

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 801 855**

51 Int. Cl.:

A61K 8/35 (2006.01)

A61K 8/37 (2006.01)

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 17/04 (2006.01)

A61K 8/34 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.07.2018 E 18181901 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **01.04.2020 EP 3437627**

54 Título: **Octanoato de 2-propilheptilo en preparaciones cosméticas**

30 Prioridad:

01.08.2017 DE 102017213232

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

14.01.2021

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**EITRICH, ANJA;
DEINHARD, SYBIL-MARIE y
SCHADE, JULIANE**

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 801 855 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

Octanoato de 2-propilheptilo en preparaciones cosméticas

5 La presente invención se refiere al uso de octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo) en preparaciones cosméticas para la reducción de las propiedades adherentes de arena de la preparación y a preparaciones que además de octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo) contienen también fenoxietanol, etanol y al menos un filtro UV orgánico que absorbe en la región UV-A.

10 La tendencia a alejarse de la aristocrática palidez hacia la "piel sana, bronceada deportivamente" ha sido ininterrumpida desde hace años. Para conseguir esto, las personas exponen su piel a la radiación solar, puesto que ésta causa una pigmentación en el sentido de una formación de melanina. Sin embargo, la radiación ultravioleta de la luz solar tiene también un efecto dañino sobre la piel. Además de la lesión aguda (quemaduras solares), aparecen daños a largo plazo, como un mayor riesgo de desarrollar cáncer de piel en caso de una exposición excesiva a la luz del rango de UVB (longitud de onda: 280-320 nm). El efecto excesivo de la radiación UVB y UVA (longitud de onda: 320-400 nm) conduce además de ello a un debilitamiento de las fibras elásticas y de colágeno del tejido conectivo. Esto conduce a numerosas reacciones fototóxicas y fotoalérgicas y tiene como consecuencia un envejecimiento prematuro de la piel.

15 20 Por eso, para proteger la piel se ha desarrollado una serie de sustancias de filtro fotoprotectoras que pueden utilizarse en preparaciones cosméticas. Estos filtros UVA y UVB están resumidos en la mayoría de los países industrializados en forma de listas positivas como el anexo 7 del reglamento sobre cosméticos.

25 La pluralidad de productos de protección solar comercialmente disponibles no debe hacer olvidar que estas preparaciones del estado de la técnica presentan una serie de desventajas:

Los protectores solares cosméticos presentan, entre otras cosas debido a su contenido en filtro UV, generalmente una cierta pegajosidad que, en particular cuando se usan en la playa, lleva a la adherencia de arena sobre las partes de la piel donde se ha aplicado la crema. Este problema se vuelve tanto mayor cuanto más filtro UV contiene una preparación. Si bien en el pasado no han faltado intentos de desarrollar protectores solares que repelan la arena, en cambio este problema no se ha resuelto hasta el día de hoy definitivamente de manera satisfactoria especialmente en preparaciones con alto factor de protección solar.

30 Por tanto, era el objetivo de la presente invención desarrollar un protector solar con adherencia a la arena reducida ("repelente de arena"). En particular deberá desarrollarse un protector solar con alto factor de protección solar (SPF 50 y superior), que se adhiera especialmente poco a la arena.

35 Sorprendentemente, el objetivo se consigue mediante el uso de octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo) en preparaciones cosméticas para la reducción de las propiedades adherentes de arena de la preparación. A este respecto es necesario de acuerdo con la invención que la preparación contenga al menos un filtro UV orgánico que absorbe en la región UV-A. Además es necesario de acuerdo con la invención que la preparación contenga fenoxietanol y/o etanol.

Además se consigue el objetivo sorprendentemente mediante una preparación cosmética que contiene

45 a) octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo) en una concentración del 1 al 5 % en peso, con respecto al peso total de la preparación,
b) fenoxietanol,
c) etanol así como
50 d) al menos un filtro UV orgánico que absorbe en la región UV-A.

Si bien el estado de la técnica conoce productos protectores solares con octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo), por ejemplos el documento DE 102007017436.7 o el documento 102007017440.5, sin embargo estos documentos no pudieron indicar el camino hacia la presente invención, dado que la importancia de octanoato de 2-propilheptilo con respecto a la pegajosidad y especialmente con respecto a la adherencia de arena seguía estando sin descubrir.

Además, el estado de la técnica conoce la entrada de banco de datos en el banco de datos Mintel GNPD, "Shimmering Sun Lotion SPF", ID de registro 4821013, así como los documentos ip.com Prior Art Database, número IP.com IPCOM000183957D, así como el documento EP3093006 A1, que tampoco han podido servir de guía para la presente invención.

