



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 322 688**

51 Int. Cl.:

A61K 8/06 (2006.01)

A61K 8/27 (2006.01)

A61K 8/19 (2006.01)

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 5/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **00944806 .9**

96 Fecha de presentación : **23.06.2000**

97 Número de publicación de la solicitud: **1189581**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **27.03.2002**

54 Título: **Composiciones antimicrobianas tópicas.**

30 Prioridad: **25.06.1999 US 141195 P**
22.06.2000 US 599624

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
25.06.2009

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
25.06.2009

73 Titular/es: **THE PROCTER & GAMBLE COMPANY**
One Procter & Gamble Plaza
Cincinnati, Ohio 45202, US
Arch Chemicals, Inc.

72 Inventor/es: **Gavin, David, Francis;**
Marchetta, Anthony, Raymond;
Nelson, John, Daniel;
Polson, George;
Schwartz, James, Robert y
Turley, Patricia, Aileen

74 Agente: **Elzaburu Márquez, Alberto**

ES 2 322 688 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

Composiciones antimicrobianas tópicas.

5 **Campo de la invención**

La presente invención se refiere a composiciones antimicrobianas tópicas y a métodos para tratar infecciones microbianas de la piel o del cuero cabelludo. Son de un interés específico métodos para el tratamiento de la caspa y composiciones que proporcionan una actividad anticasca mejorada. En particular, la presente invención se refiere a métodos y composiciones que utilizan una sal de piritona de metal polivalente y una fuente de iones metálicos.

10 **Fundamento de la invención**

Hay diversas composiciones anticasca disponibles comercialmente o que de alguna otra forma son conocidas en la técnica del champú. Estas composiciones comprenden típicamente agentes tensioactivos detergentes y agentes antimicrobianos cristalinos en partículas, dispersados y suspendidos por toda la composición. Los agentes antimicrobianos usados con este fin incluyen azufre, sulfuro de selenio y sales de piridinationa de metales polivalentes. Durante el proceso de lavado de la cabeza con champú, estos agentes antimicrobianos se depositan en el cuero cabelludo proporcionando una actividad anticasca. Los agentes anticasca solubles, tales como el cetoconazol, son también conocidos en la técnica.

Sin embargo, los consumidores desean un champú anticasca que proporcione una mejor eficacia contra la caspa.

Las sales de metales polivalentes de la piritona (también conocida como 1-hidroxi-2-piridinationa; 2-piridinatiol-1-óxido; 2-piridinationa; 2-mercaptopiridina-N-óxido; piridinationa; y piridinationa-N-óxido) son conocidas como eficaces agentes biocidas, y se usan con profusión como fungicidas y bactericidas en pinturas y líquidos para mecanizado de metales. Las sales de metales polivalentes de la piritona se usan también como fungicidas y bactericidas en composiciones para el cuidado personal tales como los polvos para los pies y los champús anticasca. Las sales de metales polivalentes de la piritona no son más que escasamente solubles en agua e incluyen piritona de magnesio, piritona de bario, piritona de bismuto, piritona de estroncio, piritona de cobre, piritona de zinc, piritona de cadmio y piritona de zirconio.

La piritona de zinc y la de cobre son especialmente útiles como agentes antimicrobianos en composiciones para el cuidado personal. La piritona de zinc es conocida como componente anticasca en los champús. La síntesis de sales polivalentes de piritona se describe en la patente de EE.UU. n° 2.809.971 concedida a Berstein, *et al.* Otras patentes que describen compuestos y procedimientos similares para prepararlos, incluyen las patentes de EE.UU. números 2.786.847, 3.589.999, 3.590.035 y 3.773.770.

Aunque los biocidas de piritona han demostrado ser útiles para un amplio margen de aplicaciones, la utilidad de estos compuestos está limitada al control de especies y cepas selectas de hongos y bacterias. Además, aunque se ha observado que concentraciones más altas de sales de piritona reprimen el crecimiento de una gama de organismos más amplia, la cantidad útil de sales de metales polivalentes de piritona que puede ser añadida a un producto comercial está limitada por la eficacia y por consideraciones económicas, y por cuestiones medioambientales. En composiciones para el cuidado personal, tales como champús, las cantidades de sales de piritona que pueden añadirse están limitadas además por cuestiones toxicológicas.

Generalmente, el uso de agentes antimicrobianos en champús anticasca es también conocido en la técnica. Sin embargo, aunque se han descrito las sales de metales polivalentes de piritonas como agentes antimicrobianos y/o anticasca, la eficacia global se ha mantenido relativamente baja. Por consiguiente, los consumidores desean un champú que proporcione una superior eficacia anticasca frente a los productos comercializados en la actualidad. Tal eficacia superior puede ser difícil de conseguir.

Por ejemplo, anteriormente se pensó que la eficacia anticasca podría conseguirse “solubilizando” un complejo de piritona de zinc en un agente fuertemente quelante. Uno de tales planteamientos, descrito en la solicitud de patente europea n° 077.630 de Dixon, era “solubilizar” piritona de zinc en un agente quelante fuerte en presencia de cationes de cobre divalente. Sin embargo, el proceso de “solubilización” descrito en dicha solicitud 077.630 tiene por resultado en realidad la destrucción de la estructura química del complejo de piritona de zinc. La composición resultante contiene un complejo del agente quelante/zinc en solución con iones piritona libres. Los iones piritona libres son solubles en la composición. La solicitud 077.630 describe que este planteamiento tiene por resultado un producto transparente que es físicamente estable y que proporciona ventajas anticasca.

Desgraciadamente, la parte negativa de este planteamiento es que se sabe que cantidades excesivas de los iones libres de piritona solubles son tóxicos para las personas, y el uso de tal composición caería fuera de la actual monografía de la Federal Drug Administration para la piritona de zinc, haciendo a la composición comercialmente inaceptable para productos para el cuidado personal.

También se cree en la técnica que los iones metálicos tales, como las sales de cobre, proporcionan eficacia en aplicaciones antimicrobianas. Los compuestos de cobre, como el sulfato de cobre y el óxido cuproso, se han usado

ampliamente como fungicidas, antiincrustantes y algicidas en una amplia gama de aplicaciones, entre las que se incluyen pinturas, agua de piscinas y productos de madera. Del mismo modo, las sales de zinc inorgánicas, tales como el cloruro de zinc, sulfato de zinc, óxido de zinc, han sido empleadas como compuestos bacteriostáticos y/o fungostáticos en una gran variedad de productos entre los que se incluyen pinturas, recubrimientos y antisépticos. Sin embargo, las sales de cobre y las sales de zinc no poseen un nivel tan elevado de eficacia biocida como sería de desear para muchas aplicaciones anticasca y de cuidado de la piel.

Sorprendentemente, se ha descubierto ahora, de acuerdo con la presente invención, que la eficacia anticasca puede incrementarse de forma drástica en composiciones tópicas por medio del uso de sales de metales polivalentes de piritona, tales como la piritona de zinc, en combinación con una fuente de iones metálicos, tales como las sales de cobre y de zinc. Por consiguiente, es un objeto de la presente invención proporcionar una composición tópica anticasca con eficacia mejorada. La eficacia mejorada permite también la reducción de los niveles de piritonas metálicas en las composiciones antimicrobianas, facilitando de esta forma la obtención de productos más seguros que contienen principios activos antimicrobianos.

La patente de EE.UU. n° 3.852.441 describe combinaciones de las sales de metales pesados de la 1-hidroxi-2-piridinationa con acetato de difenilbismuto, tricloruro de bismuto, yoduro de bismuto fórmico, o subgalato de bismuto, para la actividad antibacteriana y antifúngica.

Es un objeto de la presente invención proporcionar composiciones tópicas para la piel y/o para el cabello, que proporcionan una superior eficacia anticasca. Es también un objeto de la presente invención proporcionar un método no terapéutico para limpiar el cabello y/o la piel. También se describe en el presente texto un método para tratar el pie de atleta. Estos, y otros objetos, se harán fácilmente evidentes a partir de la descripción detallada que sigue.

