

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 772 279**

51 Int. Cl.:

A01N 37/18 (2006.01)
A01N 37/46 (2006.01)
A01N 47/16 (2006.01)
A01N 65/26 (2009.01)
A01N 65/44 (2009.01)
A01N 25/08 (2006.01)
A01N 25/12 (2006.01)
A01P 17/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **08.01.2016 PCT/EP2016/000026**
 87 Fecha y número de publicación internacional: **11.08.2016 WO16124306**
 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **08.01.2016 E 16700143 (7)**
 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.11.2019 EP 3253206**

54 Título: **Formulación de polvo fino que contiene repelente de insectos**

30 Prioridad:

02.02.2015 EP 15000302

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

07.07.2020

73 Titular/es:

**MERCK PATENT GMBH (100.0%)
 Frankfurter Strasse 250
 64293 Darmstadt , DE**

72 Inventor/es:

**TERMER, MICHAEL;
 PFLUECKER, FRANK;
 HEIDER, LILIA;
 AXT-HEIDEMANN, ALEXANDRA y
 ZUR LAGE, JUTTA**

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

Observaciones:

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

ES 2 772 279 T3

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

DESCRIPCIÓN

Formulación de polvo fino que contiene repelente de insectos

La presente invención se refiere a una formulación de polvo fino que contiene al menos un repelente de insectos e hidróxido de carbonato de magnesio, así como a un procedimiento para la producción de la formulación y al uso de la formulación para repeler insectos.

Los insectos han representado para los seres humanos y también para los animales en diversos aspectos un perjuicio o incluso una amenaza. Un gran número de mosquitos, tábanos, pulgas, piojos, chinches, así como garrapatas, ácaros, avispas, abejas, hormigas, cucarachas y moscas en lo sucesivo resumidos con los términos colectivos insectos y arañas (o de manera simplificada incluso con el término general usado incorrectamente en el sentido biológico insectos). Los mosquitos, tábanos, pulgas, piojos, chinches, así como garrapatas y ácaros se alimentan de la sangre de los animales de sangre caliente, a lo que pertenecen también los seres humanos y mamíferos. Perforan con sus herramientas de picar y succionar la piel de sus víctimas hasta que llegan a vasos sanguíneos. Durante la toma de alimento segregan agentes que ensanchan los vasos e inhiben la coagulación, que pueden conducir en el huésped a picor, formación de ronchas y reacciones alérgicas. En particular en los trópicos y subtropicales existe además el peligro de una infección con gérmenes patógenos. Así, por ejemplo, la malaria se transmite mediante el mosquito *Anopheles* o la fiebre amarilla mediante el mosquito de la fiebre amarilla. También en regiones templadas existe el peligro de infecciones con gérmenes patógenos transmitidos por insectos, tal como, por ejemplo, la encefalitis de la garrapata transmitida mediante la mordedura de la garrapata.

Una protección frente a la molestia por insectos y arañas la ofrecen los denominados repelentes de insectos o repelentes. Por estos se entienden una serie de sustancias activas, que debido a su olor actúan de manera repelente sobre los insectos y arañas. A este respecto, por regla general se trata de compuestos poco volátiles, que se evaporan lentamente sobre la piel y por consiguiente forman una cámara de aroma sobre la piel, que aleja a los insectos.

Los requisitos de un repelente de insectos son elevados y variados. Sobre todo tiene que garantizarse una protección eficaz de la piel frente a insectos. La acción repelente duradera a lo largo de varias horas, también en condiciones climáticamente desfavorables, es importante. Además, el repelente debería presentar un espectro de acción lo más amplio posible. Requisitos adicionales son una compatibilidad máxima con la piel y la mucosa sin propiedades tóxicas, alergizantes o sensibilizantes, no debiendo tener lugar sin embargo una penetración en la piel. Además, la sustancia debe presentar una alta estabilidad química, es decir ninguna capacidad de hidrólisis, ninguna capacidad de fotooxidación, ninguna capacidad de oxidación, una alta estabilidad térmica y una alta resistencia al sudor.

A los repelentes de insectos más usuales pertenece la N,N-dietil-3-metilbenzamida (o N,N'-dietil-m-toluamida) ("DEET"), que es activa frente a los mosquitos, moscas de los establos y jejenes, tábanos, pulgas, chinches, garrapatas y ácaros. Un repelente de insectos igualmente conocido es la 1-(1-metilpropoxycarbonil)-2-(2-hidroxi-etil)piperidina (icaridina). A los repelentes de insectos naturales pertenecen, por ejemplo, el aceite de citronela o de andiroba. Es especialmente eficaz el éster etílico del ácido 3-(N-n-butil-N-acetil-amino)-propiónico (que puede obtenerse con el nombre comercial IR3535® de la empresa Merck KGaA, Darmstadt, Alemania), que puede utilizarse, por ejemplo, frente a mosquitos, moscas tsé-tsé, piojos, moscas de arena, cucarachas, hormigas, garrapatas y tábanos. Estas sustancias se usan hoy en día en una serie de productos comerciales. A este respecto, en la mayoría de los casos se trata de emulsiones, aerosoles, geles o pulverizaciones.

Para poder conseguir una buena eficacia, la concentración de los repelentes de insectos en la formulación asciende por regla general a entre el 5 y el 50% en peso. Dado que en el caso de dichos repelentes de insectos se trata de líquidos (aceites), pueden incorporarse fácilmente concentraciones altas de más del 10% en emulsiones, geles o pulverizaciones.

El documento WO 98/19538 describe, por ejemplo, formulaciones acuosas estables de éster etílico del ácido 3-(N-butilacetamino)-propiónico.

Sin embargo, el uso de repelentes de insectos en altas concentraciones en formulaciones de polvo fino clásicas (que contienen exclusivamente talco en combinación con sílice, PMMA, almidón, estearato de magnesio o mica) por el contrario no es posible. El motivo de ello es que las partículas del polvo fino se pegan entre sí y por consiguiente dificultan mucho la distribución sobre la piel. Tampoco se garantiza que una formulación de este tipo presente una buena eficacia.

El documento WO 95/28410 describe en general formulaciones de polvo fino que contienen material biológicamente activo (entre otros se mencionan repelentes de insectos), así como un alquilpoliglicósido y una sustancia portadora tal como sílice, talco, una zeolita, silicato de magnesio y aluminio, sulfato de calcio, carbonato de magnesio, óxido de magnesio u óxido de aluminio.

El documento CN 86105233 A describe un polvo que repele insectos que contiene calaminas, carbonato de calcio, carbonato de magnesio, estearato de cinc, talco, alcanfor, borneol, aceite de menta, timol, sustancias de perfume y p-mentano-3,8-diol.

5 El documento US 7790202 B1 da a conocer una formulación para la piel en forma de polvo fino, que puede utilizarse entre otros para repeler insectos, que contiene almidón de maíz, óxido de cinc, polvo de menta, de albahaca, de romero y de eucalipto, así como mica de cobre y sílice.

El documento JP 2007-063185 A da a conocer un polvo fino repelente de insectos libre de alcohol que contiene un repelente de insectos seleccionado de *N,N*-dietil-*m*-toluamida y éster etílico del ácido (*N*-butilacetamino)-propiónico, un polvo inorgánico seleccionado de talco, caolín y bentonita, así como un compuesto de ácido silícico.

10 Por tanto, el objetivo de la presente invención era proporcionar una formulación de polvo fino que contiene al menos un repelente de insectos seleccionado de *N,N*-dietil-*m*-toluamida, éster etílico del ácido 3-(*N*-butilacetamino)-propiónico, 1-(1-metilpropoxicarbonil)-2-(2-hidroxietyl)piperidina, aceite de citronela y aceite de andiroba.

Sorprendentemente se ha encontrado ahora que estos repelentes de insectos pueden formularse en formulaciones de polvo fino, cuando contienen hidróxido de carbonato de magnesio.

15 Por tanto, un primer objeto de la presente invención es una formulación de polvo fino que contiene (a) al menos un repelente de insectos seleccionado de *N,N*-dietil-*m*-toluamida, éster etílico del ácido 3-(*N*-butilacetamino)-propiónico, 1-(1-metilpropoxicarbonil)-2-(2-hidroxietyl)piperidina, aceite de citronela y aceite de andiroba y (b) hidróxido de carbonato de magnesio.

20 La 1-(1-metilpropoxicarbonil)-2-(2-hidroxietyl)piperidina se conoce como repelente de insectos y puede obtenerse en el mercado, por ejemplo, con la denominación Bayrepel® de la empresa Lanxess AG (INCI: icaridina o picaridina; IUPAC: éster 2-(2-hidroxietyl)-1-metilpropílico del ácido 1-piperidincarboxílico; CAS 119515-38-7).

25 El éster etílico del ácido 3-(*N*-butilacetamino)-propiónico (sinónimo de éster etílico del ácido 3-(acetil-butyl-amino)-propiónico) (CAS 52304-36-6) es un repelente de insectos conocido, que se comercializa con el nombre comercial IR3535® por la empresa Merck KgaA, Darmstadt. Esta sustancia con sus excelentes propiedades con respecto a la compatibilidad con la piel y la mucosa sin propiedades tóxicas, alergizantes o sensibilizantes se utiliza entre otros en preparaciones cosméticas, para proteger a los seres humanos o a los animales directamente frente a ataques de, por ejemplo, mosquitos o moscas.

La *N,N*-dietil-*m*-toluamida (sinónimo de dietiltoluamida, *N,N*-dietil-3-metilbenzamida) (CAS 134-62-3) se conoce también con la abreviatura DEET y presenta un espectro de acción amplio frente a diferentes insectos.

30 Los repelentes de insectos se utilizan preferiblemente en combinación. A este respecto, puede tratarse, por ejemplo, de una combinación de éster etílico del ácido 3-(*N*-butilacetamino)-propiónico con *N,N*-dietil-*m*-toluamida, de una combinación de éster etílico del ácido 3-(*N*-butilacetamino)-propiónico con 1-(1-metilpropoxicarbonil)-2-(2-hidroxietyl)piperidina o de una combinación de éster etílico del ácido 3-(*N*-butilacetamino)-propiónico con *N,N*-dietil-*m*-toluamida y 1-(1-metilpropoxicarbonil)-2-(2-hidroxietyl)piperidina. Ejemplos adicionales son combinaciones de éster etílico del ácido 3-(*N*-butilacetamino)-propiónico con aceite de citronela y/o con aceite de andiroba.

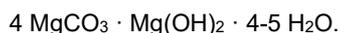
35 En una forma de realización especialmente preferida, en el caso del al menos un repelente de insectos en la formulación de polvo fino se trata de éster etílico del ácido 3-(*N*-butilacetamino)-propiónico.

El hidróxido de carbonato de magnesio se denomina también hidrogenocarbonato de magnesio, carbonato de magnesio básico o hidroxidocarbonato de magnesio. Puede describirse con la fórmula aditiva general



siendo $m=3-5$ y $n=3-8$.