60 Las formulaciones "de acuerdo con la invención", "ventajosamente de acuerdo con la invención", "ventajosamente en el sentido de la presente invención" etc. se refieren en el contexto de la presente divulgación siempre tanto a los usos de acuerdo con la invención como también a la preparación de acuerdo con la invención.

65 La preparación de acuerdo con la invención contiene octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo) en

una concentración del 1 al 5 % en peso, con respecto al peso total de la preparación. A este respecto se prefiere de acuerdo con la invención un contenido del 1 al 3,5 % en peso, con respecto al peso total de la preparación.

5 De acuerdo con la invención, preferentemente, el o los filtros UV orgánicos que absorben en la región UV-A se seleccionan del grupo de los compuestos 4-(*terc*-butil)-4'-metoxidibenzoilmetano, 2-[4-(dietilamino)-2-hidroxibenzoil]benzoato de hexilo (INCI: benzoato de dietilamino hidroxibenzoil hexilo) y/o 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (INCI: bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina).

10 De acuerdo con la invención es especialmente preferente a este respecto una combinación de 4-(*terc*-butil)-4'-metoxidibenzoilmetano y 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (INCI: bis-etilhexiloxi-fenol metoxifenil triazina),

15 Las concentraciones de uso ventajosas de acuerdo con la invención ascienden para 4-(*terc*-butil)-4'-metoxidibenzoilmetano a del 1 al 5 % en peso, para 2-[4-(dietilamino)-2-hidroxibenzoil]benzoato de hexilo (INCI: benzoato de dietilamino hidroxibenzoil hexilo) del 1 al 5 % en peso y para 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxi]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (INCI: bisetilhexiloxifenol metoxifenil triazina) del 1 al 5 % en peso, en cada caso con respecto al peso total de la preparación.

20 Es ventajoso en el sentido de la presente invención si la preparación de acuerdo con la invención contiene fenoxietanol en una concentración del 0,2 al 1,0 % en peso, con respecto al peso total de la preparación.

25 Formas de realización ventajosas de acuerdo con la invención de la presente invención están caracterizadas además por que la preparación contiene etanol en una concentración del 0,5 al 20 % en peso, con respecto al peso total de la preparación.

30 Además, la preparación de acuerdo con la invención puede contener ventajosamente uno o varios otros filtros UV seleccionados del grupo de los compuestos éster 2-etil-hexílico de ácido salicílico (INCI salicilato de octilo), 2-hidroxibezonato de 3,3,5-trimetilciclohexilo (INCI: homosalato), 2,4,6-tris-[anilino-(*p*-carbo-2'-etil-1'-hexiloxi)]-1,3,5-triazina (INCI: etilhexil triazona) y/o sales de ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico.

35 Formas de realización ventajosas de la presente invención se caracterizan además por que la preparación está libre de 3-(4-metilbenciliden)-alcanfor, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona (INCI: oxibenzona), acrilato de etil-hexil-2-ciano-3,3-difenilo (INCI: octocrieno), éster 2-etilhexílico de ácido 4-metoxicinámico (INCI metoxicinamato de octilo), parabenos, metilisotiazolinona, clorometil-isotiazolinona y DMDM-hidantoína.

Aparte de eso, de acuerdo con la invención, resulta ventajoso cuando la preparación de acuerdo con la invención no contiene polietilenglicoléteres o polietilenglicolésteres.

40 La preparación de acuerdo con la invención puede encontrarse de acuerdo con la invención en formas distintas. Las formas preferentes de acuerdo con la invención están caracterizadas por que la preparación se encuentra en forma de una emulsión O/W.

45 Si la preparación de acuerdo con la invención está presente en forma de una emulsión O/W, entonces, esta se caracteriza de acuerdo con la invención ventajosamente por que la preparación contiene uno o varios emulsionantes O/W seleccionados del grupo de los compuestos estearato citrato de glicerilo, estearato de glicerilo (autoemulsionante), ácido esteárico, sales de estearato, diestearato de poligliceril-3-metilglucosa, cetearilsulfato de sodio, cetilfosfato de potasio, estearato de poligliceril-10, estearilglutamato de sodio.

50 Es preferente de acuerdo con la invención, cuando la preparación contiene estearilglutamato de sodio como emulsionante.

