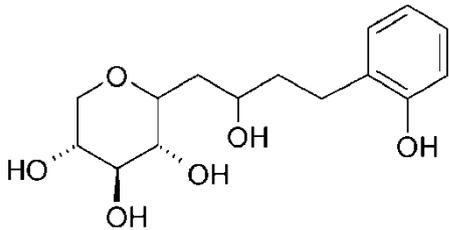
10

Compuesto 8. (3E)-4-(4-hidroxi-3,5-dimetoxifenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahidro-2H-piran-2-il]but-3-en-2-ona



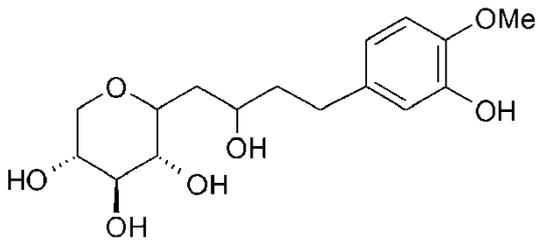
15

Compuesto 9. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(2-hidroxifenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol

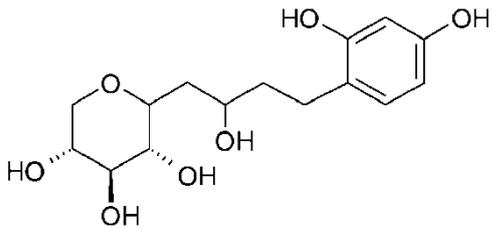


20

Compuesto 10: (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(3-hidroxi-4-metoxifenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol

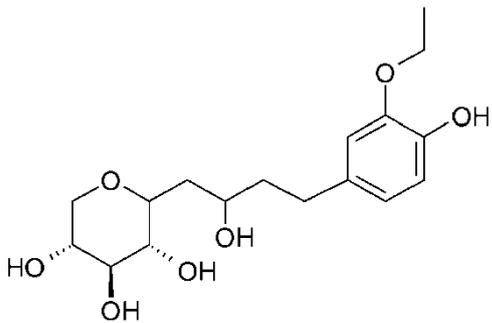


Compuesto 11. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(2,4-di-hidroxi-fenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



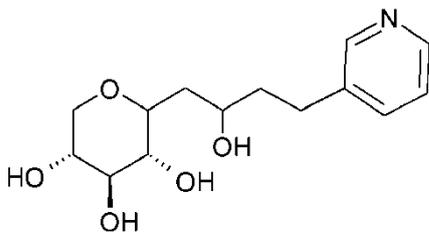
5

Compuesto 12. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(3-etoxi-4-hidroxi-fenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



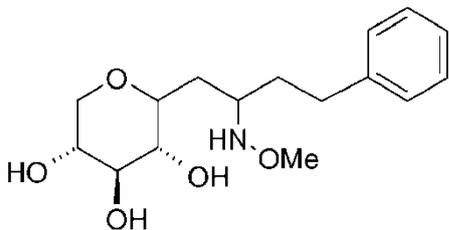
10

Compuesto 13. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-1-pyridin-3-il-D-xilo-nonitol



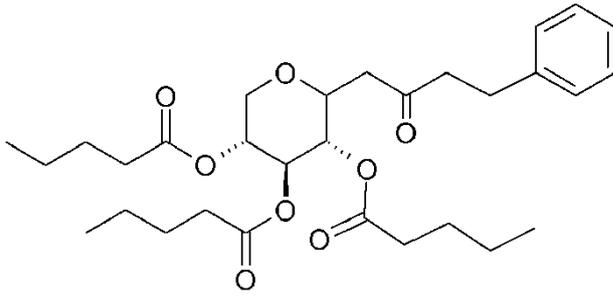
15

Compuesto 14. (3R,4S,5R)-2-[(2E)-2-(metoxiimino)-4-fenilbutil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol

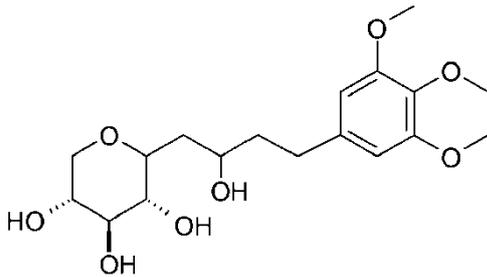


20

Compuesto 15. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-7-O-pentanoil-1-fenil-D-xilo-non-3-ulososa



Compuesto 16. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-1-(3,4,5-trimetoxifenil)-D-xilononitol



5

Los compuestos 5, 6, 10, 11, 12, 13, 14, 15 y 16 son unos compuestos nuevos que constituyen otro objeto de la invención.

10

La presente invención tiene también por objeto unas composiciones, en particular cosméticas que comprenden, en un medio fisiológicamente aceptable al menos un compuesto seleccionado entre los compuestos 5, 6, 10, 11, 12, 13, 14, 15 y 16.

15 El compuesto 13 es el compuesto preferido de fórmula (II).

Los compuestos 5, 6 y 14 son los compuestos preferidos de fórmula (III).

20 El compuesto 15 es el compuesto preferido de fórmula (IV).

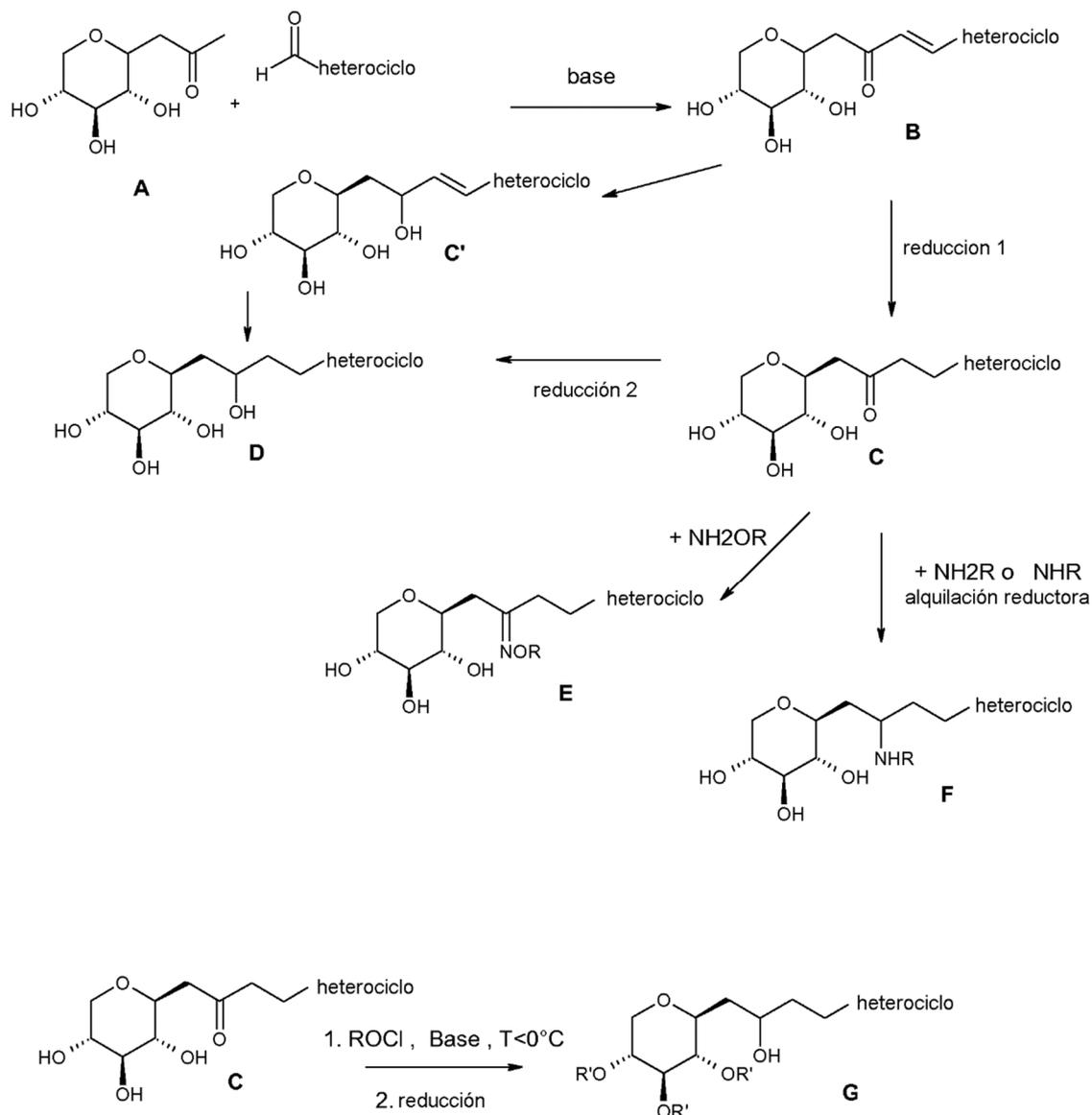
El compuesto 16 es el compuesto preferido de fórmula (V).

Los compuestos de fórmula (I) pueden ser sintetizados según el modo de realización general que aparece en la solicitud EP 2376510.

25

a.) Procedimiento de síntesis general para los compuestos nuevos

Procedimiento de síntesis general para los compuestos de fórmula (II)



5 El C-glicósido A cuya síntesis se describe en la solicitud EP1345919, se pone a reaccionar con 1 a 2 eq. De aldehído, en presencia de una base orgánica (por ejemplo: MeONa) en un disolvente polar compatible con esta base (por ejemplo: MeOH). El medio de reacción se agita durante 1-20h a temperatura ambiente para formar el producto de la aldolización B.

