



OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

**ESPAÑA** 



11) Número de publicación: 2 647 784

(51) Int. Cl.:

A61K 8/37 (2006.01) A61K 8/34 (2006.01) A61K 8/891 (2006.01) A61Q 5/02 (2006.01) A61K 8/35 A61Q 19/00 (2006.01) A61K 8/92 (2006.01) A61K 8/06 (2006.01)

(12)

# TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

**T3** 

- (96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: 08.03.2013 E 13158445 (0) (97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: 30.08.2017 EP 2774604
  - (54) Título: Composiciones cosméticas
  - (45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente: 26.12.2017

(73) Titular/es:

**SYMRISE AG (100.0%)** Mühlenfeldstrasse 1 37603 Holzminden, DE

(72) Inventor/es:

PESARO, MANUEL; LANGE, SABINE y SCHMAUS, GERHARD

(74) Agente/Representante:

**ELZABURU, S.L.P** 

# **DESCRIPCIÓN**

Composiciones cosméticas

## Campo de invención

La presente invención pertenece al área de cosméticos y se refiere a usos de derivados de acetofenona en composiciones cosméticas específicas.

### Estado de la técnica

5

10

15

20

Típicamente, las composiciones cosméticas comprenden una multitud de componentes. Mirando el listado de los ingredientes para una crema de noche media se pueden encontrar hasta 20 líneas y hay tendencia a añadir tantos ingredientes como sea posible con el fin de hacer frente a muchos diferentes aspectos, todo al mismo tiempo. De hecho, muchos consumidores igualan la complejidad de una composición con el beneficio y aceptan altos precios, ya que también esperan alto rendimiento. Por otro lado, cuanto más compleja se vuelve una composición, más difícil es evitar interacciones negativas entre los componentes. Un problema importante de las composiciones cosméticas, por supuesto en particular para todos los tipos de emulsiones, aún es su estabilidad, especialmente en caso de que se sometan a condiciones de almacenamiento difíciles, como temperaturas altas o bajas. Véase p. ej. W02007124889.

Otro objeto está relacionado con el perfil sensorial. La extensibilidad, la sensación y el olor son parámetros importantes que contribuyen al gusto general de una formulación cosmética después de la aplicación en la piel:

Cuanto más rápido se extiendan los cuerpos oleosos de una emulsión sobre la piel, mejor es la percepción del cliente. El comportamiento de extensibilidad de una formulación y, por lo tanto su perfil sensorial, está relacionado con el tamaño de partícula medio de las gotas en la composición. Cuanto más pequeñas son las gotas, más rápida es la extensibilidad. Como consecuencia, todavía hay una necesidad de aditivos que permiten cambiar la distribución media de tamaño de partícula a valores más bajos.

Otro problema especialmente para las composiciones de champú es la estabilidad y viscosidad de la espuma. Véase p. ej. EP1681046.

Por lo tanto, el objeto de la presente invención ha sido identificar un aditivo multifuncional para formulaciones cosméticas, que no interacciona negativamente con otros ingredientes al tiempo que mejora la estabilidad, viscosidad y el perfil sensorial de las composiciones cosméticas que contienen este aditivo.

#### Descripción de la invención

Es objeto de la presente invención el uso de un derivado de acetofenona de fórmula (I) en una composición cosmética, que comprende

(a) al menos un derivado de acetofenona de fórmula (I)

(I)

en la que

35 R<sub>1</sub> significa hidrógeno o metilo, y

R<sub>2</sub> significa hidrógeno, hidroxilo o un grupo -OCH<sub>3</sub>,

o una de sus sales cosmética o farmacéuticamente aceptable en una cantidad de uso desde 0,1 a 0,5% en peso corporal calculado sobre la composición tópica,

- (b) al menos un cuerpo oleoso o cera, y/o
- 40 (c) al menos un emulsionante y opcionalmente
  - (d) al menos un principio activo,

- para mejorar la estabilidad de la composición cosmética a través de la reducción del tamaño medio de partícula de las gotas y
- para mejorar el perfil sensorial de las formulaciones cosméticas,
- y para mejorar la estabilidad de la espuma y aumentar la viscosidad de la formulación cosmética que son champús.

Sorprendentemente se ha observado que los derivados de acetofenona según la presente invención satisfacen todas las necesidades mencionadas anteriormente simultáneamente:

- la adición de derivados de acetofenona de fórmula (I) mejora la estabilidad de formulaciones cosméticas incluso bajo condiciones de almacenamiento difícil, y
- al mismo tiempo, la adición de los derivados de acetofenona en una formulación cosmética mejora su perfil sensorial. En particular, derivados de acetofenona conducen a la formación de gotas más pequeñas en las composiciones. Debido al hecho de que las gotas de aceite o agua están más finamente divididas, la sensación en la piel mejora. Por ejemplo, la sensación oleosa de cremas y lociones se puede reducir de esa manera. Los desodorantes también pueden dar una sensación más suave y una sensación más cremosa cuando se aplican a la piel:
- además, se ha observado que los derivados de acetofenona de fórmula (I) mejoran la estabilidad de la espuma de champú y además, producen un aumento de la viscosidad de formulaciones de champú.

Por lo tanto, los derivados de acetofenona de fórmula (I) satisfacen la necesidad de los denominados "ingredientes reales de multitarea".

20 Derivados de acetofenona.

5

10

15

25

30

35

Derivados de acetofenona usados según la presente invención representan compuestos conocidos que se pueden obtener por métodos ordinarios de química orgánica. Se entiende que ambos sustituyentes OR1 y № pueden estar situados en posición orto, meta o para hacia el grupo ceto metil.

Preferentemente, las especies se seleccionan del grupo que consiste en

(la): 2-hidroxiacetofenona

(lb): 3-hidroxiacetofenona

(Ic): 4-hidroxiacetofenona

o sus mezclas. En la medida en que la definición se refiere a sales de dichos derivados aceptables cosmética o farmacéuticamente, esto significa que estas sales se pueden utilizar de forma segura durante con fines farmacéuticos. Esto no significa que la presente invención o cualquier aspecto de la misma esté limitado al uso de un compuesto de fórmula (I) o una mezcla correspondiente con fines farmacéuticos. Generalmente, si una sal se puede utilizar con fines farmacéuticos también se puede usar con fines cosméticos, o en formulaciones de alimentos o bebidas. En particular, las sales de sodio y potasio y amonio de los compuestos de fórmula (I) se consideran como sales (farmacéuticamente) aceptables. En algunos casos la utilización de los respectivos componentes iónicos o

vehículos de solvato demuestra ser superior al derivado no modificado. Las sales (farmacéuticamente) aceptables (y los solvatos correspondientes) de compuestos de fórmula (I) se pueden preparar por procedimientos estándar. En lo sucesivo, cualquier referencia a un compuesto de formula (I) o una mezcla correspondiente como se define anteriormente debe entenderse que comprende una referencia adicional a sus correspondientes sales (farmacéuticamente) aceptables.

En una realización preferente el conservante comprende o contiene dos o tres de los compuestos (Ia), (Ib) y (Ic), como por ejemplo 2-hidroxiacetofenona y 3-hidroxiacetofenona, o 2-hidroxiacetofenona y 4-hidroxiacetofenona, o 3-hidroxiacetofenona y 4-hidroxiacetofenona.

La composición contiene los derivados de acetofenona en una cantidad de uso desde 0,1 a 0,5% en peso corporal calculado sobre la composición tópica.

#### Cuerpos oleosos

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

Los cuerpos oleosos adecuados (componente b1) son, por ejemplo, los alcoholes de Guerbet a base de alcoholes grasos que tienen de 6 a 18, preferentemente de 8 a 10 átomos de carbono, ésteres de ácidos grasos lineales C<sub>6</sub>-C<sub>22</sub> con alcoholes grasos C6-C22 lineales o ramificados o ésteres de ácidos carboxílicos ramificados C<sub>6</sub>-C<sub>13</sub> con alcoholes grasos lineales o ramificados C<sub>6</sub>-C<sub>22</sub>, tales como, por ejemplo, miristato de miristilo, palmitato de miristilo, estearato de miristilo, isoestearato de miristilo, oleato de miristilo, behenato de miristilo, erucato de miristilo, miristato de cetil, palmitato de cetilo, estearato de cetilo, isoestearato de cetilo, oleato de cetilo, behenato de cetilo, erucato de cetilo, miristato de estearilo, palmitato de estearilo, estearato de estearilo, isoestearato de estearilo, oleato de estearilo, behenato de estearilo, erucato de estearilo, miristato de isoestearilo, palmitato de isoestearilo, estearato de isoestearilo, isoestearato de isoestearilo, oleato de isoestearilo, behenato de isoestearilo, oleato de isoestearilo, miristato de oleilo, palmitato de oleilo, estearato de oleilo, isoestearato de oleilo, oleato de oleilo, behenato de oleilo, erucato de oleilo, miristato de behenilo, palmitato de behenilo, estearato de behenilo, isoestearato de behenilo, oleato de behenilo, behenato de behenilo, erucato de behenilo, miristato de erucilo, palmitato de erucilo, estearato de erucilo, isoestearato de erucilo, oleato de erucilo, behenato de erucilo y erucato de erucilo. También son adecuados los ésteres de ácidos grasos lineales C6-C22 con alcoholes ramificados, en particular 2-etilhexanol, ésteres de ácidos alquilhidroxi carboxílicos C<sub>18</sub>-C<sub>38</sub> con alcoholes grasos lineales o ramificados C<sub>6</sub>-C<sub>22</sub>, en particular dioctil malato, ésteres de ácidos grasos lineales y/o ramificados con alcoholes polihídricos (tales como, por ejemplo, propilen glicol, dimerdiol o trimertriol) y/o alcoholes de Guerbet, triglicéridos con base de ácidos grasos C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>, mezclas líquidas de mono/di/ triglicéridos con base de ácidos grasos C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub>, ésteres de alcoholes grasos C<sub>6</sub>-C<sub>22</sub> y/o alcoholes de Guerbet con ácidos carboxílicos aromáticos, en particular ácido benzoico, ésteres de ácidos dicarboxílicos C2-C12 con alcoholes lineales o ramificados que tienen de 1 a 22 átomos de carbono o polioles que tienen de 2 a 10 átomos de carbono y de 2 a 6 grupos hidroxilo, aceites vegetales, alcoholes primarios ramificados, ciclohexanos substituidos, carbonatos de alcoholes grasos C6-C22 lineales y ramificados, tales como, por ejemplo, carbonato de dicaprililo (Cetiol® CC), carbonatos de Guerbet, con base de alcoholes grasos que tienen de 6 a 18, preferentemente de 8 a 10, átomos de carbono, ésteres del ácido benzoico con alcoholes C6-C22 lineales y/o ramificados (por ejemplo Finsolv® TN), dialquil éteres simétricos o asimétricos, lineales o ramificado, que tienen de 6 a 22 átomos de carbono por grupo alquilo, tales como, por ejemplo, dicaprilil éter (Cetiol® OE), productos de anillo abierto de ésteres de ácidos grasos epoxidados con polioles, aceites de silicona (ciclometiconas, grados de meticona de silicona, etc.), hidratos de carbono alifáticos o nafténicos, tales como, por ejemplo, escualano, escualeno o dialquilciclohexanos, y/o aceites minerales.

#### Ceras

Entre el grupo de ceras adecuadas (componente b2) se puede diferenciar entre los siguientes tipos:

- · agentes de sobreengrasado
- factores de consistencia
- ceras perlantes, y
- ceras naturales

Agentes de sobreengrasado. Los agentes de sobreengrasado se pueden seleccionar a partir de sustancias tales como, por ejemplo, lanolina y lecitina y también lanolina polietoxilada o acilada y derivados de lecitina, ésteres de ácidos grasos y polioles, monoglicéridos y alcanolamidas de ácidos grasos; alcanolamidas de ácidos grasos también pueden servir como estabilizadores de espuma.

Factores de consistencia. Los factores de consistencia pueden ser, por ejemplo, alcoholes grasos o hidroxi alcoholes grasos que contienen de 12 a 22 y preferentemente de 16 a 18 átomos de carbono y también glicéridos, ácidos grasos o ácidos hidroxi grasos del mismo número de carbonos. Preferentemente se usa una combinación de estas sustancias con alquil oligo glucósidos y/o ácidos grasos de N-metil glucamidas de la misma longitud de cadena y/o poliglicerol poli-12-hidroxi estearatos.

Ceras perlantes. Las cera perlantes adecuadas son, por ejemplo, ésteres de alquilenglicol, especialmente diestearato de etilenglicol; alcanolamidas de ácidos grasos, especialmente dietanolamida de ácido graso de coco;

glicéridos parciales, especialmente monoglicérido de ácido esteárico; ésteres de polibásico, opcionalmente ácidos carboxílicos hidroxi sustituidos con alcoholes grasos que contiene de 6 a 22 átomos de carbono, especialmente ésteres de cadena larga de ácido tartárico; compuestos grasos, tal como por ejemplo alcoholes grasos, cetonas grasas, aldehídos grasos, éteres grasos y carbonatos grasos, que contienen en total al menos 24 átomos de carbono, especialmente laurona y diestearil éter; ácidos grasos, tal como ácido esteárico, ácido hidroxi esteárico o ácido behénico, productos de anillo abierto de epóxidos olefínicos que contienen de 12 a 22 átomos de carbono con alcoholes grasos que contienen de 12 a 22 átomos de carbono y/o polioles que contienen de 2 a 15 átomos de carbono y de 2 a 10 grupos hidroxilo y mezclas de los mismos.