Sumario de la invención

La presente invención se refiere a composiciones tópicas para el tratamiento de microbios, con el fin de inhibir o prevenir el crecimiento de los mismos, sobre la piel o el cuero cabelludo, que comprende: a) de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 10% en peso de la composición, de un principio activo antimicrobiano elegido entre el grupo que consiste en sales de metales polivalentes de piritona; b) de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 10% en peso de la composición, de una fuente de iones metálicos elegida entre el grupo consistente en sales de zinc, sales de cobre, sales de plata, sales de níquel, sales de cadmio, sales de mercurio, y mezclas de las mismas; y c) un vehículo tópico para el principio activo antimicrobiano y la sal metálica, en donde la relación en peso de la fuente metálica al principio activo antimicrobiano es de aproximadamente 5:100 a aproximadamente 5:1, y en donde al menos el 50% del principio activo antimicrobiano es insoluble en la composición, y en donde dicha composición comprende uno o más agentes quelantes de di- o poli-amina pero la relación de las sales de metal polivalente de piritona a los agentes quelantes de di- o poli-amina es al menos de 5 a 1.

También se describe en el presente texto un método para proporcionar eficacia anticasca, que comprende aplicar al pelo y al cuero cabelludo una cantidad de la composición anteriormente descrita que sea efectiva para proporcionar tales beneficios.

Descripción detallada de la invención

Las composiciones anticasca tópicas de la presente invención pueden comprender, o consisten en, o consisten esencialmente en los elementos esenciales y limitaciones de la invención descritos en el presente texto, así como en cualquiera de los ingredientes, componentes o limitaciones adicionales u opcionales descritos en el presente texto.

En particular, estas composiciones comprenden un agente antimicrobiano, una fuente de iones metálicos, y un vehículo tópico. En la introducción del material antimicrobiano en partículas en el vehículo, el material antimicrobiano en partículas se incorpora al mismo en forma de dispersión, suspensión, o emulsión, en la composición. La fuente de iones metálicos potencia entonces el efecto biocida del material antimicrobiano en partículas.

Todos los porcentajes, partes y relaciones están basadas en el peso total de las composiciones de champú de la presente invención, a menos que se especifique otra cosa. Todos estos pesos, pertenecientes a ingredientes listados, se basan en la concentración de principio activo y, por consiguiente, no incluyen vehículos ni subproductos que pueden estar incluidos en materiales disponibles comercialmente.

Los componentes, entre los que se incluyen aquellos que pueden ser añadidos opcionalmente, de las composiciones antimicrobianas tópicas de la presente invención, así como los métodos para su preparación, y métodos de uso, se describen con detalle a continuación.

A. Agente antimicrobiano

Las composiciones antimicrobianas tópicas de la presente invención comprenden de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 10% del agente antimicrobiano. Preferentemente, las composiciones comprenden de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 5%, más preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 2% del agente antimicrobiano.

ES 2 322 688 T3

El agente antimicrobiano puede elegirse entre sales de metales polivalentes de piritiona y mezclas de las mismas. Puede usarse cualquier forma de sal de metal polivalente de piritiona, incluyendo estructuras en plaquetas y en agujas. Las sales preferidas para ser usadas en la presente invención incluyen las formadas a partir de los metales polivalentes magnesio, bario, estroncio, cobre, zinc, cadmio, zirconio y las mezclas de los mismos, más preferentemente zinc. Incluso más preferida para ser usada en la presente invención es la sal de zinc de la 1-hidroxi-2-piridinationa (conocida como "piritona de zinc" o "ZPT"), lo más preferentemente ZPT en forma de partículas en plaquetas, en la que las partículas tienen un tamaño medio de hasta aproximadamente 20 μ , preferentemente hasta aproximadamente 5 μ , lo más preferentemente hasta aproximadamente 2,5 μ .

Los agentes antimicrobianos y anticasca de piridinationa se describen, por ejemplo, en la patente de EE.UU. n° 2.809.971, la patente de EE.UU. n° 3.236.733, la patente de EE.UU. n° 3.761.418, la patente de EE.UU. n° 4.345.080, la patente de EE.UU. n° 4.323.683, la patente de EE.UU. n° 4.379.753, y la patente de EE.UU. n° 4.470.982.

Se considera también que, cuando se usa ZPT como material antimicrobiano en partículas en las composiciones antimicrobianas de la presente invención, la pérdida del cabello puede ser reducida o inhibida, o que el pelo puede aparecer más espeso o abundante.

La piritona de zinc puede prepararse haciendo reaccionar 1-hidroxi-2-piridinationa (es decir, ácido piritona) o una sal soluble del mismo con una sal de zinc (p. ej. sulfato de zinc) para formar un precipitado de piritona de zinc, como se ilustra en la patente de EE.UU. n° 2.809.971.

Al menos el 50%, preferentemente al menos el 75%, más preferentemente al menos el 99,9%, incluso más preferentemente al menos el 99,99%, y aún más preferentemente el 100% de la sal de metal polivalente de la piritona permanece insoluble en la composición.

Preferentemente, menos del 50%, más preferentemente menos del 30%, más preferentemente menos del 15%, más preferentemente menos del 10%, más preferentemente menos del 5%, incluso más preferentemente menos del 1%, aún más preferentemente 0%, de la sal de metal polivalente de piritona se disocia en ión de piritona libre en la composición. Por "ión de piritona libre" como se usa en el presente texto, se entiende un ion piritona soluble que no está asociado con iones de metal polivalente.

La composición comprende al menos una relación de 5 a 1 de sal de metal polivalente de piritona a los agentes quelantes de di o poliamina. Estos agentes quelantes incluyen ácido etilendiaminatetraacético (EDTA), ácido dietilenti-aminapentaacético (DTPA), tetraetiltri-aminamina (TET), etilendiamina (EDA) y dietilenti-aminamina (DETA) o sus sales. Estos agentes quelantes pueden estar presentes en cantidades relativamente pequeñas, es decir, menores que el 1%, preferentemente menores que el 0,5%, más preferentemente menores que el 0,1% en peso de la composición, cuando se usan como conservantes o estabilizantes metálicos.

40 B. Fuente de iones metálicos

Las composiciones antimicrobianas tópicas de la presente invención comprenden de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 10% de la fuente de iones metálicos. Preferentemente, las composiciones de la presente invención comprenden de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 5%, más preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 2% de la fuente de iones metálicos.

La fuente de iones metálicos puede elegirse entre zinc, cobre, plata, níquel, cadmio y mercurio. Preferentemente, el ion metálico se elige entre sales de zinc, sales de cobre, sales de plata, y mezclas de las mismas. Más preferentemente el ion metálico se elige entre sales de zinc, sales de cobre, y mezclas de las mismas.

Los ejemplos de sales de zinc que pueden ser usadas en las composiciones de la presente invención incluyen acetato de zinc, óxido de zinc, carbonato de zinc, hidróxido de zinc, cloruro de zinc, sulfato de zinc, citrato de zinc, fluoruro de zinc, yoduro de zinc, lactato de zinc, oleato de zinc, oxalato de zinc, fosfato de zinc, propionato de zinc, salicilato de zinc, seleniato de zinc, silicato de zinc, estearato de zinc, sulfuro de zinc, tanato de zinc, tartrato de zinc, valerato de zinc, gluconato de zinc, undecilato de zinc, y similares. También pueden usarse combinaciones de las sales de zinc en la composición de la invención.

Los ejemplos sales de cobre adecuadas incluyen citrato de disodio y cobre, cobre trietanolamina, carbonato de cobre, carbonato cuproso amónico, hidróxido cúprico, cloruro de cobre, cloruro cúprico, complejo de cobre etilendiamina, oxicloloro de cobre, oxicloloro sulfato de cobre, óxido cuproso, tiocianato de cobre, y similares. También pueden usarse combinaciones de estas sales de cobre en la composición de la invención. También puede usarse una diversidad de formas de plata. Los ejemplos de especies de plata útiles incluyen plata coloidal, sales de plata, y complejos de plata, tales como bromuro de plata, cloruro de plata, citrato de plata, yoduro de plata, lactato de plata, nitrato de plata, óxido de plata, picrato de plata, y similares.

Además, también pueden usarse combinaciones de sales metálicas en la composición de la invención.

La fuente de iones metálicos está presente en la composición en una relación con la sal de metal polivalente de piritona de aproximadamente 5:100 a aproximadamente 5:1, preferentemente de aproximadamente 2:10 a aproximadamente 3:1, más preferentemente de aproximadamente 1:2 a 2:1.

5 C. Vehículo tópico

Las composiciones antimicrobianas tópicas de la presente invención incluyen un vehículo tópico. El vehículo tópico puede elegirse entre un amplio margen de vehículos para el cuidado personal tradicionales, dependiendo del tipo de composición que se ha de formar. Mediante selecciones adecuadas de vehículos compatibles, se considera que las presentes composiciones antimicrobianas pueden prepararse en forma de productos diarios para la piel o el pelo, tales como lociones para la piel o lavado para el pelo, productos para el aseo diario del pelo, tales como lociones capilares, pulverizaciones, tónicos, tratamientos de acondicionamiento y productos para el moldeado del cabello, y similares, o pueden prepararse en forma de productos para el lavado tales como champús para el pelo y/o el cuero cabelludo, lavados corporales, lavados para manos, productos sanitarios y de limpieza sin agua para las manos, y similares.