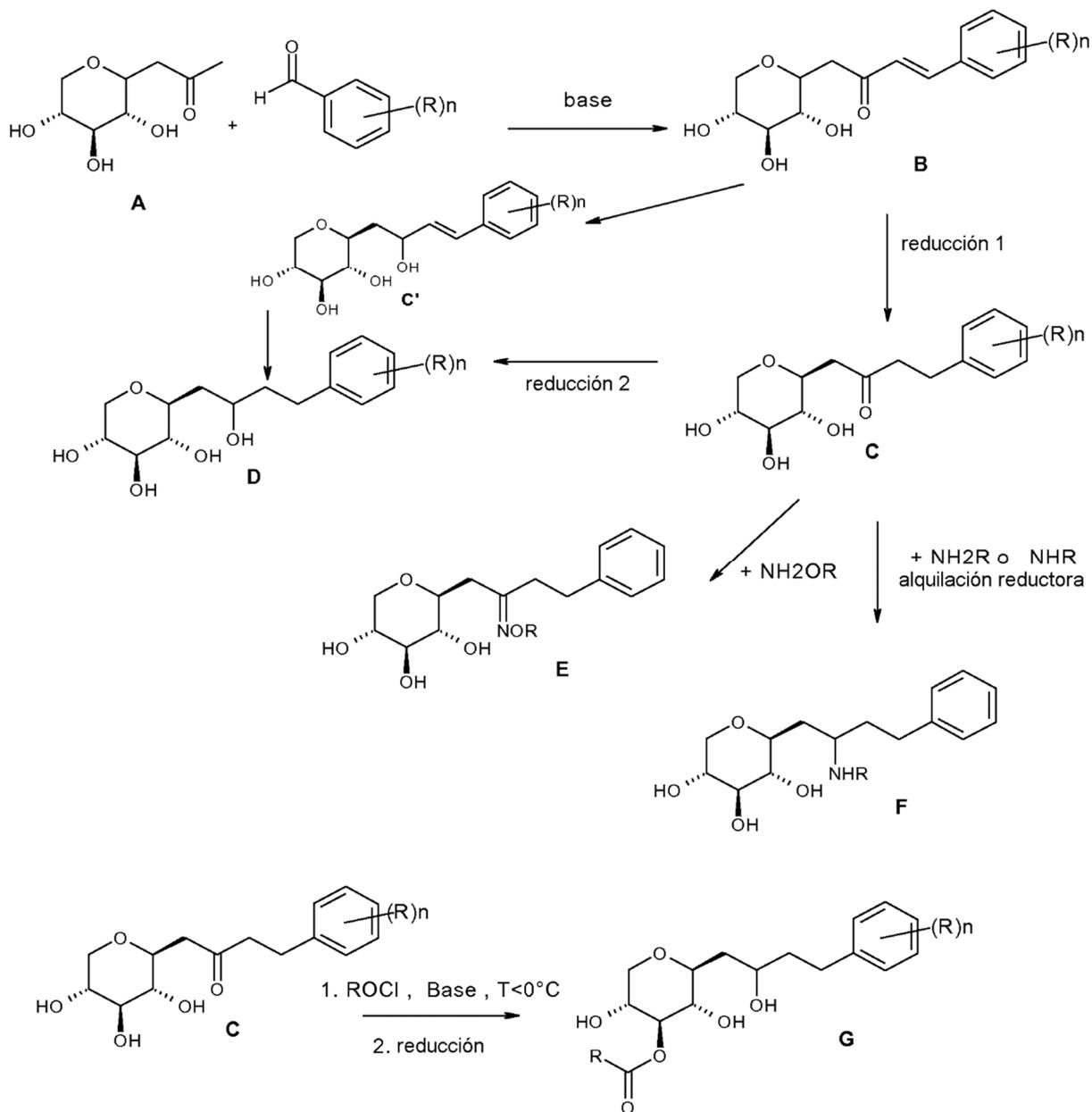
10 El producto B se somete después a 2 reducciones sucesivas. La primera es la reducción del doble enlace por hidrogenación catalítica (por ejemplo: Pd/C/H₂) para obtener C, y la segunda la reducción del carbonilo por un hidruro (por ejemplo: NaBH₄) para obtener D. Se puede también obtener D en una sola etapa a partir de B combinando las dos etapas de reducción (por ejemplo: Ru/C/H₂).

15 Los compuestos E se pueden obtener bien por una simple reacción de una alcoxiamina NH₂-OR con el compuesto C en un disolvente tal como el acetonitrilo por ejemplo; el compuesto F se puede obtener por una alquilación reductora clásica.

Los compuestos G se pueden obtener por acilación selectiva a baja temperatura de una de las funciones OH del anillo del compuesto C, seguida por una reducción de carbonilo por un hidruro (por ejemplo: NaBH₄).

20 De manera alternativa, el compuesto B se puede someter en un primer lugar a una reducción de la función cetona para conducir a C', después a una reducción del doble enlace de C' para proporcionar los compuestos D.

Procedimiento de síntesis general para los compuestos de fórmula (III, IV, V)



5

Otro objeto de la invención se refiere a una composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un derivado C-xilósido que responde a la fórmula (I) tal como se ha definido anteriormente. En particular la composición se adapta a una aplicación tópica sobre la piel. El medio fisiológicamente aceptable será preferiblemente un medio cosmético o dermatológicamente aceptable, es decir sin olor, color o aspecto desagradable, y que no genera picor, tirantez o rojeces inaceptable para el usuario.

10

Por medio fisiológicamente aceptable, se comprende un medio compatible con las materias queratínicas de seres humanos como la piel, las mucosas, las uñas, el pelo, las pestañas, el cuero cabelludo y/o el cabello.

15

La composición según la invención puede estar destinada a una aplicación cosmética o farmacéutica, particularmente dermatológica. Preferentemente, la composición según la invención está destinada a una aplicación cosmética.

La cantidad de compuestos de fórmula (I) utilizable en el ámbito de la invención depende por supuesto del efecto

buscado.

A título de ejemplo, esta cantidad puede, por ejemplo, ir del 0,001% al 10% en peso, preferentemente del 0,01% al 5% en peso, en particular del 0,1 al 3% en peso, con respecto al peso total de la composición, en particular del 0,1 al 2%.

La composición puede entonces comprender todos los constituyentes habitualmente empleados en la aplicación considerada.

Se puede citar en particular el agua, los disolventes, los aceites mineral, animal y/o vegetal, las ceras, los pigmentos, las cargas, los tensioactivos, los activos cosméticos o dermatológicos, los filtros UV, los polímeros, los gelificantes, los conservantes.

Por supuesto, el experto en la materia tendrá cuidado en seleccionar este o estos eventuales compuestos complementarios, y/o su cantidad, de manera tal que las propiedades ventajosas de los compuestos según la invención no sean, o no lo sean sustancialmente, alteradas por la adición considerada.

La composición utilizada según la invención puede presentarse bajo cualquier forma galénica normalmente utilizada en los campos cosméticos y dermatológicos; pueden estar en particular en forma de una solución acuosa, hidroalcohólica, eventualmente gelificada, de una dispersión de tipo loción eventualmente bifásica, de una emulsión de aceite en agua o de agua en aceite o múltiple, de un gel acuoso, de una dispersión de aceite en una fase acuosa con la ayuda de esférulas, pudiendo estas esférulas ser unas nanopartículas poliméricas tales como las nanoesferas y las nanocápsulas o, mejor, unas vesículas lipídicas de tipo iónico y/o no iónico

Cuando la composición es una emulsión, la proporción de la fase grasa puede ir del 5 al 80% en peso, y preferentemente del 5 al 50% en peso con respecto al peso total de la composición. Los aceites, los emulsionantes y los eventuales co-emulsionantes utilizados en la composición en forma de emulsión se seleccionan entre los clásicamente utilizados en el campo considerado. El emulsionante y el co-emulsionante están presentes, en la composición, en una proporción que puede ir del 0,3 al 30% en peso, y preferentemente del 0,5 al 20% en peso con respecto al peso total de la composición.

Esta composición puede ser más o menos fluida y tener el aspecto de una crema blanca o coloreada, de una pomada, de una leche, de una loción, de un suero, de una pasta, de una espuma. Puede eventualmente ser aplicada sobre la piel en forma de aerosol. Puede asimismo presentarse en forma sólida, y por ejemplo en forma de barra. Se puede utilizar como producto de cuidado y/o como producto de maquillaje.

Esta composición puede constituir una crema de limpieza, de protección, de tratamiento o de cuidado para la cara, para las manos, para los pies, para los grandes pliegues anatómicos o para el cuerpo (por ejemplo crema de día, crema de noche, crema desmaquilladora, cremas base de maquillaje, cremas antisolar); una base de maquillaje fluida, una leche de desmaquillado, una leche corporal de protección o de cuidado, una leche antisolar; una loción, gel o espuma para el cuidado de la piel, como una loción de limpieza.

En un aspecto ventajoso de la invención, las composiciones utilizadas pueden comprender además al menos un agente descamante, y/o al menos un agente calmante y/o al menos un agente fotoprotector orgánico y/o al menos un agente fotoprotector inorgánico.

Por "agente descamante" se entiende cualquier compuesto capaz de actuar:

- o bien directamente sobre la descamación favoreciendo la exfoliación, tal como los β -hidroxiácidos, en particular el ácido salicílico y sus derivados (de los cuales el ácido n -octanoil 5-salicílico); los α -hidroxiácidos, tales como los ácidos glicólico, cítrico, láctico, tártrico, málico o mandélico; la urea; el ácido genticónico; las oligofucosas; el ácido cinámico; el extracto de *Saphora Japonica*; el resveratrol;

- o bien sobre las enzimas implicadas en la descamación o la degradación de las corneodesmosomas, las glicosidasas, el "stratum corneum chymotryptic enzym" (SCCE) incluso otras proteasas (tripsina, tipo quimotripsina). Se pueden citar los agentes quelantes de las sales minerales: EDTA; el ácido N -acil- N,N',N' -etilen-diaminotriacético; los compuestos aminosulfónicos y en particular el ácido (N -2-hidroxiethylpiperazina- N -2-etano)-sulfónico (HEPES); los derivados del ácido 2-oxotiazolidin-4-carboxílico (procisteína); los derivados de ácidos alfa-aminados de tipo glicina (tales como se describen en el documento EP-0 852 949, así como el metil-glicina-diacetato de sodio comercializado por BASF bajo la denominación comercial de TRILON M); la miel; los derivados de azúcar tales como la O -octanoil-6- D -maltosa y la N -acetil-glucosamina.

