

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 640 571**

51 Int. Cl.:

A61K 8/34 (2006.01)

A61K 8/42 (2006.01)

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 15/00 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **04.02.2009 PCT/EP2009/000718**

87 Fecha y número de publicación internacional: **24.09.2009 WO09115164**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **04.02.2009 E 09723608 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **21.06.2017 EP 2265243**

54 Título: **Preparaciones cosméticas o dermatológicas refrescantes con un contenido de (1R,2S,5R)-2-isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil-ciclohexancarboxamida y/o (1R,2S,5R)-N-(4-(cianometil)fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida con mentoxipropanodiol**

30 Prioridad:

20.03.2008 DE 102008015424

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

03.11.2017

73 Titular/es:

**BEIERSDORF AG (100.0%)
Unnastrasse 48
20253 Hamburg, DE**

72 Inventor/es:

**KOLBE, LUDGER;
ECKERT, JULIA;
NEUFANG, GITTA;
WÖHRMANN, MICHAEL;
KNAUPMEIER, STEFANIE y
HÖLTKEMEIER, STEFANIE**

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 640 571 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

Preparaciones cosméticas o dermatológicas refrescantes con un contenido de (1R,2S,5R)-2-isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil-ciclohexancarboxamida y/o (1R,2S,5R)-N-(4-(cianometil)fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida con mentoxipropanodiol

5 La presente invención se refiere a preparaciones cosméticas y dermatológicas refrescantes, en particular a preparaciones cosméticas y dermatológicas para el cuidado de la piel.

10 El enfriamiento de la piel puede ser algo muy agradable. Esto es así especialmente cuando la piel se siente caliente, duele, pica o se acaba de afeitar. Con frecuencia, esto está relacionado con el baño de sol o la quemadura por el sol. En el caso de picaduras de insecto o de piel inflamada, acné, el enfriamiento puede percibirse así mismo como calmante.

15 Hasta ahora hay distintas sustancias refrescantes que provocan sobre la piel una agradable sensación de frescor. De este modo que emplea por ejemplo mentol para provocar una sensación de frescor en formulaciones para después del afeitado (*after shave*). El mentol tiene sin embargo propiedades que irritan la mucosa y puede provocar otras irritaciones en la piel, lo que lleva a un escozor de la piel. Además, el mentol tiene un fuerte olor propio y puede llevar a intolerabilidades en la zona de los ojos.

20 No han faltado intentos de provocar el enfriamiento de la piel mediante la aplicación de una preparación. Se intentó también hallar preparaciones que refresquen.

Esto se provocaba especialmente para la piel después del afeitado o la piel después del baño de sol o de una quemadura solar. Los productos conocidos se denominan *after-shave* o *after-sun*.

25 Era un objetivo de la presente invención remediar los defectos del estado de la técnica y proporcionar preparaciones que permitan el enfriamiento de la piel, que puedan prepararse de manera sencilla, que no ejerzan ningún efecto irritante sobre la piel o las mucosas, que tengan un olor neutro, así como brinden un enfriamiento agradable con la aplicación prevista.

30 Sin embargo, era asombroso e imprevisible para el experto, que las preparaciones cosméticas o dermatológicas tópicas refrescantes con un contenido de

sustancia A): (1R,2S,5R)-2-isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil-ciclohexancarboxamida y/o (1R,2S,5R)-N-(4-(cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida y
sustancia B): mentoxipropanodiol,

35 se caracterizan por que se encuentran en forma de emulsiones O/W por que contienen el 0,001-10 % en peso, de manera especialmente preferente el 0,01-1 % en peso, de sustancia A), con respecto a la composición total de las preparaciones y por que la relación de sustancia A) con respecto a sustancia B) de 1 a 20, de manera especialmente preferente de 40 1,5 a 15, eliminan las desventajas del estado de la técnica.

Estas sustancias refrescantes que reducen el picor pueden emplearse también en combinación con otras sustancias refrescantes.

45 Ejemplos de otras sustancias refrescantes son mentol, mentona, etil mentano carboxamido acetato (WS-5), isopulegol (Coolact P), mentanodiol (Coolact 38D), N,2,3-trimetil-2-isopropilbutanamida (WS-23), etil mentano carboxamida (WS-3), mentona glicerín acetal (Frescolat MGA), succinato de mono-mentilo (Physcool) o éster metílico del ácido 2-isopropil-5-metil-ciclohexano-carbonil-amido-propiónico.