El vehículo tópico en las composiciones líquidas para el pelo o la piel puede ser agua, disolventes orgánicos comunes o mezclas de los mismos. Los disolventes orgánicos comunes adecuados son alcoholes inferiores C2-C3 monovalentes o polivalentes tales como etanol, propanol, isopropanol, glicerina, dimetilformamida, dimetilacetamida, y dimetilsulfóxido.

En composiciones líquidas para el lavado, tales como los champús, el vehículo puede incluir un agente tensioactivo detergente para proporcionar a la composición unas propiedades limpiadoras. Tales agentes tensioactivos han de ser físicamente y químicamente compatibles con los componentes esenciales descritos en el presente texto, o no deben menoscabar de otra forma la estabilidad del producto, su estética o su rendimiento. Más adelante se discuten ejemplos de agentes tensioactivos útiles en la presente invención.

Las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden ser sistemas acuosos que comprenden de aproximadamente 40% a aproximadamente 92%, preferentemente de aproximadamente 50% a aproximadamente 85%, más preferentemente de aproximadamente 60% a aproximadamente 80% de agua, en peso de las composiciones.

Cuando las composiciones de la presente invención están en forma de champú anticaspa, el pH de las composiciones está en el intervalo, por lo general, de aproximadamente 2 a aproximadamente 10, preferentemente de aproximadamente 3 a aproximadamente 9, más preferentemente de aproximadamente 4 a aproximadamente 8, lo más preferentemente de aproximadamente 5,5 a aproximadamente 7,5.

También se describen en el presente texto composiciones antimicrobianas en forma de polvo sólido para aplicación a la piel. Tal polvo puede comprender un vehículo cosmético sólido. El vehículo cosmético sólido puede ser talco, que es un silicato de magnesio hidratado, usado en forma de partículas generalmente de un tamaño inferior a 40 μm ; micas, que son composiciones de aluminosilicatos, que existen en forma de escamas de 2 a 200 μm ; almidón modificado o no modificado, en particular almidón de arroz; sílice; alúmina; nitruro de boro; caolín, que es un silicato de aluminio hidratado; óxidos de zinc y de titanio; carbonato cálcico precipitado; carbonato o hidrocarbonato de magnesio; jabones metálicos derivados de un ácido orgánico carboxílico que tiene de 8 a 22 átomos de carbono, por ejemplo estearato de zinc, magnesio o litio, laurato de zinc, miristato de magnesio y similares; polvos de polímero (o copolímero) sintético elegidos entre polietileno y sus derivados, por ejemplo politetrafluoroetileno, poliestireno y similares; poliacrilatos, polimetacrilatos, poliésteres o poliamidas y similares, por ejemplo polvos de nilón; y polvos en forma de microesferas huecas preparadas a partir de material termoplástico sintético, cuya parte hueca contiene un gas.

1. Agente tensioactivo detergente

El componente de vehículo tópico de la presente invención puede incluir un agente tensioactivo detergente elegido entre agentes tensioactivos aniónicos, agentes tensioactivos no iónicos, agentes tensioactivos anfóteros, agentes tensioactivos zwitteriónicos, agentes tensioactivos catiónicos, y combinaciones de los mismos. Un agente tensioactivo detergente proporciona una composición antimicrobiana de champú con rendimiento limpiador. Puede usarse cualquiera de los agentes tensioactivos conocidos en la técnica para su uso en productos para el pelo o el cuidado personal, siempre y cuando el agente tensioactivo sea química y físicamente compatible con los componentes esenciales de la composición, o no perjudique de otra forma excesivamente el rendimiento del producto, su estética o su estabilidad. La concentración de los agentes tensioactivos en la composición de champú puede variar con el comportamiento limpiador o espumante deseado, el agente tensioactivo particular elegido, la concentración del producto deseada, la presencia de otros componentes en la composición, y otros factores bien conocidos en la técnica.

a) Agente tensioactivo aniónico

Los agentes tensioactivos aniónicos adecuados conocidos para ser usados en la presente invención incluyen agentes tensioactivos detergentes aniónicos y zwitteriónicos o agentes tensioactivos detergentes anfóteros que tienen un resto unido que es aniónico al pH de la composición, o mezclas de los mismos. Se prefieren los agentes tensioactivos detergentes aniónicos. Tales agentes tensioactivos han de ser física y químicamente compatibles con los componentes esenciales descritos en el presente texto, y no deben perjudicar de otra forma excesivamente la estabilidad del producto, su estética o su rendimiento.

ES 2 322 688 T3

Los ejemplos de componentes de agente tensioactivo detergente aniónico adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen aquellos que son conocidos por su uso para el cuidado del pelo o en otras composiciones de limpieza para el cuidado personal. La concentración del componente de agente tensioactivo aniónico en la composición debe ser suficiente para proporcionar el rendimiento limpiador y espumante deseado, y generalmente se encuentra en el intervalo de aproximadamente 5% a aproximadamente 50%, preferentemente de aproximadamente 8% a aproximadamente 30%, más preferentemente de aproximadamente 10% a aproximadamente 25%, incluso más preferentemente de aproximadamente 12% a aproximadamente 22% en peso de la composición.

Los agentes tensioactivos aniónicos preferidos adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención son los alquil y alquil éter sulfatos. Estos materiales tienen las fórmulas respectivas ROSO_3M y $\text{RO}(\text{C}_2\text{H}_4\text{O})_x\text{SO}_3\text{M}$, en las que R es el grupo alquilo o alquenilo de aproximadamente 8 a aproximadamente 18 átomos de carbono, x es un número entero que tiene un valor de 1 a 10, y M es un catión tal como amonio, alcanolaminas tales como trietanolamina, metales monovalentes tales como sodio y potasio, y cationes de metal polivalente tales como magnesio, y calcio. La solubilidad del agente tensioactivo dependerá de los agentes tensioactivos detergentes aniónicos y los cationes elegidos en particular.

Preferentemente R tiene de aproximadamente 8 a aproximadamente 18 átomos de carbono, más preferentemente de aproximadamente 10 a aproximadamente 16 átomos de carbono, incluso más preferentemente de aproximadamente 12 a aproximadamente 14 átomos de carbono, tanto en los alquil como en los alquil éter sulfatos. Los alquil éter sulfatos se preparan típicamente como productos de condensación de óxido de etileno y alcoholes monovalentes que tienen de aproximadamente 8 a aproximadamente 24 átomos de carbono. Los alcoholes pueden ser de síntesis o pueden derivarse de grasas, p. ej., aceite de coco, aceite de palmiste, sebo. Se prefieren el alcohol láurico y alcoholes de cadena lineal derivados del aceite de coco o del aceite de palmiste. Tales alcoholes se hacen reaccionar con entre aproximadamente 0 y aproximadamente 10, preferentemente de aproximadamente 2 a aproximadamente 5, más preferentemente aproximadamente 3, proporciones molares de óxido de etileno, y la mezcla de especies moleculares resultante que tiene, por ejemplo, un promedio de 3 moles de óxido de etileno por mol de alcohol, se sulfata y se neutraliza.

Los ejemplos no limitantes específicos de alquil éter sulfatos que pueden ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen sales de sodio y amonio de (alquilos de aceite de coco) trietilenglicol éter sulfato, alquilos de sebo trietilenglicol éter sulfato, y alquilos de sebo hexaoxietilensulfato. Los alquil éter sulfatos altamente preferidos son aquellos que comprenden una mezcla de compuestos individuales, en la que los compuestos de la mezcla tienen una longitud media de la cadena de alquilo de aproximadamente 10 a aproximadamente 16 átomos de carbono y un grado medio de etoxilación de aproximadamente 1 a aproximadamente 4 moles de óxido de etileno.

Los ejemplos específicos de alquil sulfatos preferidos incluyen lauril sulfato amónico, alquilos de aceite de coco sulfato amónico, lauril sulfato potásico, alquilos de aceite de coco sulfato potásico, lauril sulfato sódico, alquilos de aceite de coco sulfato sódico, lauril sulfato de monoetanolamina, alquilos de aceite de coco sulfato de monoetanolamina, lauril sulfato de dietanolamina, lauril sulfato de trietanolamina, lauril sulfato de trietilamina, y mezclas de los mismos. Especialmente preferido es el lauril sulfato amónico.