55 Formas de realización ventajosas de acuerdo con la invención de la presente invención se caracterizan por que la preparación contiene uno o varios compuestos seleccionados del grupo de los compuestos ácido alfa-lipoico, ácido fólico, fitoeno, D-biotina, coenzima Q10, alfa-glucosil-rutina, carnitina, carnosina, isoflavonoides naturales y/o sintéticos, flavonoides, creatina, creatinina, taurina, β -alanina, pantenol, magnolol, honokiol, acetato de tocoferilo, dihidroxiacetona; ácido 8-hexadeceno-1,16-dicarboxílico, glicerilglucosa, (2-hidroxietyl)urea, vitamina E o sus derivados, ácido hialurónico y/o sus sales y/o licochalcona A.

60 Además, las formas de realización ventajosas de acuerdo con la invención de la presente invención están caracterizadas por que la preparación contiene uno o varios alcanodiolos del grupo de los compuestos 1,2-pentanodiol, 1,2-hexanodiol, 1,2-octanodiol, 1,2-decanodiol, 2-metil-1,3-propanodiol.

65 No en último lugar, se obtienen formas de realización especialmente ventajosas de acuerdo con la invención, cuando la preparación contiene uno o varios aceites seleccionados del grupo de los compuestos adipato de di-*n*-butilo, carbonato de dicaprililo, benzoato de alquilo C12-C15, y/o dicaprilato/dicaprato de butilenglicol.

Además, las preparaciones de acuerdo con la invención pueden contener las sustancias constitutivas habituales para productos protectores solares cosméticos en las concentraciones de uso habituales.

Ensayo comparativo

5 El efecto de acuerdo con la invención pudo mostrarse con el siguiente ensayo comparativo. A este respecto se trata de formulaciones idénticas, que se diferencian sólo en el contenido de octanoato de 2-propilheptilo, que se intercambi6 por la cantidad correspondiente (en % en peso) de agua.

10 Se prepararon las siguientes formulaciones:

IYFACE#68	IYFACE#70	INCI
0,125	0,125	Principios activos (ácido glicirrético, extracto de raíz de Glycyrrhiza Inflata, acetato de tocoferilo)
3,46	3,44	CI 77491, CI 77492, CI 77499, CI 77891
2,8	2,8	Dicaprilato/dicaprato de butilenglicol + dimeticona
	1	Caprilato de propilheptilo
0,4	0,4	Estearoil glutamato de sodio
3	3	Dimetil sililato de sílice + fosfato de dialmid6n
0,3	0,3	Perfume
3	3	Glicerina + agua
0,8	0,8	Fenoxietanol
2,5	2,5	Alcohol behenílico + alcohol cetearílico
0,55	0,55	Carb6mero, polímero cruzado de acrilato/acrilato de alquilo C10-30 Goma xantana
añadir hasta 100	añadir hasta 100	Agua
5	5	Alcohol desnat. + agua
1,7	1,7	Agua + EDTA tris6dico + hidr6xido de sodio
9,5	9,5	Homosalato, salicilato de etilhexilo
3,5	3,5	Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina
4	4	Etilhexil triazona + ácido fenilbencimidazol sulf6nico
4,5	4,5	Butil metoxidibenzoilmetano

Adherencia a la arena *in-vitro*

15 Se aplicaron 50 mg de la emulsi6n de prueba sobre placas de PMMA Sch6nberg (5,0 x 5,0 cm) y se distribuyeron al mismo tiempo con un dedil sobre la placa. A continuaci6n se seca la formulaci6n de ejemplo aplicada durante 15 min a temperatura ambiente. Despu6s se determin6 el peso de las placas secadas con una balanza analítica. A continuaci6n se rociaron las placas con arena de mar fina (1.07711.1000 arena de mar pura, de la empresa Merck KGaA) en exceso. Al deslizar una vez las placas sobre un dispositivo de deslizamiento previsto para ello (véase más adelante) se retir6 la arena adherida suelta con una fuerza uniforme, reproducible.

La arena adherida que quedaba sobre la placa despu6s de eso se determin6 mediante pesada. La adherencia a la arena puede determinarse con la siguiente ecuaci6n:

25
$$\Delta (\text{adherencia}) [mg] = m (\text{placa con arena})[mg] - m (\text{placa con crema}) [mg]$$

El dispositivo de deslizamiento es una construcci6n construida en forma de un triángulo, en la que la anchura del deslizamiento asciende a 5 cm. El dispositivo de deslizamiento es una construcci6n construida en forma de un triángulo rectángulo, en la que la anchura del deslizamiento asciende a 5 cm. El cateto adyacente del triángulo rectángulo (= área ocupada del deslizamiento) tiene una longitud de 13,5 cm, el cateto opuesto (= altura de caida) tiene una longitud de 49 cm. La hipotenusa en la que tiene lugar el proceso de deslizamiento, y el área ocupada forman un ángulo de 275°.