50 Las preparaciones pueden formularse de manera sencilla y no exigen grandes requisitos en cuanto a los procesos de producción.

Las sustancias refrescantes se disuelven previamente en polioles y se añaden a aproximadamente 40°C a la emulsión antes del enfriamiento hasta temperatura ambiente.

55 La invención comprende también el uso de preparaciones cosméticas o dermatológicas con un contenido de

sustancia A): (1R,2S,5R)-2-isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil-ciclohexancarboxamida y/o (1R,2S,5R)-N-(4-(cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida y
60 sustancia B): mentoxipropanodiol,

- caracterizado por que se encuentran en forma de emulsiones O/W por que contienen el 0,001-10 % en peso, de manera especialmente preferente el 0,01-1 % en peso, de sustancia A), con respecto a la composición total de las preparaciones y por que la relación de sustancia A) con respecto a sustancia B) es de 1 a 20, de manera especialmente preferente de 1,5 a 15, para generar una sensación refrescante sobre la piel.
- Se prefiere más especialmente cuando las preparaciones contienen antioxidantes. Se prefiere más especialmente cuando las preparaciones contienen vitaminas. Se prefiere más especialmente cuando las preparaciones contienen alcoholes. Se prefiere más especialmente cuando las preparaciones contienen antitranspirantes. Se prefiere más especialmente cuando las preparaciones contienen desodorantes.
- Para la aplicación se aplican las preparaciones cosméticas y dermatológicas de acuerdo con la invención de la manera habitual para los cosméticos sobre la piel cantidad suficiente.
- Las preparaciones cosméticas y dermatológicas pueden contener de acuerdo con la invención excipientes cosméticas, tal como se usan habitualmente en las preparaciones de este tipo, por ejemplo conservantes, bactericidas, perfumes, sustancias para impedir la espumación, colorantes, pigmentos, que tienen un efecto colorante, espesantes, sustancias hidratantes y/o humectantes, grasas, aceites, ceras u otros constituyentes habituales de una formulación cosmética o dermatológica tales como alcoholes, polioles, polímeros, estabilizadores de la espuma, electrolitos, disolventes orgánicos o derivados de silicona.
- En general se prefiere un contenido adicional de antioxidantes habituales. De acuerdo con la invención, pueden usarse como antioxidantes favorables todos los antioxidantes adecuados o habituales para aplicaciones cosméticas y/o dermatológicas.
- La cantidad de los antioxidantes mencionados anteriormente (uno o varios compuestos) en las preparaciones asciende preferentemente a del 0,001 al 30 % en peso, de manera especialmente preferente al 0,05-20 % en peso, en particular al 1-10 % en peso, con respecto al peso total de la preparación.
- Pueden usarse como disolvente:
- agua o soluciones acuosas
 - aceites, tales como triglicéridos del ácido cáprico o del ácido caprílico, pero preferentemente aceite de ricino;
 - grasas, ceras y otros sólidos naturales y sintéticos, preferentemente ésteres de ácidos grasos con alcoholes de bajo número de C, por ejemplo con isopropanol, propilenglicol o glicerol, o ésteres de alcoholes grasos con ácidos alcanóicos de bajo número de C o con ácidos grasos;
 - alcoholes, dioles o polioles de bajo número de C, así como sus éteres, preferentemente etanol, isopropanol, propilenglicol, glicerol, etilenglicol, etilenglicolmonoetil- o -monobutil éter, polietilenglicolmonometil-, -monoetil- o -monobutil éter, dietilenglicolmonometil o -monoetil éter y productos análogos.
- En particular se usan mezclas de los disolventes mencionados anteriormente.
- Se obtienen preparaciones especialmente ventajosas además cuando como aditivos o principios activos se emplean antioxidantes. De acuerdo con la invención, las preparaciones contienen ventajosamente uno o varios antioxidantes. Como antioxidantes favorables, pero que, no obstante, van a usarse facultativamente, pueden usarse todos los antioxidantes adecuados o habituales para aplicaciones cosméticas y dermatológicas.
- De manera muy especialmente ventajosa en el sentido de la presente invención, pueden emplearse antioxidantes solubles en agua, tales como por ejemplo vitaminas, por ejemplo ácido ascórbico y sus derivados - en particular palmitato de ascorbilo, ascorbilfosfato de Na y Mg y acetato de ascorbilo - así como ácido rutínico y sus derivados en particular alfa glucosilrutina, quercetina e isoquercetina.
- Antioxidantes especialmente preferidos son así mismo vitamina E y sus derivados (en particular acetato de vitamina E), vitamina A y sus derivados (en particular palmitato de vitamina A) así como carnosina, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, beta-alanina así como carotinoides (en particular beta-caroteno) y fitoeno.
- La cantidad de los antioxidantes (uno o varios compuestos) en las preparaciones asciende preferentemente a del 0,001 al 30 % en peso, de manera especialmente preferente del 0,05 al 20 % en peso, en particular del 0,1 al 10 % en peso, con respecto al peso total de la preparación.
- De acuerdo con la invención es ventajoso emplear, además de las combinaciones de acuerdo con la invención, filtros UVB y/o filtros UVA solubles en aceite adicionales en la fase lipídica y/o filtros UVB y/o filtros UVA solubles en agua adicionales en la fase acuosa.
- De manera ventajosa, las formulaciones fotoprotectoras pueden contener de acuerdo con la invención sustancias adicionales que absorben la radiación UV en la región UVB, ascendiendo la cantidad total de las sustancias de filtro