Los ejemplos específicos de alquil éter sulfatos preferidos incluyen lauril éter ("laureth") sulfato amónico, lauril éter sulfato potásico, lauril éter sulfato sódico, lauril éter sulfato de monoetanolamina, lauril éter sulfato de dietanolamina, lauril éter sulfato de trietanolamina, lauril éter sulfato de trietilamina, y mezclas de los mismos. Especialmente preferido es el lauril éter sulfato amónico.

Otra clase más de agentes tensioactivos de sulfato adecuados para su uso en las realizaciones de champús anti-caspa y acondicionadores de la presente invención son los glicéridos sulfatados, un ejemplo de los cuales incluye monoglicérido láurico sulfato sódico.

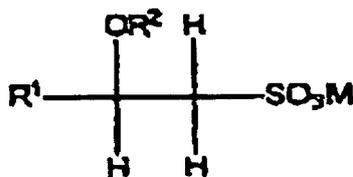
Otros agentes tensioactivos detergentes aniónicos adecuados son las sales hidrosolubles de productos orgánicos de reacción con ácido sulfúrico conformes con la fórmula $[\text{R}^1-\text{SO}_3-\text{M}]$ en la que R^1 es un radical hidrocarburo alifático saturado, de cadena lineal o ramificada, que tiene de aproximadamente 8 a aproximadamente 24, preferentemente de aproximadamente 10 a aproximadamente 18 átomos de carbono; y M es un catión descrito anteriormente en el presente texto. Ejemplos no limitantes de tales agentes tensioactivos detergentes son las sales de un producto orgánico de reacción con ácido sulfúrico de un hidrocarburo de la serie del metano, que incluye iso-, neo- y n-parafinas, que tiene de aproximadamente 8 a aproximadamente 24 átomos de carbono, preferentemente de aproximadamente 12 a aproximadamente 18 átomos de carbono, y un agente de sulfonación, p. ej. SO_3 , H_2SO_4 , obtenido de acuerdo con métodos de sulfonación conocidos, entre los que se incluyen blanqueo e hidrólisis. Se prefieren las n-parafinas sulfonadas C_{10} a C_{18} de metal alcalino y amonio.

Otros agentes tensioactivos detergentes aniónicos adecuados son los productos de reacción de ácidos grasos esterificados con ácido isetiónico y neutralizados con hidróxido de sodio en los que, por ejemplo, los ácidos grasos se derivan del aceite de coco o del aceite de palmiste; las sales de sodio o de potasio de amidas de ácidos grasos de metil taurida en las que los ácidos grasos, por ejemplo, se derivan del aceite de coco o del aceite de palmiste. Otros agentes tensioactivos aniónicos similares se describen en las patentes de EE.UU. n° 2.486.921, n° 2.486.922 y n° 2.396.278.

Otros agentes tensioactivos detergentes aniónicos adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas son los succinatos, entre cuyos ejemplos se incluyen N-octadecilsulfosuccinato disódico, lauril sulfosuccinato disódico, lauril sulfosuccinato diamónico, N-(1,2-dicarboxietil)-N-octadecilsulfosuccinato tetrasódico, diamil éster del ácido sulfosuccínico de sodio, dihexil éster de ácido sulfosuccínico de sodio y dioctil ésteres de ácido sulfosuccínico de sodio.

Otros agentes tensioactivos detergentes aniónicos adecuados incluyen sulfonatos de olefina que tienen de aproximadamente 10 a aproximadamente 24 átomos de carbono. En este contexto, la expresión "sulfonatos de olefina" se refiere a compuestos que pueden ser preparados mediante la sulfonación de alfa-olefinas por medio de trióxido de azufre no complejado, seguida por la neutralización de la mezcla de reacción ácida en condiciones tales que cualquier sulfona que se haya formado en la reacción se hidrolice para dar el correspondiente hidroxialcanosulfonato. El trióxido de azufre puede ser líquido o gaseoso, y usualmente, pero no necesariamente, se diluye con disolventes inertes, por ejemplo con SO₂ líquido, hidrocarburos clorados, etc., cuando se usa en forma de líquido, o con aire, nitrógeno, SO₂ gaseoso, etc., cuando se usa en forma gaseosa. Las alfa-olefinas de las que se derivan los sulfonatos de olefina son mono-olefinas que tienen de aproximadamente 10 a aproximadamente 24 átomos de carbono, preferentemente de aproximadamente 12 a aproximadamente 16 átomos de carbono. Preferentemente, son olefinas de cadena lineal. Además de los verdaderos alqueno sulfonatos y una proporción de hidroxialcanosulfonatos, los sulfonatos de olefina pueden contener cantidades minoritarias de otros materiales, tales como alqueno disulfonatos dependiendo de las condiciones de reacción, la proporción de sustancias reaccionantes, la naturaleza de las olefinas de partida y las impurezas de la olefina bruta, y las reacciones secundarias durante el proceso de sulfonación. Un ejemplo no limitante de tal mezcla de sulfonato de alfa-olefina se describe en la patente de EE.UU. n° 3.332.880.

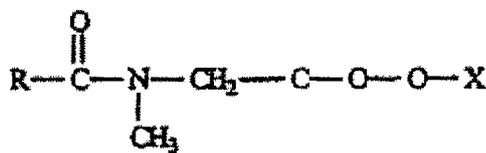
Otra clase de agentes tensioactivos detergentes aniónicos adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas son los beta-alquiloxi alcano sulfonatos. Estos agentes tensioactivos se ajustan a la fórmula



en la que R¹ es un grupo alquilo de cadena lineal que tiene de aproximadamente 6 a aproximadamente 20 átomos de carbono, R² es un grupo alquilo inferior que tiene de aproximadamente 1 a aproximadamente 3 átomos de carbono, preferentemente 1 átomo de carbono, y M es un catión soluble en agua como se describió anteriormente en el presente texto.

Hay otros sulfonatos adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención que son los agentes tensioactivos detergentes aniónicos conocidos como alquil aril sulfonatos. Los ejemplos no limitantes de alquil aril sulfonatos incluyen tridecil benceno sulfonato sódico, dodecil benceno sulfonato sódico y mezclas de los mismos.

También son adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención son los agentes tensioactivos detergentes aniónicos conocidos como sarcosinatos y derivados de sarcosina. Los sarcosinatos son los derivados de sarcosina y N-metil glicina, acilados con un cloruro de ácido graso. Se ajustan a la Fórmula general (II)



en la que RCO- es un radical ácido graso y en la que X es o bien hidrógeno (forma ácida) o una especie catiónica, tal como Na⁺ ó TEA⁺ (forma de sal). Los ejemplos no limitantes de sarcosinatos y derivados de sarcosina incluyen: lauril sarcosinato de sodio, lauril sarcosina, cocoil sarcosina, y mezclas de los mismos. Un sarcosinato preferido es el lauril sarcosinato de sodio.

Los agentes tensioactivos detergentes aniónicos preferidos para ser usados en las composiciones antimicrobianas incluyen lauril sulfato amónico, lauril éter sulfato amónico, lauril sulfato de trietilamina, lauril éter sulfato de trietilamina, lauril sulfato de trietanolamina, lauril éter sulfato de trietanolamina, lauril sulfato de monoetanolamina, lauril éter sulfato de monoetanolamina, lauril sulfato de dietanolamina, lauril éter sulfato de dietanolamina, monoglicérido láurico sulfato sódico, lauril sulfato sódico, lauril éter sulfato sódico, lauril sulfato potásico, lauril éter sulfato potásico, lauril sarcosinato sódico, lauroil sarcosinato sódico, lauril sarcosina, cocoil sarcosina, cocoil sulfato amónico, lauroil sulfato amónico, cocoil sulfato sódico, lauroil sulfato sódico, cocoil sulfato potásico, lauril sulfato potásico,

lauril sulfato de trietanolamina, lauril sulfato de trietanolamina, cocoil sulfato de monoetanolamina, lauril sulfato de monoetanolamina, tridecil benceno sulfonato sódico, dodecil benceno sulfonato sódico, y combinaciones de los mismos.

5

b) *Agentes tensioactivos no iónicos*

Los agentes tensioactivos no iónicos adecuados para ser usados en composiciones de la presente invención pueden incluir productos de condensación de alcoholes alifáticos primarios o secundarios de cadena lineal o ramificada o fenoles con óxidos de alquileno, usualmente óxido de etileno, y que generalmente tienen de 6 a 30 grupos óxido de etileno. Otros agentes no iónicos adecuados incluyen mono- o di-alquil alcanolamidas. Los ejemplos incluyen coco mono- o di-etanolamida y coco mono-isopropanolamida.