Normalmente se trata de



45 El carbonato de magnesio básico o hidróxido de carbonato de magnesio, con la composición química: $4 \text{ MgCO}_3 \cdot \text{Mg(OH)}_2 \cdot 5 \text{ H}_2\text{O}$ puede producirse a partir de carbonato de magnesio (MgCO_3). El carbonato de magnesio es un polvo blanco, muy difícilmente soluble en agua. Se produce a partir de una disolución acuosa solo cuando esta contiene mucho ácido carbónico en exceso. El carbonato de magnesio puede cristalizar con 5, 3 y 1 mol de agua de cristalización y se descompone durante la cocción con agua progresivamente para dar el carbonato de magnesio básico. Procedimientos correspondientes para la producción se conocen desde hace mucho tiempo. Habitualmente se obtiene hidróxido de carbonato de magnesio mediante precipitación a partir de una disolución de sulfato de magnesio con sosa. En el mercado pueden obtenerse, por ejemplo, productos correspondientes de la empresa Lehmann & Voss & Co.: "PharMagnesia® MC Type E", de Kremer-pigmentos: "Magnesiumhydroxidcarbonat", de

50

Magnesia GmbH: "Magnesia 11", "Magnesia 12", "Magnesia 10" o de Merck KGaA: "Magnesiumhydroxidcarbonat leicht".

5 Según la invención ha demostrado ser ventajoso que el hidróxido de carbonato de magnesio utilizado en la formulación de polvo fino presente una densidad aparente de como máximo aproximadamente 200 g/l, preferiblemente como máximo aproximadamente 150 g/l. Se prefiere especialmente una densidad aparente de menos de 130 g/l.

10 Por densidad aparente (también denominada "peso aparente") se entiende la densidad (es decir la masa por volumen), de un sólido granulado en un fluido, en este caso aire. Según la invención, la densidad aparente se determina de manera correspondiente a la norma ISO 3923/2 con ayuda de un volímetro de Scott: para ello se llena la muestra de manera correspondiente a las normativas con ayuda del embudo mediante el volímetro de Scott a través de varias placas deflectoras en un recipiente cilíndrico con una capacidad de $25 \pm 0,05 \text{ cm}^3$ y un diámetro interno de $30 \pm 1 \text{ mm}$ y se pesa. Se determina la media de las 3 muestras y se indica en g/cm^3 , o g/ml o g/l . Según la invención, por ejemplo, "PharMagnesia® MC Type E", comercializada por la empresa Lehmann & Voss & Co. (número de artículo 24202010-00), con una densidad aparente de aproximadamente 120 g/l, es adecuada de manera excelente para su utilización en la formulación de polvo fino según la invención. También son adecuados el hidróxido de carbonato de magnesio comercializado por Kremer-pigmentos (número de artículo 64135), con una densidad aparente de aproximadamente 100 g/l, Magnesia 11 comercializada por Magnesia GmbH (número de artículo 1110000), con una densidad aparente de aproximadamente 100-150 g/l, Magnesia 10 (número de artículo 1100000) con una densidad aparente de 80-100 g/l, Magnesia 12 (número de artículo 1120000) con una densidad aparente de 65 - 85 g/l o hidróxido de carbonato de magnesio comercializados por Merck KGaA (número de artículo 105828) con una densidad aparente de aproximadamente 110 g/l.

En la presente invención, la formulación de polvo fino contiene del 5 al 20% en peso del al menos un repelente de insectos, con respecto al peso total de la formulación. De manera especialmente preferible, la formulación contiene del 10 al 20% en peso del al menos un repelente de insectos, con respecto al peso total de la formulación.

25 En una forma de realización preferida adicional, la formulación de polvo fino tal como se definió anteriormente contiene del 5 al 40% en peso hidróxido de carbonato de magnesio, con respecto al peso total de la formulación, de manera especialmente preferible del 5 al 30% en peso.

30 Las preparaciones según la invención se caracterizan porque presentan una alta eficacia frente a insectos y aun así tienen una consistencia pulverulenta. Sorprendentemente, mediante el uso de hidróxido de carbonato de magnesio puede evitarse la adhesión de las partículas, de modo que se posibilita la incorporación de altas cantidades de repelente de insectos de hasta el 40%, sin que la formulación se vuelva oleosa o se pegue. De este modo se obtiene una protección muy duradera frente a mosquitos, tábanos, pulgas, piojos, chinches, así como garrapatas, ácaros, avispas, abejas, hormigas, cucarachas o moscas. Las formulaciones se caracterizan además por propiedades cosméticas excelentes, son espolvoreables y pueden aplicarse, por ejemplo, con un pincel o con la mano sobre la piel o el cabello.

En la presente invención, la razón en peso de hidróxido de carbonato de magnesio con respecto a repelente de insectos en la formulación asciende a de 2:1 a 1:1. Preferiblemente, la razón asciende a de 1,5:1 a 1:1.

40 Si el contenido en hidróxido de carbonato de magnesio es demasiado alto, existe la posibilidad de que el repelente de insectos se adsorba demasiado intensamente en las partículas de hidróxido de magnesio y ya no pueda tener lugar una liberación del mismo. De este modo disminuye la eficacia de la formulación. Por el contrario, dado que en el caso de dichos repelentes de insectos se trata de líquidos (aceites), en el caso de un contenido demasiado alto de repelente de insectos puede disminuir la consistencia de polvo fino de la formulación.

45 En el caso de las preparaciones se trata por regla general de preparaciones que pueden emplearse tópicamente, por ejemplo, de una formulación cosmética, farmacéutica o dermatológica o un producto medicinal, de una formulación biocida, un pesticida, un biopesticida o un insecticida. A este respecto, puede tratarse también de una formulación así farmacológica o un fármaco de venta sin receta (preparación OTC ("over the counter")). Las preparaciones contienen en este caso un portador tópica, cosmética o dermatológicamente adecuado y según el perfil de propiedades deseado opcionalmente componentes adecuados adicionales.

50 Además del uso tópico también son posibles usos adicionales. Por ejemplo, en el caso de la preparación puede tratarse de una formulación de uso doméstico.

En el sentido de la presente invención, además del término preparación se usa con el mismo significado también el término agente o formulación.

55 Las preparaciones pueden comprender o contener dichos componentes necesarios u opcionales, estar compuestos esencialmente o estar compuestos de los mismos. Todos los compuestos o componentes, que pueden usarse en las preparaciones, o bien se conocen y pueden adquirirse comercialmente o bien pueden sintetizarse según procedimientos conocidos.

De uso tópico significa en el sentido de la invención que la preparación se usa de manera externa y local, es decir que la preparación tiene que ser adecuada para, por ejemplo, poder aplicarse sobre la piel o el cabello. La preparación según la invención puede aplicarse, por ejemplo, sobre la cara, el cuerpo, los pies o el cabello.

5 Las formulaciones de polvo fino según la invención son adecuadas para el uso no terapéutico en un ser humano o un animal. Preferiblemente, el uso es en el ser humano.

En el caso de la formulación de polvo fino según la invención puede tratarse, por ejemplo, de un polvo fino para la cara, un polvo fino para el cuerpo, un polvo fino para bebés o un polvo fino para los pies. Por tanto, según el propósito de uso, las formulaciones de polvo fino pueden presentar diferentes propiedades, tal como poder de recubrimiento y de adhesión, poder de succión, poder de adsorción o acción antimicrobiana.

10 Estas propiedades pueden conseguirse mediante el uso de determinados componentes de polvo fino. Así se utilizan, por ejemplo, dióxido de silicio, carbonato de magnesio, caolín, creta o almidón, para producir polvos finos, que pueden absorber o bien agua y sustancias hidrófilas o bien sino aceites, grasas o sustancias lipófilas. El dióxido de titanio, el óxido de cinc y la creta se usan para aumentar el poder de recubrimiento y el poder de adhesión de un polvo fino. El poder de adhesión puede mejorarse además mediante almidón, óxido de aluminio, undecanato de cinc o también jabones metálicos. Por lo demás, mediante la utilización de sales de cinc, de magnesio y/o de aluminio del ácido láurico, mirístico y/o esteárico así como mediante decanato de cinc y/o de magnesio o talco se pretende aumentar la capacidad de deslizamiento del polvo fino.

20 Para la aceptación de un polvo fino son de gran importancia, además de las propiedades de recubrimiento y de succión, también las propiedades táctiles. En consecuencia, también desempeña un papel decisivo el tamaño de grano de los sólidos usados, dado que pigmentos demasiado gruesos provocan una "sensación de frenado" y vuelven la piel áspera.

Las formulaciones de polvo fino decorativas contienen además los más diversos pigmentos de color. La selección de los colorantes tiene lugar en primera línea con el propósito de conseguir una tonalidad que esté actualmente de moda.

25 Por tanto, la formulación de polvo fino puede presentar, además de los componentes según la invención, componentes adicionales conocidos por el experto en la técnica.

En una forma de realización ventajosa, el producto de polvo fino presenta al menos uno de los siguientes componentes en forma de polvo: cargas, pigmentos, nácar o mezclas de los mismos.

30 Según sea necesario, a la preparación se le pueden añadirse cargas. Las cargas tienen una influencia positiva sobre la textura y pueden variar las propiedades de producto en cuanto a la finura, uniformidad, háptica, durabilidad y resistencia al sebo. Además, las cargas pueden posibilitar efectos visuales en el producto final.

35 Como cargas pueden utilizarse sustancias inorgánicas, preferiblemente talco, caolín, nitrato de boro, silicatos, en particular zeolitas o silicatos laminares (mica). En el caso de los silicatos laminares se prefiere el uso de moscovita, flogopita, biotita, sericita, lepidolita, paragonita, silicatos laminares sintéticos o mezclas de los mismos. Además pueden utilizarse óxido de cinc, óxido de titanio, óxido de circonio, óxido de cerio, carbonato de magnesio y carbonato de calcio, apatita-(CaOH), vidrio o microcápsulas de cerámica.

40 En el caso de los polímeros orgánicos sintéticos pueden usarse preferiblemente policarbonatos, poliéteres, poliésteres, polietilenos, polipropileno, poli(cloruro de vinilo), poliestirenos, poliamidas, poliuretanos, poliácridatos, polvo de poli-β-alanina o lauril-lisina. Cargas orgánicas preferidas adicionales pueden seleccionarse de politetrafluoroetileno, poli(metacrilatos de metilo), resinas de silicona o elastómeros de silicona, celulosas, almidones o derivados de almidón.

45 En el caso de los productos teñidos pueden utilizarse un gran número de diferentes colorantes, pigmentos de color, pigmentos de brillo perlado o pigmentos de efecto. El experto en la técnica puede seleccionar para el respectivo uso los colorantes o pigmentos adecuados. Estos pueden encontrarse tanto individualmente como en una mezcla así como estar recubiertos mutuamente entre sí, para conseguir diversos efectos de color. Las partículas pueden estar conformadas de diferente manera, tal como, por ejemplo, en forma de esfera, ovalada, de plaquita o de manera irregular, así como en cualquier combinación de las diferentes formas.

50 Los pigmentos de color pueden seleccionarse de pigmentos blancos o coloridos, pigmentos inorgánicos u orgánicos, así como pigmentos recubiertos o no recubiertos. En el caso de los pigmentos inorgánicos se prefiere el uso de dióxido de titanio, dado el caso también recubierto, óxido de circonio, óxido de cinc, óxido de cerio, óxido de hierro (por ejemplo, Fe₂O₃, Fe₃O₄, FeO(OH)), silicatos de aluminio naturales tales como ocre, mica y caolín, arcilla que contiene manganeso tales como tierra de sombra y bol rojo, violeta de manganeso, azul ultramar, verde de óxido de cromo, verde de óxido de cromo hidratado, hidróxido de cromo y azul de Berlín. En el caso de los pigmentos orgánicos pueden utilizarse negro de carbón, FD&C rojo 40, FD&C amarillo 5, FD&C azul 1, D&C verde 5, pinturas de carmín (a partir de cochinillas), así como barnices de colorantes orgánicos con aluminio, bario, calcio, estroncio, circonio o mezclas de dichas sustancias.