por ejemplo a del 0,1 % en peso al 30 % en peso, preferentemente del 0,5 al 10 % en peso, en particular del 1 al 6 % en peso, con respecto al peso total de las preparaciones, para proporcionar preparaciones cosméticas que protegen la piel frente a toda la región de la radiación ultravioleta. Estos pueden servir también como agentes protectores solares.

5 Los siguientes Ejemplos aclararán la presente invención, sin limitarla. Todos los datos de cantidades, proporciones y partes en porcentaje se refieren, siempre que no se indique otra cosa, al peso y la cantidad total o al peso total de las preparaciones.

Crema de día % en peso	
Gliceril estearato citrato	3
Alcohol cetílico	2
Estearato de glicerilo	1
Ciclometicona 3-Butilmetoxidibenzoilmetano (Parsol(R) 1789)	2
2-Ciano-3,3-difenilacrilato de etilhexilo (Octocrileno)	5
Metoxicinnamato de etilhexilo	2
Mentoxipropanodiol	1
(1R,2S,5R)-2-Isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil-ciclohexancarboxamida	0,1
Benzoato de alquilo C12-15	3
Carbómero	0,2
Ascorbilfosfato de sodio	0,2
3-(4-Hidroxi-3-metoxifenil)-1-(4-hidroxifenil)-propan-1-ona	0,5
Glicerol	8
(1R,2S,5R)-N-(4-(Cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida	0,02
Perfume	0,3
Hidróxido de sodio	c. s.
Agua	hasta 100
pH 5	

10	Crema para el cuidado	% en peso
	Estearato de glicerilo, autoemulsionante	5
	Alcohol estearílico	3
	Ácido esteárico	1
	(1R,2S,5R)-N-(4-(Cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida	0,08
	Dimeticonol	0,5
	Ciclometicona	4
	Octildodecanol	3
	Glicéridos de grasa de coco hidrogenados	2
	Mentoxipropanodiol	0,4
	3-(4-Hidroxi-3-metoxifenil)-1-(4-hidroxifenil)-propan-1-ona	0,2
	Octenilsuccinato sódico de almidón	1
	Carbómero	0,2
	(1R,2S,5R)-2-Isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil-ciclohexancarboxamida	0,06
	Glicerol	9
	EDTA	0,1
	Perfume	0,3
	Acetato de tocoferilo	0,5
	Coenzima Q 10	0,1
	Metilpropanodiol	1
	Hidróxido de sodio	c. s.
	Agua	hasta 100
	pH: 7	