15 c) *Agentes tensioactivos anfóteros y zwitteriónicos*

Los agentes tensioactivos detergentes anfóteros o zwitteriónicos adecuados para ser usados en la composición de champú de la presente invención incluyen aquellos que son conocidos para el uso en productos para el cuidado del pelo u otros productos de limpieza para el cuidado personal. La concentración de tales agentes tensioactivos detergentes anfóteros preferentemente se encuentra en el intervalo de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 20%, preferentemente de aproximadamente 1% a aproximadamente 10% en peso de la composición. Ejemplos no limitantes de agentes tensioactivos zwitteriónicos o anfóteros adecuados se describen en la patente de EE.UU. n° 5.104.646 (Bolich Jr. *et al.*), y en la patente de EE.UU. n° 5.106.609 (Bolich Jr. *et al.*).

25 Los agentes tensioactivos detergentes anfóteros adecuados para ser usados en la composición de champú son bien conocidos en la técnica, e incluyen los agentes tensioactivos descritos ampliamente como derivados de aminas alifáticas secundarias y terciarias en las que el radical alifático puede ser de cadena lineal o ramificada y en las que uno de los sustituyentes alifáticos contiene de aproximadamente 8 a aproximadamente 18 átomos de carbono, y uno contiene un grupo aniónico hidrosolubilizante tal como carboxi, sulfonato, sulfato, fosfato o fosfonato. Los agentes tensioactivos detergentes anfóteros preferidos para ser usados en la presente invención incluyen cocoanfoacetato, cocoanfodiaceato, lauroanfoacetato, lauroanfodiaceato, y mezclas de los mismos.

35 Los agentes tensioactivos anfóteros disponibles comercialmente incluyen los comercializados bajo los nombres comerciales MIRANOL C2M CONC. N.P., MIRANOL C2M CONC. O.P., MIRANOL C2M SF, MIRANOL CM SPECIAL (Miranol, Inc.), ALCATERIC 2CIB (Alcaril Chemicals), AMPHOTERGE W-2 (Lonza, Inc.), MONATERIC CDX-38, MONATERIC CSH-32 (Mona Industries), REWOTERIC AM-2C (Rewo Chemical Grupo) y SCHER-COTERIC MS-2 (Scher Chemicals).

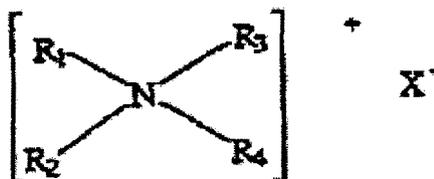
40 Los agentes tensioactivos detergentes zwitteriónicos adecuados para ser usados en la presente invención incluyen los agentes tensioactivos descritos ampliamente como derivados compuestos alifáticos de amonio cuaternario, sulfonio, y sulfonio, en los que los radicales alifáticos pueden ser de cadena lineal o ramificada, y en los que uno de los sustituyentes alifáticos contiene de aproximadamente 8 a aproximadamente 18 átomos de carbono y uno contiene un grupo aniónico tal como carboxi, sulfonato, sulfato, fosfato o fosfonato. Los agentes tensioactivos detergentes zwitteriónicos preferidos son las betaínas.

45

d) *Agentes tensioactivos catiónicos*

50 Los agentes tensioactivos detergentes catiónicos adecuados para ser usados en la presente invención incluyen agentes tensioactivos que contienen restos de nitrógeno cuaternario. Los ejemplos de agentes tensioactivos catiónicos adecuados son aquellos que corresponden a la Fórmula general (XVIII):

55



60

65 en la que R₁, R₂, R₃ y R₄ se eligen independientemente entre un grupo alifático C₁ a C₂₂ o un grupo aromático, alcoxi, polioxialquileno, alquilamido, hidroxialquilo, arilo o alquilarilo que tiene hasta aproximadamente 22 átomos de carbono, preferentemente alquilo C₁ a C₂₂; y X es un anión formador de sales, tal como el elegido entre halógeno (p. ej. cloruro, bromuro), acetato, citrato, lactato, glicolato, fosfato, nitrato, sulfato, y radicales alquilsulfato. Los grupos alifáticos pueden contener, además de átomos de carbono e hidrógeno, uniones éter, y otros grupos, tales como grupos amino. Los grupos alifáticos de cadena más larga (p. ej. C₁₂ y superiores) pueden ser saturados o insaturados.

Agentes tensioactivos detergentes catiónicos preferidos son aquellos que contienen dos cadenas alquilo largas y dos cadenas alquilo cortas o los que contienen una cadena alquilo larga y tres cadenas alquilo cortas. Tales cadenas alquilo largas son preferentemente de C₁₂ a C₂₂, más preferentemente de C₁₆ a C₂₂. Tales cadenas alquilo cortas son preferentemente de C₁ a C₃, más preferentemente de C₁ a C₂.

Los agentes tensioactivos detergentes no iónicos adecuados para ser usados en el presente texto incluyen, pero sin limitarse a ellos, los compuestos preparados por condensación de grupos óxido de alquileo (de naturaleza hidrofílica) con un compuesto orgánico hidrófobo, que puede ser de naturaleza alifática o alquil aromática.

Ejemplos no limitantes de otros agentes tensioactivos detergentes aniónicos, no iónicos, anfóteros, zwitteriónicos y catiónicos adecuados para ser usados en composiciones antimicrobianas de la presente invención se describen en la obra de McCutcheon, *Emulsifiers and Detergents*, (1989), publicada por M. C. Pub. Co., y en la patente de EE.UU. n° 2.438.091, la patente de EE.UU. n° 2.528.378, la patente de EE.UU. n° 2.658.072, la patente de EE.UU. n° 3.155.591, la patente de EE.UU. n° 3.929.678, la patente de EE.UU. n° 3.959.461, la patente de EE.UU. n° 4.387.090, la patente de EE.UU. n° No. 5.104.646, la patente de EE.UU. n° 5.106.609, y la patente de EE.UU. n° 5.837.661.

2. Vehículo volátil

Cuando los polímeros para moldeado del cabello descritos más adelante se incluyen en las composiciones antimicrobianas de la presente invención, especialmente las realizaciones de champús para moldeado del cabello, es preferible en particular incluir también un vehículo volátil para solubilizar el polímero para el moldeado del cabello. Tal vehículo ayuda a dispersar el polímero para la moldeado del cabello en forma de partículas líquidas insolubles en agua por toda la composición, en donde las partículas dispersadas comprenden polímero para el moldeado y el vehículo volátil. Los vehículos adecuados para este fin incluyen hidrocarburos, éteres, ésteres, aminas, alquil alcoholes, derivados volátiles de silicona y combinaciones de los mismos, muchos ejemplos de los cuales son bien conocidos en la técnica.

Tal vehículo volátil ha de ser insoluble en agua o tener una solubilidad en agua baja. Sin embargo, el polímero para moldeado del cabello ha de ser también suficientemente soluble en el vehículo elegido para permitir la dispersión del polímero para el moldeado del cabello y la combinación de disolventes en forma de una fase fluida separada dispersa, en la composición de champú para moldeado del cabello. El vehículo debe ser también volátil. En este contexto, el término volátil significa que el vehículo tiene un punto de ebullición menor que aproximadamente 300°C, preferentemente de aproximadamente 90°C a aproximadamente 260°C, más preferentemente de aproximadamente 100°C a aproximadamente 200°C (a aproximadamente una atmósfera de presión).

La concentración del vehículo volátil en la composición ha de ser suficiente para solubilizar el polímero para el moldeado del cabello y dispersarlo como una fase fluida separada en la composición de champú. Tales concentraciones están generalmente en el intervalo de aproximadamente 0,10% a aproximadamente 10%, preferentemente de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 8%, lo más preferentemente de aproximadamente 1% a aproximadamente 6% en peso de la composición de champú, en donde la relación en peso de polímero de moldeado a vehículo es preferentemente de aproximadamente 10:90 a aproximadamente 70:30, más preferentemente de aproximadamente 20:80 a aproximadamente 65:35, incluso más preferentemente de aproximadamente 30:70 a aproximadamente 60:40. Si la relación en peso de polímero de moldeado a vehículo es demasiado baja, el comportamiento de espumado de la composición de champú se verá afectado negativamente. Si la relación de polímero a disolvente es demasiado alta, la composición se hace demasiado viscosa y causa dificultades en la dispersión del polímero de moldeado. Los agentes para el moldeado del cabello han de tener un diámetro de partícula medio en el producto final de champú de aproximadamente 0,05 a aproximadamente 100 micrómetros, preferentemente de aproximadamente 1 a aproximadamente 25 micrómetros, más preferentemente de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 10 micrómetros. El tamaño de partícula puede medirse de acuerdo con métodos conocidos en la técnica, entre los que se incluye, por ejemplo, la microscopía óptica.