55

Para conseguir efectos de color especiales pueden utilizarse además diferentes pigmentos de brillo perlado naturales, tales como, por ejemplo, "plata de pescado" (cristales mixtos de guanina/hipoxantina de escamas de pescado) o "nácar" (conchas molidas). Los pigmentos de brillo perlado pueden seleccionarse además de los pigmentos de brillo perlado blancos, tal como, por ejemplo, mica recubierta con dióxido de titanio o con óxido de cloruro de bismuto (BiOCl).

Además pueden utilizarse pigmentos de brillo perlado coloridos tales como pigmentos de mica de dióxido de titanio con óxidos de hierro, pigmento de mica de dióxido de titanio en particular con azul de Berlín u óxido de cromo y pigmentos e mica de dióxido de titanio con diferentes pigmentos orgánicos, así como pigmentos de brillo perlado monocristalinos, tal como, por ejemplo, óxido de cloruro de bismuto. Por lo demás pueden usarse también polvos metálicos en forma de plaquitas de aluminio, bronce, latón, cobre, plata u oro. Estas listas son solo a modo de ejemplo y de ningún modo concluyentes.

Como componentes en forma de polvo pueden utilizarse en el producto de polvo fino componentes en forma de polvo tanto hidrófobos como hidrófilos o mezclas de los mismos. En el caso del componente en forma de polvo hidrófobo puede tratarse de al menos uno de los siguientes: talco, polvo de polímero hidrófobo, preferiblemente poliamidas, de manera especialmente preferible poliamida 6.6, polvo de polietileno, polvo de polifluor, preferiblemente polímeros de tetrafluoretileno, polvo de silicona o polvo de poliestireno. Como componentes en forma de polvo hidrófobos son adecuados además lipoaminoácidos, tales como, por ejemplo, lauril-lisina y nitruro de boro.

Los componentes en forma de polvo hidrófobos pueden seleccionarse igualmente de componentes en forma de polvo hidrófobos o hidrófilos, que se han recubierto o tratado de manera hidrófoba. Los componentes en forma de polvo recubiertos de manera hidrófoba pueden estar recubiertos preferiblemente con una silicona. Los componentes en forma de polvo pueden recubrirse igualmente con lecitinas o ceras vegetales, tal como cera de carnauba. Igualmente es posible el uso de aminoácidos, derivados de flúor, aceites minerales, polietileno, poliácridatos y/o mezclas de los mismos. En el caso de los componentes recubiertos y/o tratados de manera hidrófoba se prefiere el uso de los siguientes componentes en forma de polvo: mica, silicatos, caolín, óxidos de metal, preferiblemente dióxido de titanio, óxidos de hierro, óxidos de cinc recubiertos y/o tratados de manera hidrófoba y/o mezclas de los mismos.

En una configuración ventajosa adicional, en el caso del componente en forma de polvo hidrófilo en el producto de polvo fino cosmético se trata de al menos uno de los siguientes: mica hidrófila, preferiblemente flogopitas, óxido de cloruro de bismuto, silicatos, polímeros hidrófilos, preferiblemente poliácridatos, poliamidas o poliuretanos, derivados de celulosa o de almidón, caolín, apatita-(CaOH), óxido de cinc, óxido de titanio, carbonato de calcio, carbonato de magnesio, y/o mezclas de los mismos.

Los componentes en forma de polvo pueden hidrofizarse además por medio de diferentes materiales. Entre los componentes en forma de polvo recubiertos y/o tratados de manera hidrófila se prefiere el uso de los siguientes: polvo de poliamida recubierto y/o tratado de manera hidrófila, talco, polvo de polietileno, copolímeros de cloruro de vinilideno-acetonitrilo-(met)acrilato de metilo expandidos, polvo de polifluoro, polvo de silicona, polvo de poliácridato, polvo de poliestireno, pigmentos y mezclas de los mismos, pigmentos orgánicos o inorgánicos hidrófilos.

En una forma de realización preferida, la formulación de polvo fino contiene además uno o varios componentes seleccionados de almidón de cereal, almidón de arroz, almidón de maíz, almidón modificado (por ejemplo, octenilsuccinato aluminico de almidón), mica, mica sintética, nitruro de boro, dióxido de titanio, talco, óxido de aluminio, oxiclорuro de bismuto, PMMA, nailon y sílice. Estos componentes pueden optimizar adicionalmente la capacidad de distribución fácil y homogénea de la formulación de polvo fino según la invención.

Una formulación de polvo fino típica contiene por ejemplo, además del repelente de insectos y el hidróxido de carbonato de magnesio, del 30 al 80% en peso de talco, del 1 al 15% en peso de almidón o mica (mica) y del 1 al 5% en peso de sulfato de magnesio.

En una forma de realización ventajosa adicional, la formulación de polvo fino puede presentar adicionalmente al menos un componente de aceite. A este respecto, el componente de aceite se utiliza como aglutinante. El sistema de aglutinante está compuesto por componentes en su mayoría líquidos, que humectan los componentes en forma de polvo y así le proporcionan al producto de polvo fino compacidad y una cierta cohesión. Los aglutinantes tienen además una gran influencia sobre la sensación de textura. En el caso del componente de aceite se trata preferiblemente de una de las siguientes sustancias o el componente de aceite contiene una o varias de las siguientes sustancias: poli(organo)siloxanos (siliconas), preferiblemente metilciclopilisiloxano, dietilpolisiloxano, metilfenilpolisiloxano, polisiloxano modificado con ácidos grasos, polisiloxano modificado con grupos amino, de manera especialmente preferible metilpolisiloxano y/o dimetilpolisiloxano, aceites de éster, preferiblemente miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, estearato de isopropilo, oleato de isopropilo, estearato de n-butilo, laurato de n-hexilo, oleato de n-decilo, estearato de isoocilo, estearato de isononilo, isononanoato de isononilo, palmitato de 2-etilhexilo, laurato de 2-etilhexilo, estearato de 2-hexildecilo, palmitato de 2-octildodecilo, oleato de oleilo, erucato de oleilo, oleato de erucilo, erucato de erucilo así como mezclas sintéticas, semisintéticas y naturales de tales ésteres, tales como aceite de maíz, aceite de aguacate, aceite de camelia, aceite de oliva, aceite de germen de trigo, aceite

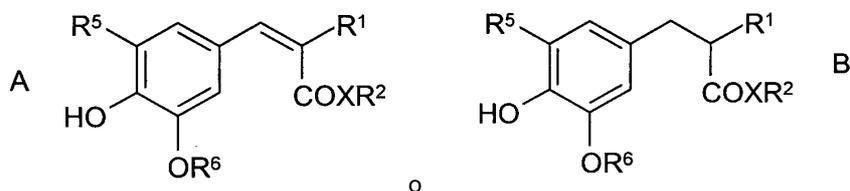
de huesos de albaricoque, aceite de soja, aceite de cacahuete, manteca de cacao y/o aceite de ricino, ceras, preferiblemente ceras animales, ceras vegetales, ceras minerales y/o ceras sintéticas.

La formulación de polvo fino según la invención puede contener en una forma de realización adicional además uno o varios de las siguientes sustancias auxiliares: elementos traza, sustancias calmantes, sustancias tensioactivas, sustancias que retienen la humedad, agentes que restauran el nivel lipídico, grasas, alcoholes, polioles y sus éteres y éteres toxicológicamente compatibles, hidrocarburos ramificados y/o no ramificados, antioxidantes, vitaminas, emulsionantes, estabilizadores, reguladores del valor de pH, bactericidas, sustancias antimicrobianas, agentes enmascarantes, perfumes, siliconas, ceramidas, extractos vegetales, plastificantes, agentes de cohesión, estabilizadores de espumación, agentes espesantes, filtros UV, agentes conservantes, principios activos antienviejecimiento, antiarrugas, anticasma, antiacné, anticelulitis, desodorantes, sustancias activas que aclaran la piel o sustancias autobronceadoras.

La acción protectora de preparaciones frente al estrés oxidativo o frente a la intervención de radicales puede mejorarse cuando las preparaciones contienen uno o varios antioxidantes, no suponiéndole al experto en la técnica ninguna dificultad seleccionar de manera adecuada antioxidantes que actúen de manera rápida o retardada en el tiempo. Como antioxidantes favorables, pero que aun así deben usarse de manera facultativa, pueden usarse todos los antioxidantes adecuados o usuales para aplicaciones cosméticas y/o dermatológicas.

De manera especialmente ventajosa, los antioxidantes se seleccionan del grupo compuesto por 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 lipoico y sus derivados (por ejemplo, ácido dihidrolipoico), aurotioglucosa, propiltiouracilo y otros tioles (por ejemplo, tioredoxina, glutatión, cisteína, cistina, cistamina y sus ésteres glicosílicos, N-acetillico, metílico, etílico, propílico, amílico, butílico y laurílico, palmitoílico, oleílico, gamma-linoleílico, colesterílico y glicerílico) así como sus sales, tiodipropionato de dilaurilo, tiodipropionato de diestearilo, ácido tiodipropiónico y sus derivados (ésteres, éteres, péptidos, lípidos, nucleótidos, nucleósidos y sales) así como compuestos de sulfoximina (por ejemplo, butioninsulfoximinas, monocisteinsulfoximina, butioninsulfonas, penta-, hexa-, heptationinsulfoximina) en dosificaciones compartibles muy pequeñas (por ejemplo, de pmol a $\mu\text{mol/kg}$), además quelantes (de metal) (por ejemplo, ácidos alfa-hidroxigrasos, ácido palmítico, ácido fítico, lactoferrina), alfa-hidroxiácidos (por ejemplo, ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico), ácido húmico, ácido biliar, extractos biliares, bilirrubina, biliverdina, EDTA, EGTA, etilendiaminotetrametilfosfonato de pentasodio y sus derivados, ácidos grasos insaturados y sus derivados (por ejemplo, ácido gamma-linolénico, ácido linoico, ácido oleico), ácido fólico y sus derivados, ubiquinona y ubiquinol y sus derivados, vitamina C y derivados (por ejemplo, palmitato de ascorbilo, fosfato de Mg-ascorbilo, acetato de ascorbilo), tocoferoles y derivados (por ejemplo, acetato de vitamina E), vitamina A y derivados (palmitato de vitamina A) así como benzoato de coniferilo de la resina benzoica, ácido rútico y sus derivados, alfa-glicosilrutina, ácido ferúlico, furfúridenglucitol, carnosina, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, ácido resínico nordihidroguayáquico, ácido nordihidroguayarético, trihidroxibutirolfenona, quercitina, ácido úrico y sus derivados, manosa y sus derivados, cinc y sus derivados (por ejemplo, ZnO, ZnSO₄), selenio y sus derivados (por ejemplo, seleniometonina), estilbenos y sus derivados (por ejemplo, óxido de estilbeno, óxido de trans-estilbeno).

Son antioxidantes adecuados también compuestos de fórmulas A o B



en las que

- R¹ puede seleccionarse el grupo -C(O)CH₃, -CO₂R³, -C(O)NH₂ y -C(O)N(R⁴)₂,
- X O o NH,
- R² alquilo lineal o ramificado con de 1 a 30 átomos de C,
- R³ alquilo lineal o ramificado con de 1 a 20 átomos de C,
- R⁴ en cada caso independientemente entre sí H o alquilo lineal o ramificado con de 1 a 8 átomos de C,
- R⁵ H, alquilo lineal o ramificado con de 1 a 8 átomos de C o alcoxi lineal o ramificado con de 1 a 8 átomos de C y

R⁶ alquilo lineal o ramificado con de 1 a 8 átomos de C,

preferiblemente derivados del ácido 2-(4-hidroxi-3,5-dimetoxibenciliden)-malónico y/o ácido 2-(4-hidroxi-3,5-dimetoxibencil)-malónico, de manera especialmente preferible éster bis-(2-etilhexílico) del ácido 2-(4-hidroxi-3,5-dimetoxibenciliden)-malónico (por ejemplo, Oxynex® ST Liquid) y/o éster bis-(2-etilhexílico) del ácido 2-(4-hidroxi-3,5-dimetoxibencil)-malónico (por ejemplo, RonaCare ® AP).