Como agentes calmantes utilizables en la composición según la invención, se pueden citar: los triterpenos pentacíclicos y los extractos de plantas (por ejemplo: *Glycyrrhiza glabra*) que los contienen como el ácido β -glicirretínico y sus sales y/o sus derivados (el ácido glicirretínico monoglucuronido, el glicirretinato de estearilo, el ácido 3-estearoiloxi glicirretínico), el ácido ursólico y sus sales, el ácido oleanólico y sus sales, el ácido betulínico y sus

sales, un extracto de *Paeonia suffruticosa* y/o *lactiflora*, las sales del ácido salicílico y en particular el salicilato de zinc, los ficosacáridos de la compañía Codif, un extracto de *Laminaria saccharina*, el aceite de Canola, el bisabobol y los extractos de camomila, la alantoína, el Sépivital EPC (diesterfosfórico de la vitamina E y C), de Seppic, los aceites insaturados en omega 3 tales como los aceites de rosa mosqueta, de grosella negra, de ecchio, de pescado, extractos de plancton, el capriolil glicina, el Seppicalm VG (palmitoilprolina de sodio y *Nymphaea alba*) de Seppic, un extracto de *Pygeum*, un extracto de *Boswellia serrata*, un extracto de *Centipeda cunnighami*, un extracto de *Helianthus annuus*, un extracto de *Linum usitatissimum*, los tocotrienoles, los extractos de *Cola nitida*, el piperonal, un extracto de clavo, un extracto de *Epilobium Angustifolium*, el aloe vera, un extracto de *Bacopa moniera*, los fitosteroles, la cortisona, la hidrocortisona, la indometacina y la beta metasona.

Los agentes fotoprotectores orgánicos se seleccionan en particular entre los filtros UVA, los filtros UVB y los filtros mixtos UVA-UVB y sus mezclas.

Filtros UVA

El o los filtros UVA según la presente invención se pueden seleccionar entre los filtros siguientes.

1) Filtros hidrófobos UVA

Derivados del dibenzoilmetano:

- Metoxidibenzoilmetano de butilo vendido en particular bajo el nombre comercial de "PARSOL 1789" por DSM Nutritional Products, Inc;

- Dibenzoilmetano de Isopropilo;

Aminobenzofenonas:

- 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil)-benzoato de n-hexilo vendido en particular bajo el nombre comercial de "UVINUL A +" por BASF;

Derivados antranílicos:

- Mentil antranilato vendido en particular bajo el nombre comercial "NEO HELIOPAN MA" por SYMRISE;

Derivados de 4.4-diarilbutadieno:

- 1,1-dicarboxi (2,2'-dimetil-propil)-4,4-difenilbutadieno;

Derivados de merocianina:

- Octil-5-N,N-dietilamino-2-fenisulfonil-2,4-pentadienoato;

2) Filtros hidrosolubles UVA

- los derivados del alcanfor tal como el ácido TereftalilidenDialcanfor sulfónico fabricado bajo el nombre de "MEXORYL SX" por CHIMEX,

- los derivados bis-benzoazolilo tales como se describen en las patentes EP 669 323, y US 2,463,264 y más particularmente el compuesto FenilDibenzimidazotetra-sulfonato disódico vendido bajo el nombre comercial de "NEO HELIOPAN AP" por SYMRISE;

Según un modo de realización preferido, dicho al menos un filtro UVA se selecciona entre

Los derivados hidrófobos del dibenzoilmetano, los derivados hidrosolubles del alcanfor y sus mezclas.

Más particularmente, dicho al menos un filtro UVA se selecciona entre el metoxidibenzoilmetano de butilo, el ácido tereftaliliden dialcanfor sulfónico y sus mezclas. Preferentemente, una composición según la invención se caracteriza por que dicho al menos un filtro UVA está presente en un contenido que va del 1 al 20%, en particular, del 2 al 15% en peso con respecto al peso total de la composición.

Filtros UVB

El o los filtros UVB según la presente invención se pueden seleccionar entre los filtros siguientes.

1) Filtros hidrófobos UVB

Para-aminobenzoatos:

- Etil PABA;
- Etil Dihidroxipropil PABA;
- Etilhexil Dimetil PABA (ESCALOL 507 de ISP);

Derivados salicílicos:

- Homosalato vendido en particular bajo el nombre de "Eusolex HMS" por Rona/EM Industries;
- Etilhexilsalicilato vendido en particular bajo el nombre "NEO HELIOPAN OS" por SYMRISE;
- Salicilato de Dipropilenglicol vendido en particular bajo el nombre "DIPSAL" por SCHER;
- TEA Salicilato bajo el nombre "NEO HELIOPAN TS" por SYMRISE;

Cinamatos

- Metoxicinamato de etilhexilo vendido en particular bajo el nombre comercial "PARSOL MCX" por DSM Nutritional Products, Inc.;
- Isopropil Metoxi cinamato;
- Isoamil Metoxi cinamato vendido en particular bajo el nombre comercial "NEO HELIOPAN E 1000" por SYMRISE;
- Diisopropil Metilcinamato;
- Cinoxato;
- Gliceril Etilhexanoato Dimetoxicinamato;

Derivados de β,β' -difenilacrilato:

- Octocrileno, vendido en particular bajo el nombre comercial "UVINUL N539" por BASF;
- Etocrileno, vendido en particular bajo el nombre comercial "UVINUL N35" por BASF;

Derivados de benciliden alcanfor:

- 3-Benciliden alcanfor fabricado bajo el nombre "MEXORYL SD" por CHIMEX;
- Metilbenciliden alcanfor vendido en particular bajo el nombre "EUSOLEX 6300" por MERCK;
- Poliacrilamidometilo Bencilideno alcanfor fabricado bajo el nombre "MEXORYL SW" por CHIMEX;

Derivados de triazina:

- Etilhexil triazona vendida en particular bajo el nombre comercial "UVINUL T150" por BASF;
- Dietilhexil Butamido Triazona vendida en particular bajo el nombre comercial "UVASORB HEB" por SIGMA 3V;
- 2,4,6-tris(4'-amino benzalmalonato de dineopentil)-s-triazina;
- 2,4,6-tris(4'-amino benzalmalonato de diisobutil)-s-triazina;
- 2,4-bis(4'-amino benzalmalonato de dineopentil)-6-(4'-aminobenzoato de n-butil)-s-triazina;
- 2,4-bis(4'-amino benzoato de n-butil)-6-(aminopropiltrisiloxan)-s-triazina;

- los filtros triazinas simétricas descritos en la patente US 6,225,467, la solicitud WO 2004/085412 (véanse los compuestos 6 y 9) o el documento "Symetrical Triazine Derivatives" IP.COM Journal, IP.COM INC WEST HENRIETTA, NY, US (20 de septiembre de 2004) en particular las 2,4,6-tris-(bifenil)-1,3,5-triazina (en particular la 2,4,6-tris(bifenil-4-il-1,3,5-triazina) y la 2,4,6-tris(terfenil)-1,3,5-triazina, siendo estos dos últimos descritos en las

solicitudes de BEIERSDORF WO 06/035000, WO 06/034982, WO 06/034991, WO 06/035007, WO 2006/034992, WO 2006/034985).

Derivados de imidazolinas:

- 5 - Etilhexil Dimetoxibencilideno Dioxoimidazolin Propionato,

Derivados del benzalmalonato:

- 10 - Poliorganosiloxanos con función benzalmalonato tales como la Polisilicona-15 vendida en particular bajo la denominación comercial "PARSOL SLX" por DSM Nutritional Products, Inc.;
- Di-neopentil 4'-metoxibenzalmalonato;

15 2) Filtros hidrosolubles UVB

Los derivados de ácido p-aminobenzoico (PABA) siguientes:

- 20 - PABA,
- Gliceril PABA, y
- PEG-25 PABA vendido en particular bajo la denominación comercial "UVINUL P25" por BASF.
- 25 - el ácido Fenilbenzimidazol sulfónico vendido en particular bajo la denominación comercial "EUSOLEX 232" por MERCK,
- el ácido ferúlico,
- 30 - el ácido salicílico,
- el DEA metoxicinamato,
- elenciliden alcanfor ácido sulfónico fabricado bajo el nombre "MEXORYL SL" por CHIMEX,
- 35 - el alcanfor Benzalconio Metosulfato fabricado bajo el nombre "MEXORYL SO" por CHIMEX.

Según un modo de realización preferido, el al menos un filtro UVB comprendido en una composición según la invención es un filtro hidrófobo UVB.

40 En particular, dicho al menos un filtro hidrófobo UVB se selecciona entre los derivados salicílicos, los cinamatos, los derivados de α,α' -difenilacrilato, los derivados de triazina y sus mezclas.

45 Preferentemente, el al menos un filtro UVB se selecciona entre el etilhexilsalicilato, el etilhexilmetoxicinamato, el octocrileno, la etilhexiltriazona y sus mezclas.

50 Preferentemente, una composición según la invención se caracteriza por que dicho al menos un filtro UVB está presente en un contenido que va del 1 al 20 %, en particular del 5 al 15 %, y preferentemente del 7 al 10 % en peso con respecto al peso total de la composición.