Ceras naturales. Además de los aceites naturales utilizados, las ceras también pueden estar presentes en las preparaciones, más especialmente ceras naturales tales como, por ejemplo, cera de candelilla, cera de carnauba, cera de Japón, cera de esparto, cera de corcho, cera de Guaruma, cera de aceite de arroz, cera de caña de azúcar, cera ouricury, cera de montana, cera de abeja, cera de goma laca, esperma de ballena, lanolina (cera de lana), grasa uropygial, ceresina, ozocerita (cera de tierra), vaselina, ceras de parafina y microceras; ceras modificadas químicamente (ceras duras), tales como, por ejemplo, ceras de éster de montana, cera de sasol, ceras de jojoba hidrogenada y ceras sintéticas tales como, por ejemplo, ceras de polialquileno y ceras de glicol polietileno.

#### Emulsionantes

De modo opcional, las composiciones según la presente invención también pueden incluir emulsionantes (componente c). Los emulsionantes pueden ser de naturaleza no iónica, aniónica, catiónica y/o anfótera.

En particular los emulsionantes no iónicos son preferentes, tales como:

- productos de la adición de 2 a 30 moles de óxido de etileno y/o de 0 a 5 moles de óxido de propileno a alcoholes grasos lineales C<sub>8-22</sub>, sobre ácidos grasos C<sub>12-22</sub> y sobre alquilfenoles que contienen de 8 a 15 átomos de carbono en el grupo alquilo;
  - productos de adición de monoésteres y diésteres de ácidos grasos C<sub>12-18</sub> de 1 a 30 moles de óxido de etileno sobre glicerol;
- mono y diésteres de glicerol y mono y diésteres de sorbitán de ácidos grasos saturados e insaturados que contienen de 6 a 22 átomos de carbono y sus productos de adición de óxido de etileno;
  - productos de adición de óxido de etileno de 15 a 60 moles sobre aceite de ricino y/o aceite de ricino hidrogenado;
- ésteres de poliol y, en particular, ésteres de poliglicerol tales como, por ejemplo, poliglicerol polirricinoleato,
   poliglicerol poli-12-hidroxiestearato o poliglicerol dimerato isoestearato. También son adecuadas mezclas de compuestos de varias de estas clases;
  - productos de adición de 2 a 15 moles de óxido de etileno sobre aceite de ricino y/o aceite de ricino hidrogenado;
  - ésteres parciales con base de ácidos grasos C<sub>6-22</sub> lineales, ramificados, insaturados o saturados, ácido ricinoleico y ácido 12-hidroxiesteárico y glicerol, poliglicerol, pentaeritritol, dipentaeritritol, alcoholes de azúcar (por ejemplo, sorbitol), glucósidos de alquilo (por ejemplo metilglucósido, butilglucósido, lauril glucósido) y poliglucósidos (por ejemplo celulosa);
  - mono, di y trialquil fosfatos y mono, di y/o de tri-PEG-alquil fosfatos y sus sales;
  - alcoholes de cera de lana;
  - copolímeros polisiloxano/polialquil de poliéter y derivados correspondientes;
- mezclas de ésteres de pentaeritritol, ácidos grasos, ácido cítrico y alcohol graso y/o mezclas de ésteres de ácidos grasos C<sub>6-22</sub>, metil glucosa y polioles, preferentemente glicerol o poliglicerol,
  - polialquilen glicoles y

35

55

· carbonato de glicerol.

Los productos de adición de óxido de etileno y/o óxido de propileno sobre alcoholes grasos, ácidos grasos, alquilfenoles, mono y diésteres de glicerol y mono y diésteres de sorbitán de ácidos grasos o sobre aceite de ricino son productos conocidos comercialmente disponibles. Son mezclas homólogas de las que el grado promedio de alcoxilación corresponde a la relación entre las cantidades de óxido de etileno y/o óxido de propileno y sustrato con la que se lleva a cabo la reacción de adición. Los productos de adición de monoésteres y diésteres de ácidos grasos C<sub>12-18</sub> de óxido de etileno sobre glicerol son conocidos como potenciadores de la capa lipídica para formulaciones cosméticas. Los emulsionantes más preferentes se describen con más detalle de la siguiente manera:

#### C.1 Glicéridos parciales

Ejemplos típicos de glicéridos parciales adecuados son monoglicéridos de ácido hidroxiesteárico, diglicérido de ácido isosteárico, diglicérido de ácido isosteárico, monoglicérido de oleico, diglicérido de ácido oleico, monoglicérido de ácido ricinoleico, diglicérido ácido ricinoleico, monoglicérido de ácido linoleico, diglicérido de ácido linoleico, monoglicérido de ácido linoleico, monoglicérido de ácido linoleico, monoglicérido de ácido erúcico, diglicérido de ácido tartárico, diglicérido de ácido tartárico, monoglicérido de ácido cítrico, diglicérido de ácido cítrico, monoglicérido de ácido málico, diglicérido de á

proceso de producción. Productos de adición de 1 a 30 y preferentemente de 5 a 10 moles de óxido de etileno sobre los glicéridos parciales mencionados también son adecuados.

#### C.2 Ésteres de sorbitán

Ésteres de sorbitán adecuados son monoisoestearato de sorbitán, sesquiisoestearato de sorbitán, diisoestearato de sorbitán, triisoestearato de sorbitán, monooleato de sorbitán, sesquioleato de sorbitán, dioleato de sorbitán, trierucato de sorbitán, monorricinoleato de sorbitán, sesquiricinoleato de sorbitán, dirricinoleato de sorbitán, trierucato de sorbitán, monohidroxiestearato de sorbitán, sesquiricinoleato de sorbitán, dirricinoleato de sorbitán, monohidroxiestearato de sorbitán, sesquihidroxiestearato de sorbitán, trihidroxiestearato de sorbitán, monocitrato de sorbitán, sesquitartrato de sorbitán, ditartrato de sorbitán, tritartrato de sorbitán, monocitrato de sorbitán, sesquicitrato de sorbitán, dicitrato de sorbitán, tricitrato de sorbitán, monomaleato de sorbitán, sesquimaleato de sorbitán, dimaleato de sorbitán, trimaleato de sorbitán y mezclas técnicas de los mismos. También son adecuados productos de adición de 1 a 30 y preferentemente de 5 a 10 moles de óxido de etileno sobre los ésteres de sorbitán mencionados.

#### C.3 Ésteres de poliglicerol

10

30

35

40

Ejemplos típicos de ésteres de poliglicerol adecuados son poligliceril-2 dipolihidroxiestearato (Dehymuls® PGPH), poliglicerín-3-diisoestearato (Lameform® TGI), poligliceril-4 isoestearato (Isolan® GI 34), poligliceril-3 oleato, diisoestearoil poligliceril-3 diisostearato (Isolan® PDI), poligliceril-3 metilglucosa distearato (Tego Care® 450), cera de abeja poligliceril-3 (Cera Bellina®), poligliceril-4 caprato (Poliglicerol caprato T2010/90), poligliceril-3 cetil éter (Chimexane® NL), poligliceril-3 diestearato (Cremophor® GS 32) y poligliceril polirricinoleato (Admul® WOL 1403), isostearato de poligliceril dimerato y sus mezclas. Ejemplos de otros ésteres de poliol adecuados son los mono, di y triésteres de trimetilolpropano o pentaeritritol con ácido láurico, ácido graso de coco, ácido graso de sebo, ácido palmítico, ácido esteárico, ácido oleico, ácido behénico y similares, que opcionalmente se hace reaccionar con 1 a 30 moles óxido de etileno.

#### C.4 Emulsionantes aniónicos

25 Emulsionantes aniónicos típicos son ácidos grasos C<sub>12-22</sub> alifáticos, tales como ácido palmítico, ácido esteárico o ácido behénico por ejemplo, y ácidos dicarboxílicos C<sub>12-22</sub>, tales como ácido azelaico o ácido sebácico por ejemplo.

## C.5 Emulsionantes anfóteros o zwitteriónicos

Otros emulsionantes adecuados son tensioactivos anfóteros o zwitteriónicos. Tensioactivos zwitteriónica son compuestos tensioactivos que contienen al menos un grupo amonio cuaternario y al menos un carboxilato y un grupo sulfonato en la molécula. Los tensioactivos zwitteriónicos particularmente adecuados son los denominadas betaínas, tales como los N-alquil-N, N-dimetil amonio glicinatos, por ejemplo glicinato de cocoalquil dimetil amonio, N-acilaminopropil-N, N-dimetilamonio glicinatos, por ejemplo cocoacilaminopropil dimetil amonio glicinato, y 2-alquil-3-carboximetil-3-hidroxietil imidazolinas que contienen de 8 a 18 átomos de carbono en el grupo alquilo o acilo y cocoacilaminoetil hidroxietil carboximetil glicinato. El derivado de amida de ácido graso conocido bajo el nombre CTFA de cocamidopropil betaína es particularmente preferente. Los tensioactivos anfolíticos también son emisionantes adecuados. Tensioactivos anfolíticos son compuestos tensioactivos que, además de un grupo alguilo o acilo C<sub>8/18</sub>, contiene al menos un grupo amino libre y al menos un grupo -COOH- o -SO<sub>3</sub>H- en la molécula y que son capaces de formar sales internas. Ejemplos de tensioactivos anfolíticos adecuados son N-alquilglicinas, ácidos Nalquil propiónicos, ácidos N-alquilamino butíricos, ácidos N-alquilimino dipropiónicos, N-hidroxietil-Nalguilamidopropil glicinas, N-alguil taurinas, N-alguil sarcosinas, ácidos 2-alquilaminopropiónicos y ácidos alquilaminoacéticos que contienen aproximadamente de 8 a 18 átomos de carbono en el grupo alquilo. Tensioactivos anfolíticos particularmente preferentes son N-cocoalquilaminopropionato, cocoacilaminoetil aminopropionato y acil sarcosina C<sub>12/18</sub>.

#### Principios activos

45 Las composiciones según la presente invención pueden contener ingredientes adicionales (componente d) englobados en el término "principios activos". Ejemplos de ingredientes adecuados son abrasivos, agentes antiacné, agentes contra el envejecimiento de la piel, agentes anticelulíticos, agentes anticaspa, agentes antiinflamatorios, agentes de prevención de irritación, agentes de inhibición de irritación, antioxidantes, astringentes, agentes de inhibición del sudor, agentes antisépticos, antiestáticos, aglutinantes, tampones, materiales de vehículo, 50 agentes quelantes, estimulantes de células, agentes de limpieza, agentes de cuidado, agentes depilatorios, sustancias tensioactivas, agentes desodorantes, antitranspirantes, suavizantes, enzimas, aceites esenciales, fibras, agentes formadores de película, fijadores, agentes formadores de espuma, estabilizadores de espuma, sustancias para prevenir la formación de espuma, reforzadores de espuma, agentes gelificantes, agentes formadores de geles, agentes para el cuidado del cabello, agentes para fijar el cabello, agentes para alisar el cabello, agentes humectantes, sustancias hidratantes, sustancias que retienen la humedad, agentes blanqueadores, agentes de 55 refuerzo, agentes antimanchas, agentes ópticamente abrillantadores, agentes impregnantes, agentes repelentes de suciedad, agentes reductores de fricción, lubricantes, cremas hidratantes, ungüentos, agentes opacificantes, agentes plastificantes, agentes de recubrimiento, esmaltes, agentes de brillo, polímeros, polvos, proteínas, agentes de reengrase, agentes de abrasión, siliconas, agentes suavizantes de la piel, agentes limpiadores de la piel, agentes para el cuidado de la piel, agentes protectores de la piel, agentes aclaradores de la piel, agentes protectores de la piel, agentes suavizantes de la piel, agentes de cuidado del cabello, agentes refrescantes, agentes refrescantes de la piel, agentes de calentamiento, agentes de calentamiento la piel, estabilizadores, agentes absorbentes de UV, filtros UV detergentes, agentes acondicionadores de tejidos, agentes de disolución, agentes de bronceado de la piel, espesantes, vitaminas, aceites, ceras, grasas, fosfolípidos, ácidos grasos saturados, ácidos grasos mono o poliinsaturados, α-hidroxi ácidos, ácidos polihidroxi ácidos, licuadores, colorantes, agentes protectores del color, pigmentos, anticorrosivos, aromas, sustancias aromatizantes, sustancias odoríferas, polioles, tensioactivos, electrolitos, disolventes orgánicos o derivados de silicona y similares como auxiliares y aditivos adicionales.

#### D.1 Agentes espesantes v aditivos reológicos

Espesantes adecuados son espesantes poliméricos, como los tipos Aerosil® (sílices hidrófilas), polisacáridos, más especialmente goma xantana, guar-guar, agar-agar, alginatos y tilosas, carboxymetil celulosa y hidroxietil celulosa, también ácidos grasos de monoésteres y diésteres de polietilen glicol de alto peso molecular, poliacrilatos (por ejemplo Carbopols® [Goodrich] o Synthalene® [Sigma]), poliacrilamidas, alcohol polivinílico y polivinil pirrolidona, tensioactivos tales como, por ejemplo, glicéridos etoxilados de ácidos grasos, ésteres de ácidos grasos con polioles, por ejemplo pentaeritritol o trimetilol propano, alcoholes grasos etoxilados y electrolitos con una limitada distribución de homólogos, tales como cloruro de sodio y cloruro de amonio.