Mezclas de antioxidantes son igualmente adecuadas para su uso en las preparaciones cosméticas según la invención. Mezclas conocidas y en venta son, por ejemplo, mezclas que contienen como componentes activos lecitina, palmitato de L-(+)-ascorbilo y ácido cítrico, tocoferoles naturales, palmitato de L-(+)-ascorbilo, ácido L-(+)-ascórbico y ácido cítrico (por ejemplo, Oxynex® K LIQUID), extractos de tocoferol de fuentes naturales, palmitato de L-(+)-ascorbilo, ácido L-(+)-ascórbico y ácido cítrico (por ejemplo, Oxynex® L LIQUID), DL- α -tocoferol, palmitato de L-(+)-ascorbilo, ácido cítrico y lecitina (por ejemplo, Oxynex® LM) o butilhidroxitolueno (BHT), palmitato de L-(+)-ascorbilo y ácido cítrico (por ejemplo, Oxynex® 2004). Tales antioxidantes se utilizan con los compuestos según la invención en tales composiciones habitualmente en razones porcentuales en peso en el intervalo de desde 1000:1 hasta 1:1000, preferiblemente en razones porcentuales en peso de desde 100:1 hasta 1:100.

Entre los fenoles, que pueden usarse según la invención, son especialmente interesantes los polifenoles que aparecen parcialmente como sustancias naturales para aplicaciones en el campo farmacéutico, cosmético o alimenticio. Por ejemplo, los flavonoides o bioflavonoides conocidos principalmente como colorantes vegetales presentan con frecuencia un potencial antioxidante. De efectos del patrón de sustitución de mono- y dihidroxiflavonas se encargan K. Lemanska, H. Szymusiak, B. Tyrakowska, R. Zielinski, I.M.C.M. Rietjens; Current Topics in Biophysics 2000, 24(2), 101-108. En este documento se observa que las dihidroxiflavonas con un grupo OH de manera adyacente a la función ceto o grupos OH en la posición 3'4' o 6,7 o 7,8 presentan propiedades antioxidantes, mientras que otras mono- y dihidroxiflavonas parcialmente no presentan propiedades antioxidantes.

Con frecuencia se menciona la quercetina (cianidanol, cianidenolona 1522, meletina, soforetina, ericina, 3,3',4',5,7-pentahidroxiflavona) como antioxidante especialmente eficaz (por ejemplo, C.A. Rice-Evans, N.J. Miller, G. Paganga, Trends in Plant Science 1997, 2(4), 152-159). K. Lemanska, H. Szymusiak, B. Tyrakowska, R. Zielinski, A.E.M.F. Soffers y I.M.C.M. Rietjens (Free Radical Biology&Medicine 2001, 31(7), 869-881 estudian la dependencia del pH de la acción antioxidante de hidroxiflavonas. La quercetina muestra por todo el intervalo de pH la máxima actividad de las estructuras estudiadas.

La cantidad de los antioxidantes mencionados anteriormente (uno o varios compuestos) en las preparaciones según la invención asciende preferiblemente a del 0,001 al 30% en peso, de manera especialmente preferible del 0,05 al 20% en peso, en particular del 0,1 al 10% en peso, con respecto al peso total de la preparación.

Las preparaciones pueden contener como componentes adicionales vitaminas. Se prefieren vitaminas y derivados de vitamina seleccionados de vitamina A, propionato de vitamina A, palmitato de vitamina A, acetato de vitamina A, retinol, vitamina B, cloruro/hidrocloruro de tiamina (vitamina B1), riboflavina (vitamina B2), amida de ácido nicotínico, vitamina C (ácido ascórbico), vitamina D, ergocalciferol (vitamina D2), vitamina E, DL- α -tocoferol, acetato de tocoferol-E, hidrogenosuccinato de tocoferol, vitamina K1, esculina (sustancia activa de vitamina P), tiamina (vitamina B1), ácido nicotínico (niacina), piridoxina, piridoxal, piridoxamina, (vitamina B6), ácido pantoténico, biotina, ácido fólico y cobalamina (vitamina B12), en particular preferiblemente palmitato de vitamina A, vitamina C y sus derivados, DL- α -tocoferol, acetato de tocoferol-E, ácido nicotínico, ácido pantoténico y biotina. Las vitaminas se añaden con los porcentajes habituales en la aplicación cosmética en intervalos de desde el 0,01 hasta el 5,0% en peso, con respecto a peso total.

Las formulaciones mencionadas anteriormente pueden combinarse ventajosamente con todas las sustancias conservantes o sustancias activas antimicrobianas conocidas, tal como, por ejemplo, ácido anísico, alcohol, benzoato de amonio, propionato de amonio, ácido benzoico, bronopol, butilparabeno, cloruro de bencetonio, cloruro de benzalconio, 5-bromo-5-nitro-1,3-dioxano, alcohol bencilico, ácido bórico, bencisotiazolinona, benzotriazol, hemiformiato de bencilo, bencilparabeno, 2-bromo-2-nitropropano-1,3-diol, benzoato de butilo, clorfenesina, capril/capringlicéridos, caprililglicol, extracto de hoja de *Camellia sinensis*, *Candida bombicola*/glucosa/rapeseedato de metilo, cloroxilenol, cloroacetamida, clorhexidina, clorobutanol, benzoato de calcio, parabeno de calcio, propionato de calcio, salicilato de calcio, sorbato de calcio, captano, cloroamina T, diacetato de clorhexidina, digluconato de clorhexidina, dihidrocloruro de clorhexidina, cloroacetamina, p-cloro-m-cresol, clorofeno, p-clorofenol, clorotimol, extracto de fruta de *Citrus grandis* (pomelo), extracto de semilla de *Citrus grandis* (pomelo), m-cresol, o-cresol, p-cresol, cresoles mixtos, 1,2-decanodiol (INCI decilenglicol), diazolidinilurea, alcohol diclorobencilico, dimetiloxazolidina, DMDM hidantoína, dimetilhidroximetilpirazol, ácido dihidroacético, Diazolidinilurea, DEDM hidantoína, dilaurato de DEDM hidantoína, diisotonato de dibromopropamidina, dimetiloletilentiourea, ditiometilbenzamida, DMHF, bromuro de domifeno, 7-etilbicicloxazolidina, etilparabeno, etilhexilglicerina, etanol, ferulato de etilo, formaldehído, ácido ferúlico, caprato de glicerilo, glutaral, formiato de glicerol, glioxal, diisetonato de hexamidina, hexanodiol, hexetidina, hexamidina, hexamidindiparabeno, hexamidinparabeno, ácido 4-hidroxibenzoico, hidroximetildioxazabiciclooctano, imidazolidinilurea, imidiazolidinilurea NF, isobutilparabeno, isotiazolinona, carbamato de yodopropinilbutilo, isodecilparabeno, isopropilcresol, isopropilparabeno, sorbato de isopropilo, sorbato de potasio NF FCC, usnato de cobre, benzoato de potasio, etilparabeno de potasio,

metilparabeno de potasio, parabeno de potasio, fenóxido de potasio, o-fenilfenato de potasio, propionato de potasio, propilparabeno de potasio, salicilato de potasio, sorbato de potasio, metilparabeno, metilisotiazolinona, cloruro de metilbencetonio-fenol, metildibromoglutaronitrilo, cloruro de metenamónio, metilbromoglutaronitrilo, benzoato de magnesio, propionato de magnesio, salicilato de magnesio, MDM hidantoína, benzoato de MEA, o-fenilfenato de MEA, salicilato de MEA, metilcloroistiazolinona, benzoato de sodio NF FCC, caprilato de sodio, deshidroacetato de sodio, deshidroacetato de sodio FCC, hidroximetilglicinato de sodio, metilparabeno de sodio, propilparabeno de sodio, yodato de sodio, aceite de semilla del nimbo de la India, nisina, benzoato de sodio, butilparabeno de sodio, sodio-p-cloro-m-cresol, etilparabeno de sodio, formiato de sodio, hidroximetanosulfonato de sodio, isobutilparabeno de sodio, parabeno de sodio, fenolsulfonato de sodio, fenóxido de sodio, o-fenilfenato de sodio, propionato de sodio, propilparabeno de sodio, piritona de sodio, salicilato de sodio, sorbato de sodio, ortofenilfenol, fenoxietanol, propilparabeno, polimetoxibiclicoxazolidina, extracto de corteza de *Pinus pinaster*, poloxámero 188, PVP-yodo, parabenos, pircotonolaminas, alcohol fenético, poliaminopropilbiguanida, Polyquaternium-42, PEG-5 DEDM hidantoína, PEG-15 DEDM hidantoína, oleato de PEG-5 hidantoína, estearato de PEG-15 DEDM hidantoína, alcohol fenético, fenol, fenoxietilparabeno, fenoxiisopropanol, benzoato de fenilo, acetato de fenilmercurio, benzoato de fenilmercurio, borato de fenilmercurio, bromuro de fenilmercurio, cloruro de fenilmercurio, fenilparabeno, o-fenilfenol, estearato de poliaminopropilbiguanida, ácido propiónico, benzoato de propilo, Quaternium-15, Quaternium-8, Quaternium-14, extracto de hojas de *Rosmarinus officinalis*, ácido sórbico NF FCC, disulfuro de selenio, ácido sórbico, ácido salicílico, borosilicato de plata, fosfato de plata-magnesio-aluminio, triclosán, di-alfa-tocoferol, acetato de tocoferol, timersal, triclocarbán, sorbato de TEA, timerosal, ácido úsnico, undecilenoilo PEG-5 parabeno, extracto de semillas de *Vitis vinifera*, aceite de árbol del té, peróxido de hidrógeno, piritona de cinc, óxido de cinc, fenolsulfonato de cinc o combinaciones de los mismos.

Las preparaciones pueden contener también una o varias sustancias activas antienvjecimiento. Sustancias activas antienvjecimiento adecuadas, en particular para preparaciones de cuidado de la piel, son preferiblemente los denominados solutos compatibles. A este respecto se trata de sustancias, que están implicadas en la osmorregulación de plantas o microorganismos y pueden aislarse de estos organismos. A este respecto, en el término general solutos compatibles se incluyen también los osmolitos descritos en la solicitud de patente alemana DE-A-10133202. Osmolitos adecuados son, por ejemplo, los polioles, compuestos de metilamina y aminoácidos así como en cada caso sus precursores. Por osmolitos se entienden en el sentido de la solicitud de patente alemana DE-A-10133202 en particular sustancias del grupo de los polioles, tales como, por ejemplo, mio-inositol, manitol o sorbitol y/o una o varias de las sustancias osmolíticamente activas mencionadas a continuación: taurina, colina, betaína, fosforilcolina, glicerofosforilcolina, glutamina, glicina, α -alanina, glutamato, aspartato, prolina y taurina. Precursores de estas sustancias son, por ejemplo, glucosa, polímeros de glucosa, fosfatidilcolina, fosfatidilinositol, fosfatos inorgánicos, proteínas, péptidos y ácidos poliamínicos. Los precursores son compuestos, que se transforman mediante etapas metabólicas en osmolitos.