Vehículos volátiles preferidos para su uso en la composición de champú son los disolventes de hidrocarburo, especialmente disolventes de hidrocarburo de cadena ramificada. Los disolventes de hidrocarburo pueden ser lineales o ramificados, saturados o insaturados, hidrocarburos que tienen de aproximadamente 8 a aproximadamente 18 átomos de carbono, preferentemente de aproximadamente 10 a aproximadamente 16 átomos de carbono. Se prefieren los hidrocarburos saturados, como lo son los hidrocarburos de cadena ramificada. Los ejemplos no limitantes de algunos hidrocarburos lineales adecuados incluyen decano, dodecano, deceno, trideceno, y combinaciones de los mismos. Los hidrocarburos de cadena ramificada adecuados incluyen isoparafinas, entre cuyos ejemplos se incluyen las isoparafinas disponibles comercialmente de Exxon Chemical Company tales como Isopar H y K (isoparafinas C₁₁-C₁₂), e Isopar L (isoparafinas C₁₁-C₁₃). Hidrocarburos de cadena ramificada preferidos son isohexadecano, isododecano, 2,5-dimetil decano, isotetradecano, y combinaciones de los mismos. Los hidrocarburos de cadena ramificada disponibles comercialmente incluyen Permetil 99A y 101A (disponible de Preperse, Inc., South Plainfield, N.J., EE.UU.).

Otros vehículos volátiles adecuados incluyen isopropanol, butil alcohol, amil alcohol, fenil etanol, bencil alcohol, fenil propanol, butirato de etilo, butirato de isopropilo, ftalato de dietilo, malonato de dietilo, succinato de dietilo, malonato de dimetilo, succinato de dimetilo, fenil etil dimetil carbinol, etil-6-acetoxihexanoato, y (2-pentanil-3-oxi) ciclopentilacetato de metilo, y mezclas de los mismos. Entre estos otros disolventes adecuados se prefieren el ftalato de

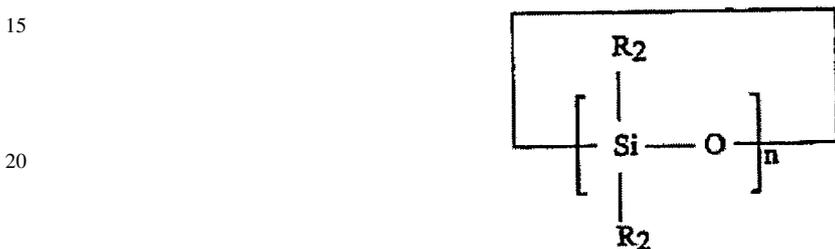
ES 2 322 688 T3

dietilo, malonato de dietilo, succinato de dietilo, malonato de dimetilo, succinato de dimetilo, feniletil dimetil carbinol, etil-6-acetoxihexanoato, y mezclas de los mismos.

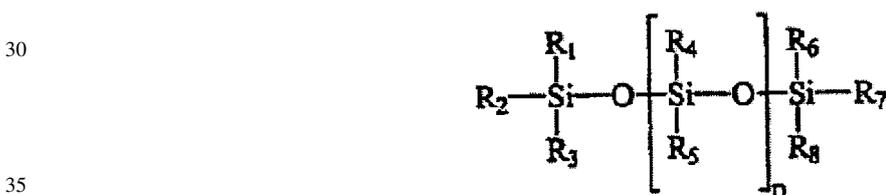
5 Vehículos de éter adecuados son los di(C₅-C₇)alquil éteres y diéteres, especialmente los di(C₅-C₆) alquil éteres tales como isoamil éter, dipentil éter y dihexil éter.

Otros vehículos volátiles adecuados para su uso en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen los derivados volátiles de silicio tales como polidialquilsiloxano cíclico o lineal, compuestos siloxi lineales o silano. El número de átomos de silicio en las siliconas cíclicas es preferentemente de aproximadamente 3 a 10 aproximadamente 7, más preferentemente de aproximadamente 3 a aproximadamente 5.

La fórmula general para tales siliconas es:



25 en la que R₁ y R₂ se eligen independientemente entre alquilo C₁ a C₈, arilo o alquilarilo y en la que n = 3 a 7. Los poliorganosiloxanos lineales tienen de aproximadamente 2 a 7 átomos de silicio y tienen la fórmula general:



35 en la que R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ y R₈ pueden ser independientemente grupos C₁-C₈ saturados o insaturados alquilo, arilo, alquilarilo, hidroxialquilo, amino alquilo o alquil siloxi.

40 Los compuestos siloxi lineales tienen la fórmula general:



50 en la que R₁, R₂, R₃, R₄, R₅ y R₆ se eligen independientemente entre grupos C₁ a C₇ saturados o insaturados alquilo, arilo y alquil arilo y R₇ es alquileno C₁ a C₄.

55 Los compuestos de silano tienen la fórmula general:



65 en la que R₁, R₂, R₃ y R₄ pueden elegirse independientemente entre los grupos C₁-C₈ alquilo, arilo, alquilarilo, hidroxialquilo y alquilsiloxi.

Las siliconas del tipo anterior, tanto cíclicas como lineales, son ofrecidas por Dow Corning Corporation, fluidos Dow Corning 344, 345 y 200, Union Carbide, Silicona 7202 y Silicona 7158, y Stauffer Chemical, SWS-03314.

Las siliconas volátiles tienen generalmente viscosidades menores que aproximadamente 5 centistokes a 25°C mientras que los materiales cíclicos tienen viscosidades menores que aproximadamente 10 centistokes. Ejemplos de siliconas volátiles se describen en Todd y Byers, "Volatile Silicone Fluids for Cosmetics", Cosmetics and Toiletries, Vol. 91, enero, 1976, pp. 27-32, y también en Silicon Compounds, páginas 253 a 295, distribuido por Petrarch Chemicals.

5

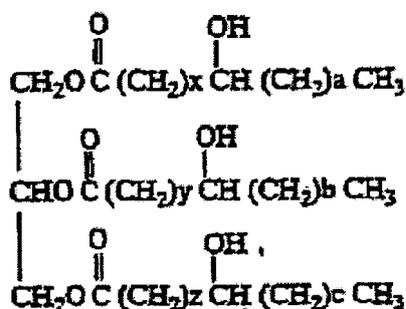
3. Principio activo de estabilidad seleccionado

En las realizaciones de champú para moldeado de la presente invención que incluyen un polímero de moldeado del cabello y un vehículo volátil, es también preferible que la composición contenga un principio activo de estabilidad seleccionado. El estabilizante cristalino seleccionado, que contiene grupos hidroxilo, se usa para formar una red cristalina estabilizante en la emulsión, que impide la coalescencia de las gotículas de polímero de moldeado/vehículo volátil y la separación de las fases en el champú. Adicionalmente, se necesita usar niveles significativamente más bajos de estabilizante cristalino, que contiene grupos hidroxilo, en relación con los principios activos de estabilidad tradicionales. Esto tiene por resultado una mejor eficacia de deposición del polímero para el moldeado del cabello sobre el pelo, así como una reducción de las interacciones con otros componentes del champú.

15

El estabilizante adecuado para ser usado en las composiciones de champú se caracteriza por la fórmula general:

20



25

30

en la que:

35

(x + a) es de 11 a 17,

(y + b) es de 11 a 17,

40

(z + c) es de 11 a 17;

o preferentemente:

45

x = y = z = 10, y

a = b = c = 5.

50

El estabilizante cristalino que contiene grupos hidroxilo comprende de aproximadamente 0,005% a aproximadamente 0,5%, preferentemente de aproximadamente 0,05% a aproximadamente 0,25% en peso de la composición. Un agente estabilizante preferido para su uso en las realizaciones de champú para moldeado de las composiciones antimicrobianas de la presente invención es la trihidroxiestearina, disponible de Rheox, Inc. (New Jersey, EEUU) bajo el nombre comercial "THIXCIN R".