#### D.2 Polímeros

5

10

15

- 20 Polímeros catiónicos adecuados son, por ejemplo, derivados de celulosa catiónicos tales como, por ejemplo, la hidroxietil celulosa cuaternizada que puede obtenerse de Amerchol bajo el nombre de Polymer JR 400®, almidón catiónico, copolímeros de sales de dialilamonio y acrilamidas, polímeros cuaternizados de vinil pirrolidona/vinil imidazol tales como, por ejemplo, Luviquat® (BASF), productos de condensación de poliglicoles y aminas, polipéptidos de colágeno cuaternizados tal como, por ejemplo, colágeno hidrolizado de hidroxipropil laurildimonio (Lamequat® L, Grunau), polipéptidos de trigo cuaternizados, polietilenimina, polímeros de silicona catiónicos tales 25 como, por ejemplo, amodimeticona, copolímeros de ácido adípico y dimetilaminohidroxipropil dietilentriamina (Cartaretine®, Sandoz), copolímeros de ácido acrílico con dimetil dialil cloruro de amonio (Merquat® Chemviron), poliaminopoliamidas y sus polímeros solubles en agua reticulados, derivados catiónicos de quitina tal como, por ejemplo, quitosano cuaternizado, opcionalmente en distribución microcristalina, productos de 30 condensación de dihaloalquilos, por ejemplo dibromobutano, con bisdialquilaminas, por ejemplo bis-dimetilamino-1,3-propano, goma guar catiónica tal como, por ejemplo, Jaguar® CBS, Jaguar® C-17, Jaguar® C-16 de Celanese, polímeros de sal de amonio cuaternizados tales como, por ejemplo, Mirapol® A-15, Mirapol® AD-1, Mirapol® AZ-1 de Miranol y varios tipos policuaternios (por ejemplo 6, 7, 32 o 37) que se pueden encontrar en el mercado con los nombres comerciales Rheocare® CC o Ultragel® 300.
- Polímeros aniónicos, zwitteriónicos, anfóteros y no iónicos adecuados son, por ejemplo, copolímeros de vinil acetato/ácido crotónico, copolímeros de vinil pirrolidona /vinil acrilato, copolímeros de vinil acetato/butil maleato/isobornil acrilato, copolímeros de metil vinil éter/anhídrido maleico y sus ésteres, no reticulados y ácidos poliacrílicos reticulados con polioles, copolímeros de cloruro acrilamidopropil trimetilamonio/acrilato, copolímeros de octilacrilamida/metil metacrilato/terc-butilaminoetil metacrilato/2-hidroxipropil metacrilato, polivinil pirrolidona, copolímeros de vinil pirrolidona/vinil acetato, terpolímeros de vinil pirrolidona/dimetilaminoetil metacrilato/vinil caprolactama y opcionalmente derivados de éteres de celulosa y siliconas.

### D.3 Siliconas

45

55

Compuestos de silicona adecuados son, por ejemplo, dimetil polisiloxanos, metilfenil polisiloxanos, siliconas cíclicas y compuestos de silicona modificados con amino, ácido graso, alcohol, poliéter, epoxi, flúor, glicósido y/o alquil que pueden ser tanto líquidos como de tipo resina a temperatura ambiente. Otros compuestos de silicona adecuados son simeticonas que son mezclas de dimeticonas con una longitud de cadena media de 200 a 300 unidades de dimetilsiloxano y silicatos hidrogenados Se puede encontrar una descripción detallada de las siliconas volátiles adecuadas en Todd et al. in Cosm. Toil. 91, 27 (1976).

#### D.4 Factores de protección solar primarios

- Factores de protección solar primarios en el contexto de la invención son, por ejemplo, sustancias orgánicas (filtros de luz) que son líquidas o cristalinas a temperatura ambiente y que son capaces de absorber radiación ultravioleta y de liberar la energía absorbida en forma de radiación de onda más larga, por ejemplo calor.
  - Las formulaciones según la invención ventajosamente contienen al menos un filtro UV-A y/o al menos un filtro UV-B y/o un filtro de banda ancha y/o al menos un pigmento inorgánico. Las formulaciones según la invención preferentemente contienen al menos un filtro UV-B o un filtro de banda ancha, más particularmente preferentemente al menos un filtro UV-A y al menos un filtro UV-B.

Composiciones cosméticas preferentes, preferentemente formulaciones tópicas según la presente invención comprenden una, dos, tres o más factores de protección solar seleccionados del grupo que consiste en ácido 4-aminobenzoico y derivados, derivados de ácido salicílico, derivados de benzofenona, derivados de dibenzoilmetano, acrilatos de difenilo, ácido 3-imidazol-4-il acrílico y sus ésteres, derivados de benzofurano, derivados de benciliden malonato, absorbentes de UV poliméricos que contienen uno o más radicales de organosilicio, derivados de ácido cinámico, derivados de alcanfor, derivados de trianilino-s-triazina, derivados de 2-hidroxifenil benzotriazol, derivados de nylbenzimidazole de ácido sulfónico y sus sales, ésteres de mentilo de ácido antranílico, derivados de benzotriazol y derivados de indol.

Además, es ventajoso combinar compuestos de fórmula (I) con ingredientes activos que penetran en la piel y protegen las células de la piel desde el interior contra el daño inducido por la luz solar y reducen el nivel de metaloproteasas de la matriz cutánea. Ingredientes preferentes respectivos, los llamados antagonistas de los receptores de arilhidrocarburo, se describen en el documento WO 2007/128723, que se incorpora en la presente memoria por referencia. Es preferente 2-bencilideno-5,6-dimetoxi-3,3-dimetilindan-1-ona.

Los filtros UV citados a continuación que se pueden usar dentro del contexto de la presente invención son preferentes pero naturalmente no son limitantes.

Los filtros UV que se usan preferentemente se seleccionan del grupo que consiste en

ácido p-aminobenzoico

5

- etil éster (25 mol) de ácido p-aminobenzoico etoxilado (nombre INCI: PEG-25 PABA)
- 2-etilhexil éster de ácido p-dimetilaminobenzoico
- etil éster (2 mol) de ácido p-aminobenzoico de N-propoxilado
  - éster de glicerol de ácido p-aminobenzoico
  - éster homomentilo (homosalatos) de ácido salicílico (Neo Heliopan® HMS)
  - 2-etilhexilo éster de ácido salicílico (Neo Heliopan® OS)
  - salicilato de trietanolamina
- 4-isopropil bencil salicilato
  - éster de mentilo de ácido antranílico (Neo Heliopan® MA)
  - éster etílico del ácido cinámico de diisopropilo
  - 2-etilhexil éster de ácido p-metoxicinámico (Neo Heliopan® AV)
  - éster metílico de ácido diisopropil cinámico
- isoamil éster de ácido p-metoxicinamato (Neo Heliopan® E 1000)
  - sal de dietanolamina de ácido p-metoxicinámico
  - éster isopropílico de ácido p-metoxicinámico
  - ácido 2-fenilbencimidazol sulfónico y sales (Neo Heliopan® Hydro)
  - sulfato de metilo de 3-(4'-trimetilamonio) bencilideno bornan-2-ona
- ácido beta-imidazol-4(5)-acrílico (ácido urocánico)
  - 3-(4'-sulfo) benciliden bornan-2-ona y sales
  - 3-(4'-metil bencilideno)-D,L-alcanfor (Neo Heliopan® MBC)
  - 3-bencilideno-D,L-alcanfor
  - polímero N-[(2 y 4)-[2-(oxoborn-3-iliden)metil]bencil] acrilamida
- 4,4'-[(6-[4-(1,1-dimetil) aminocarbonil)fenilamino]-1,3,5-triazina-2,4-diil)diimino]bis-(éster de ácido-2-etilhexilo benzoico) (Uvasorb® HEB)
  - bencilideno polisiloxano malonato (Parsol® SLX)
  - etilhexanoato de glicerilo dimetoxicinamato
  - dipropilen glicol salicilato
- tris (2-etilhexil)-4,4',4"-(1,3,5-triazina-2,4,6-triiltriimino)tribenzoato (=2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina) (Uvinul® T150)

Filtros de banda ancha que se combinan preferentemente con uno o más compuestos de fórmula (I) en una preparación según la presente invención se seleccionan del grupo que consiste en

- acrilato de 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenilo (Neo Heliopan® 303)
- etil-2-ciano-3,3'difenil acrilato
  - 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona (Neo Heliopan® BB)
  - ácido 2-hidroxi-4-metoxi benzofenona-5-sulfónico
  - dihidroxi-4-metoxibenzofenona
  - 2,4-dihidroxibenzofenona
- tetra hidroxi benzofenona
  - 2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetoxi benzofenona
  - 2-hidroxi-4-n-octoxi benzofenona
  - 2-hidroxi-4-metoxi-4'-metil benzofenona

- sulfonato de sodio hidroxi metoxi benzofenona
- disodio-2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetoxi-5,5-disulfobenzofenona
- fenol, 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-(2-metil-3(1,3,3,3-tetrametil-1-(trimetilsilil) oxi) disiloxianil) propil) (Mexoryl® XL)
- 2,2'-metilen bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-1,1,3,3-tetrametilbutil)fenol) (Tinosorb® M)
  - 2,4-bis-[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxifenil]-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis-[{(4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (Tinosorb® S)
  - 2,4-bis-[{(4-(3-sulfonato)-2-hidroxipropiloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina sal de sodio
  - 2,4-bis-[{(3-(2-propiloxi)-2-hidroxipropiloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina
- 2,4-bis-[{4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-[4-(2-metoxietil carbonilo)fenilamino]-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis-[{4-(3-(2-propiloxi)-2-hidroxipropiloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-[4-(2-etilcarboxil)fenilamino]-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis-[{4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-(1-metilpirrol-2-il)-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis-[{4-tris-(trimetilsiloxisililpropiloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis-[{4-(2"-metilpropeniloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina
- 2,4-bis-[{4-(1',1',1',3',5',5',5'-heptametilsiloxi-2"-metilpropiloxi)-2-hidroxi}fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina

Filtros de filtros UV-A que se combinan preferentemente con uno o más compuestos de fórmula (I) en una preparación según la presente invención se seleccionan del grupo que consiste en

- 4-isopropil dibenzoil metano
- ácido dibornane tereftalideno sulfónico y sales (Mexoryl® SX)
- 4-t-butil-4'-metoxidibenzoil metano (avobenzone) / (Neo Heliopan® 357)
  - sal disódica de ácido fenileno bis-bencimidazil tetrasulfónico (Neo Heliopan® AP)
  - 2,2'-(1,4-fenileno)-bis-(ácido 1H-bencimidazol-4,6-disulfónico), sal monosódica
  - hexil éster de ácido 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil)benzoico (Uvinul® A Plus)
  - compuestos de indanilideno según el documento DE 100 55 940 A1 (= WO 2002 038537 A1)
- Filtros UV que se combinan más preferentemente con uno o más compuestos de fórmula (I) en una preparación según la presente invención se seleccionan del grupo que consiste en
  - ácido p-aminobenzoico
  - sulfato de metilo de 3-(4'-trimetilamonio) bencilideno bornan-2-ona
  - éster homomentilo de ácido salicílico (Neo Heliopan® HMS)
- 30 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona (Neo Heliopan® BB)
  - ácido 2-fenilbencimidazol sulfónico (Neo Heliopan® Hydro)
  - ácido dibornane tereftalideno sulfónico y sales (Mexoryl SX)
  - 4-tert-butil-4'-metoxidibenzoil metano (Neo Heliopan® 357)3-(4'-sulfo) benciliden bornan-2-ona y sales
  - 2-etilhexil-2-ciano-3,3-difenil acrilato (Neo Heliopan® 303)
- N-[(2 y 4)-[2-(oxoborn-3-iliden)metil]bencil]polímero de acrilamida
  - ácido p-metoxicinámico-2-etilhexil éster (Neo Heliopan® AV)
  - ácido p-aminobenzoico éster etíl (25 mol) etoxilado (nombre INCI: PEG-25 PABA)
  - ácido p-metoxicinámico de isoamil éster (Neo Heliopan® E1000)
  - 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etilhexil-1'-oxi)-1,3,5-triazina (Uvinul® T150)
- fenol, 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-(2-metil-3(1,3,3,3-tetrametil-1-(trimetilsilil)oxi)disiloxianil)propil) (Mexoryl® XI )
  - 4,4'-[(6-[4-(1,1-dimetil)aminocarbonil)fenilamino]-1,3,5-triazina-2,4-diil)diimino]bis-(éster de ácido-2-etilhexilo benzoico) (Uvasorb HEB)
  - 3-(4'-metil bencilideno)-D,L-alcanfor (Neo Heliopan® MBC)
- 45 3-benciliden alcanfor
  - ácido 2-etilhexilo éster salicílico (Neo Heliopan® OS)
  - ácido 2-etilhexilo éster 4-dimetilaminobenzoico (Padimate O)
  - ácido hidroxi-4-metoxibenzofenona-5-sulfónico y sal de Na
  - 2,2'-metilen bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-1,1,3,3-tetrametilbutil)fenol) (Tinosorb® M)
- sal disódica del ácido fenileno bis-bencimidazil tetrasulfónico (Neo Heliopan® AP)
  - 2,4-bis-[{(4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxilfenil]-6-(4-metoxiienil)-1,3,5-triazina (Tinosorb® S)
  - bencilideno polisiloxano malonato (Parsol® SLX)
  - mentilo antranilato (Neo Heliopan® MA)
  - 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil) éster de hexilo de ácido benzoico (Uvinul® A Plus)
- compuestos de indanilideno según el documento DE 100 55 940 (= WO 02/38537)

Ventajosamente factores de protección solar primarios y también secundarios se mencionan en el documento WO 2005 123101 A1. Ventajosamente, estas preparaciones contienen al menos un filtro UVA y/o al menos un filtro UVB y/o al menos un pigmento inorgánico. Las preparaciones se pueden presentar en la presente memoria en diversas

formas tales como las que se usan convencionalmente para preparaciones de protección solar. Por lo tanto, pueden estar en forma de una disolución, una emulsión del tipo agua-en-aceite (W/O) o de la aceite-en-agua tipo (O/W) o una emulsión múltiple, por ejemplo del tipo agua-en-aceite-en-agua (W/O/W), un gel, una hidrodispersión, una barra sólida o también un aerosol.