Preferiblemente, según la invención como solutos compatibles se seleccionan sustancias del grupo compuesto por ácidos pirimidinocarboxílicos (tales como ectoína e hidroxiectoína), prolina, betaína, glutamina, difosfoglicerato cíclico, N-acetilornitina, N-óxido de trimetilamina, fosfato de di-mio-inositol (DIP), 2,3-difosfoglicerato cíclico (cDPG), fosfato de 1,1-diglicerina (DGP), glicerato de β -manosil (firoína), β -manosilgliceramida (firoína-A) y/o fosfato de di-manosil-diinositol (DMIP) o un isómero óptico, derivado, por ejemplo, un ácido, una sal o éster de estos compuestos o combinaciones de los mismos.

A este respecto, entre los ácidos pirimidinocarboxílicos pueden mencionarse en particular ectoína (ácido (S)-1,4,5,6-tetrahidro-2-metil-4-pirimidinocarboxílico) e hidroxiectoína (ácido (S,S)-1,4,5,6-tetrahidro-5-hidroxi-2-metil-4-pirimidinocarboxílico) y sus derivados.

Adicionalmente pueden usarse como sustancias activas antienvjecimiento productos de la empresa Merck tales como, por ejemplo, 5,7-dihidroxi-2-metil-cromona, comercializada con el nombre comercial RonaCare®Luremine, Ronacare®Isoquercefin, Ronacare®Tilirosid o Ronacare®Cyclopeptide 5.

Las preparaciones pueden contener también una o varias sustancias activas que aclaran la piel o de manera sinónima sustancias activas despigmentantes o inhibidores de la melanogénesis. Las sustancias activas que aclaran la piel pueden ser en principio todas las sustancias activas conocidas por el experto en la técnica. Ejemplos de compuestos con actividad que aclara la piel son hidroquinona, ácido kójico, arbutina, aloesina, niacinamidas, ácido azelaico, ácido elágico, extracto de morera, fosfato de magnesio-ascorbilo, extracto de raíz de regaliz, emblica, ácido ascórbico o rucinol.

Además, las preparaciones según la invención pueden contener al menos una sustancia autobronceadora como componente adicional. Como sustancias autobronceadoras ventajosas pueden utilizarse, entre otras: 1,3-dihidroxiacetona, glicerolaldehído, hidroximetilgloxal, γ -dialdehído, eritrolosa, 6-aldo-D-fructosa, ninhidrina, 5-hidroxi-1,4-naftoquinona (juglona) o 2-hidroxi-1,4-naftoquinona (lawsona). Se prefiere muy especialmente 1,3-dihidroxiacetona, eritrolosa o su combinación. Preferiblemente, la al menos una sustancia autobronceadora adicional está contenida en la preparación en una cantidad de desde el 0,01 hasta el 20% en peso, de manera especialmente preferible en una cantidad de desde el 0,5 hasta el 15% en peso y de manera muy especialmente preferible en una cantidad de desde el 1 hasta el 8% en peso, con respecto a la cantidad total de la preparación.

Las sustancias que restauran el nivel lipídico pueden seleccionarse, por ejemplo, de aceite de purcelina, Eucerit TM y Neoceht TM.

5 También son favorables aquellas preparaciones, que contienen un filtro UV. A este respecto, puede tratarse de una sustancia de filtro UV-A y/o una sustancia de filtro UV-B. Tales formulaciones pueden contener dado el caso también uno o varios pigmentos inorgánicos como sustancias de filtro UV.

Las preparaciones según la invención pueden contener adicionalmente al menos un filtro UV.

10 Los filtros UV orgánicos, los denominados filtros de protección solar hidrófilos o lipófilos, son eficaz en el rango UVA y/o rango UVB y/o IR y/o rango VIS (absorbedores). Estas sustancias pueden seleccionarse en particular de derivados del ácido cinámico, derivados del ácido salicílico, derivados de alcanfor, derivados de triazina, derivados de acrilato de β,β -difenilo, derivados del ácido p-aminobenzoico así como filtros poliméricos y filtros de silicona, que se describen en la solicitud WO-93/04665. Ejemplos adicionales de filtros orgánicos se indican en la solicitud de patente EP-A 0 487 404. A continuación se mencionan dichos filtros UV en la mayoría de los casos según la nomenclatura INCI.

15 En particular para una combinación son adecuados: el ácido para-aminobenzoico y sus derivados: PABA, etil-PABA, etildihidroxipropil-PABA, etilhexildimetil-PABA, por ejemplo, comercializado con el nombre "Escalol 507" por la empresa ISP, gliceril-PABA, PEG-25 PABA, por ejemplo, comercializado con el nombre "Uvinul P25" por la empresa BASF.

20 Salicilatos: homosalato comercializado con el nombre "Eusolex HMS" por la empresa Merck; salicilato de etilhexilo, por ejemplo, comercializado con el nombre "Neo Heliopan OS" por la empresa Symrise, salicilato de dipropilenglicol, por ejemplo, comercializado con el nombre "Dipsal" por la empresa Scher, salicilato de TEA, por ejemplo, comercializado con el nombre "Neo Heliopan TS" por la empresa Symrise.

Derivados de acrilato de β,β -difenilo: octocrileno, por ejemplo, comercializado con el nombre "Eusolex® OCR" por la empresa Merck, "Uvinul N539" por la empresa BASF, etocrileno, por ejemplo, comercializado con el nombre "Uvinul N35" por BASF.

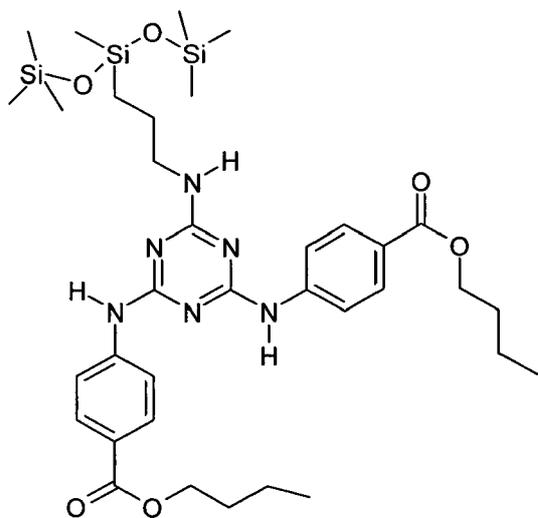
25 Derivados de benzofenona: benzofenona-1, por ejemplo, comercializada con el nombre "Uvinul 400"; benzofenona-2, por ejemplo, comercializada con el nombre "Uvinul D50"; benzofenona-3 u oxibenzona, por ejemplo, comercializada con el nombre "Uvinul M40"; benzofenona-4, por ejemplo, comercializada con el nombre "Uvinul MS40"; benzofenona-9, por ejemplo, comercializada con el nombre "Uvinul DS-49" por la empresa BASF, benzofenona-5, benzofenona-6, por ejemplo, comercializada con el nombre "Helisorb 11" por la empresa Norquay, benzofenona-8, por ejemplo, comercializada con el nombre "Spectra-Sorb UV-24" por la empresa American Cyanamid, n-hexil-2-(4-dietilamino-2-hidroxi-benzoil)benzoatos de benzofenona-12 o 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona, comercializada por la empresa Merck, Darmstadt con el nombre Eusolex® 4360.

35 Derivados de bencilidenalcanfor: 3-bencilidenalcanfor, por ejemplo, comercializado con el nombre "Mexoryl SD" por la empresa Chimex, 4-metilbencilidenalcanfor, por ejemplo, comercializado con el nombre "Eusolex 6300" por la empresa Merck, ácido bencilidenalcanforsulfónico, por ejemplo, comercializado con el nombre "Mexoryl SL" por la empresa Chimex, metosulfato de alcanforbenzalconio, por ejemplo, comercializado con el nombre "Mexoryl SO" por la empresa Chimex, ácido tereftalilidialcanforsulfónico, por ejemplo, comercializado con el nombre "Mexoryl SX" por la empresa Chimex, poliacrilamidometilbencilidenalcanfor comercializado con el nombre "Mexoryl SW" por la empresa Chimex.

40 Derivados de fenilbencimidazol: ácido fenilbencimidazolsulfónico, por ejemplo, comercializado con el nombre "Eusolex 232" por la empresa Merck, fenilbencimidazoltetrasulfonato de disodio, por ejemplo, comercializado con el nombre "Neo Heliopan AP" por la empresa Symrise.

45 Derivados de fenilbenzotriazol: trisiloxano de drometrizol, por ejemplo, comercializado con el nombre "silatrizol" por la empresa Rhodia Chimie, metilen-bis(benzotriazolil)tetrametilbutilfenol en forma sólida, por ejemplo, comercializado con el nombre "MIXXIM BB/100" por la empresa Fairmount Chemical, o en forma micronizada como dispersión acuosa, por ejemplo, comercializada con el nombre "Tinosorb M" por la empresa BASF.

50 Derivados de triazina: etilhexiltriazona, por ejemplo, comercializada con el nombre "Uvinul T150" por la empresa BASF, dietilhexilbutamidotriazona, por ejemplo, comercializada con el nombre "Uvasorb HEB" por la empresa Sigma 3V. Derivados de triazina adicionales son a modo de ejemplo 2,4,6-tris(diisobutil-4'-aminobenzalmalonato)-s-triazina, o 2,4,6-tris-(bifenil)-1,3,5-triazina, 4-({4-[(4-(butoxicarbonil)fenil)amino]-6-[(3-{1,3,3-tetrametil-1-[(trimetilsilil)oxi]disiloxanil)propil]amino]-1,3,5-triazin-2-il)amino]benzoato de butilo, comercializado con el nombre Mexoryl SBS. Estructura de Mexoryl SBS:



así como bis-etilhexiloxifenolmetoxifeniltriazina, por ejemplo, comercializada con el nombre Tinosorb S por la empresa BASF.

- 5 Derivados de antranilina: antranilato de mentilo, por ejemplo, comercializado con el nombre "Neo Heliopan MA" por la empresa Symrise.

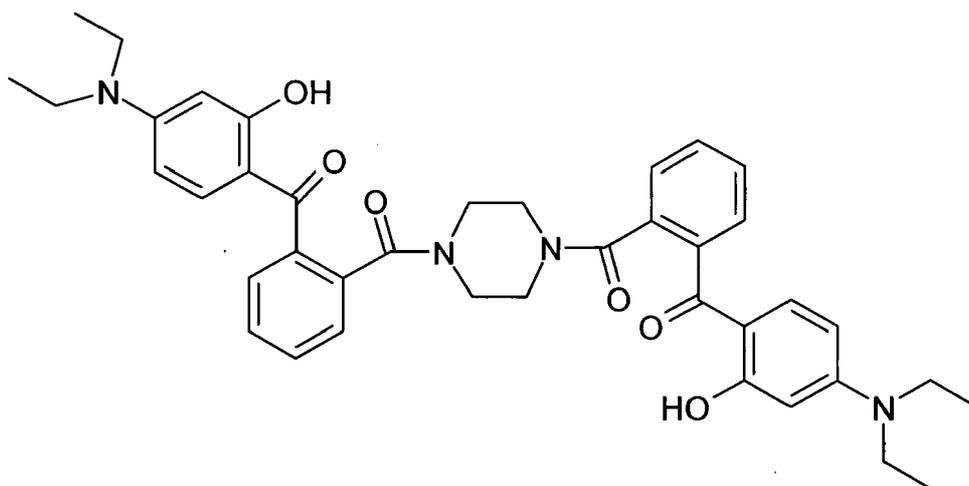
Derivados de imidazol: propionato de etilhexildimetoxibencilidendioxoimidazolina.