Según una variante particular de la invención, dicho sistema filtrante orgánico utilizado en la invención contiene, incluso está constituido, de uno o varios filtros mixtos UVA-UVB.

55 Ventajosamente, dicho sistema filtrante orgánico utilizado en la invención contiene uno o varios filtros UVA, uno o varios filtros UVB y uno o varios filtros mixtos UVA-UVB.

Filtros mixtos UVA y UVB

Dicho al menos un filtro mixto UVA-UVB se puede seleccionar entre los filtros siguientes.

- 60 1) Filtros hidrófobos mixtos UVA y UVB

Derivados de benzofenona

- 65 - Benzofenona-1 vendido en particular bajo el nombre comercial "UVINUL 400" por BASF;

- Benzofenona-2 vendido en particular bajo el nombre comercial "UVINUL D50" por BASF;
- Benzofenona-3 u Oxibenzona vendido en particular bajo el nombre comercial "UVINUL M40" por BASF;
- 5 - Benzofenona-6 vendido en particular bajo el nombre comercial "Helisorb 11" por Norquay;
- Benzofenona-8 vendido en particular bajo el nombre comercial "Spectra-Sorb UV-24" por American Cyanamid;
- Benzofenona-10;
- 10 - Benzofenona-11;
- Benzofenona-12;
- 15 Derivados del fenilbenzotriazol:
 - Drometrizol Trisiloxano vendido en particular bajo el nombre "Silatrizole" por RHODIA CHIMIE o fabricado bajo el nombre "Meroxil XL" por la compañía CHIMEX;
 - 20 - Metilen bis-Benzotriazolil Tetrametilbutilfenol, vendido en forma sólida, en particular bajo el nombre comercial "MIXXIM BB/100" por FAIRMOUNT CHEMICAL o en forma micronizada en dispersión acuosa, en particular bajo el nombre comercial "TINOSORB M" por CIBA SPECIALTY CHEMICALS;
- 25 Derivados bis-resorcinil triazinas
 - Bis-Etilhexiloxifenol Metoxifenil Triazina vendida en particular bajo el nombre comercial "TINOSORB S" por CIBA GEIGY;
- 30 Derivados de benzoxazol:
 - 2,4-bis-[5-1(dimetilpropil)benzoxazol-2-il-(4-fenil)-imino]-6-(2-etilhexil)-imino-1,3,5-triazina vendida en particular bajo el nombre de Uvasorb K2A por Sigma 3V.
- 35 2) Filtros hidrosolubles mixtos UVA y UVB

Derivados de benzofenona que comprenden al menos un radical sulfónico como

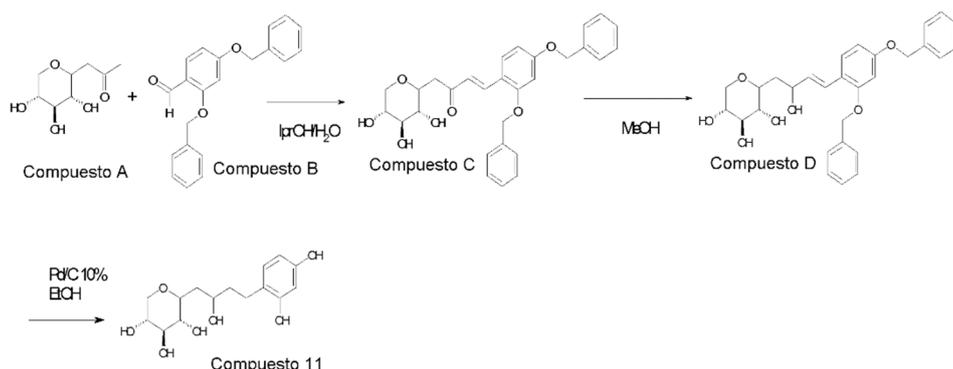
 - Benzofenona-4 vendido en particular bajo el nombre comercial "UVINUL MS 40" por BASF,
 - 40 - Benzofenona-5, y
 - Benzofenona-9.

Los agentes fotoprotectores inorgánicos se seleccionan entre unos pigmentos (de tamaños variables) de óxidos metálicos recubiertos o no como por ejemplo unos pigmentos de óxido de titanio (amorfo o cristalizado en forma rutila y/o anatasa), de hierro, de zinc, de circonio o de cerio que son todos unos agentes fotoprotectores UV bien conocidos en sí. Unos agentes de recubrimiento clásicos son por otro lado la alúmina y/o el estearato de aluminio. Tales pigmentos de óxidos metálicos, recubiertos o no recubiertos, se describen en particular en las solicitudes de patentes EP518772 y EP518773.

- 50 Los agentes fotoprotectores, cuando están presentes, representan del 0,1 al 20% en peso con respecto al peso total de la composición, y preferentemente del 0,2 al 15% en peso con respecto al peso total de la composición.

Los ejemplos siguientes ilustran la invención sin limitar su alcance. Los compuestos son, según el caso, citados en nombres químicos o en nombres CTFA (International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook).

- 55 Ejemplo 1: Síntesis del compuesto 11



Síntesis del compuesto C:

5 El compuesto A (418 mg) se pone en agitación en una mezcladora lprOH/H₂O (40/10 ml) en presencia de 3 equivalentes de hidróxido de litio. Se calienta el medio a 50°C durante 30 minutos después se añade compuesto B (4,9 g). La temperatura se mantiene durante 2h. Después de volver hasta temperatura ambiente, el medio de reacción se concentra al vacío y después se purifica por cromatografía sobre columna de sílice (diclorometano/metanol 95/5). El compuesto intermedio C se obtiene en mezcla con unas impurezas no caracterizadas.

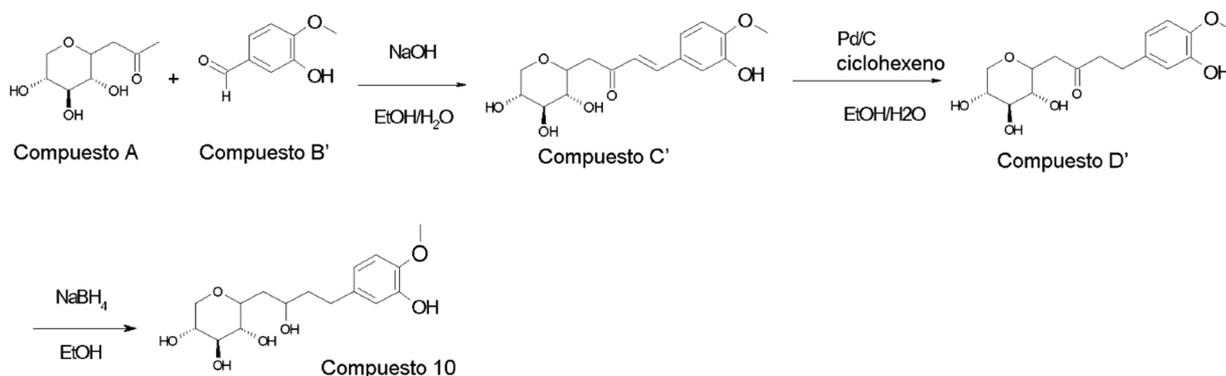
Síntesis del compuesto D

15 Se solubiliza 1,1 g del compuesto C tal como se obtiene en la etapa anterior en 15 ml de MeOH. Se añade progresivamente el borohidruro de sodio (2 eq.). Después del final de la liberación gaseosa, se añaden 20 ml de acetona. El medio de reacción se pasa después sobre resina DOWEX 50WX8 y después Amberlite IRA 743. Los filtrados se concentran al vacío y el residuo bruto obtenido se pone en solución en acetato de etilo, después se lava 2 veces con una solución saturada de NaCl. La fase orgánica se recoge y después se concentra al vacío. Se obtiene así el compuesto D en forma de polvo amarillo. El compuesto D se introducirá sin purificación suplementaria en la etapa siguiente.

Síntesis del compuesto 11:

25 El compuesto D se solubiliza en una mezcla ciclohexeno/EtOH 50/50 8ml/8ml después se añaden 235 mg de Pd/C 10%. La mezcla se lleva a reflujo durante 2h. El medio de reacción se filtra sobre un lecho de celita y después se purifica sobre columna cromatográfica de sílice (diclorometano/metanol 80/20). El compuesto 11 se obtiene en forma de un polvo beige con un rendimiento del 29%. Los espectros RMN y espectros de masas son conformes a la estructura 11.

30 Ejemplo 2: Síntesis del compuesto 10



Síntesis del compuesto C':

35 El compuesto A (4g) se pone bajo agitación en una mezcla EtOH/H₂O (40/10 ml) en presencia de 3,5 equivalentes de hidróxido de sodio en 27 ml de agua. El medio se calienta a 50°C durante 30 minutos y después se añade el compuesto B' (3,84 g). La temperatura se mantiene durante 2h. Después de volver a temperatura ambiente, el

medio de reacción se concentra al vacío y después se purifica por cromatografía sobre columna de sílice (diclorometano/metanol 95/5). El compuesto intermedio C' se obtiene en mezcla con unas impurezas no caracterizadas con un rendimiento del 38% (2,6 g).

5 Síntesis del compuesto D'

Se solubiliza 1,87 g del compuesto C' tal como se ha obtenido en la etapa anterior en 50 ml de etanol con 17 ml de agua y 13 ml de ciclohexeno. Se añaden 500 mg de Pd/C y el medio de reacción se calienta a reflujo durante 18h. Después del enfriamiento, la mezcla se filtra sobre celita y se aclara con etanol. Después, la concentración en bruto en forma de un sólido gris se introduce en la etapa siguiente sin purificación suplementaria.