- En una realización preferente más una formulación según la invención contiene una cantidad total de agentes de filtro solar, es decir, en particular filtros UV y/o pigmentos inorgánicos (pigmentos que filtran UV) de modo que la formulación según la invención tiene un factor de protección a la luz de mayor que o igual a 2 (preferentemente mayor que o igual a 5). Tales formulaciones según la invención son particularmente adecuadas para proteger la piel y el cabello.
- 10 D.5 factores de protección solar secundarios

15

20

25

30

35

40

50

55

Además de los grupos de factores de protección solar primarios mencionados anteriormente, también se pueden usar factores de protección solar secundarios de tipo antioxidante. Los factores de protección solar secundarios de tipo antioxidante interrumpen la cadena de reacción fotoquímica que se inicia cuando los rayos UV penetran en la piel. Ejemplos típicos son aminoácidos (por ejemplo glicina, histidina, tirosina, triptófano) y sus derivados, imidazoles (por ejemplo ácido urocánico) y sus derivados, péptidos, tales como D, L-carnosina, D-carnosina, L carnosina y sus derivados (por ejemplo anserina), carotenoides, carotenos (por ejemplo alfa-caroteno, beta-caroteno, licopeno) y sus derivados, ácido clorogénico y sus derivados, ácido lipónico y sus derivados (por ejemplo ácido dihidrolipónico), aurotioglucosa, propiltiouracil y otros tioles (por ejemplo tiorredoxina, glutatión, cisteína, cistamina y glicosil, N-acetilo, metilo, etilo, propilo, amilo, butilo y laurilo, palmitoilo, oleilo, alfa-linoleilo, colesterilo y sus ésteres glicerilo) y sus sales, dilauriltiodipropionato, diestearil tiodipropionato, ácido tiodipropiónico y sus derivados (ésteres, éteres, péptidos, lípidos, nucleótidos, nucleósidos y sales) y compuestos de sulfoximina (por ejemplo sulfoximinas butionina, homocisteína sulfoximina, butionina sulfonas, penta-, hexa- y hepta- tionina sulfoximina) en muy pequeñas dosis compatibles, también (metal) quelantes (por ejemplo, ácidos alfa-hidroxigraso, ácido palmítico, ácido fítico, lactoferrina), alfa hidroxiácidos (por ejemplo ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico), ácido húmico, ácido biliar, extractos de bilis, bilirrubina, biliverdina, EDTA, EGTA y sus derivados, ácidos grasos insaturados y derivados de los mismos (por ejemplo ácido linoleico, ácido oleico), ácido fólico y sus derivados, ubiquinona y ubiquinol y sus derivados, vitamina C y sus derivados (por ejemplo palmitato de ascorbilo, Mg fosfato de ascorbilo, acetato de ascorbilo), tocoferoles y sus derivados (por ejemplo acetato de vitamina E), vitamina A y derivados (palmitato de vitamina A) y benzoato de coniferilo de resina de benjuí, ácido rutínico y sus derivados, rutín glicosilo, ácido ferúlico, furfurilideno glucitol, carnosina, hidroxitolueno butilo, hidroxianisol butilo, ácido nordihidroquaiaco resina, ácido nordihidroguaiarético, trihidroxibutirofenona, ácido úrico y sus derivados, manosa y derivados de los mismos, superóxido dismutasa, titanio dióxido (por ejemplo, dispersiones en etanol), cinc y sus derivados (por ejemplo ZnO, ZnSO<sub>4</sub>), selenio y sus derivados (por ejemplo metionina selenio), estilbenos y sus derivados (por ejemplo óxido de estilbeno, óxido de trans-estilbeno) y derivados de estas sustancias activas adecuados para los fines de la invención (sales, ésteres, éteres, azúcares, nucleótidos, nucleósidos, péptidos y lípidos).

Ventajosamente pigmentos de protección de luz secundarios inorgánicos son óxidos de metales y sales metálica finamente dispersos que también se mencionan en el documento WO 2005 123 101 A1. La cantidad total de pigmentos inorgánicos, en particular micropigmentos inorgánicos hidrófobos en la preparación cosmética terminada según la presente invención es ventajosamente de 0,1 a 30% en peso, preferentemente de 0,5 a 10,0% en peso, en cada caso en base al peso total de la preparación.

También son preferentes filtros UV de partículas o pigmentos inorgánicos, que opcionalmente puede ser hidrófobos, se puede utilizar, tales como los óxidos de titanio  $(TiO_2)$ , cinc (ZnO), hierro  $(Fe_2O_3)$ , circonio  $(ZrO_2)$ , silicio  $(SiO_2)$ , manganeso (por ejemplo MnO), aluminio  $(Al_2O_3)$ , cerio (por ejemplo,  $Ce_2O_3$ ) y/o sus mezclas.

D.6. Activos que modulan la pigmentación de la piel y/o cabello

45 Ingredientes activos preferentes para aclarar piel y/o cabello se seleccionan del grupo que consiste en:

ácido kójico (5-hidroxi-2-hidroximetil-4-piranona), derivados del ácido kójico, preferentemente dipalmitato de ácido kójico, arbutina, ácido ascórbico, derivados de ácido ascórbico, preferentemente fosfato de magnesio ascorbilo, hidroquinona, derivados de hidroquinona, resorcinol, derivados de resorcinol, preferentemente 4-alquilresorcinoles y 4-(1-feniletil) 1,3-dihidroxibenceno (resorcinol feniletilo), cyclohexylcarbamatos (preferentemente uno o más carbamatos ciclohexilo descritos en WO 2010/122178 y WO 2010/097480), moléculas que contienen azufre, preferentemente de glutatión o cisteína, ácidos alfa-hidroxi (preferentemente ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico), sus sales y ésteres, tirosina N-acetilo y derivados, fenilalanina undecenoil, ácido glucónico, derivados de cromona, preferentemente aloesina, flavonoides, ácido fosfínico 1-aminoetilo, derivados de tiourea, ácido elágico, nicotinamida (niacinamida), sales de cinc, preferentemente cloruro de cinc o gluconato de cinc, tujaplicina y derivados, triterpenos, preferentemente ácido maslínico, esteroles, preferentemente ergosterol, benzofuranonas, preferentemente senkyunolide, guayacol vinilo, guayacol etilo, ácidos diónicos, preferentemente ácido diónico octodeceno y/o ácido azelaico, inhibidores de la síntesis de óxido de nitrógeno, preferentemente L-nitroarginina y sus derivados, 2,7-dinitroindazole o tiocitrulina, quelantes de metales (preferentemente ácidos alfa-hidroxi grasos, ácido fítico, ácido húmico, ácido biliar, extractos biliares, EDTA, EGTA y sus derivados), retinoides, leche de soja y

extracto, inhibidores de serina proteasa o ácido lipoico u otros ingredientes activos sintéticos o naturales para aclarar la piel y el cabello, este último se usa preferentemente en la forma de un extracto de plantas, preferentemente extracto de gayuba, extracto de arroz, extracto de papaya, extracto de cúrcuma, extracto de mora, extracto de bengkoang, extracto de nutgrass, extracto de raíz de regaliz o sus constituyentes concentrados o aislado de la misma, preferentemente glabridina o licochalcona A, extracto de artocarpus, extracto de especies de rumex y ramulus, extractos de especies de pino (Pinus), los extractos de especie de vitis o derivados de estilbeno aislados o concentrados de los mismos, extracto de saxifraga, extracto de scutelleria, extracto de uva y/o extracto de microalgas, en particular extracto de Tetraselmis suecica.

- Aclarantes preferentes de la piel como componente (b) son el ácido kójico y resorcinol feniletil como inhibidores de tirosinasa, beta- y alfa-arbutina, hidroquinona, nicotinamida, ácido dioico, Mg ascorbil fosfato y vitamina C y sus derivados, extracto de mora, extracto de Bengkoang, extracto de papaya, extracto de cúrcuma, extracto de nutgrass, extracto de regaliz (que contiene glicirricina), alfa-hidroxi-ácidos, 4-alquilresorcinoles, 4-hidroxianisol. Estos aclarantes de la piel son preferentes debido a su actividad muy buena, en particular en combinación con esclareólido según la presente invención. Además, aclarantes preferentes de la piel están fácilmente disponibles.
- 15 Ingredientes activos ventajosos de bronceado de la piel y pelo a este respecto son sustratos o sustratos análogos de tirosinasa, tales como L-tirosina, N-acetil tirosina, L-DOPA o L-dihidroxifenilalanina, alcaloides de xantina tales como cafeína, teobromina y teofillina y sus derivados, proopiomelanocortina péptidos tales como ACTH, alfa-MSH, sus péptidos análogos y otras sustancias que se unen al receptor de la melanocortina, péptidos tales como Val-Gly-Val-Ala-Pro-Gly, Lys-Ile- Gly-Arg-Lys o Leu-Ile-Gly-Lys, purinas, pirimidinas, ácido fólico, sales de cobre tales como gluconato de cobre, cloruro o pirrolidonato, 1,3,4-oxadiazol-2-tioles tales como 5-pirazin-2-il-1,3,4-oxadiazol-2-tiol, 20 curcumina, diglicinato de cinc (Zn (Gly) 2), manganeso (II) complejos de bicarbonato ("pseudocatalasas") según se describe por ejemplo en el documento EP 0584 178, derivados de ciclohexano tetrasustituidos según se describe por ejemplo en el documento WO 2005/032501, isoprenoides, según se describe en el documento WO 2005/102252 y en el documento WO 2006/010661, derivados de melanina tales como Melasyn-100 y MelanZe, diacilgliceroles, 25 dioles alifáticos o cíclicos, psoralenos, prostaglandinas y sus análogos, activadores de la adenilato ciclasa y compuestos que activan la transferencia de melanosomas a queratinocitos tales como serina proteasas o agonistas del receptor PAR-2, extractos de plantas y partes de plantas de las especies de crisantemo, especies san-quisorba. extractos de nuez, extractos de achiote, extractos de ruibarbo, extractos de microalgas, en particular de Isochrysis galbana, trehalosa, eritrulosa y dihidroxiacetona. También se pueden usar flavonoides que dan tinte o pardeamiento 30 a la piel y cabello o (por ejemplo, quercetina, ramnetina, kaempferol, fisetina, genisteína, daidzeína, crisina y apigenina, epicatequina, diosmina y diosmetina, morin, quercitrina, naringenina, hesperidina, floridzina y floretina).

La cantidad de los ejemplos mencionados anteriormente de los ingredientes activos adicionales para la modulación de pigmentación piel y cabello (uno o más compuestos) en los productos según la invención es preferentemente de 0,0001 a 30% en peso, preferentemente de 0,0001 a 20% en peso, particularmente preferente de 0,001 a 5% en peso en base al peso total de la preparación.

### D.7 Activos anti-envejecimiento

5

35

En el contexto de la invención, anti-envejecimiento o agentes biogénicos son, por ejemplo antioxidantes, inhibidores de matriz metaloproteinasa (MMPI), agentes hidratantes de la piel, estimuladores de glicosaminoglicanos, agentes anti-inflamatorios, antagonistas de TRPV1 y extractos de plantas.

40 (i) Antioxidantes. Aminoácidos ácidos (preferentemente glicina, histidina, tirosina, triptófano) y sus derivados, imidazoles (preferentemente ácido urocánico) y sus derivados, péptidos, preferentemente D, L-carnosina, Dcarnosina, L-carnosina y sus derivados (preferentemente anserina), carnitina, creatina, péptidos matrikinas (preferentemente lisil-treonil-lisil-serina) y palmitoil pentapéptidos, carotenoides, carotenos (preferentemente alfa-caroteno, beta-caroteno, licopeno) y sus derivados, ácido lipoico y sus derivados (preferentemente ácido dihidrolipoico), aurotioglucosa, tiouracilo de propilo y otros tioles (preferentemente tiorredoxina, glutatión, cisteína, 45 cistina, cistamina y glicosilo, N-acetilo, metilo, etilo, propilo, amilo, butilo y laurilo, palmitoílo, oleílo, gamma-linoleilo, colesterilo, glicerilo y sus oligogliceril ésteres) y sus sales, tiodipropionato de dilaurilo, diestearilo tiodipropionato, ácido tiodipropiónico y sus derivados (preferentemente ésteres, éteres, péptidos, lípidos, nucleótidos, nucleósidos y sales) y compuestos sulfoximina (preferentemente butionina sulfoximinas, sulfoximina de homocisteína, butionina 50 sulfonas, penta-, hexa-, heptathionine sulfoximina) en dosis toleradas muy pequeñas (por ejemplo pmol a µmol/kg), también quelantes (de metal) (preferentemente alfa-hidroxi ácidos grasos, ácido palmítico, ácido fítico, lactoferrina, alfa-hidroxi ácidos (preferentemente ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico), ácido húmico, ácido de bilis, extractos biliares, taninos, bilirrubina, biliverdina, EDTA, EGTA y sus derivados), ácidos grasos insaturados y sus derivados (preferentemente ácido gamma-linolénico, ácido linoleico, ácido oleico), ácido fólico y sus derivados, ubiquinona y sus derivados, ubiquinol y sus derivados, vitamina C y derivados (preferentemente palmitato de ascorbilo, Mg fosfato 55 de ascorbilo, acetato de ascorbilo, ascorbil glucósido), tocoferoles y derivados (preferentemente acetato de vitamina E), vitamina A y derivados (palmitato de vitamina A) y coniferil benzoato de resina benzoico, ácido rutínico y sus derivados, flavonoides y sus precursores glicosilados, en particular quercetina y sus derivados, preferentemente alfaglucosín rutina, ácido rosmarínico, carnosol, ácido carnosolico, resveratrol, ácido cafeico y sus derivados, ácido sinápico y sus derivados, ácido ferúlico y sus derivados, curcuminoides, ácido clorogénico y sus derivados, 60

retinoides, preferentemente retinilo palmitato, retinol o tretinoína, ácido ursólico, ácido levulínico, hidroxitolueno butilo, butil hidroxianisol, ácido nordihidroguayaco, ácido nordihidroguaiarético, trihidroxibutirofenona, ácido úrico y sus derivados, manosa y sus derivados, cinc y sus derivados(preferentemente ZnO, ZnSO<sub>4</sub>), selenio y sus derivados (preferentemente selenio metionina), superóxido dismutasa, estilbenos y sus derivados (preferentemente óxido de estilbeno, óxido de trans-estilbeno) y los derivados (sales, ésteres, éteres, azúcares, nucleótidos, nucleósidos, péptidos y lípidos) de estos ingredientes activos citados que son adecuados según la invención o extractos o fracciones de plantas que tienen un efecto antioxidante, preferentemente té verde, rooibos, arbusto de miel, uva, romero, salvia, melisa, tomillo, lavanda, oliva, avena, cacao, biloba, ginseng, regaliz, madreselva, sophora, pueraria, pinus, cítricos, Phyllanthus emblica o hierba de San Juan, semillas de uva, germen de trigo, Phyllanthus emblica, coenzimas, preferentemente coenzima Q10, plastoquinona y menaquinona. Los antioxidantes preferentes se seleccionan del grupo que consiste en vitamina A y derivados, vitamina C y derivados, tocoferol y derivados, preferentemente acetato de tocoferilo, y ubiquinona.