Los ensayos se repitieron 10x por cada formulaci6n y se form6 el valor medio correspondiente.

Preparaci6n	Placa sin arena	Placa con arena	Arena adherente en g	Valor medio	Desviaci6n estandar
IYFACE#68	7,233	7,606	0,373		
(sin caprilato de propilheptilo)	7,180	7,607	0,427		
	7,136	7,550	0,414		

(continuación)

Preparación	Placa sin arena	Placa con arena	Arena adherente en g	Valor medio	Desviación estándar
	7,227	7,629	0,402		
	7,213	7,591	0,378		
	7,155	7,487	0,332		
	7,142	7,576	0,434		
	7,156	7,611	0,455		
	7,171	7,523	0,352		
	7,134	7,463	0,329	0,390	0,044
IYFACE#70	7,167	7,473	0,306		
(con el 1 % de caprilato de propilheptilo)	7,137	7,497	0,360		
	7,153	7,436	0,283		
	7,149	7,445	0,296		
	7,209	7,581	0,372		
	7,230	7,541	0,311		
	7,180	7,528	0,348		
	7,220	7,533	0,313		
	7,167	7,423	0,256		
	7,127	7,472	0,345	0,319	0,037
Preparación	Arena adherente en mg/cm²				
IYFACE #68	15,58				
IYFACE #70	12,76				

Ejemplos

- 5 Los siguientes ejemplos deberían aclarar la presente invención sin limitarla. Todos los datos de cantidades, proporciones y porcentajes se refieren, siempre que no se indique lo contrario, al peso y la cantidad total o al peso total de las preparaciones. Estas preparaciones presentan sólo una baja adherencia de arena.

1	2	3	4	5	6	INCI
0,1	0,1	0,1	0,1	0,1	0,1	Acetato de tocoferilo
0,025	0,025	0,025	0,025	0,025	0,025	Extracto de raíz de Glycyrrhiza Inflata
			0,05		0,05	Extracto de corteza de Magnolia Officinalis
				0,3		Etilhexilglicerol
				0,03		Ubiquinona + agua
0,27		0,27	0,27			CI 77492 + CI 77491 + CI 77499
0,08		0,08	0,08			CI 77491 + CI 77499
0,37		0,37	0,37			CI 77492
0,013		0,013	0,013			CI 77491
3,71		3,71	3,71			CI 77891
3	2	1,5	2	2	2	Caprilato de propilheptilo
0,8	0,8	0,8	0,8	0,8	0,8	Dimeticona
	1	1,5	1	3	1	Dicaprilato/dicaprato de butilenglicol
		2	2		2	Adipato de dibutilo
		5	5	1	5	Benzoato de alquilo C12-15
0,4	0,4	0,4	0,4	0,4	0,4	Estearoil glutamato de sodio
				0,8		Estearato de glicerilo
1	1	1	1		1	Dimetil sililato de sílice
3	4	2	3	2	3	Fosfato de dialmidón
0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	0,3	Perfume
1	2	3	1	6	1	Glicerina + agua
0,7	0,7	0,65	0,65	0,92	0,65	Agua + hidróxido de sodio
0,8	0,8	0,8	0,9	0,7	0,9	Fenoxietanol
1	1	1	1		1	Alcohol behenílico
1,5	1,5	1,5	1,5	2	1,5	Alcohol cetearílico

ES 2 801 855 T3

(continuación)

1	2	3	4	5	6	INCI
0,2	0,2	0,2	0,2	0,1	0,2	Carbómero
0,15	0,15	0,15	0,15	0,15	0,15	Polímero cruzado de acrilato/acrilato de alquilo C10-30
0,2	0,2	0,2	0,2	0,1	0,2	Goma xantana
53,882	57,325	54,932	54,782	49,275	59,225	Agua
6	5	5	6	4	6	Alcohol desnat. + agua
1	1	1	1	1	1	Agua + EDTA trisódico
4	4			6		Homosalato
4,5	4,5	4,5	4,5	4,75	4,5	Salicilato de etilhexilo
3,5	3,5	2,5	2,5	3,5	2,5	Bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina
3	3	1,5	1,5	4	1,5	Etilhexil triazona
4,5	4,5	3	3	4,75	3	Butil metoxidibenzoilmetano
1	1	1	1	2	1	Ácido fenilbencimidazol sulfónico