Síntesis del compuesto 10:

El compuesto D' tal como se ha obtenido en la etapa anterior, se solubiliza en 120 ml de etanol y 20 ml de metanol. El borohidruro de sodio (2 eq. 460 mg) se añade progresivamente. Después del final de la liberación gaseosa, se añaden 20 ml de acetona y después una solución acuosa saturada de cloruro de amonio. El bruto obtenido después de la concentración se purifica después por cromatografía sobre columna de sílice con, por eluyente, una mezcla diclorometano/metanol 80/20 para conducir a 1,58 g de una miel beige identificada como el compuesto 10 en forma de una mezcla de diaestereoisómeros.

Ejemplo 3: Puesta en evidencia de la actividad sobre la melanogénesis.

Un ensayo ha puesto en evidencia la actividad despigmentante del compuesto 11 del ejemplo 1.

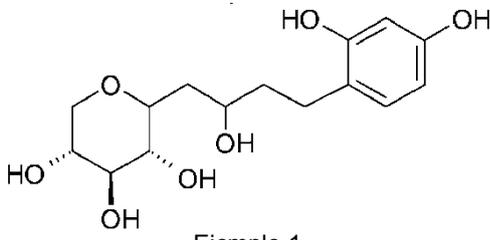
El efecto modulador sobre la melanogénesis del compuesto del ejemplo 1 se ha medido según el método descrito en la patente FR-A-2734825, así como en el artículo de R.Schmidt, P. Krien y M. Régnier, Anal. Bichem., 235(2), 113-18,1996. Este ensayo se realiza sobre cocultivo de queratinocitos y de melanocitos.

Para el compuesto ensayado, se ha determinado:

- la citotoxicidad, estimando la incorporación de la leucina,
- la actividad inhibidora sobre la síntesis de la melanina, estimando la relación de la incorporación de tiouracilo a la incorporación de leucina, con respecto al 100% del control (el control corresponde al ensayo realizado sin compuesto a ensayar). Se determinaron los valores de IC50 (concentración para la cual el 50% de la síntesis de la melanina está inhibida).

Se ha efectuado también el ensayo con la arbutina y el ácido kójico que son unos compuestos despigmentantes conocidos.

Los resultados se reúnen en la tabla siguiente:

Compuesto	Citotoxicidad sobre co-cultivo	IC50
Arbutina	No citotóxico	No alcanzada (o superior a 500 µM)
Ácido kójico	100 µM	NO alcanzada (o superior a 500 µM)
<p>Compuesto 11</p>  <p>Ejemplo 1</p>	No citotóxico	145 µM

El compuesto 11 presenta una actividad despigmentante superior a la del ácido kójico y a la arbutina.

Puesta en evidencia de la actividad del compuesto 1 sobre la pigmentación en un modelo de piel reconstruida completa que comprende una dermis viva.

La actividad del compuesto 1 se ha evaluado sobre el modelo de piel reconstruida completa descrito en la patente FR2928654 según el procedimiento descrito en la patente FR2930644.

El compuesto 1 se ha añadido al medio de cultivo durante un periodo de 16 días a partir del 2º día de la fase de emersión. La pigmentación se ha inducido por la forskolina añadida durante un periodo de 14 días a partir del 4º día de emersión (condición de control positivo pigmentado).

La ausencia de efecto tóxico de la molécula se ha verificado por histología (morfología de la piel reconstruida) y por cuantificación del número de melanocitos (marcado TRP1 y reacción DOPA sobre lámina epidérmica).

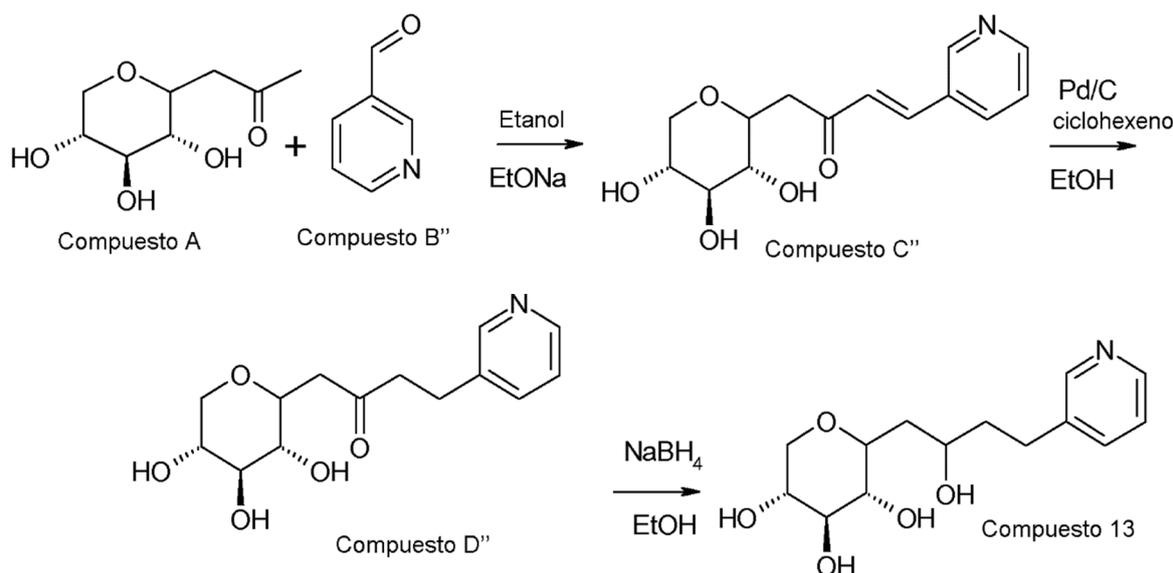
El compuesto 1 ha mostrado una actividad despigmentante sobre los parámetros siguientes:

Luminancia (claridad de la piel), cuanto más elevado sea el valor de luminancia, más clara será la muestra de piel:

aumento significativo de 6 puntos de la luminancia para el compuesto 1 (valor de L control positivo = 63, valor de L tratamiento por molécula 1 a 1 mM = 69)

Cuantificación de la melanina por análisis de imágenes sobre cortes coloreados con Fontana Masson (coloración argéntica de los granos de melanina): reducción del 60% de la cantidad de melanina por el compuesto 1 (control positivo = valor arbitrario del 100%, compuesto 1 a 1 mM = 39,48%).

Ejemplo 4: Síntesis del compuesto 13



Síntesis del compuesto C'':

El compuesto A (1 g) se ha puesto bajo agitación en 30 ml de etanol. El medio se ha calentado a 60°C durante 30 minutos, después se ha añadido el compuesto B'' (0,54 ml). Se añade después lentamente 1,8 ml de etilato de sodio al 20% en etanol (5,21 mmoles). Se deja reaccionar durante 1h a 60°C y después 7h hasta volver a temperatura ambiente.

Tras verificar el consumo total del compuesto A, el medio de reacción se concentró al vacío y después se purificó por cromatografía sobre columna de sílice (diclorometano/metanol 95/5). El compuesto intermedio C'' se obtuvo en mezcla con unas impurezas no caracterizadas con un rendimiento del 28% (2,6 g). La caracterización por RMN era conforme al producto esperado.

Síntesis del compuesto D''

Se ha solubilizado 0,4 g del compuesto C'' tal como se obtiene en la etapa anterior, en 20 ml de etanol y 5 ml de ciclohexeno. Se han añadido 500 mg de Pd/C y se ha calentado el medio de reacción a reflujo durante 4h.

Tras haber verificado la desaparición total del producto de partida, el medio se filtró sobre papel fieltro para eliminar el catalizador, después se concentró en evaporador rotatorio.

Se recuperó 0,2 g del compuesto D'' en forma de una pasta incolora con un rendimiento del 50%. La caracterización por RMN era conforme al producto esperado.

Síntesis del compuesto 13:

5 En un matraz, se ha solubilizado 0,2 g del compuesto D'' (0,71 mmoles) en 10 ml de etanol. Se han añadido 0,2 g de borohidruro de sodio en gránulos (5,3 mmoles) y se ha dejado reaccionar a temperatura ambiente durante 3h.

Tras verificar la desaparición total del producto de partida, el medio se concentró en evaporador rotatorio y después se purificó sobre sílice.

10 Se recuperaron 50 mg del compuesto 13 en forma de un sólido beige con un rendimiento del 25%. La caracterización por RMN era conforme al producto esperado.

Ejemplos de composiciones

15 Ejemplo A:

Crema agua en aceite (E/H):

dodecanol de octilo	1%
Estearato de magnesio	4%
Cera de abeja natural	5%
Sesquioleato de sorbitán	4,5%
Mono y diestearato de glicerol y estearato de potasio	1,0%
Aceite de vaselina	22%
Aceite de Jojoba	4%
Compuesto 1	2,5%
Conservantes	0,4%
Perfume	0,6%
Agua	csp 100%

20 Ejemplo B:

Se prepara una crema blanqueadora de cuidado de la cara de tipo emulsión aceite en agua, que comprende (% en peso):

Compuesto 1	3%
Estearato de glicerol	2%
Polisorbato 60 (Tween 60 de ICI)	1%
Ácido esteárico	1,4%
Trietanolamina	0,7%
Carbómero	0,4%
Fracción líquida de la manteca de karité	12%
Perhidroescualeno	12%
Antioxidante	0,05%
Perfume, conservante	cs
Agua	csp 100%

25

Ejemplo C:

Se prepara un gel despigmentante para la piel que comprende (% en peso):

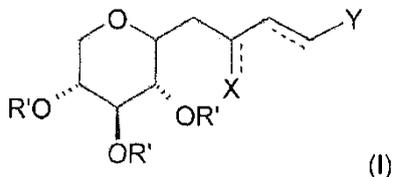
Compuesto 11 (ejemplo 1)	2%
hidroxipropilcelulosa (Klucel H de Hercules)	1%
Antioxidante	0,05%
Isopropanol	40%
Perfume, conservante	cs
agua	csp 100%