5

10

15

20

25

30

- (ii) Inhibidores de matriz de metaloproteinasa (MMPI). Las composiciones preferentes comprenden inhibidores de matriz de metaloproteinasa, especialmente los que inhiben matriz de metaloproteinasas que escinden enzimáticamente colágeno, seleccionado del grupo que consiste en: ácido ursólico, palmitato de retinol, galato de propilo, precocenos, 6-hidroxi-7-metoxi-2,2-dimetil-1(2H)-benzopirano, 3,4-dihidro-6-hidroxi-7-metoxi-2,2-dimetil-1-(2H)-benzopirano, benzamidina hidrocloruro, los inhibidores de la cisteína proteinasa N-etilmaleimida y ácido épsilon-amino-n-caproico de los inhibidores de serinproteasa: fenilmetilsufonil fluoruro, collhibin (empresa Pentapharm; INCI: proteína de arroz hidrolizada), oenoterol (empresa Soliance; INCI: propilenglicol, aqua, extracto de raíz Oenothera biennis, ácido elágico y elagitaninos, por ejemplo de la granada), fosforamidona hinokitiol, EDTA, galardin, EquiStat (Collaborative Group Company; extracto de fruta de manzana, extracto de semilla de soja, ácido ursólico, isoflavonas de soja y proteínas de soja), extractos de salvia, MDI (compañía Atrium; INCI: glicosaminoglicanos), Fermiskin (compañía Silab/Mawi; INCI: agua y extracto de Lentinus edodes), actimp 1.9.3 (empresa Expanscience/Rahn; INCI: hidrolizado de proteínas de altramuz), soyaglycone lipobelle (empresa Mibelle; INCI: alcohol, polisorbato 80, lecitina e isoflavonas de soja), extractos de té verde y negro y más extractos de plantas, que se enumeran en el documento WO 02 069 992 A1 (véase tablas 1-12, incorporadas en la presente memoria como referencia), proteínas o glicoproteínas de soja, proteínas hidrolizadas de arroz, guisante o altramuz, extractos de plantas que inhiben MMPs, preferentemente extractos de setas shiitake, extractos de las hojas de la familia Rosaceae, subfamilia Rosoideae, muy particularmente extractos de hoja de zarzamora (preferentemente como se describe en el documento WO 2005 123101 A1, incorporado en la presente memoria como referencia). como por ejemplo SymMatrix (empresa SymMatrix, INCI: Maltodextrin, Rubus Fruticosus (Blackberry) Leaf Extract). Activos preferentes de se seleccionan del grupo que consiste en palmitato de retinilo, ácido ursólico, extractos de las hojas de la familia Rosaceae, subfamilia rosoideae, genisteína y daidzeína.
- (iii) Agentes hidratantes de la piel. Agentes hidratantes para la piel preferentes se seleccionan del grupo que consiste en alcano dioles o alcano trioles que comprenden de 3 a 12 átomos de carbono, preferentemente alcano dioles C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> y alcano trioles C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>. Más preferentemente los agentes hidratantes de la piel se seleccionan del grupo que consiste en: glicerol, 1,2-propilen glicol, 1,2-butilen glicol, 1,3-butilen glicol, 1,2-pentanodiol, 1,2-hexanodiol, 1,2-octanodiol y 1,2-decanodiol.
- (iv) Estimuladores de glucisaminoglicano. Composiciones preferentes comprenden sustancias estimulantes de la 40 síntesis de glicosaminoglicanos seleccionados del grupo que consiste en ácido hialurónico y derivados o sales, Subliskin (Sederma, INCI: fermento filtrado de Sinorhizobium meliloti, cetil hidroxietilcelulosa, lecitina), Hyalufix (BASF, INCI: agua, butilen glicol, extracto de hoja de Alpinia galanga, goma xantana, triglicérido caprílico/cáprico), Stimulhyal (Soliance, INCI: cetogluconato calcio), Syn-glicanos (DSM, INCI: tetradecil aminobutiroil valil aminobutirico urea trifluoroacetato, glicerina, cloruro de magnesio), Kalpariane (Biotech Marine), DC Upregulex (ingredientes característicos de cosmética, INCI: agua, glicol butileno, fosfolípidos, hidrolizado de sericina), 45 glucosamina, N-acetil glucosamina, retinoides, preferentemente retinol y vitamina A, extracto de fruta de Arctium lappa, extracto de Eriobotrya japonica, Genkwanin, N-metil-L-serina, (-)-alfa-bisabolol o alfa-bisabolol sintético tal como por ejemplo dragosantol y dragosantol 100 de Symrise, glucano de avena, extracto de Echinacea purpurea e hidrolizado de proteínas de soja. Activos preferentes se seleccionan del grupo que consiste en ácido hialurónico y 50 derivados o sales, retinol y derivados, (-)-alfa-bisabolol o alfa-bisabolol sintético, tales como por ejemplo, Dragosantol y dragosantol 100 de Symrise, glucano de avena, extracto de Echinacea purpurea, fermento filtrado de Sinorhizobium Meliloti, cetogluconato calcio, extracto de hoja de Alpinia galanga y tetradecilo trifluoroacetato urea aminobutiroil valil aminobutirico.
- (v) Agentes antiinflamatorios. Las composiciones también pueden contener ingredientes antiinflamatorios y/o que mejoran enrojecimiento y/o picor, en particular sustancias esteroideas de tipo corticosteroide seleccionadas del grupo que consiste en hidrocortisona, dexametasona, fosfato de dexametasona, metil prednisolona o cortisona, se utilizan ventajosamente como ingredientes activos antiinflamatorios o ingredientes activos para aliviar el enrojecimiento y la picazón, la lista de los cuales se puede ampliar mediante la adición de otros antiinflamatorios esteroideos. También se pueden usar antiinflamatorios no esteroideos. Ejemplos que se pueden citar aquí son oxicams tales como piroxicam o tenoxicam; salicilatos tales como aspirina, disalcid, solprin o fendosal; derivados de ácido acético, tales como diclofenaco, fenclofenaco, indometacina, sulindaco, tolmetina o clindanac; fenamatos tales como mefenámico, meclofenámico, flufenámico o niflúmico; derivados del ácido propiónico tales como ibuprofeno,

naproxeno, benoxaprofeno o pirazoles tales como fenilbutazona, oxifenilbutazona, febrazona o azapropazona. Derivados del ácido antranílico, en particular avenantramidas descritas en el documento WO 2004 047833 A1, son ingredientes preferentes anti picazón en una composición según la presente invención.

- También son útiles mezclas antiinflamatorias que se dan natural o naturalmente de sustancias o mezclas de sustancias que alivian el enrojecimiento y/o picazón, en particulares extractos o fracciones de manzanilla, aloe vera, especies de Commiphora, especies de Rubia, sauce, sauce-hierba, avena, caléndula, árnica, hierba de San Juan, madreselva, romero, Passiflora incarnata, hamamelis, jengibre o Echinacea; preferentemente seleccionadas del grupo que consiste en extractos o fracciones de manzanilla, aloe vera, avena, caléndula, árnica, madreselva, romero, hamamelis, jengibre o Echinacea, y/o sustancias puras, preferentemente alfa-bisabolol, apigenina, apigenina-7-glucósido, gingeroles, shogaoles, gingerdioles, dehidrogingerdiones, paradoles, avenantramidas que se dan naturales o naturalmente, preferentemente tranilast, avenantramida A, avenantramida B, avenantramida C, avenantramidas que no se dan naturales o naturalmente, preferentemente diiydroavenantramida D, dihidroavenantramida E, avenantramida D, avenantramide E, avenantramida F, ácido boswélico, fitoesteroles, glicirricina, glabridina y licocalcona A; preferentemente seleccionadas del grupo que consiste en alfa-bisabolol, avenantramidas naturales, avenantramidas no naturales, preferentemente dihidroavenantramida D (según describe en el documento WO 2004 047 833 A1), ácido boswélico, fitoesteroles, glicirricina, y licocalcona A, y/o alantoína, pantenol, lanolina, (pseudo) ceramidas [preferentemente ceramida 2, hidroxipropil MEA bispalmitamida, cetiloxipropil glicerilo metoxipropilo miristamida, N-(1-hexadecanoil)-4-hidroxi-L-prolina(1-hexadecil) éster, hidroxietilo palmitilo oxihidroxipropil palmitamida], glicoesfingolípidos, fitoesteroles, quitosano, manosa, lactosa y  $\beta$ -glucanos, en particular de 1,3-1,4-β-glucano de avenas.
  - (vi) Antagonistas de TRPV1. Son preferentes compuestos adecuados que reducen la hipersensibilidad de los nervios de la piel en base a su acción como antagonistas de TRPV1, engloban por ejemplo, trans-4-terc-butil ciclohexanol según se describe en el documento WO 2009 087 242 A1, o moduladores indirectos de TRPV1 mediante una activación del μ-receptor, por ejemplo acetilo tetrapéptido-15.
- (vii) Agentes anticelulíticos. Agentes anticelulíticos y agentes lipolíticos se seleccionan preferentemente del grupo que consisten en los descritos en el documento WO 2007/077541, y agonistas de los receptores beta-adrenérgicos tales como sinefrina y sus derivados, y ciclohexilo carbamatos descritos en el documento WO 2010/097479. Agentes que mejoran o potencian la actividad de los agentes anticelulíticos, en particular agentes que estimulan y/o depolarizan fibras nerviosas C, se seleccionan preferentemente del grupo que consiste en capsaicina y sus derivados, vanillil nonilamida y sus derivados, L carnitina, coenzima A, isoflavonoides, extractos de soja, extracto de piña y ácido linoleico conjugado.
  - (viii) Agentes potenciadores de grasa. Formulaciones y productos según la presente invención también pueden comprender uno o más potenciadores de grasa y/o agentes adipogénicos así como agentes potenciadores o que realzan la actividad de agentes potenciadores de grasa. Un agente potenciador de grasa es por ejemplo hidroximetoxifenil propilmetilmetoxibenzofurano (nombre comercial: Sym3D®).

# D.8 Activadores o inhibidores de crecimiento del cabello

5

10

15

20

35

40

45

50

Formulaciones y productos según la presente invención también pueden comprender uno o más activadores de crecimiento del cabello, es decir agentes para estimular el crecimiento del cabello. Activadores de crecimiento del cabello se seleccionan preferentemente del grupo que consiste en derivados de pirimidina tales como 2,4diaminopirimidina-3-óxido (Aminexil), 2,4-diamino-6-piperidinopirimidina-3-óxido (Minoxidil) y sus derivados, 6-amino-1,2-dihidro-1-hidroxi-2-imino-4-piperidinopirimidina y sus derivados, alcaloides de xantina tales como la cafeína, teobromina y teofilina y sus derivados, quercetina y derivados, dihidroquercetina (taxifolina) y derivados, abridores del canal de potasio, agentes antiandrogénicos, inhibiciones de 5-reductasa sintética o natural, ésteres de ácido nicotínico tales como nicotinato de tocoferilo, nicotinato de bencilo y alquilo nicotinato C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, proteínas tales como por ejemplo el tripéptido Lis-Pro-Val, difencipreno, hormonas, finasterido, dutasterido, flutamida, bicalutamida, derivados de pregnano, progesterona y sus derivados, acetato de ciproterona, espironolactona y otros diuréticos, inhibidores de calcineurina tales como FK506 (Tacrolimus, Fujimycin) y sus derivados, ciclosporina A y sus derivados, cinc y sales de cinc, polifenoles, procianidinas, proantocianidinas, fitoesteroles tales como, por ejemplo beta-sitosterol, biotina, eugenol, (±)-beta-citronelol, pantenol, glucógeno por ejemplo de mejillones, extractos de microorganismos, algas, plantas y partes de plantas de por ejemplo el género diente de león (Leontodon o Taraxacum), Orthosiphon, Vitex, Coffea, Paullinia, Theobroma, Asiasarum, Cucurbita o Styphnolobium, Serenoa repens (palma enana americana), Sophora flavescens, Pygeum africanum, Panicum miliaceum, Cimicifuga racemosa, Glycine max, Eugenia caryophyllata, Cotinus coggygria, Hibiscus rosa sinensis, Camellia sinensis, Ilex paraguariensis, Isochrysis galbana, regaliz, uva, manzana, cebada o lúpulo o/y hidrolizados se arroz o de trigo.