55

Ingredientes opcionales

A. Otros principios activos antimicrobianos

60

Además del principio activo antimicrobiano elegido entre sales de metales polivalentes de piritiona, las composiciones de la presente invención pueden comprender además uno o más principios activos anti-fúngicos o antimicrobianos, además de los principios activos de sal metálica de piritiona. Los principios activos antimicrobianos adecuados incluyen alquitrán de carbón, azufre, pomada de Whitfield, pintura de castellani, cloruro de aluminio, violeta de geniana, octopirox, compuesto de ácido undecilénico, permanganato potásico, sulfuro de selenio, tiosulfato sódico, propilenglicol, aceite de naranja amarga, preparados de urea, griseofulvina, 8-hidroxiquinoleina ciloquinol, tiabendazol, tiocarbamatos, haloprogina, polienos, hidroxipiridona, morfolina, bencilamina, alilaminas (tales como terbinafina), y azoles. Los antimicrobianos preferidos incluyen itraconazol, cetoconazol, sulfuro de selenio y alquitrán de carbón.

65

1. Azoles

Los productos antimicrobianos de azol incluyen imidazoles tales como bironazol, nitrato de butaconazol, climbazol, clotrimazol, croconazol, eberconazol, econazol, fenticonazol, flutimazol, isoconazol, itraconazol, cetoconazol, lanoconazol, miconazol, neticonazol, omoconazol, nitrato de oxiconazol, sertaconazol, nitrato de sulconazol, tioconazol, y trizoles tales como terconazol. Cuando está presente en la composición, el principio activo antimicrobiano de azol se incluye en una cantidad de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 5%, preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 3%, y más preferentemente de aproximadamente 0,3% a aproximadamente 2% en peso de la composición. En la presente invención es especialmente preferido el cetoconazol.

2. Sulfuro de selenio

El sulfuro de selenio es un agente anticasca en partículas adecuado para ser usado en las composiciones antimicrobianas de la presente invención, cuyas concentraciones efectivas están en el intervalo de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 4% en peso de la composición, preferentemente de aproximadamente 0,3% a aproximadamente 2,5%, más preferentemente de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 1,5%. El sulfuro de selenio se considera generalmente como un compuesto que tiene un mol de selenio y dos moles de azufre, aunque también puede ser una estructura cíclica que se ajusta a la fórmula general Se_xS_y , en la que $x + y = 8$. Los diámetros de partícula medios para el sulfuro de selenio son típicamente menores que $15 \mu\text{m}$, medidos mediante el dispositivo de dispersión de luz de láser por detrás (p. ej. instrumento Malvern 3600), preferentemente menor que $10 \mu\text{m}$. Los compuestos de sulfuro de selenio se describen, por ejemplo, en la patente de EE.UU. n° 2.694.668, la patente de EE.UU. n° 3.152.046, la patente de EE.UU. n° 4.089.945 y la patente de EE.UU. n° 4.885.107.

3. Azufre

También puede usarse azufre como agente antimicrobiano/anticasca en partículas en las composiciones antimicrobianas de la presente invención. Las concentraciones efectivas del azufre en partículas son típicamente de aproximadamente 1% a aproximadamente 4% en peso de la composición, preferentemente de aproximadamente 2% a aproximadamente 4%.

B. Agente de suspensión o espesante

Las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden comprender, en algunas realizaciones, de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 10% en peso de la composición, preferentemente de aproximadamente 0,3% a aproximadamente 5%, más preferentemente de aproximadamente 0,3% a aproximadamente 2,5%, de un agente de suspensión adecuado para la aplicación al pelo o a la piel. Se cree que el agente de suspensión suspende materiales dispersos insolubles en agua, en las composiciones antimicrobianas. Tal agente de suspensión ha de ser física y químicamente compatible con los componentes esenciales de la composición, y no deben perjudicar excesivamente de ninguna otra forma la estabilidad, la estética ni el rendimiento del producto. Los ejemplos de agentes de suspensión que pueden emplearse adecuadamente en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen, pero sin limitarse a ellos: derivados acilo, óxidos de amina de cadena larga, goma xantano, y mezclas de los mismos. Estos y otros agentes de suspensión adecuados se describen más detalladamente más adelante.

Los agentes de suspensión cristalinos son preferidos para suspender el agente antimicrobiano en partículas en las composiciones antimicrobianas. El agente de suspensión elegido, a la concentración elegida, debe ayudar a mantener la suspensión durante un periodo de al menos un mes, preferentemente al menos tres meses, más preferentemente al menos aproximadamente veinticuatro meses, a temperatura ambiente. En general, las concentraciones efectivas del agente de suspensión cristalino están en el intervalo de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 10%, preferentemente de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 5%, más preferentemente de aproximadamente 1% a aproximadamente 4%, lo más preferentemente de aproximadamente 1% a aproximadamente 3% en peso de la composición antimicrobiana.

En general, las concentraciones del agente de suspensión cristalino deben reducirse al mínimo para conseguir solamente la propiedad deseada.

Los agentes de suspensión cristalinos preferidos son los derivados de acilo y óxidos de amina, especialmente los derivados de acilo, especialmente aquellos que pueden ser solubilizados en una solución de premezcla y después ser recristalizados al enfriarse. Estos materiales comprenden grupos alifáticos de cadena larga (p. ej. C_8 - C_{22} , preferentemente C_{14} - C_{22} , más preferentemente C_{16} - C_{22}), es decir, materiales derivados de acilo de cadena larga y óxidos de amina de cadena larga, así como mezclas de tales materiales. Se incluyen ésteres de cadena larga de etilen glicol, alcanolamidas de ácidos grasos de cadena larga, ésteres de cadena larga de ácidos grasos de cadena larga, gliceril ésteres de cadena larga, ésteres de cadena larga de alcanolamidas de cadena larga, y óxidos de alquil de cadena larga dimetil amina, y combinaciones de los mismos.

Agentes de suspensión cristalinos se describen, por ejemplo, en la patente de EE.UU. n° 4.741.855.

Los agentes de suspensión adecuados para su uso en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen ésteres de etilenglicol de ácidos grasos que tienen preferentemente de aproximadamente 14 a aproximadamente 22 átomos de carbono, más preferentemente 16 a 22 átomos de carbono. Más preferidos son los estearatos de etilenglicol, tanto el mono como el diestearato, pero en particular el diestearato que contiene menos que aproximadamente 7% de monoestearato. Otros agentes de suspensión incluyen alcanolamidas de ácidos grasos, que preferentemente tienen de aproximadamente 16 a aproximadamente 22 átomos de carbono, más preferentemente de aproximadamente 16 a 18 átomos de carbono. Las alcanolamidas preferidas son la monoetanolamida del ácido esteárico, dietanolamida del ácido esteárico, monoisopropanolamida del ácido esteárico y estearato de monoetanolamida del ácido esteárico. Otros derivados acilo de cadena larga incluyen ésteres de cadena larga de ácidos grasos de cadena larga (p. ej., estearato de estearilo, palmitato de cetilo); ésteres de glicerilo (p. ej., diestearato de glicerilo) y ésteres de cadena larga de alcanolamidas de cadena larga (p. ej., diestearato de estearamida dietanolamida, estearato de estearamida monoetanolamida). Los ésteres de etilenglicol de ácidos carboxílicos de cadena larga, óxidos de amina de cadena larga, y alcanolamidas de ácidos carboxílicos de cadena larga, además de los materiales preferidos listados anteriormente, pueden ser usados como agentes de suspensión.

Los agentes de suspensión incluyen también óxidos de amina de cadena larga tales como óxidos de alquil (C₁₆-C₂₂) dimetilamina, p. ej. óxido de estearil dimetil amina.

Otros derivados de acilo de cadena larga que pueden ser usados incluyen ácido N,N-dihidrocarbilo (C₁₂-C₂₂, preferentemente C₁₆-C₁₈) amido benzoico y sus sales solubles (p. ej. sales de Na y K), en particular las especies ácido N,N-di(C₁₆-C₁₈, y sebo hidrogenado) amidobenzoico de esta familia, que son disponibles comercialmente de Stepan Company (Northfield, Ill., EE.UU.).

El agente de suspensión cristalino puede ser incorporado a las composiciones antimicrobianas de la presente invención solubilizándolo en una solución que contiene agua y un agente tensioactivo aniónico de sulfato, a una temperatura por encima del punto de fusión del agente de suspensión. El agente de suspensión se recristaliza entonces, típicamente enfriando la solución hasta una temperatura suficiente para inducir la cristalización.