30

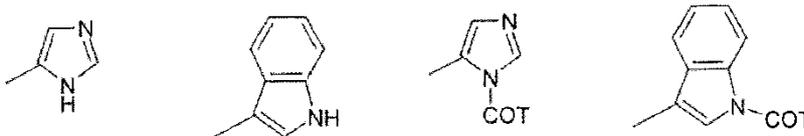
REIVINDICACIONES

1. Procedimiento cosmético de despigmentación, de aclarado y/o de blanqueamiento de la piel, del pelo o del
 5 cabello, que comprende la aplicación sobre la piel, el pelo o el cabello de una composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un compuesto de fórmula (I):

en la que,



- 10 - los compuestos de fórmula (I) son unos derivados de xilosa
- Y designa un radical fenilo o un heterociclo, eventualmente sustituidos con 1 a 5 grupos (OR_a)
- 15 - X = -OR'; (=O); NR_bR_c; NHOR_d
- R' designa:
- * un átomo de hidrógeno,
 - * un radical alquilo lineal y saturado de C1-C18,
 - * un radical alquilo lineal e insaturado C2-C18
 - 25 * un radical alquilo ramificado, saturado o insaturado, de C3-C18
 - * un radical cíclico saturado o insaturado de C5 o C6
 - * un radical acilo, lineal o ramificado, saturado o insaturado, de C2-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6,
- 30 R_a designa:
- un átomo de hidrógeno
 - 35 - un radical alquilo lineal o ramificado, de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4
 - un radical acilo lineal o ramificado de C2-C18 o alencilcarbonilo lineal o ramificado de C2-C18
 - 40 cuando Y designa un radical fenilo o un heterociclo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente -O-CH₂-O
 - 45 con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH,
- R_b designa:
- un átomo de hidrógeno
 - 50 - un radical alquilo lineal de C2-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4 o un radical -CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que
- 55 Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



y/o interrumpido por un grupo-NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico de C3-C6,

5 y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

R_c designa:

10 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

15 R_d designa:

- un átomo de hidrógeno

20 - un radical alquilo lineal de C1-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C18, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo, así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos y sus estereoisómeros.

2. Procedimiento según la reivindicación anterior, caracterizado por que:

25 - los compuestos de fórmula (I) son unos derivados de xilosa

- Y designa un radical fenilo o un heterociclo, eventualmente sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)

30 - X = -OR'; (=O); NR_bR_c; NHOR_d

- R' designa:

* un átomo de hidrógeno,

35 * un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C12, o cíclico saturé de C5 o C6

* un radical acilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C2-C6, o cíclico saturé de C5 o C6

R_a designa:

40 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal o ramificado, de C1-C4,

45 - un radical acilo lineal o ramificado de C2-C6,

cuando Y designa un radical fenilo o un heterociclo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente -O-CH₂-O

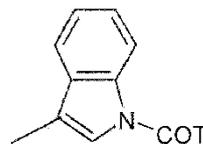
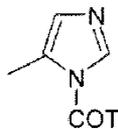
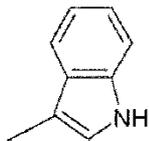
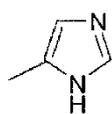
50 con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH,

R_b designa:

55 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C2-C12, o ramificado de C3-C12, o un radical-CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que

60 Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal de C1-C6, cíclico de C5-C6,

5 y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

R_c designa:

10 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

15 R_d designa:

- un átomo de hidrógeno

20 - un radical alquilo lineal de C1-C12, o ramificado de C3-C12, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos y sus estereoisómeros.

3. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizado por que:

25 - los compuestos de fórmula (I) son unos derivados de xilosa

- Y designa un radical fenilo o un heterociclo, eventualmente sustituido con 1 a 3 grupos (OR_a)

30 - X = -OR'; (=O); NR_bR_c; NHOR_d

- R' designa:

35 * un átomo de hidrógeno,

* un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C4,

* un radical acilo lineal o ramificado de C2-C6,

R_a designa:

40 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal o ramificado, de C1-C4,

- un radical acilo lineal o ramificado de C2-C6,

45 cuando Y designa un radical fenilo o un heterociclo sustituido con 2 o 3 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente -O-CH₂-O

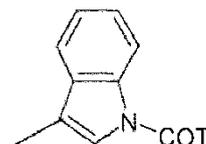
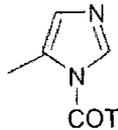
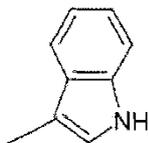
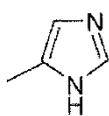
50 con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH,

R_b designa:

55 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C2-C8, o ramificado de C3-C8, o un radical-CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que

60 Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal de C1-C6, cíclico de C5-C6,

5 y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

R_c designa:

10 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

R_d designa:

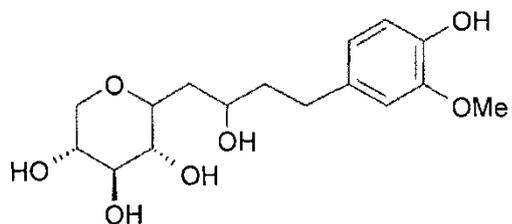
15 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

20 así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos y sus estereoisómeros.

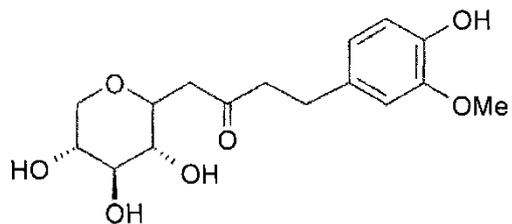
4. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizado por que el compuesto de fórmula (I) se selecciona entre:

25 Compuesto 1.: (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(4-hidroxi-3-metoxifenil)butil]tetrahydro-2H-piran-3,4,5-triol



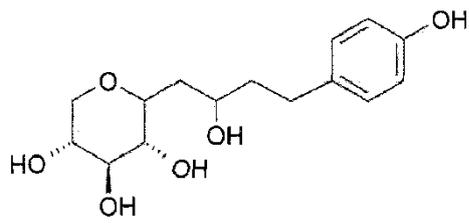
(1)

30 Compuesto 2. 4-(4-hidroxi-3-metoxifenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahydro-2H-piran-2-il]butan-2-ona



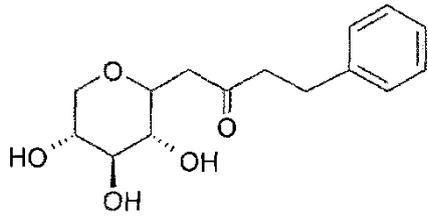
(2)

35 Compuesto 3. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(4-hidroxi-fenil)butil]tetrahydro-2H-piran-3,4,5-triol

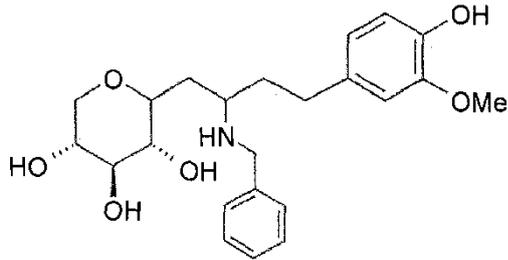


(3)

Compuesto 4. 4-(4-hidroxi-fenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahydro-2H-piran-2-il]butan-2-ona

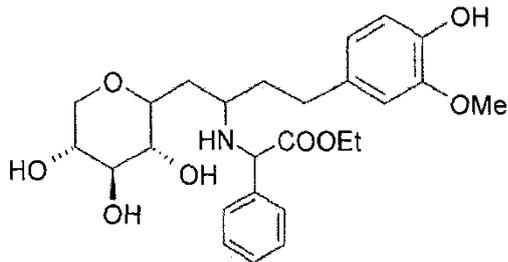


Compuesto 5. (3R,4S,5R)-2-[2-(bencilamino)-4-(4-hidroxi-3-metoxifenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



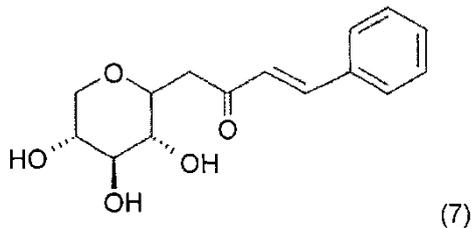
5

Compuesto 6. {[3-(4-hidroxi-3-metoxifenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahidro-2H-piran-2-il]metil]propil]amino}(fenil)acetato de etilo



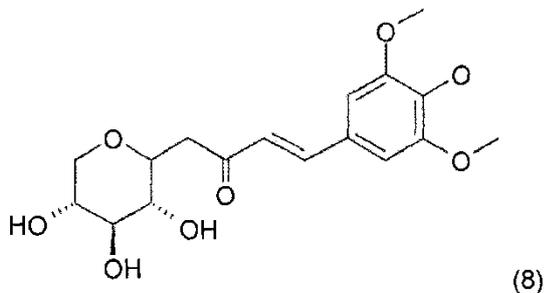
10

Compuesto 7. (3E)-4-fenil-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahidro-2H-piran-2-il]but-3-en-2-ona



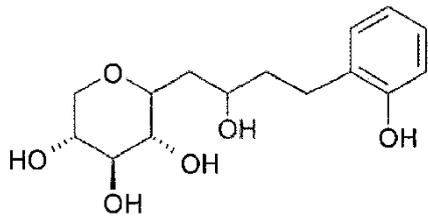
15

Compuesto 8. (3E)-4-(4-hidroxi-3,5-dimetoxifenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahidro-2H-piran-2-il]but-3-en-2-ona