Alternativamente, formulaciones y productos según la presente invención pueden comprender uno o más inhibidores de crecimiento del cabello (como se describió anteriormente), es decir agentes para reducir o prevenir el crecimiento del cabello. Inhibidores de crecimiento del cabello se seleccionan preferentemente del grupo que consiste de activina, derivados de activina o agonistas de activina, inhibidores de ornitina descarboxilasa tales como alfa difluoro metil ornitina o triterpenos pentacíclicos como por ejemplo ácido ursólico, betulina, ácido betulínico, ácido oleanólico y sus derivados, inhibidores de 5 alfa reductasa, antagonistas de receptores andrógenos, inhibidores de

descarboxilasa S-adenosilmetionina, inhibidores de gamma-glutamil transpeptidasa, inhibidores de transglutaminasa, inhibidores de proteasa de serina derivada de soja , extractos de microorganismos, algas, diferentes microalgas o plantas y partes de plantas de por ejemplo las familias Leguminosae, Solanaceae, Graminae, Asclepiadaceae o Cucurbitaceae, los géneros Chondrus, Gloiopeltis, Ceramium, Durvillea, Glycine max, Sanguisorba officinalis, Caléndula officinalis, Hamamelis virginiana, Arnica montana, Salix alba, Hypericum perforatum o Gymnema sylvestre.

## D.9 Agentes de enfriamiento

5

10

15

20

25

40

45

50

55

Las composiciones también pueden contener una o más sustancias con efecto de enfriamiento fisiológico (agentes de enfriamiento), que preferentemente se seleccionan de la siguiente lista: mentol y derivados de mentol (por ejemplo L-mentol, D-mentol, mentol racémico, isomentol, neoisomentol, neomentol) mentiléteres (por ejemplo (1mentoxi)-1,2-propanodiol, (1-mentoxi)-2-metil-1,2-propanodiol, 1-mentil-metiléter), mentilésteres (por ejemplo mentilformiato, mentilacetato, mentilisobutirato, mentillacetato, L-mentil-L-lactato, L-mentil-D-lactato, mentil-(2metoxi) acetato, mentil- (2-metoxietoxi) acetato, mentilpiroglutamato, mentilcarbonatos (por ejemplo mentilpropileneglicol carbonato, mentiletileneglicol carbonato, mentilglicerol carbonate o sus mezclas), los semiésteres de mentoles con un ácido dicarboxílico o sus derivados (por ejemplo monomentil succinato, monomentil glutarato, monomentil malonato, O-mentilo de ácido succínico con éster N,N-(dimetil) amida, O-mentilo de ácido succínico con éster amida), ácido mentanecarboxílico amida (en este caso preferentemente ácido-N-etilamida mentanecarboxílico [WS3] o N<sup>a</sup>- (mentanecarbonil) glicinetil éster [WS5], según se describe en el documento EE.UU 4.150.052, ácido N-(4-cianofenil) amida mentanecarboxílico o ácido N-(4-cianometilfenil) amida mentanecarboxílico según se describe en el documento WO 2005 049 553 A1, ácido N-(alcoxialquilo) amida metanecarboxílico, mentano y derivados de mentona (por ejemplo L-mentona glicerol cetal), derivados de ácido 2,3-dimetil-2-(2-propil) butírico (por ejemplo ácido N-metilamida 2,3-dimetil-2-(2-propil) butírico [WS23]), isopulegol o sus ésteres (1-(-)-isopulegol, 1-(-)-isopulegol acetato), derivados de mentano (por ejemplo p-mentano-3,8-diol), cubebol o mezclas sintéticas o naturales, que contienen cubebol, derivados de pirrolidona de derivados de cicloalquildiona (por ejemplo 3-metil-2(1pirrolidinilo)-2-ciclopentano-1-ona) o tetrahidropirimidina-2-ona (por ejemplo iciline o compuestos relacionados, según se describe en el documento WO 2004/026840), más carboxamidas (por ejemplo N-(2-(piridin-2-il)etil)-3-pmentancarboxamida o compuestos relacionados), (1R, 2S, 5R)-N-(4-metoxifenil)-5-metil-2-(1-isopropil) ciclohexano carboxamida [WS12], oxamatos (preferentemente los descritos en el documento EP 2033688 A2).

### D.10 Agentes antimicrobianos

Agentes antimicrobianos adecuados son, en principio, todas las sustancias eficaces contra bacterias gram positivas, tales como, por ejemplo, ácido 4 hidroxibenzoico y sus sales y ésteres, N-(4-clorofenil)-N'-(3,4-diclorofenil) urea, 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxi-difenil éter (Triclosan), 4-cloro-3,5-dimetil-fenol, 2,2'-metilenbis(6-bromo-4-clorofenol), 3-metil-4-(1-metiletil) fenol, 2-bencil-4-cloro-fenol, 3-(4-clorofenoxi)-1,2-propanodiol, 3-yodo-2-propinil butilcarbamato, clorhexidina, 3,4,4'-triclorocarbanilida (TTC), fragancias antibacterianas, timol, aceite de tomillo, eugenol, aceite de clavo, mentol, aceite de menta, farnesol, fenoxietanol, monocaprato glicerol, monocaprilato de glicerol, glicerol monolaurato (GML), monocaprinato de diglicerina (DMC), ácido salicílico N-alquilamidas, tal como, por ejemplo, noctilamida o n-decilamida.

### D.11 Inhibidores de enzimas

Inhibidores de enzimas adecuados son, por ejemplo, inhibidores de esterasa. Estos son preferentemente trialquil citratos, tales como citrato de trimetilo, citrato de tripropilo, citrato de triisopropilo, citrato de tributilo y, en particular, citrato de trietilo (Hydagen CAT). Las sustancias inhiben la actividad enzimática, por tanto reducen la formación de olor. Otras sustancias que son adecuados inhibidores de esterasa son sulfatos o fosfatos de esterol, tales como, por ejemplo, lanosterol, colesterol, campesterol, estigmasterol y sulfato o fosfato de sitosterol, ácidos dicarboxílicos y sus ésteres, tales como, por ejemplo, ácido glutárico, monoetil glutarato, glutarato de dietilo, ácido adípico, monoetil adipato, dietil adipato, ácido malónico y malonato de dietilo, ácidos hidroxicarboxílicos y sus ésteres, tales como, por ejemplo, ácido cítrico, ácido málico, ácido tartárico o tartrato de dietilo, y glicinato de cinc.

# D.12 Agentes activos absorbentes de olor y antitranspirantes

Absorbentes de olor apropiados son sustancias que son capaces de absorber y retener en gran parte compuestos que dan olor. Reducen la presión parcial de los componentes individuales, por lo tanto también reducen su velocidad de difusión. Es importante que los perfumes permanezcan inalterados en este proceso. Los absorbentes de olor no son eficaces contra bacterias. Comprenden, por ejemplo, como constituyente principal, una sal de cinc complejada de ácido ricinoleico o específico, fragancias con amplio olor neutro que son conocidos por la persona experta en la técnica como "fijadores", tales como, por ejemplo, extractos de ládano o estoraque o determinados derivados de ácido abiético. Los agentes que enmascaran olores son fragancias o aceites de perfume, que, además de su función como agentes que enmascaran olores, dan a los desodorantes su respectiva nota de fragancia. Aceites de perfume que se pueden mencionar son, por ejemplo, mezclas de fragancias naturales y sintéticas. Fragancias naturales son extractos de flores, tallos y hojas, frutos, cáscaras de frutas, raíces, maderas, hierbas y pastos, agujas y ramas, y resinas y bálsamos. También son adecuados productos animales, tales como, por ejemplo, algalia y castóreo. Compuestos de fragancia sintéticos típicos son productos del tipo éster, éter, aldehído, cetona, alcohol, e hidrato de

carbono. Compuestos fragancia del tipo de éster son, por ejemplo, acetato de bencilo, acetato de p-tercbutilciclohexilo, acetato de linalilo, acetato de feniletilo, benzoato de linalilo, formiato de bencilo, ciclohexilpropionato de alilo, propionato de estiralilo y salicilato de bencilo. Los éteres incluyen, por ejemplo, bencil etil éter, y los aldehídos incluyen, por ejemplo, los alcanales lineales que tienen de 8 a 18 átomos de carbono, citral, citronelal, citroneliloxiacetaldehído, ciclamen aldehído, hidroxicitronellal, lilial y bourgeonal, las cetonas incluyen, por ejemplo, las iononas y metilcedrilcetona, los alcoholes incluyen anetol, citronelol, eugenol, isoeugenol, geraniol, linaool, alcohol feniletílico y terpineol, y los hidratos de carbono incluyen principalmente los terpenos y bálsamos. Sin embargo, se da preferencia a utilizar mezclas de diferentes fragancias que juntas producen una nota de olor agradable. Los aceites esenciales de relativamente baja volatilidad, que se utilizan principalmente como componentes de aroma, también son adecuados como aceites de perfume, por ejemplo aceite de salvia, aceite de manzanilla, aceite de clavo, aceite de melisa, aceite de menta, aceite de hoja de canela, aceite de flor de tilo, aceite de bayas de enebro, aceite de vetiver, aceite de olíbano, esencia de gálbano, aceite de ládano y aceite de lavandina. Se da preferencia al uso de aceite de bergamota, dihidromircenol , lilial, liral, citronelol, feniletil alcohol, αhexilcinamaldehído, geraniol, bencilacetona, aldehído ciclamen, linalol, Forte Boisambrene, ambroxan, indol, hediona, sandelice, aceite de limón, aceite de mandarina, aceite de naranja, alil glicolato de amilo, ciclovertal, aceite de lavandina, aceite de salvia, β-damascona, aceite de geranio bourbon, salicilato de ciclohexilo, Vertofix coeur, iso-E-super, Fixolide NP, evernil, iraldeína gamma, ácido fenilacético, acetato de geranilo, acetato de bencilo, rosa óxido, romilato, irotilo y floramato solos o en mezclas.

Ingredientes activos antitranspirantes astringentes adecuados son principalmente sales de aluminio, zirconium o de cinc. Tales ingredientes activos antihidrópicos adecuados son, por ejemplo, cloruro de aluminio, clorhidrato de aluminio, diclorhidrato de aluminio, sesquiclorhidrato de aluminio y sus compuestos complejos, por ejemplo con 1,2-propilen glicol, hidroxialantoinato de aluminio, cloruro tartrato de aluminio, triclorhidrato de aluminio y zirconio, tetraclorhidrato de aluminio y circonio, pentaclorohidrato de aluminio y circonio y sus complejos compuestos, por ejemplo con aminoácidos, tales como glicina.

# 25 D.13 Agentes formadores de película y anticaspa

5

10

15

40

45

55

Formadores de película estándar son, por ejemplo, quitosano, quitosano microcristalino, quitosano cuaternizado, polivinil pirrolidona, copolímeros de vinil pirrolidona/acetato de vinilo, polímeros de la serie del ácido acrílico, derivados cuaternarios de celulosa, colágeno, ácido hialurónico y sus sales y compuestos similares.

Agentes anticaspa adecuados son Pirocton Olamin (1-hidroxi-4-metil-6-(2,4,4-trimetil-pentil)-2-(1H)-piridinona sal de monoetanolamina), Baypival® (Climbazole), Ketoconazol® (4-acetil-1-{4-[2-(2,4-diclorofenil)r-2-(1H-imidazol-1-ilmetil)-1,3-dioxilan-c-4-ilmetoxifenil-piperazina, ketoconazol, elubiol, disulfuro de selenio, azufre coloidal, polietilenglicol sorbitan monooleato de azufre, polietoxilato de ricinol de azufre, azufre alquitrán destilado, ácido salicílico (o en combinación con hexaclorofeno), ácido undecilénico, monoetanolamida sulfosuccinato sal de Na, Lamepon® UD (proteína/condensado de ácido undecilénico), piritiona de cinc, piritiona de aluminio y piritiona de magnesio/dipiritiona de magnesio sulfato.

# D.14 Vehículos e hidrótropos

Materiales de vehículos cosméticos preferentes son sólido o líquido a 25°C y 1.013 mbar (que incluye sustancias muy viscosas), como por ejemplo, glicerol, 1,2-propilenglicol, 1,2-butilenglicol, 1,3-propilenglicol, 1,3-butilenglicol, etanol, agua y mezclas de dos o más de dichos materiales de vehículo líquido con agua. Opcionalmente, estas preparaciones según la invención se pueden producir usando conservantes o solubilizantes. Otra sustancia de vehículo líquido preferente, que puede ser un componente de una preparación según la invención se selecciona del grupo que consiste en aceites tales como aceite vegetal, aceite neutral y aceite mineral.

Materiales de vehículo sólidos preferentes, que pueden ser un componente de una preparación según la invención son hidrocoloides, tales como almidones, almidones degradados, almidones modificados química o físicamente, dextrinas, (en polvo) maltodextrinas (preferentemente con un valor de dextrosa equivalente de 5 a 25, preferentemente de 10 - 20), lactosa, dióxido de silicio, glucosa, celulosas modificadas, goma arábiga, goma ghatti, tragacanto, karaya, carragenina, pululano, curdlano, goma xantana, goma gellan, harina de guar, harina de algarroba, alginatos, agar, pectina e inulina y mezclas de dos o más de estos sólidos, en particular maltodextrinas (preferentemente con un valor de dextrosa equivalente de 15 - 20), lactosa, dióxido de silicio y/o glucosa.