Derivados de benzalmalonato: poliorganosiloxanos que contienen grupos benzalmalonato funcionales, tal como, por ejemplo, polisilicona-15, por ejemplo, comercializada con el nombre "Parsol SLX" por Hoffmann LaRoche.

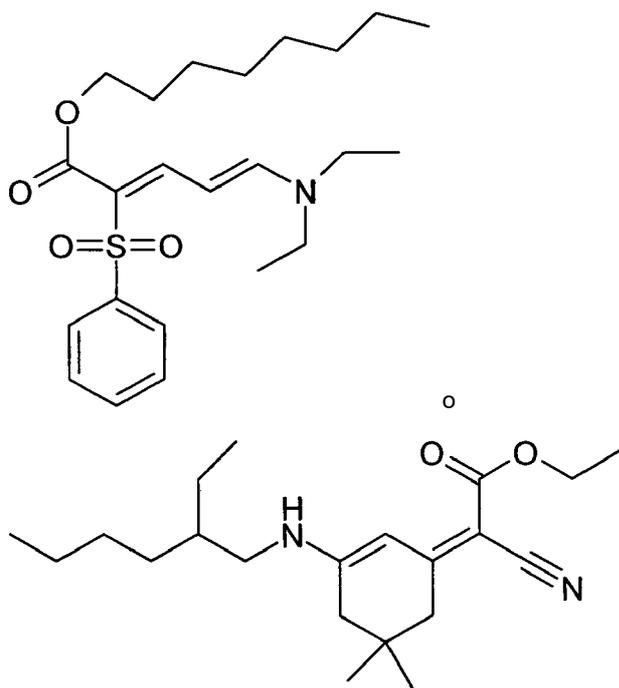
Derivados de 4,4-diarilbutadieno: 1,1-dicarboxi(2,2'-dimetilpropil)-4,4-difenilbutadieno.

- 10 Derivados de benzoxazol: 2,4-bis[5-(1-dimetilpropil)benzoxazol-2-il(4-fenil)imino]-6-(2-etilhexil)imino-1,3,5-triazina, por ejemplo, comercializada con el nombre Uvasorb K2A por la empresa Sigma 3V y mezclas que la contiene.

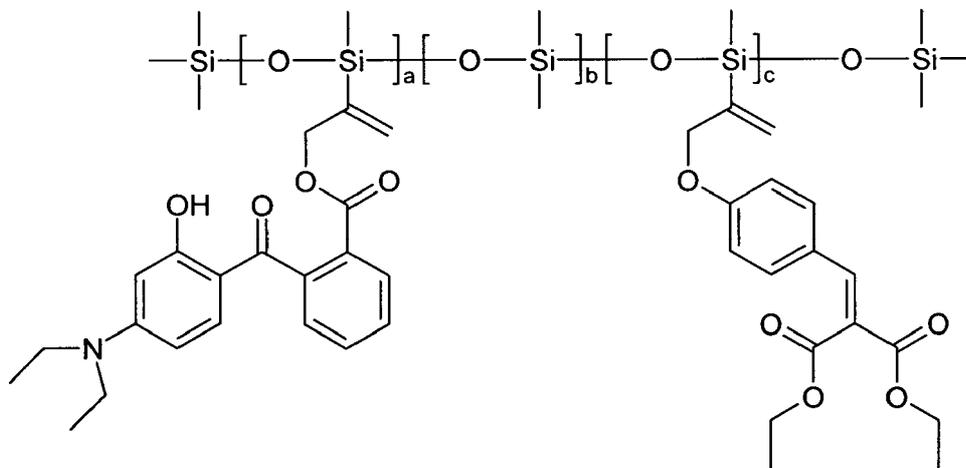
Derivados de piperazina, tal como, por ejemplo, el compuesto



o los filtros UV de las siguientes estructuras



También pueden usarse filtros UV a base de copolímeros de polisiloxano con una distribución estadística según la siguiente fórmula, siendo, por ejemplo, a = 1,2; b= 58 y c=2,8:



5

Los compuestos expuestos en la lista deben interpretarse solo como ejemplos. Naturalmente pueden usarse también otros filtros UV.

10 Las sustancias que protegen frente a UV orgánicas adecuadas deben seleccionarse preferiblemente de la siguiente lista: salicilato de etilhexilo, ácido fenilbencimidazolsulfónico, benzofenona-3, benzofenona-4, benzofenona-5, 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil)benzoato de n-hexilo, 4-metilbencilidenalcanfor, ácido tereftalididendialcanforsulfónico, fenildibencimidazoltetrasulfonato de disodio, metilen-bis(benzotriazolil)tetrametilbutilfenol, etilhexiltriazona, dietilhexilbutamidotriazona, trisiloxano de drometrizol, polisilicona-15, 1,1-dicarboxi(2,2'-dimetilpropil)-4,4-difenilbutadieno, 2,4-bis[5-(dimetilpropil)benzoxazol-2-il(4-fenil)imino]-6-(2-etilhexil)imino-1,3,5-triazina y mezclas de los mismos.

15 Estos filtros UV orgánicos se incorporan por regla general en una cantidad de desde el 0,01 por ciento en peso hasta el 20 por ciento en peso, preferiblemente el 1% en peso - 10% en peso, en las formulaciones.

Las preparaciones pueden contener, además de los filtros UV dado el caso orgánicos, tal como se ha descrito anteriormente, filtros UV inorgánicos adicionales, los denominados filtros UV particulados.

20 Estas combinaciones con filtros UV particulados son posibles tanto como polvo como como dispersión o pasta e los siguientes tipos.

A este respecto se prefieren tanto aquellos del grupo de los dióxido de titanio tal como, por ejemplo, dióxido de titanio recubierto (por ejemplo, Eusolex® T-2000, Eusolex®T-AQUA, Eusolex®T-AVO, Eusolex®T-OLEO), óxidos de cinc (por ejemplo, Sachtotec®), óxidos de hierro o también óxidos de cerio y/u óxidos de circonio.

5 Además, también son posibles combinaciones con óxido de cinc o dióxido de titanio pigmentario, siendo el tamaño de partícula de estos pigmentos mayor o menor de 200 nm, por ejemplo, Hombitan® FG o Hombitan® FF-Pharma.

10 Además puede preferirse que las preparaciones contengan filtros UV inorgánicos, que se trataron posteriormente con métodos habituales, tal como se describe, por ejemplo, en Cosmetics & Toiletries, febrero de 1990, vol. 105, págs. 53 64. A este respecto, pueden seleccionarse uno o varios de los siguientes componentes de tratamiento posterior: aminoácidos, cera de abejas, ácidos grasos, alcoholes de ácidos grasos, tensioactivos aniónicos, lecitina, fosfolípidos, sales de sodio, de potasio, de cinc, de hierro o de aluminio de ácidos grasos, polietilenos, siliconas, proteínas (especialmente colágeno o elastina), alcanolaminas, dióxido de silicio, óxido de aluminio, óxidos de metal adicionales, fosfatos, tal como hexametáfosfato de sodio, o glicerina.

A este respecto, filtro UV particulados utilizados preferiblemente son:

- 15 - dióxidos de titanio no tratados posteriormente, tal como, por ejemplo, los productos Microtitanium Dioxide MT 500 B de la empresa Tayca; Titandioxd P25 de la empresa Evonik,
- dióxidos de titanio micronizados tratados posteriormente con óxido de aluminio y dióxido de silicio, tratamiento posterior tal como, por ejemplo, el producto "Microtitanium Dioxide MT 100 SA de Tayca; o el producto "Tioveil Fin" de la empresa Uniqema,
- 20 - dióxidos de titanio micronizados tratados posteriormente con óxido de aluminio y/o estearato/laurato de aluminio, tratamiento posterior tal como, por ejemplo, Microtitanium Dioxide MT 100 T de la empresa Tayca, Eusolex T-2000 de la empresa Merck,
- dióxidos de titanio micronizados tratados posteriormente con óxido de hierro y/o estearato de hierro, tratamiento posterior tal como por ejemplo, el producto "Microtitanium Dioxide MT 100 F" de la empresa Tayca,
- 25 - dióxidos de titanio micronizados tratados posteriormente con dióxidos de silicio, óxido de aluminio y silicona, tratamiento posterior tal como, por ejemplo, el producto "Microtitanium Dioxide MT 100 SAS", de la empresa Tayca,
- dióxidos de titanio micronizados tratados posteriormente con hexametáfosfato de sodio, tal como, por ejemplo, el producto "Microtitanium Dioxide MT 150 W" de la empresa Tayca,
- 30 - dióxidos de titanio micronizados tratados posteriormente con óxido de aluminio y dióxido de manganeso, tratamiento posterior tal como, por ejemplo, el producto "Eusolex T-PRO" de la empresa Merck,

Los dióxidos de titanio micronizados tratados utilizados para la combinación pueden también estar tratados posteriormente con:

- octiltrimetoxisilano; tal como, por ejemplo, el producto "Tego Sun T 805" de la empresa Degussa,
- 35 - dióxido de silicio; tal como, por ejemplo, el producto Parsol "T-X" de la empresa DSM,
- óxido de aluminio y ácido esteárico; tal como, por ejemplo, el producto "UV-Titan M160" de la empresa Sachtleben,
- aluminio y glicerina; tal como, por ejemplo, el producto "UV-Titan 212" de la empresa Sachtleben
- 40 - aluminio y aceites de silicona, tal como, por ejemplo, el producto "UV-Titan M262" de la empresa Sachtleben,
- hexametáfosfato de sodio y polivinilpirrolidona,
- polidimetilsiloxano, tal como, por ejemplo, el producto "70250 Cardre UF TiO2Si3" de la empresa Cardre,
- polidimetilhidrogenosiloxano, tal como, por ejemplo, el producto "Microtitanium Dioxide USP Grade hydrophobic" de la empresa Color Techniques,
- 45 - dióxido de silicio y fosfato de cetilo, tal como, por ejemplo, el producto Eusolex T-EASY de la empresa Merck.

Además puede resultar ventajosa también la combinación con los siguientes productos:

- óxidos de cinc no tratados, tales como, por ejemplo, el producto Z-Cote de la empresa BASF (Sunsmart), Nanox de la empresa Elementis
- óxidos de cinc tratados posteriormente, tales como, por ejemplo, los siguientes productos:
 - 5 • “Zinc Oxide CS-5” de la empresa Toshiba (ZnO tratado posteriormente con polimetilhidrogenosiloxano)
 - Nanogard Zinc Oxide FN de la empresa Nanophase Technologies
 - “SPD-Z1” de la empresa Shin-Etsu (ZnO tratado posteriormente con un polímero acrílico injertado con silicona, dispersado en ciclodimetilsiloxano)
 - 10 • “Escalol Z100” de la empresa ISP (ZnO tratado posteriormente con óxido de aluminio dispersado en una mezcla de copolímero de metoxicinamato de etilhexilo/PVP-hexadeceno/meticona)
 - “Fuji ZNO-SMS-10” de la empresa Fuji Pigment (ZnO tratado posteriormente con dióxido de silicio y polimetilsilsequioxano);
 - micropigmento de óxido de cerio no tratado, por ejemplo, con la denominación “Colloidal Cerium Oxide” de la empresa Rhone Poulenc
 - 15 • óxidos de hierro no tratados y/o tratados posteriormente con la denominación Nanogar de la empresa Arnaud.