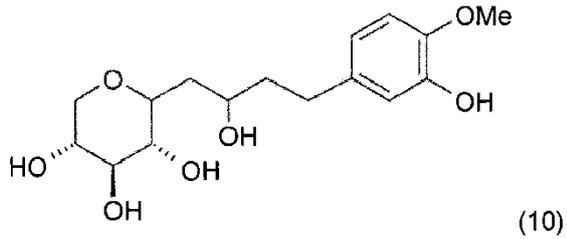


20

Compuesto 9. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(2-hidroxifenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol

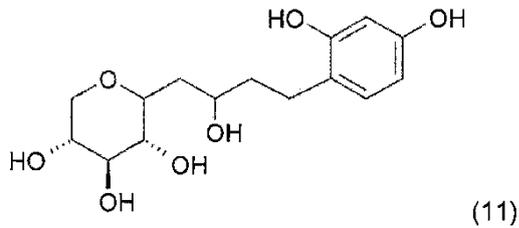


Compuesto 10: (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(3-hidroxi-4-metoxifenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



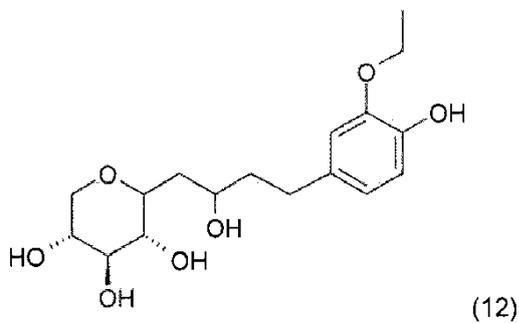
5

Compuesto 11. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(2,4-di-hidroxi-fenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



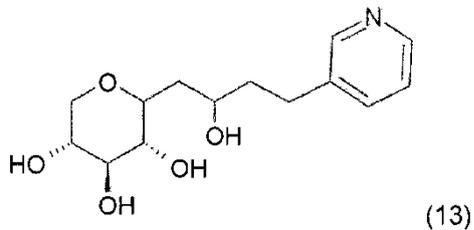
10

Compuesto 12. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(3-etoxi-4-hidroxi-fenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



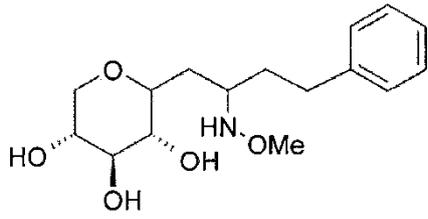
15

Compuesto 13. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-1-piridin-3-il-D-xilo-nonitol



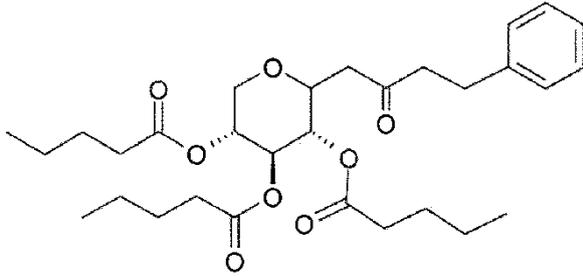
20

Compuesto 14. (3R,4S,5R)-2-[(2E)-2-(metoxiimino)-4-fenilbutil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



(14)

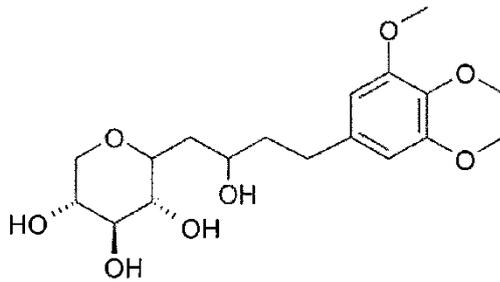
Compuesto 15. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-7-O-pentanoil-1-fenil-D-xilo-non-3-ulososa



5

(15)

Compuesto 16. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-1-(3,4,5-trimetoxifenil)-D-xilononitol



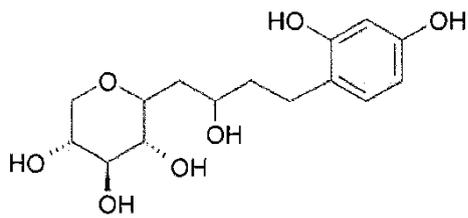
(16)

10

5. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizado por que el compuesto de fórmula (I) se selecciona entre:

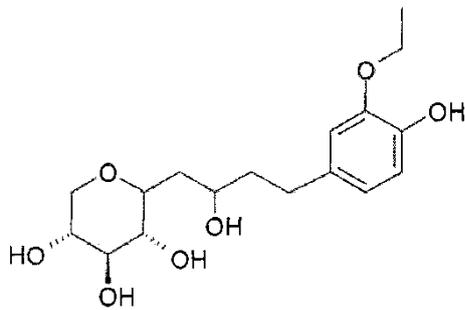
Compuesto 11. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(2,4-dihidroxi-fenil)butil]tetrahydro-2H-piran-3,4,5-triol

15



(11)

Compuesto 12. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(3-etoxi-4-hidroxi-fenil)butil]tetrahydro-2H-piran-3,4,5-triol



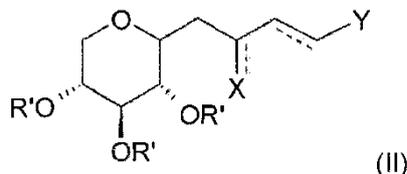
20

(12)

6. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizado por que el compuesto de fórmula (I) está presente en una cantidad que va del 0,001% al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferentemente que va del 0,01% al 5% en peso, en particular del 0,1 al 2%.

7. Utilización cosmética de un compuesto de fórmula (I) tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, como agente blanqueador, aclarante y/o despigmentante de la piel, del pelo o del cabello.

8. Compuestos C-xilósidos de fórmula (II):



en la que,

- los compuestos de fórmula (II) son unos derivados de xilosa

- Y designa un heterociclo, eventualmente sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)

- X = -OR'; (=O); NR_bR_c; NHOR_d

R' designa:

* un átomo de hidrógeno,

* un radical alquilo lineal y saturado de C1-C18,

* un radical alquilo lineal e insaturado C2-C18

* un radical alquilo ramificado, saturado o insaturado, de C3-C18

* un radical cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

* un radical acilo, lineal o ramificado, saturado o insaturado, de C2-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6,

R_a designa:

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal o ramificado, de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4

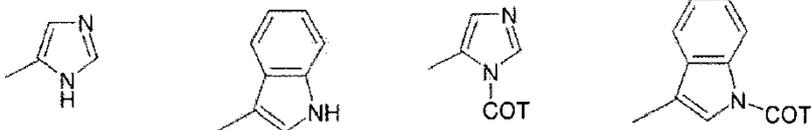
- un radical acilo lineal o ramificado de C2-C18 o acenilcarbonilo lineal o ramificado de C2-C18,

R_b designa:

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C2-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4 o un radical -CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que

Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico de C3-C6,

y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

5

R_c designa:

- un átomo de hidrógeno

10 - un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

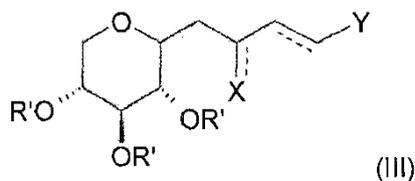
R_d designa:

15 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C18, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

20 así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos y sus estereoisómeros.

9. Compuestos C-xilósidos de fórmula (III): en la que,



25

- los compuestos de fórmula (III) son unos derivados de xilosa

- Y designa un radical fenilo eventualmente sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)

30

- X = -OR''; NR_bR_c; NHOR_d

- R' designa:

* un átomo de hidrógeno,

35

* un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

40

* un radical acilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

- R'' designa:

45

* un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

* un radical acilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

R_a designa:

50

- un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4

55

- un radical acilo lineal o ramificado de C1-C18 o alcenilcarbonilo lineal o ramificado de C2-C18

cuando Y designa un radical fenilo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente-O-CH₂-O,

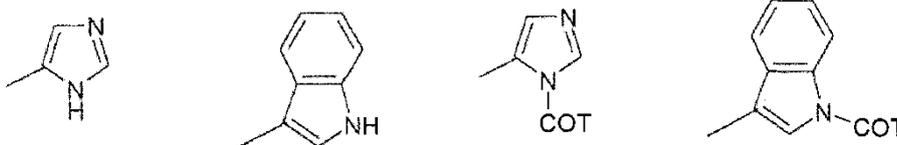
60

R_b designa:

- un átomo de hidrógeno

5 - un radical alquilo lineal de C2-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4 o un radical -CH(Z₁)-CO₂Z₂ en el que

10 Z₁ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico saturado o insaturado de C3-C6, estando dicho radical eventualmente sustituido con al menos un grupo seleccionado entre =NH, -NH₂, -N(T)₂, =O, -OH, -OT, -SH, -ST, -CO₂T, fenilo, fenilo sustituido con -OH o -OT,



15 y/o interrumpido por un grupo -NH-, -N-(COT)-, o -S-, con designando T un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6, o cíclico de C3-C6,

15 y Z₂ designa un átomo de hidrógeno o un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C6

R_c designa:

20 - un átomo de hidrógeno

- un radical alquilo lineal de C1-C4, o ramificado de C3-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo,

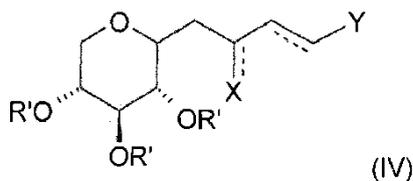
25 R_d designa:

- un átomo de hidrógeno

30 - un radical alquilo lineal de C1-C18, o ramificado de C3-C18, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C18, estando dicho radical eventualmente sustituido con un grupo fenilo

así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos, y sus estereoisómeros.