Además, hidrótropos, por ejemplo etanol, alcohol isopropílico o polioles, se pueden utilizar para mejorar el comportamiento de flujo. Polioles adecuados preferentemente contienen de 2 a 15 átomos de carbono y al menos dos grupos hidroxilo. Los polioles pueden contener otros grupos funcionales, más especialmente grupos amino, o se pueden modificar con nitrógeno. Ejemplos típicos son

- glicerol
- alquileno glicoles, tales como, por ejemplo, etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol glicol, butileno glicol, hexilenglicol, y polietileno glicoles con un peso molecular medio de 100 a 1000 Dalton;

- mezclas técnicas de oligoglicerina con un grado de autocondensación de 1,5 a 10, tales como por ejemplo mezclas técnicas de diglicerol con un contenido en diglicerina de 40 a 50% en peso;•compuestos de metilol tales como, en particular, trimetilol etano, trimetilol propano, trimetilol butano, pentaeritritol y dipentaeritritol;
- alquil glucósidos menores, particularmente los que contienen de 1 a 8 átomos de carbono en el grupo alquilo, por ejemplo, metil y butil glucósido;
- azúcar alcoholes que contienen de 5 a 12 átomos de carbono, por ejemplo sorbitol o manitol,
- azúcares que contienen de 5 a 12 átomos de carbono, por ejemplo glucosa o sacarosa;
- amino azúcares, por ejemplo glucamina;
- dialcoholaminas, tales como dietanolamina o 2-aminopropano-1,3-diol.

#### 10 D.15 Conservantes

5

Conservantes adecuados son, por ejemplo, fenoxietanol, disolución de formaldehído, parabenos, pentanodiol o ácido sórbico y las otras clases de compuestos indicadas en el anexo 6, partes A y B de Kosmetikverordnung ("directiva de cosméticos").

## D. 16 Aceites y fragancias de perfumes

15 Aceites de perfume adecuados son mezclas de perfumes naturales y sintéticos. Los perfumes naturales incluyen extractos de flores (lirio, lavanda, rosa, jazmín, neroli, ylang-ylang), tallos y hojas (geranio, pachulí, petitgrain), frutas (anís, cilantro, comino, enebro), cáscara de fruta (bergamota, limón, naranja), raíces (nuez moscada, angélica, apio, cardamomo, Costus, Iris, cálamo), maderas (madera de pino, sándalo, guayaco, cedro, palo de rosa), hierbas y pastos (estragón, hierba de limón, salvia, tomillo), agujas y ramas (abeto, pino, pino enano), resinas y bálsamos 20 (gálbano, elemi, benjuí, mirra, olíbano, opoponax). Materias primas animales, por ejemplo algalia y castor, también se pueden utilizar. Compuestos de perfume sintéticos típicos son productos del tipo éster, éter, aldehído, cetona, alcohol e hidrato de carobono. Ejemplos de compuestos de perfume del tipo éster son acetato de bencilo, isobutirato de fenoxietilo, acetato de p-terc-butilo, acetato de linalilo, acetato de dimetil carbinilo bencilo, fenil acetato de etilo, benzoato de linalilo, formiato de bencilo, glicinato de fenilo etilmetilo, alilo ciclohexil propionato, propionato de 25 estiralilo y salicilato de bencilo. Los éteres incluyen, por ejemplo, bencil etil éter, entre los aldehídos se inlcuye, por ejemplo, los alcanales lineales que contienen de 8 a 18 átomos de carbono, citral, citronelal, citronelaloxi acetaldehído, ciclamen aldehído, hidroxicitronelal, lilial y bourgeonal. Ejemplos de cetonas adecuadas son las iononas, isometilionona y metilcedril cetona. Alcoholes adecuados son anetol, citronelol, eugenol, isoeugenol, geraniol, linalool, alcohol feniletílico y terpineol. Los hidratos de carbono incluyen principalmente los terpenos y bálsamos. Sin embargo, es preferente utilizar mezclas de diferentes compuestos de perfume que, juntos, producen 30 un perfume agradable. Otros aceites de perfume adecuados son aceites esenciales de volatilidad relativamente baja que se utilizan principalmente como componentes de aroma. Ejemplos son aceite de salvia, aceite de manzanilla, aceite de clavo, aceite de melisa, esencia de menta, aceite de hoja de canela, aceite de flores de tilo, esencia de bayas de enebro, aceite de vetiver, aceite de olíbano, aceite de gálbano, aceite de ládano y aceite de lavanda. Los 35 siguientes se usan preferentemente o bien de forma individual o en forma de mezclas: aceite de bergamota, dihidromircenol, Iilial, Iiral, citronelol, alcohol feniletílico, hexilcinnamaldehido, geraniol, acetona bencilo, aldehído ciclamen, linalool, Boisambrene Forte, Ambroxan, indol, hediona, sandelice, aceite de cítricos, aceite de mandarina. aceite de naranja, alilamilo glicolato, ciclovertal, esencia de lavanda, esencia de salvia, damascona, aceite de geranio bourbon, ciclohexil salicilato, Vertofix Coeur, Iso-E-super, Fixolide NP, evernil, Iraldein gamma, ácido 40 fenilacético, acetato de geranilo, acetato de bencilo, óxido de rosas, romilato, irotilo y floramato.

## D.17 Colorantes

Colorantes adecuados son cualquiera de las substancias adecuadas y admitidas para finalidades cosméticas, como las que figuran, por ejemplo, en la publicación "Kosmetische Färbemittel" del Farbstoff-kommission der Deutschen Forschungsgemeinschaft, Verlag Chemie, Weinheim, 1984, páginas 81 a 106. Ejemplos incluyen rojo cochinilla A (CI 16255), azul patente V (CI 42051), indigotina (CI 73015), clorofilina (CI 75810), amarillo quinolina (CI 47005), titanio dióxido (CI 77891), azul de indantreno RS (CI 69800) y laca de rubia (CI 58000). Luminol también puede estar presente como un colorante luminiscente. Pigmentos de color ventajosos son por ejemplo dióxido de titanio, mica, óxidos de hierro (por ejemplo, Fe<sub>2</sub>O<sub>3</sub> Fe<sub>3</sub>O<sub>4</sub>, FeO(OH)) y/o óxido de estaño. Colorantes ventajosos son por ejemplo el carmín, azul Berlín, óxido de cromo verde, azul ultramarino y/o violeta de manganeso.

# 50 D.18 Preparaciones

45

55

Composiciones preferentes según las presentes invenciones se seleccionan del grupo de productos para tratamiento, protección, cuidado y limpieza de la piel y/o el cabello o como un producto de maquillaje, preferentemente como un producto de carácter permanente (lo que significa que uno o más compuestos de fórmula (I) se quedan en la piel y/o el cabello durante un periodo de tiempo más largo, en comparación con productos de aclarado, de modo que la acción que promueve hidratación y/o antienvejecimiento y/o cicatrización de heridas es más pronunciada).

Las formulaciones según la invención están preferentemente en forma de una emulsión, por ejemplo W/O (agua en aceite), O/W (aceite en agua), W/O/W (agua en aceite en agua), O/W/O (aceite en agua en aceite) emulsión,

emulsión PIT, emulsión de Pickering, emulsión con un bajo contenido de aceite, micro- o nanoemulsión, una disolución, por ejemplo, en aceite (aceites grasos o ésteres de ácidos grasos, en particular C6-C32 ésteres de ácido graso C2-C30) o aceite de silicona, dispersión, suspensión, crema, loción o leche, dependiendo del método de producción e ingredientes, un gel (que incluye hidrogel, gel de hidrodispersión, oleogel), pulverizado (por ejemplo pulverizadores de bomba o aerosol con propelente) o una espuma o una disolución de impregnación para toallitas cosméticas, un detergente, por ejemplo, jabón, detergente sintético, líquido de lavado, preparación de ducha y baño, producto de baño (cápsula, aceite, tableta, sal, sal de baño, jabón, etc.), preparación efervescente, un producto de cuidado de la piel tal como por ejemplo una emulsión (como se describió anteriormente), unquento, pasta, gel (como se describió anteriormente), aceite, bálsamo, suero, polvo (por ejemplo polvo de cara, polvos para el cuerpo), una máscara, un lápiz, stick, roll-on, bomba, aerosol (espumante, no espumante o posterior a la formación de espuma), un desodorante y/o antitranspirante, lavado bucal y enjuague bucal, un producto de cuidado de los pies (que incluye queratolíticos, desodorante), un repelente de insectos, un filtro solar, preparación aftersun, un producto de afeitado, bálsamo para después del afeitado, loción para antes y después del afeitado, un agente depilatorio, un producto de cuidado del cabello tal como por ejemplo champú (que incluye champú 2 en 1, champú anticaspa, champú para bebé, champú para el cuero cabelludo seco, champú concentrado), acondicionador, tónico para el cabello, agua de cabello, enjuague para el cabello, crema estilo, pomada, loción de ondulado y fijadora, spray para el cabello, ayudante de marcado (por ejemplo gel o cera), agente de suavizado del cabello (agente desenredante, relajante), tinte para el cabello tales como por ejemplo temporal y colorantes directos cabello, tinte para el cabello semipermanente, tinte para el cabello permanente, acondicionador de cabello, espuma para el cabello, productos para el cuidado de ojos, eliminador de maquillaje o producto de bebé.

Las formulaciones según la invención son particularmente preferentemente en la forma de una emulsión, en particular en la forma de una emulsión W/O, O/W, W/O/W, O/W/O, emulsión PIT, emulsión de Pickering, emulsión con un bajo contenido de aceite, micro- o nanoemulsión, un gel (que incluye hidrogel, gel de hidrodispersión, oleogel), una disolución por ejemplo en aceite (aceites grasos o ésteres de ácidos grasos, en particular  $C_6$ - $C_{32}$  ésteres de ácidos grasos  $C_2$ - $C_{30}$ )) o aceite de silicona, o un pulverizado (por ejemplo, pulverizadores de bomba o pulverizado con propelente).

Se pueden incluir sustancias auxiliares y aditivos en cantidades de 5 a 99% de peso corporal, preferentemente 10 a 80% de peso corporal, en base al peso total de la formulación. Las cantidades de cosméticos o agentes auxiliares dermatológicos y aditivos y perfume a usar en cada caso se puede determinar fácilmente por la persona experta en la técnica mediante simple ensayo y error, dependiendo de la naturaleza del producto particular.

Las preparaciones también pueden contener agua en una cantidad de hasta 99% en peso corporal, preferentemente de 5 a 80 % en peso corporal, en base al peso total de la preparación.

# Aplicación industrial

5

10

15

20

25

30

35

40

55

En una realización preferente las composiciones según se usan en presente invención comprenden los componentes en las siguientes cantidades:

- a) derivados de acetofenona de fórmula (I) en una cantidad de 0,1 a 0,5% en peso corporal calculado sobre la composición total;
- b) aproximadamente de 99,9 a aproximadamente 50, preferentemente de aproximadamente 95 a aproximadamente 65 y más preferentemente de aproximadamente 80 a aproximadamente 70% en peso corporal de cuerpos oleosos y/o ceras;
- c) de 0,1 a aproximadamente 25, preferentemente de aproximadamente 1 a aproximadamente 15 y más preferentemente de aproximadamente 4 a aproximadamente 8 % en peso corporal de emulsionantes;
- d) de 0 a aproximadamente 25, preferentemente de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 10 y más preferentemente de aproximadamente 1 a aproximadamente 5% en peso corporal de principios activos;
- 45 a condición de que las cantidades sumen opcionalmente junto con agua e ingredientes adicionales el 100% en peso corporal.

Las composiciones de la invención pueden contener agua o están esencialmente libres de agua. Esencialmente libre significa que la cantidad de agua es menor de 2, preferentemente menor de 1 y más preferentemente menos de 0,5% en peso corporal calculado sobre el producto final.

Las composiciones según la invención pueden representar emulsión o/w o w/o o múltiple o/w/o o w/o/w. Se pueden usar como un intermediario o un producto final, por ejemplo, en la forma de una loción, una crema o una barra.

Como se ha explicado anteriormente la presente invención se refiere al uso de derivados de acetofenona según la fórmula (I) como estabilizadores para composiciones cosméticas, en particular para reducir el tamaño medio de partícula de las gotitas en una emulsión y como aditivo capaz de mejorar el perfil sensorial de las composiciones cosméticas.

### **Ejemplos**

### Ejemplos 1 a 3, ejemplo comparativo C1

5

10

Se prepararon emulsiones OW calentando una fase A lipídica y una fase B acuosa separadamente a aproximadamente 80°C. Después la fase B acuosa se añadió a la fase A lipídica y se mezclan en un Ultra-Turrax durante 2 minutos a 5.000 rpm. La emulsión así obtenida se dejó enfriar durante 10 minutos usando un agitador de paletas a 150 rpm. Finalmente, el valor pH se ajustó a aproximadamente 8,0 por adición de disolución acuosa de hidróxido de sodio. La estabilidad de las emulsiones se determinó usando una centrífuga analítica del tipo LUMisizer® (L.U.M. GmbH) que mide el cambio en la transmisión a lo largo del tiempo. El índice de inestabilidad se define entre 0 (muy estable) y 1 (separación completa). Los experimentos se llevaron a cabo a 25°C con una velocidad de 2.500 rpm durante 1,25 h correspondiente a un tiempo de almacenamiento de aproximadamente de 1 mes. La composición de las emulsiones y los resultados de estabilidad se proporcionan en la Tabla 1. Los ejemplos 1 a 3 son según la invención, el ejemplo C1 sirve como comparación.