20 A modo de ejemplo pueden utilizarse también mezclas de diferentes óxidos de metal, tales como, por ejemplo, dióxido de titanio y óxido de cerio con y sin tratamiento posterior, tal como, por ejemplo, el producto Sunveil A de la empresa Ikeda. Además pueden usarse también mezclas de óxido de aluminio, dióxido de silicio y dióxido de titanio tratado posteriormente con silicona, mezclas de óxido de cinc tal como, por ejemplo, el producto UV-Titan M261 de la empresa Sachtleben.

Estos filtros UV inorgánicos se incorporan por regla general en una cantidad de desde el 0,1 por ciento en peso hasta el 25 por ciento en peso, preferiblemente el 2% en peso - 10% en peso, a las preparaciones.

25 Mediante la combinación de uno o varios de dichos compuestos con acción de filtro UV puede optimizarse la acción protectora frente a las influencias nocivas de la radiación UV.

Todos los filtros UV mencionados pueden utilizarse también en forma encapsulada. En particular resulta ventajoso utilizar filtros UV orgánicos en forma encapsulada.

30 A este respecto, las cápsulas están contenidas en preparaciones que deben utilizarse según la invención preferiblemente en cantidades tales que garantizan que los filtros UV encapsulados se encuentran en las razones en tanto por ciento en peso indicadas anteriormente en la preparación.

A este respecto, al experto en la técnica no le supone ninguna dificultad seleccionar los componentes adicionales adecuados para el respectivo propósito de uso del polvo fino según la invención, así como determinar la cantidad adecuada.

35 En el caso de la formulación de polvo fino según la invención puede tratarse tanto de un producto de polvo fino comprimido como uno suelto. La formulación también puede encontrarse como aerosol de polvo fino.

También es objeto de la presente invención un procedimiento para la producción de una formulación de polvo fino tal como se ha descrito anteriormente, caracterizado porque el al menos un repelente de insectos se mezcla con el hidróxido de carbonato de magnesio y los componentes dado el caso adicionales, tal como se ha descrito anteriormente.

40 Dichos componentes de la preparación pueden incorporarse de la manera habitual, con ayuda de técnicas que el experto en la técnica conoce ampliamente. Normalmente se mezclan en primer lugar los componentes de polvo fino individuales con herramientas de mezclado o máquinas de mezclado de polvo adecuadas, hasta que se produce una mezcla homogénea. Para ello es adecuado, por ejemplo, un mecanismo agitador con un agitador de hélice o un molino, por ejemplo, un molino de cuchillas, molino de rotor, molino de bolas o molino de mortero o instalaciones de mezclado a contracorriente o mezcladora de chorro giratorio. A continuación se añade el repelente de insectos y se sigue agitando hasta que está distribuido homogéneamente en la mezcla.

45 Un objeto adicional de la presente invención es también el uso de una formulación de polvo fino tal como se describió anteriormente para repeler insectos.

50 Para su uso se aplican las formulaciones de polvo fino según la invención en una cantidad suficiente de la manera habitual para productos tópicos sobre la piel o el cabello.

Figuras:

La figura 1a muestra la primera etapa de la prueba para la distribución de polvo fino según el ejemplo 2: las formulaciones de polvo fino que deben someterse a prueba se colocan en pequeños montones sobre una cartulina sobre una báscula de precisión.

- 5 La figura 1b muestra la segunda etapa de la prueba para la distribución de polvo fino según el ejemplo 2: los montones se distribuyeron con el dedo con una presión uniforme a lo largo de un trayecto de 20 cm.

Los siguientes ejemplos pretenden ilustrar la presente invención:

Ejemplos:**Ejemplo 1: Producción del polvo fino**

- 10 Los componentes del polvo fino individuales (véanse la tabla 2, tabla 3 y tabla 4) se mezclan con ayuda de un molino de cuchillas GM 200 de la empresa Retsch dos veces a 8000 rpm durante 15 s. Entre cada mezclado se vacía el recipiente con el polvo fino sobre un papel y se vierte de nuevo al recipiente de mezclado. El repelente de insectos se añade gota a gota al recipiente de mezclado; se mezcla tres veces más a 8000 rpm durante en cada caso 15 s.

Tabla 1: Materiales y fuentes de suministro:

Nombre	INCI	Número de artículo	Fuente de suministro
IR3535® (éster etílico del ácido 3-(N-butilacetamino)-propiónico)	BUTILACETILAMINOPROPIONATO DE ETILO	111887	Merck KGaA
Pardeck® LUB Talc	TALCO	108070	Merck KGaA
Maisita Natural	ALMIDÓN DE ZEA MAYS (MAÍZ)	9083	Agrana
Covabead PMMA	POLI(METACRILATO DE METILO)		Sensient
Magnesiumhydroxydcarbonate Schwer (densidad aparente >400 g/l)	CARBONATO DE MAGNESIO	105829	Merck Millipore
PharMagnesia MC Type E (densidad aparente aproximadamente 120 g/l)	CARBONATO DE MAGNESIO	24202010-00	Lehmann& Voss&Co
Reisita Natural	ALMIDÓN DE OROZA SATIVA	9094	Agrana almidón GmbH
Pardeck® LUB MST	ESTEARATO DE MAGNESIO	100663	Merck KGaA
Polietilenglicol 400	PEG-8	817003	Merck KGaA
Arlamol PS15E	ESTEARIL ÉTER DE PPG-15		Croda GmbH
Etanol 96%	ALCOHOL	100971	Merck KGaA
Polietilenglicol 1500	PEG-32	817005	Merck KGaA
Tween 20	POLISORBATO 20	817072	Merck KGaA
RonaFlair® Mica M	MICA	104750	Merck KGaA
Magnesia® 12	CARBONATO DE MAGNESIO	1120000	Magnesia GmbH
RonaFlair® Soft Sphere	FLUOROFLOGOPITA SINTÉTICA	117756	Merck KGaA
RonaFlair® ESQ	OXICLORURO DE BISMUTO	117061	Merck KGaA
RonaFlair® Boroneige® SF-15	NITRURO DE BORO	117778	Merck KGaA

RonaFlair® White Sapphire	ZAFIRO SINTÉTICO	117751	Merck KGaA
Orgasol® 2002 D NAT COS	NAILON-12		Arkema

Ejemplo 2: Evaluación de la distribución de polvo fino

Materiales usados:

- 5 - báscula de precisión MSE4202S-0CE-D0 de Sartorius AG
- báscula de análisis MSA324S-0CE-DU de Sartorius AG
- cartulina de 300 g/m² de Ludwig Bähr GmbH & Co. KG (n.º de art.: 3774690)

Realización:

- 10 La cartulina se fija sobre la báscula de precisión con cinta adhesiva de doble cara. Se aplican 30,0 ± 3 mg de polvo fino en forma de un montón pequeño sobre el papel. Se anota la cantidad usada exactamente (figura 1a).

Se presiona el dedo índice con de 200 a 250 g de peso sobre el montón de polvo fino (el peso se controla sobre la báscula de precisión) y se desplaza uniformemente por un tramo de 20 cm. El resultado se muestra en la figura 1b. La cantidad de material, que no queda sobre el tramo de 20 cm se pasa cuantitativamente a una navecilla de pesaje y se pesa. Se anota la cantidad.

- 15 El procedimiento se repite para cada muestra al menos tres veces.

El cociente del material que queda sobre los 20 cm con el material utilizado originariamente describe la capacidad de distribución del polvo fino y se expresa en % (abrasión) (véanse tabla 2 y la tabla 3). Cuanto mayor sea la abrasión, mejor será la distribución de la formulación sobre la piel. Las formulaciones con poca abrasión no pueden distribuirse sobre la piel, dado que las partículas de estas formulaciones se pegan entre sí.

- 20 Se sometieron a prueba las formulaciones A a G. Las formulaciones A, B y C representan formulaciones de polvo fino clásicas como formulaciones comparativas (tabla 2). Son formulaciones según la invención las formulaciones D, E, F y G (tabla 3).

Tabla 2: Formulaciones comparativas

Material		A	B	C
IR 3535	BUTILACETILAMINOPROPIONATO DE ETILO	20%	20%	20%
Pardeck® LUB Talc	TALCO	80%		
Maisita Natural	ALMIDÓN DE ZEA MAYS (MAÍZ)		80%	
Covabead PMMA	POLI(METACRILATO DE METILO)			80%
Suma		100,0%	100,0%	100,0%
Abrasión en %		23,5%	52,7%	45,8%

- 25 La formulación A representa una formulación usual compuesta principalmente por talco. Esta presenta una abrasión reducida y no puede distribuirse sobre la piel. Sustancias usuales que se utilizan para hacer que las formulaciones sean de polvo más fino, para que estas puedan distribuirse mejor sobre la piel, son, por ejemplo, almidón o PMMA. Las formulaciones B o C muestran una abrasión algo mayor, pero demasiado reducida para poder distribuirse bien sobre la piel.

Tabla 3:

Material		D	E	F	G
Pardeck® LUB Talc	TALCO	30,00	30,00	48,00	47,00
Magnesiumhydroxydcarbonate Schwer (densidad aparente >400 g/l)	CARBONATO DE MAGNESIO	28,00			
PharMagnesia MC Type E (densidad aparente aproximadamente 120 g/l)	CARBONATO DE MAGNESIO		28,00	10,00	25,00
Reisita Natural	ALMIDÓN DE OROZA SATIVA	19,00	19,00	19,00	5,00
Pardeck® LUB MST	ESTEARATO DE MAGNESIO	3,00	3,00	3,00	3,00
IR 3535	BUTILACETILAMINOPROPIONATO DE ETILO	20,00	20,00	20,00	20,00
Suma		100,00	100,00	100,00	100,00
Abrasión en %		37,2%	87,7%	35,6%	68,8%

En el caso de las formulaciones D y F se trata de formulaciones comparativas no según la invención. Sorprendentemente, la utilización de hidróxido de carbonato de magnesio en las formulaciones muestra un claro aumento de la abrasión.

5

Ejemplo 3: Estudio de eficacia *in vivo* para determinar la eficacia de los polvos finos frente a mosquitos

Realización:

i. Prueba de idoneidad

- a) Mosquitos: *Aedes albopictus*, hembras no alimentadas con sangre, 3 - 5 días tras la eclosión.
- b) Temperatura ambiente: 25°C - 26°C
- c) Humedad del aire: 60% - 65%
- d) Balanza de análisis: BP110S de Sartorius AG
- e) Cronómetro: SJ9-2 de Jinqe

10

Al menos 300 mosquitos se encuentran en una jaula con las dimensiones: longitud = 400 mm, anchura = 300 mm y altura = 300 mm. Las personas de prueba con un guante de prueba, que deja 16 cm² (4 cm x 4 cm) de la piel del dorso de la mano sin proteger, ponen su mano durante 2 min en la jaula.

15

Cuando más de 30 mosquitos se posaron sobre la piel expuesta, la persona de prueba y los mosquitos se consideraban adecuados para la prueba. Se seleccionan 4 personas de prueba adecuadas (2 hombres y 2 mujeres) para la prueba.

20

ii. Dosis del polvo fino: 1,5 mg/cm²

Se aplica una cantidad total de 37,5 mg del polvo fino sobre una superficie de 25 cm² (5 cm x 5 cm).

iii. Realización de la prueba:

El polvo fino de prueba se aplica en cada caso uniformemente sobre el dorso de la mano (5 cm x 5 cm) de una mano de cada persona de prueba en una dosis de 1,5 mg/cm².