REIVINDICACIONES

1. Uso de octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo) en preparaciones cosméticas para la reducción de las propiedades adherentes a la arena de la preparación.
- 5 2. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado por que** la preparación contiene al menos un filtro UV orgánico que absorbe en la región UV-A.
- 10 3. Uso según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado por que** la preparación contiene fenoxietanol y/o etanol.
4. Preparación cosmética que contiene
- 15 a) octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo) en una concentración del 1 al 5 % en peso, con respecto al peso total de la preparación,
- b) fenoxietanol,
- c) etanol así como
- d) al menos un filtro UV orgánico que absorbe en la región UV-A.
- 20 5. Uso según las reivindicaciones 1-3, **caracterizado por que** la preparación contiene octanoato de 2-propilheptilo (INCI caprilato de propilheptilo) en una concentración del 11 al 5 % en peso, con respecto al peso total de la preparación.
- 25 6. Preparación según la reivindicación 4, **caracterizada por que** el o los filtros UV orgánicos que absorben en la región UV-A se seleccionan del grupo de los compuestos 4-(*terc*-butil)-4'-metoxidibenzoilmetano, 2-[4-(dietilamino)-2-hidroxibenzoil] benzoato de hexilo (INCI: benzoato de dietilamino hidroxibenzoil hexilo) y/o 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexiloxi)-2-hidroxil]-fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina (INCI: bis-etilhexiloxifenol metoxifenil triazina).
- 30 7. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6, **caracterizada por que** la preparación contiene fenoxietanol en una concentración del 0,2 al 1,0 % en peso, con respecto al peso total de la preparación.
8. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 7, **caracterizada por que** la preparación contiene etanol en una concentración del 0,5 al 20 % en peso, con respecto al peso total de la preparación.
- 35 9. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 8, **caracterizada por que** la preparación contiene uno o varios otros filtros UV seleccionados del grupo de los compuestos éster 2-etil-hexílico de ácido salicílico (INCI salicilato de octilo), 2-hidroxibezonato de 3,3,5-trimetilciclohexilo (INCI: homosalato), 2,4,6-tris-[anilino-(*p*-carbo-2'-etil-1'-hexiloxi)]-1,3,5-triazina (INCI: etilhexil triazona) y/o sales de ácido 2-fenilbencimidazol-5-sulfónico.
- 40 10. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 9, **caracterizada por que** la preparación está libre de 3-(4-metilbenciliden)-alcanfor, 2-hidroxi-4-metoxibenzofenona (INCI: oxibenzona), acrilato de etilhexil-2-ciano-3,3-difenilo (INCI: octocrileno), éster 2-etilhexílico de ácido 4-metoxicinámico (INCI metoxicinamato de octilo), parabenos, metilisotiazolinona, clorometil-isotiazolinona y DMDM-hidantoína.
- 45 11. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 10, **caracterizada por que** la preparación se encuentra en forma de una emulsión O/W.
12. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 11, **caracterizada por que** la preparación contiene estearilglutamato de sodio como emulsionante.
- 50 13. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 12, **caracterizada por que** la preparación contiene uno o varios compuestos seleccionados del grupo de los compuestos ácido alfa-lipoico, ácido fólico, fitoeno, D-biotina, coenzima Q10, alfa-glucosil-rutina, carnitina, carnosina, isoflavonoides naturales y/o sintéticos, flavonoides, creatina, creatinina, taurina, β -alanina, pantenol, magnolol, honokiol, acetato de tocoferilo, dihidroxiacetona; ácido 8-hexadeceno-1,16-dicarboxílico, glicerilglucosa, (2-hidroxietil)urea, vitamina E o sus derivados, ácido hialurónico y/o sus sales y/o licochalcona A.
- 55 14. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 13, **caracterizada por que** la preparación contiene uno o varios alcanodiolos del grupo de los compuestos 1,2-pentanodiol, 1,2-hexanodiol, 1,2-octanodiol, 1,2-decanodiol, 2-metil-1,3-propanodiol.
- 60 15. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 14, **caracterizada por que** la preparación contiene uno o varios aceites seleccionados del grupo de los compuestos adipato de di-*n*-butilo, carbonato de dicaprililo, benzoato de alquilo C12-C15, butilen glicol y/o dicaprilato/dicaprato.
- 65 16. Preparación según una de las reivindicaciones anteriores 4 o 6 a 15, **caracterizada por que** la preparación no

contiene polietilenglicoléteres o polietilenglicolésteres.