Tabla 1

Emulsiones O/W que comprenden Emulsiphos®

Fase	Compuesto	C1	1	2	3
Α	Potasio cetílico fosfato (y) glicéridos de palma hidrogenados	2,0	2,0	2,0	2,0
	Emulsiphos® PN 677660				
	Alcohol cetearílico	0,7	0,7	0,7	0,7
	LANETTE® O				
	Glicéridos cáprico caprílico	0,8	0,8	0,8	0,8
	MYRITOL® 312				
	Cetearil etilhexanoato	4,0	4,0	4,0	4,0
	PCL líquido 100				
	Dimeticona	0,1	0,1	0,1	0,1
	Abil® R 350				
В	4-Hidroxiacetofenona	-	0,1	0,3	0,5
	Glicerol		1,5	1,5	1,5
	Agua	hasta 100			
Índice de inestabilidad (media de 3 experimentos)		0,35	0,30	0,29	0,29
Significado estadístico frente a C1 (prueba t) 1)			nd	0,004	0,027

nd = no determinado valores 1) por debajo de 0,05 indican un significado estadístico

Los ejemplos y ejemplos comparativos demuestran claramente que la adición de 4-hidroxiacetofenona a las emulsiones conduce a significativamente menos separación y mejora la estabilidad de la emulsión.

Ejemplos 4 a 6, ejemplo comparativo C2

Se prepararon emulsiones OW según el procedimiento explicado para los ejemplos 1 a 3 con la única excepción de que el valor pH se ajustó a aproximadamente 9,1. La estabilidad de las emulsiones se determinó de nuevo usando una centrífuga analítica del tipo LUMisizer® (L.U.M. GmbH). La composición de las emulsiones y los resultados de estabilidad se proporcionan en la Tabla 2. Los ejemplos 4 a 6 son según la invención, el ejemplo C2 sirve como comparación.

Tabla 2

Emulsiones O/W que comprenden Dracorin®

25

20

Fase	Compuesto	C1	4	5	6
А	Citrato de estearato de glicerilo	2,0	2,0	2,0	2,0
	Dracorin® CE				
	Alcohol cetearílico	0,2	0,2	0,2	0,2
	LANETTE® O				
	Glicéridos cáprico caprílico	10,0	10,0	10,0	10,0
	MYRITOL® 312				
	Aceite de aguacate	2,0	2,0	2,0	2,0
	Dimeticona	0,1	0,1	0,1	0,1
	Abil® 350				
В	4-Hidroxiacetofenona	-	0,1	0,3	0,5
	Glicerol	1,5	1,5	1,5	1,5
	Agua	has	sta 100		
Índice d	Índice de inestabilidad (media de 3 experimentos)		0,31	0,30	0,26
Significado estadístico frente a C2 (prueba t) 1) nd 0,062			0,013		

nd = no determinado valores <sup>1)</sup> por debajo de 0,05 indican un significado estadístico

También el segundo conjunto de ejemplos y ejemplos comparativos demuestran claramente que la adición de 4-hidroxiacetofenona a las emulsiones conduce a significativamente menos separación y demuestra la estabilidad de la emulsión.

# 5 Ejemplos 1 a 6, ejemplos comparativos C1 y C2

Se prepararon emulsiones O/W según el procedimiento explicado en los ejemplos 1 a 3. Las distribuciones de tamaño de partícula de las emulsiones según el ejemplo 1 a 6 y ejemplos comparativos C1 y C2 se midieron utilizando un Mastersizer Micro (Malvern) que usa el principio de difracción láser. Los resultados se muestran en la tabla 3.

# 10 Tabla 3

15

Distribución de tamaño de partícula (todos los valores en µm)

Tamaño de partícula	C1	2	3	4	C2	4	5	6
D (v, 0,1) = 10%	2,10	1,98	1,76	1,83	1,64	1,42	1,45	1,55
D (v, 0,5) = 50%	11,32	10,42	8,93	9,40	10,93	7,31	7,59	8,81
D (v, 0,9) = 90%	33,73	28,37	18,7	23,76	20,35	13,64	14,20	17,50

El índice "v" se refiere a un volumen en base a la distribución de tamaño de partícula; todos los valores se tomaron de la distribución de la suma Qr. Por ejemplo, el valor 1,64 para C2 significa que 10% de las partículas muestran un tamaño de partícula menor de 1,64 µm y así sucesivamente.

Como uno puede ver, la adición de 4-hidroxiacetofenona cambia el tamaño de partícula medio máximo a valores más pequeños y da emulsiones más finamente divididas.

## REIVINDICACIONES

- 1. El uso de derivado(s) de acetofenona de fórmula (I)
- para mejorar la estabilidad de la composición cosmética a través de la reducción del tamaño medo de partícula de las gotas; y
- para mejorar el perfil sensorial de las formulaciones cosméticas; y
- para mejorar la estabilidad de la espuma y aumentar la viscosidad de la formulación cosmética que son champús en una composición cosmética, que comprende
- (a) al menos un derivado de acetofenona de fórmula (I)

$$O$$
 $CH_3$ 
 $R_2$ 
 $OR_1$ 

10 (I)

5

en la que

R<sub>1</sub> significa hidrógeno o metilo, y

R<sub>2</sub> significa hidrógeno, hidroxilo o un grupo -OCH<sub>3</sub>,

o una de sus sales cosmética o farmacéuticamente aceptable en una cantidad de uso desde 0,1 a 0,5% en peso corporal calculado sobre la composición tópica,

- (b) al menos un cuerpo oleoso o cera, y/o
- (c) al menos un emulsionante y opcionalmente
- (d) al menos un principio activo.
- 2. El uso de la reivindicación 1, en el que los derivados de acetofenona se seleccionan del grupo que consiste en

20 (la): 2-hidroxiacetofenona

(lb): 3-hidroxiacetofenona

25 (Ic): 4-hidroxiacetofenona

o sus mezclas.

- 3. El uso de la reivindicación 2 que comprende o que consiste en dos o tres de los compuestos (la), (lb) y (lc).
- 4. El uso de la reivindicación 1, en el que los derivados de acetofenona están presentes en cantidades de 0,1 a 0,5 % en peso calculado sobre la composición final.
- 5. El uso de la reivindicación 1, en el que los cuerpos oleosos (componente b1) se seleccionan del grupo que consiste en alcoholes de Guerbet a base de alcoholes grasos que tienen de 6 a 18 átomos de carbono, ésteres

de ácidos grasos lineales C6-C22 con alcoholes grasos lineales o ramificados C6-C22 o ésteres de ácidos carboxílicos C6-C13 ramificados con alcoholes grasos C6-C22 lineales o ramificados, ésteres de graso ácidos lineales C6-C22 con alcoholes ramificados, ésteres de ácidos alquilhidroxi carboxílicos C18-C38 con alcoholes grasos lineales o ramificados C6-C22, ésteres de ácidos grasos lineales y/o ramificados con alcoholes polihídricos y/o alcoholes de Guerbet, triglicéridos con base de ácidos grasos C6-C10, mezclas líquidas de mono- / di- / triglicéridos con base de ácidos grasos C6-C18, ésteres de alcoholes grasos C6-C22 y/o alcoholes de Guerbet con ácidos carboxílicos aromáticos, ésteres de ácidos dicarboxílicos C2-C12 con alcoholes lineales o ramificados que tienen de 1 a 22 átomos de carbono o polioles que tienen de 2 a 10 átomos de carbono y 2 a 6 grupos hidroxilo, aceites vegetales, alcoholes primarios ramificados, ciclohexanos sustituidos, carbonatos alcoholes grasos lineales y ramificado C6-C22, carbonatos de Guerbet, basados en alcoholes grasos que tienen de 6 a 18, preferentemente de 8 a 10 átomos de carbono, ésteres del ácido benzoico con alcoholes lineales y/o ramificados C6-C22 éteres de dialquilo simétricos o asimétricas que tienen de 6 a 22 átomos de carbono por grupo alquilo, productos de anillo abierto de ésteres de ácidos grasos epoxidados con polioles, aceites de silicona y/o hidratos de carbono alifáticos o nafténicos, aceites minerales y sus mezclas.

- 15 6. El uso de la reivindicación 1, en el que las ceras (componente b2) se seleccionan del grupo que consiste en agentes súper engrasantes, factores de consistencia, ceras perlantes, ceras naturales y sus mezclas.
  - 7. El uso de la reivindicación 1, en el que los emulsionantes (componente c) se seleccionan del grupo que consiste de emulsionantes no iónicos, aniónicos, catiónicos, o anfóteros y sus mezclas.
- El uso de la reivindicación 1, en el que los principios activos (componente d) se seleccionan del grupo que 20 consiste en abrasivos, agentes anti-acné, agentes contra el envejecimiento de la piel, agentes anticelulíticos, agentes anticaspa, agentes antiinflamatorios, agentes de prevención de irritación, agentes de inhibición de irritación, antioxidantes, astringentes, agentes de inhibición del sudor, agentes antisépticos, antiestáticos, aglutinantes, tampones, materiales de vehículo, agentes quelantes, estimulantes de células, agentes de limpieza, agentes de cuidado, agentes depilatorios, sustancias tensioactivas, agentes desodorantes, 25 antitranspirantes, suavizantes, enzimas, aceites esenciales, fibras, agentes formadores de película, fijadores, agentes formadores de espuma, estabilizadores de espuma, sustancias para prevenir la formación de espuma, reforzadores de espuma, agentes gelificantes, agentes formadores de geles, agentes para el cuidado del cabello, agentes para fijar el cabello, agentes para alisar el cabello, agentes humectantes, sustancias hidratantes, sustancias que retienen la humedad, agentes blanqueadores, agentes de refuerzo, agentes 30 antimanchas, agentes ópticamente abrillantadores, agentes impregnantes, agentes repelentes de suciedad, agentes reductores de fricción, lubricantes, cremas hidratantes, ungüentos, agentes opacificantes, agentes plastificantes, agentes de recubrimiento, esmaltes, agentes de brillo, polímeros, polvos, proteínas, agentes de reengrase, agentes de abrasión, siliconas, agentes suavizantes de la piel, agentes limpiadores de la piel, agentes para el cuidado de la piel, agentes protectores de la piel, agentes aclaradores de la piel, agentes 35 protectores de la piel, agentes suavizantes de la piel, agentes de cuidado del cabello, agentes refrescantes, agentes refrescantes de la piel, agentes de calentamiento, agentes de calentamiento la piel, estabilizadores. agentes absorbentes de UV, filtros UV detergentes, agentes acondicionadores de tejidos, agentes de disolución, agentes de bronceado de la piel, espesantes, vitaminas, aceites, ceras, grasas, fosfolípidos, ácidos grasos saturados, ácidos grasos mono o poliinsaturados, α-hidroxi ácidos, ácidos polihidroxi ácidos. licuadores. 40 colorantes, agentes protectores del color, pigmentos, anticorrosivos, aromas, sustancias aromatizantes, sustancias odoríferas, polioles, tensioactivos, electrolitos, disolventes orgánicos o derivados de silicona.
  - 9. El uso de la reivindicación 1, en el que la composición cosmética comprende los componentes en las siguientes cantidades:
    - a) de 0,1 a 0,5% en peso corporal de derivados de acetofenona de fórmula (I);
    - b) aproximadamente de 99,9 a aproximadamente 50% en peso corporal de cuerpos oleosos y/o ceras;
    - c) de 0,1 a aproximadamente 25% en peso corporal de emulsionantes;
    - d) de 0 a aproximadamente 25% en peso corporal de principios activos;

a condición de que las cantidades sumen - opcionalmente junto con agua e ingredientes adicionales - el 100% en peso corporal.

- 10. El uso de la reivindicación 1, en el que el producto o bien contiene agua o está esencialmente libre de agua.
- 11. El uso de la reivindicación 1, en el que el producto es una emulsión o/w o w/o o múltiple o/w/o o w/o/w.
- 12. El uso de la reivindicación 1, en el que el producto es una loción, una crema o una barra.
- 13. Un método de estabilizar una emulsión frente a la separación en el que una cantidad de 0,1 a 0,5% en peso de 4-hidroxiacetofenona se añade a una composición que comprende
  - (b) al menos un cuerpo oleoso o cera, y/o
  - (c) al menos un emulsionante y opcionalmente
  - (d) al menos un principio activo,

calculado sobre la emulsión total.

5

10

45

50

55

- 60 14. El uso de 4-hidroxiacetofenona como estabilizante frente a separación para composiciones emulsiones cosméticas que comprenden
  - (a) al menos un derivado de acetofenona de fórmula (I)

- (b) al menos un cuerpo oleoso o cera, y/o
- (c) al menos un emulsionante y opcionalmente
- (d) al menos un principio activo,

### calculado sobre la emulsión total.

- 5 15. Un método para reducir el tamaño medio de partícula de las gotas en una emulsión en la que se añade una cantidad es de 0,1 a 0,5% en peso de al menos un derivado acetofenona de fórmula (I) a una composición que comprende
  - (b) al menos un cuerpo oleoso o cera, y/o
  - (c) al menos un emulsionante y opcionalmente
- 10 (d) al menos un principio activo,

### calculado sobre la emulsión total.

- 16. Un método para mejorar la estabilidad de la espuma y el aumento de viscosidad de champús en la que se añade una cantidad es de 0,1 a 0,5% en peso de al menos un derivado acetofenona de fórmula (I) a una composición que comprende
- 15 (b) al menos un cuerpo oleoso o cera, y/o
  - (c) al menos un emulsionante y opcionalmente
  - (d) al menos un principio activo,

calculado sobre la emulsión total.