25

La otra mano sirve como comparación. Dos horas tras la aplicación de los polvos, las personas de prueba mantienen sus brazos en la jaula. A este respecto llevan puesto el guante de prueba, dejando este al descubierto la zona en la que se aplicó el polvo fino.

Durante dos minutos se observa si los mosquitos se posan sobre las zonas abiertas y chupan la sangre.

Este modo de proceder se repite cada hora hasta que un mosquito, durante los dos minutos de tiempo de observación, se posa sobre la piel y succiona sangre. La expresión "eficacia *in vivo*" indica cuánto tiempo hay protección frente a los mosquitos para las respectivas formulaciones, es decir cuánto tiempo se tarda en que el primer mosquito se pose sobre la piel y succione sangre. El valor indicado se determina a partir del valor medio de la determinación de tiempo de protección de los cuatro sujetos de prueba.

5

iv. Muestras sometidas a prueba:

Se someten a prueba las formulaciones según la invención E, G, H, I y J (véase la tabla 4; la producción tiene lugar según el ejemplo 1).

Como control positivo sirve una pulverización repelente de insectos de la siguiente formulación:

Componentes	INCI	[%]
A		
IR3535®	BUTILACETILAMINOPROPIONATO DE ETILO	20,00
Polietilenglicol 400	PEG-8	5,00
Arlamol PS15E	ESTEARIL ÉTER DE PPG-15	3,00
B		
Etanol 96%	ALCOHOL	35,00
Polietilenglicol 1500	PEG-32	4,00
Tween 20	POLISORBATO 20	1,50
Agua	AGUA	31,50

10

La fase A y B se mezclan por separado. La fase B se vierte lentamente a la fase A y se agita la mezcla hasta que se produce una mezcla homogénea y clara (pH (21°C)=6,70).

Resultado:

El resultado de la prueba se expone en la tabla 4. Para el control positivo se obtiene una eficacia *in vivo* de 4,5 horas.

15

Tabla 4:

Material		E	G	H	I	J
Parteck® LUB Talc	TALCO	30,00	47,00	42,00	57,00	72,00
PharMagnesia MC Type E	CARBONATO DE MAGNESIO	28,00	25,00	25,00	20,00	10,00
Reisita Natural	ALMIDÓN DE OROZA SATIVA	19,00	5,00		5,00	5,00
Parteck® LUB MST	ESTEARATO DE MAGNESIO	3,00	3,00	3,00	3,00	3,00
RonaFlair® Mica M	MICA			10,00		
IR 3535	BUTILACETILAMINOPROPIONATO DE ETILO	20,00	20,00	20,00	15,00	15,00
Suma		100,00	100,00	100,00	100,00	100,00
Eficacia <i>in vivo</i>		2,3 h	3,8 h	2,8 h	3,5 h	2,5 h

La formulación G muestra que una menor concentración de hidróxido de carbonato de magnesio y almidón puede prolongar la eficacia. Las formulaciones I y J muestran la dependencia de la concentración de IR 3535 y de la duración de la eficacia.

Ejemplo 4: Ejemplos de formulación

5 Tabla 5:

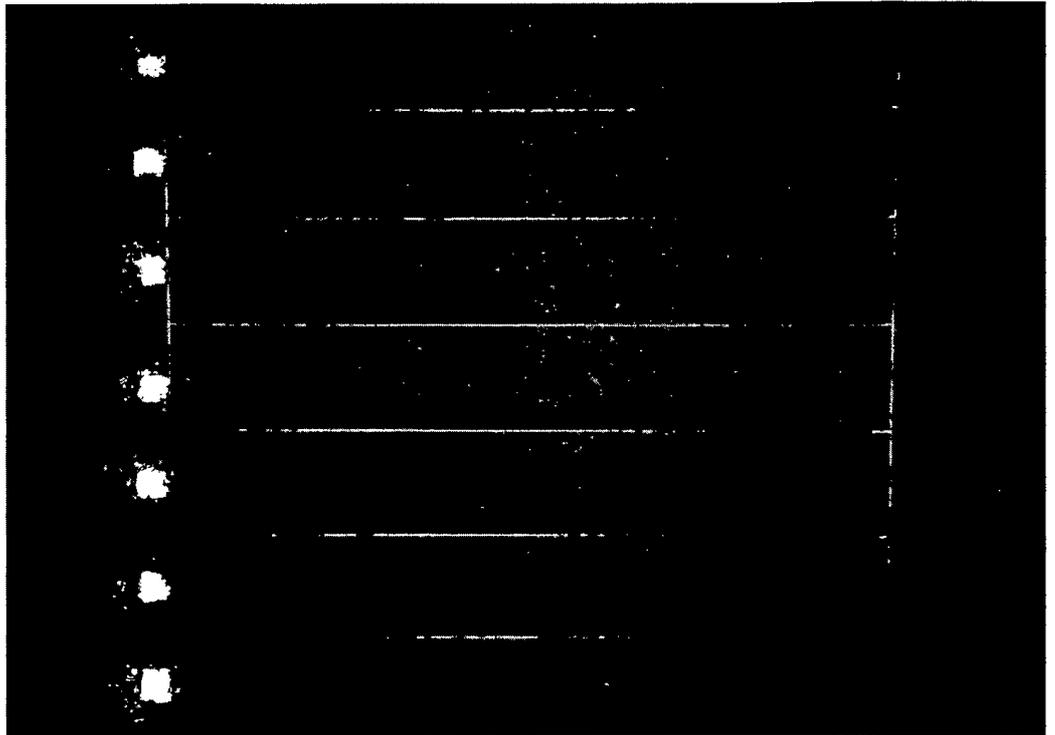
Material		1	2	3	4	5	6	7
Parteck® LUB Talc	TALCO	70,00	60,00	85,00	65,00	65,00	50,00	55,00
PharMagnesi a MC Type E	CARBONATO DE MAGNESIO	20,00	10,00				20,00	
Magnesia® 12	CARBONATO DE MAGNESIO			5,00	10,00	15,00		15,00
RonaFlair® Soft Sphere	FLUOROFLOGOPITA SINTÉTICA		10,00					
RonaFlair® ESQ	OXICLORURO DE BISMUTO					5,00		
RonaFlair® Boroneige® SF-15	NITRURO DE BORO						10,00	
RonaFlair® White Sapphire	ZAFIRO SINTÉTICO							10,00
Orgasol® 2002 D NAT COS	NAILON-12				5,00			
IR 3535	BUTILACETILAMINOPROPIONAT O DE ETILO	10,00	20,00	10,00	20,00	15,00	20,00	20,00
Suma		100,0 0						

REIVINDICACIONES

- 5 1. Formulación de polvo fino que contiene (a) al menos un repelente de insectos seleccionado de N,N-dietil-m-toluamida, éster etílico del ácido 3-(N-butilacetamino)-propiónico, 1-(1-metilpropoxycarbonil)-2-(2-hidroxi-etil)piperidina, aceite de citronela y aceite de andiroba y (b) hidróxido de carbonato de magnesio, presentando el hidróxido de carbonato de magnesio una densidad aparente de como máximo aproximadamente 200 g/l, ascendiendo la razón en peso de hidróxido de carbonato de magnesio con respecto a repelente de insectos en la formulación a de 2:1 a 1:1 y conteniendo la formulación del 5 al 20% en peso, con respecto al peso total de la formulación, del al menos un repelente de insectos.
- 10 2. Formulación de polvo fino según la reivindicación 1, caracterizada porque el al menos un repelente de insectos es éster etílico del ácido 3-(N-butilacetamino)-propiónico.
3. Formulación de polvo fino según la reivindicación 1 o 2, caracterizada porque la formulación contiene del 10 al 20% en peso, con respecto al peso total de la formulación, del al menos un repelente de insectos.
4. Formulación de polvo fino según una o varias de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizada porque la formulación contiene del 5 al 40% en peso, con respecto al peso total de la formulación, de hidróxido de carbonato de magnesio.
- 15 5. Formulación de polvo fino según la reivindicación 4, caracterizada porque la formulación contiene del 5 al 30% en peso, con respecto al peso total de la formulación, de hidróxido de carbonato de magnesio.
6. Formulación de polvo fino según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizada porque la razón en peso de hidróxido de carbonato de magnesio con respecto a repelente de insectos en la formulación asciende a de 1,5:1 a 1:1.
- 20 7. Formulación de polvo fino según una o varias de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizada porque la formulación contiene además uno o varios componentes seleccionados de almidón de cereal, almidón de arroz, almidón de maíz, almidón modificado, mica, mica sintética, nitruro de boro, dióxido de titanio, talco, óxido de aluminio, oxiclورو de bismuto, PMMA, nailon y sílice.
- 25 8. Procedimiento para la producción de una formulación de polvo fino según una o varias de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado porque el al menos un repelente de insectos se mezcla con el hidróxido de carbonato de magnesio y dado el caso componentes adicionales.
9. Uso no terapéutico de una formulación de polvo fino según una o varias de las reivindicaciones 1 a 7 para repeler insectos.

1a

A
B
C
D
G
F
E



1b

A
B
C
D
G
F
E

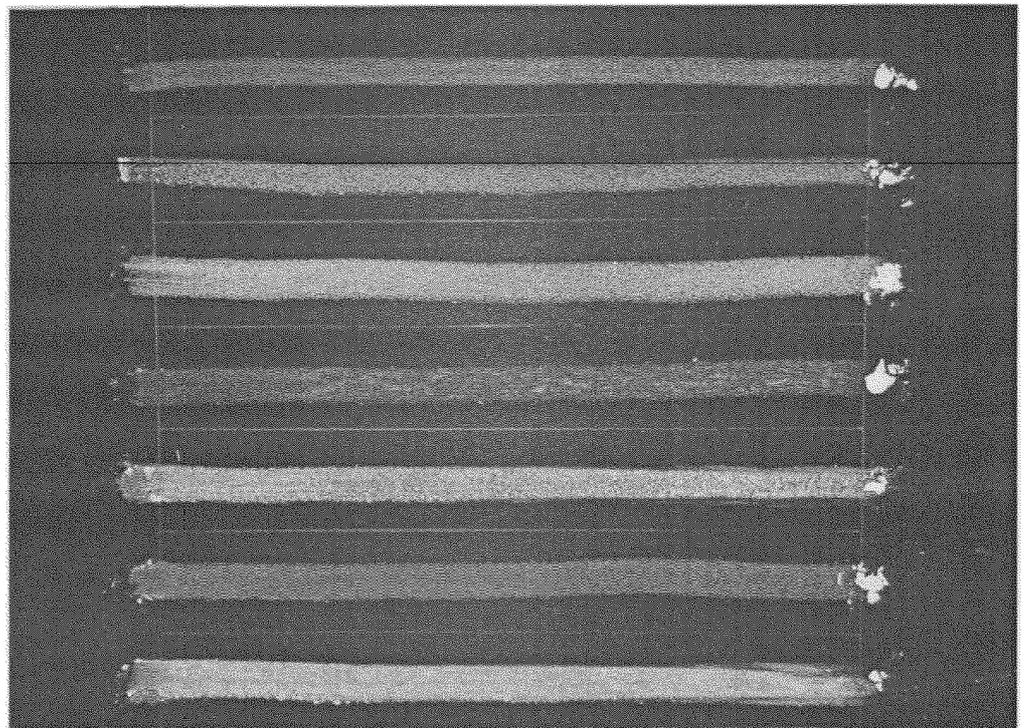


Fig. 1