35 10. Compuestos C-xilósidos de fórmula (IV): en la que,



- los compuestos de fórmula (IV) son unos derivados de xilosa

40 - Y designa un radical fenilo eventualmente sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)

- X = -OH; (=O)

- R' designa:

45 * un radical alquilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

50 * un radical acilo lineal o ramificado, saturado o insaturado de C1-C18, o cíclico saturado o insaturado de C5 o C6

R_a designa:

- un átomo de hidrógeno

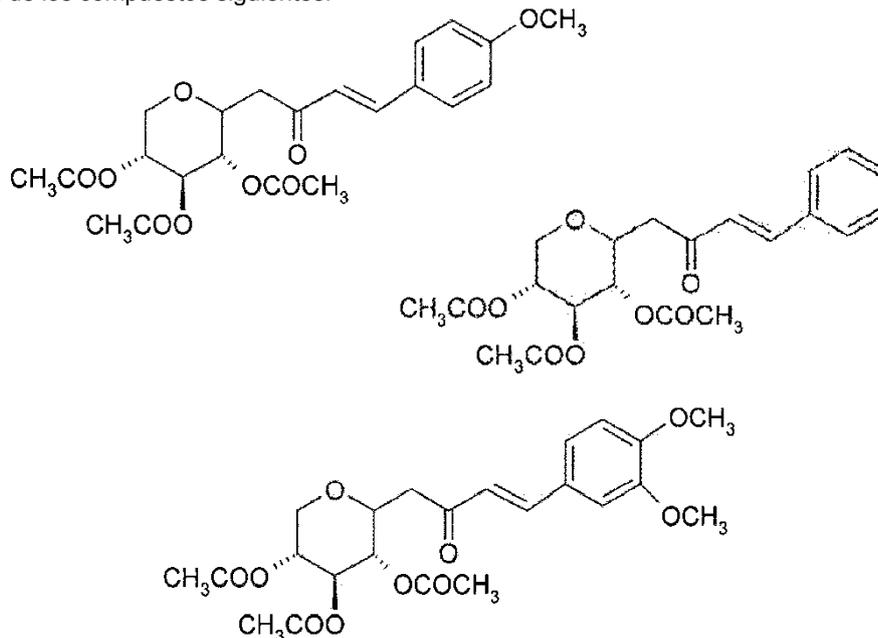
55 - un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4

- un radical acilo lineal o ramificado de C1-C18 o alencilarbonilo lineal o ramificado de C2-C18

5 cuando Y designa un radical fenilo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente-O-CH₂-O

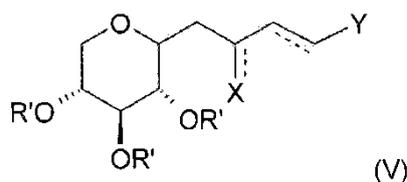
con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH,

10 así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos, y sus estereoisómeros, con la excepción de los compuestos siguientes:



15

11. Compuestos C-xilósidos de fórmula (V): en la que,



20

- los compuestos de fórmula (V) son unos derivados de xilosa

- Y designa un radical fenilo sustituido con 1 a 5 grupos (OR_a)

25 - X = -OH; (=O)

- R' designa un átomo de hidrógeno

R_a designa

30

- un radical alquilo lineal o ramificado de C1-C4, o un radical hidrocarbonado insaturado lineal o ramificado de C3-C4

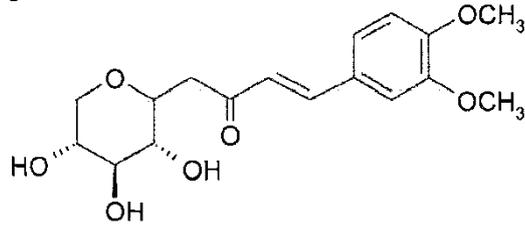
- un radical acilo lineal de C1-C18 o ramificado de C3-C18 o alencilarbonilo lineal o ramificado de C2-C18

35 con la condición de que cuando X=OH, el compuesto no comprende doble enlace etilénico en posición alfa del carbono que lleva este OH,

cuando Y designa un radical fenilo sustituido con 2 a 5 grupos (OR_a), dos grupos adyacentes OR_a pueden formar, juntos, un radical divalente-O-CH₂-O,

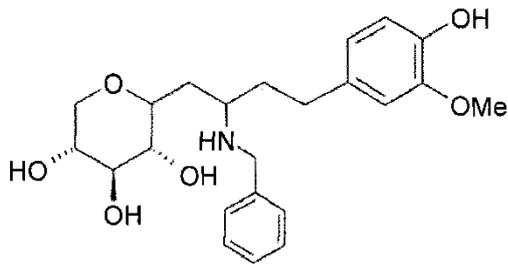
40 así como sus sales cosméticamente aceptables, sus solvatos tales como los hidratos, y sus estereoisómeros,

con la excepción del compuesto siguiente:



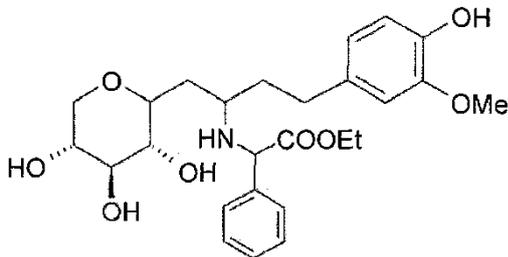
5 12. Compuestos C-xilósidos de fórmulas 5, 6, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16

Compuesto 5. (3R,4S,5R)-2-[2-(bencilamino)-4-(4-hidroxi-3-metoxifenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



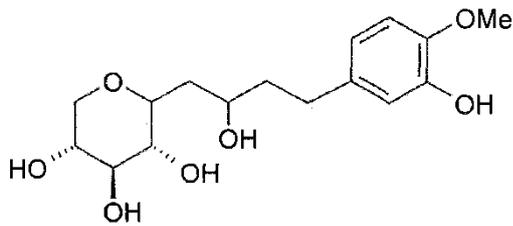
(5)

10 Compuesto 6: {[3-(4-hidroxi-3-metoxifenil)-1-[(3R,4S,5R)-3,4,5-trihidroxitetrahidro-2H-piran-2-il]metil]propil]amino}(fenil)acetato de etilo



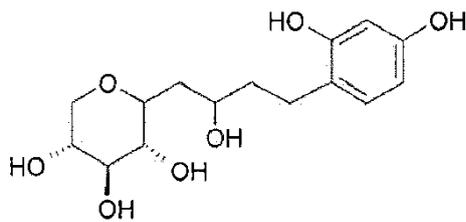
(6)

15 Compuesto 10: (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(3-hidroxi-4-metoxifenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



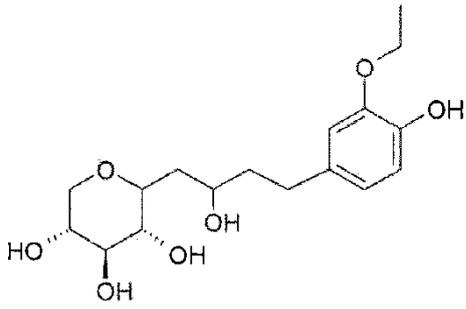
(10)

20 Compuesto 11. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(2,4-di-hidroxi-fenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



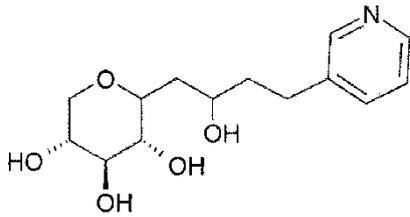
(11)

25 Compuesto 12. (3R,4S,5R)-2-[2-hidroxi-4-(3-etoxi-4-hidroxi-fenil)butil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



(12)

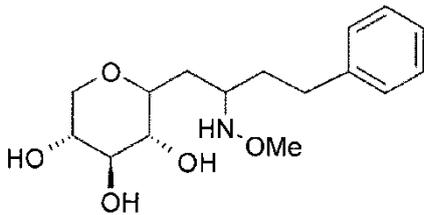
Compuesto 13. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-1-piridin-3-il-D-xilo-nonitol



5

(13)

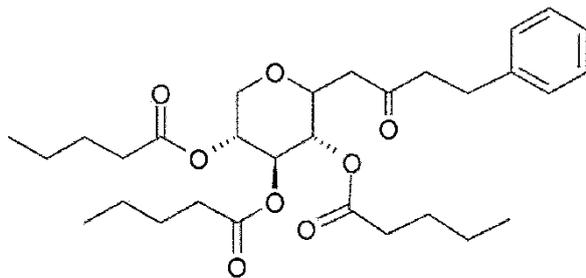
Compuesto 14. (3R,4S,5R)-2-[(2E)-2-(metoxiimino)-4-fenilbutil]tetrahidro-2H-piran-3,4,5-triol



10

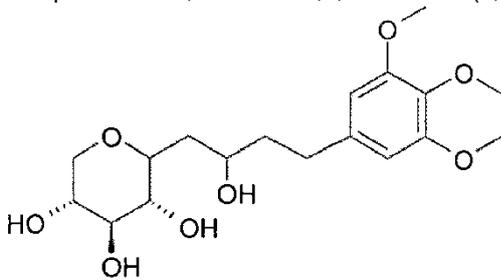
(14)

Compuesto 15. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-7-O-pentanoil-1-fenil-D-xilo-non-3-ulosa



(15)

15 Compuesto 16. 5,9-anhidro-1,2,4-trideoxi-1-(3,4,5-trimetoxifenil)-D-xilo-nonitol



(16)

13. Composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un compuesto C-xilósidos de fórmula (II) según la reivindicación 8.

20

14. Composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un compuesto C-xilósidos de fórmula (III) según la reivindicación 9.

15. Composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un compuesto C-xilósidos de fórmula (IV) según la reivindicación 10.

5 16. Composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un compuesto C-xilósidos de fórmula (V) según la reivindicación 11.

17. Composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos un compuesto C-xilósidos según la reivindicación 12.

10