	Crema para la piel refrescante	% en peso
	Poliglyceril-3 metilglucosa diestearato:	2
	Estearato de sorbitano	2
	Alcohol estearílico	2
	Benzoato de alquilo C12-15	2
	Dimeticona	2
	Triglicéridos de ácido caprílico/ácido cáprico	3
	Ciclometicona	4
	Etilhexil triazona	1
	2,2'-Metilen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol)	2
	2-Ciano-3,3-difenilacrilato de etilhexilo (Octocrileno)	3
	3-(4-Hidroxi-3-metoxifenil)-1-(4-hidroxifenil)-propan-1-ona	0,5

ES 2 640 571 T3

Carragenanos	0,1
Acrilato de alquilo reticulado (polímero cruzado de acrilato de alquilo)	0,1
(1R,2S,5R)-N-(4-(Cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida	0,05
Mentoxipropanodiol	0,8
Glicerol	8
Etilhexilglicerol	0,4
(1R,2S,5R)-2-Isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil)-ciclohexancarboxamida	0,06
Etilparabeno	0,2
Fenoxietanol	0,4
Aditivos (nailon, fosfato de almidón)	2
Ácido cítrico, sal de sodio	c. s.
Agua	hasta 100
pH: 6	
Crema de protección solar con efecto refrescante	% en peso
Estearato de glicerilo	3
PEG-40-estearato	1
Alcohol cetílico	2
Benzoato de alquilo C12-15	2
Dicaprilil éter	2
Octildodecanol	2
Ciclometicona	2
Miristato de miristilo	1
(1R,2S,5R)-N-(4-(Cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida	0,04
Metoxicinnamato de etilhexilo	6
Ácido fenilbenzimidazolsulfónico	1
Aniso Triazina (2,4-bis-1{[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil}-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina)	2
3-(4-Hidroxi-3-metoxifenil)-1-(4-hidroxifenil)-propan-1-ona	0,2
Carragenanos	0,2
Carbómero	0,2
Glicerol	7
Butilenglicol	3
(1R,2S,5R)-2-Isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil)-ciclohexancarboxamida	0,6
Mentoxipropanodiol	1,5
Perfume	c. s.
Hidróxido de sodio	c. s.
Agua hasta 100	
pH: 7	
Bálsamo para después del afeitado (<i>after shave</i>)	% en peso
Tricetearth-4 fosfato	1
Ciclometicona	3
Benzoato de alquilo C12-15	2
Mentoxipropanodiol	1
Fosfato de dialmidón	1
(1R,2S,5R)-2-Isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil)-ciclohexancarboxamida	0,1
Goma xantana	0,1
Metilparabeno	0,2
Fenoxietanol	0,4
(1R,2S,5R)-N-(4-(cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida	0,04
Glicerol	6
EDTA	0,1
Perfume	0,3
Hidróxido de sodio	c. s.
Agua	hasta 100
pH: 7	

REIVINDICACIONES

1. Preparaciones cosméticas o dermatológicas tópicas refrescantes con un contenido de

5 sustancia A): (1R,2S,5R)-2-isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil-ciclohexancarboxamida y/o (1R,2S,5R)-N-(4-(cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida y sustancia B): mentoxipropanodiol,

caracterizadas por que se encuentran en forma de emulsiones O/W

10 **por que** contienen el 0,001-10 % en peso, de manera especialmente preferente el 0,01-1 % en peso, de sustancia A), con respecto a la composición total de las preparaciones y **por que** la relación de sustancia A) con respecto a sustancia B) es de 1 a 20, de manera especialmente preferente de 1,5 a 15.

15 2. Uso de preparaciones cosméticas o dermatológicas con un contenido de

sustancia A): (1R,2S,5R)-2-isopropil-5-metil-N-(2-(piridin-2-il)etil-ciclohexancarboxamida y/o (1R,2S,5R)-N-(4-(cianometil)-fenil)-2-isopropil-5-metilciclohexancarboxamida y sustancia B): mentoxipropanodiol,

20 **caracterizado por que** se encuentran en forma de emulsiones O/W

por que contienen el 0,001-10 % en peso, de manera especialmente preferente el 0,01-1 % en peso, de sustancia A), con respecto a la composición total de las preparaciones y **por que** la relación de sustancia A) con respecto a sustancia B) es de 1 a 20, de manera especialmente preferente de 1,5 a 15, para generar una sensación refrescante sobre la piel.