Otros agentes de suspensión adecuados para su uso en las composiciones antimicrobianas que pueden utilizarse incluyen espesantes poliméricos tales como polímeros de carboxivinilo, ejemplos de los cuales se describen en la patente de EE.UU. n° 2.798.053, y en la patente de EE.UU. n° 4.686.254. Los ejemplos de polímeros de carboxivinilo adecuados incluyen Carbopol[®]934, -940, -941, -956, -980, -981, -1342, y -1382, todos ellos disponibles comercialmente de B.F. Goodrich Company.

Otros agentes de suspensión adecuados incluyen aquellos que confieren a la composición una viscosidad de tipo gel, tales como polímeros solubles en agua o solubles en agua coloidalmente, como los éteres de celulosa (p. ej., hidroxietil celulosa), goma guar, polivinil alcohol, polivinil pirrolidona, hidroxipropil goma guar, almidón y derivados de almidón, y otros espesantes, agentes de modificación de la viscosidad, agentes gelificantes, goma xantano y combinaciones de los mismos. Un agente modificador de la viscosidad preferido, útil como agente de suspensión, es la trihidroxiestearina (p. ej. THIXIN R[®], disponible de Rheox Company).

Otros agentes de suspensión adecuados se describen en las patentes de EE.UU. n° 4.788.006 y n° 4.704.272.

C. *Polímero catiónico de deposición*

En algunas realizaciones, las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden incluir un polímero orgánico catiónico que se usa como coadyuvante para la deposición. Tal coadyuvante para la deposición es especialmente útil en composiciones antimicrobianas que contienen también un polímero de moldeado del cabello como se describe más adelante en el presente texto. Cuando se incluyen en composiciones de la presente invención, la concentración del polímero catiónico está en el intervalo de aproximadamente 0,025% a aproximadamente 3%, preferentemente de aproximadamente 0,05% a aproximadamente 0,5%, más preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 0,25% en peso da la composición.

Los ejemplos de polímeros catiónicos adecuados para su uso en las composiciones de la presente invención incluyen restos catiónicos que contienen nitrógeno, tales como amonio cuaternario o restos amino catiónicos protonados. Las aminas catiónicas protonadas pueden ser aminas primarias, secundarias o terciarias (preferentemente secundarias o terciarias), dependiendo de la especie particular y el pH de la composición elegido. El peso molecular medio del polímero catiónico está entre aproximadamente 10 millones y aproximadamente 5.000, preferentemente al menos aproximadamente 100.000, más preferentemente al menos aproximadamente 200.000, pero preferentemente no más de aproximadamente 2 millones, más preferentemente no más de aproximadamente 1,5 millones. Los polímeros tienen también una densidad de carga catiónica que se encuentra en el intervalo de aproximadamente 0,2 meq/gm a aproximadamente 7 meq/gm, preferentemente al menos aproximadamente 0,4 meq/gm, más preferentemente al menos aproximadamente 0,6 meq/gm, pero también preferentemente menor que aproximadamente 5 meq/gm, más preferentemente menor que aproximadamente 2 meq/gm, al pH del uso para el que se destina la composición, que para composiciones de champú, el pH estará generalmente en el intervalo de aproximadamente pH 3 a aproximadamente pH 9, preferentemente entre aproximadamente pH 4 y aproximadamente pH 7.

ES 2 322 688 T3

Puede usarse cualquier ión contrario aniónico en asociación con los polímeros catiónicos, siempre y cuando los polímeros se mantengan solubles en agua, en la composición, o en una fase de cocervado de una composición de champú, y siempre y cuando los iones contrarios sean físicamente y químicamente compatibles con los componentes esenciales de la composición o no afecten excesivamente de alguna otra forma al rendimiento, la estabilidad o la estética del producto. Los ejemplos no limitantes de tales iones contrarios incluyen haluros (p. ej., cloro, flúor, bromo, yodo), sulfato y metilsulfato.

El resto catiónico que contiene nitrógeno del polímero catiónico está generalmente presente como un sustituyente en todas, o más típicamente en algunas de sus unidades monómeras. Así, los polímeros catiónicos adecuados para su uso en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen homopolímeros, copolímeros, terpolímeros, etc., de unidades de amonio cuaternario o monómeros catiónicos sustituidos con amina, opcionalmente en combinación con monómeros no catiónicos denominados en el presente texto como monómeros espaciadores. Los ejemplos no limitantes de tales polímeros se describen en el *CTFA Cosmetic Ingredient Dictionary*, 3ª edición, editado por Estrin, Crosley, y Haynes, (The Cosmetic, Toiletry, and Fragrance Association, Inc., Washington, D.C. (1982)).

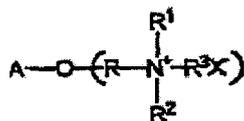
Los ejemplos no limitantes de polímeros catiónicos adecuados incluyen copolímeros monómeros de vinilo que tienen funcionalidades catiónicas amina protonada o amonio cuaternario con monómeros espaciadores solubles en agua tales como acrilamida, metacrilamida, alquil y dialquil acrilamidas, alquil y dialquil metacrilamidas, acrilato de alquilo, metacrilato de alquilo, vinil caprolactona o vinil pirrolidona. Los monómeros sustituidos con alquilo y dialquilo tienen preferentemente grupos alquilo de C₁ a C₇, más preferentemente grupos alquilo de C₁ a C₃. Otros monómeros espaciadores adecuados incluyen ésteres de vinil, alcohol vinílico (preparado por hidrólisis de poli(acetato de vinilo), anhídrido maleico, propilenglicol, y etilenglicol.

Los monómeros catiónicos protonados de amino y amonio cuaternario adecuados para su inclusión en los polímeros catiónicos de la composición antimicrobiana de la presente invención, incluyen compuestos de vinilo sustituido con acrilato de dialquilaminoalquilo, metacrilato de dialquilaminoalquilo, acrilato de monoalquilaminoalquilo, metacrilato de monoalquilaminoalquilo, sal de amonio de trialquil metacriloxialquilo, sal de amonio de trialquil acriloxialquilo, sales de amonio cuaternario de dialilo, y monómeros de vinil amonio cuaternario que tienen anillos nitrogenados catiónicos cíclicos tales como piridinio, imidazolio, y pirrolidona cuaternizada, p. ej. alquil vinil imidazolio, alquil vinil piridinio, sales de alquil vinil pirrolidona. Las porciones alquilo de estos monómeros son preferentemente alquilos inferiores tales como los alquilos C₁, C₂ ó C₃.

Los monómeros de vinilo sustituidos con amina adecuados para su uso en la presente invención incluyen acrilato de dialquilaminoalquilo, metacrilato de dialquilaminoalquilo, dialquilaminoalquil acrilamida, y dialquilaminoalquil metacrilamida, en donde los grupos alquilo son preferentemente hidrocarbilos C₁-C₇, más preferentemente alquilos C₁-C₃.

Otros polímeros catiónicos adecuados para su uso en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen copolímeros de 1-vinil-2-pirrolidona y sal de 1-vinil-3-metilimidazolio (p. ej. sal cloruro) (llamado en la industria por la Cosmetic, Toiletry, and Fragrance Association, "CTFA", Poliquaternium-16), tales como los que son comercialmente disponibles de BASF Wyandotte Corp. (Parsippany, N.J., EE.UU.) bajo el nombre comercial LUVIQUAT (p. ej. LUVIQUAT FC 370); copolímeros de 1-vinil-2-pirrolidona y metacrilato dimetilaminoetilo (denominados en la industria por TEA como Poliquaternium-11) tal como los que son disponibles comercialmente de ISP Corporation (Wayne, N.J., EE.UU.) nombre comercial GAFQUAT (p. ej. GAFQUAT 755N); polímeros catiónicos que contienen dialil amonio cuaternario, entre los que se incluyen, por ejemplo, homopolímero de cloruro dimetildialilamonio y copolímeros de acrilamida y cloruro dimetildialilamonio, denominados en la industria (CTFA) como Poliquaternium 6 y Poliquaternium 7, respectivamente; y sales de ácidos minerales de amino-alquil ésteres de homopolímeros y copolímeros de ácidos carboxílicos insaturados que tienen de 3 a 5 átomos de carbono, como se describen en la patente de EE.UU. n° 4.009.256.

Otros polímeros catiónicos adecuados para su uso en la composición antimicrobiana incluyen polímeros de polisacárido, tales como derivados catiónicos de celulosa y derivados catiónicos de almidón. Los polímeros catiónicos de polisacárido adecuados incluyen aquellos que se ajustan a la fórmula



en la que A es un grupo residual anhidroglucosa, tal como un grupo residual anhidroglucosa de almidón o celulosa; R es un grupo alquileno, oxialquileno, polioxilquileno o hidroxialquileno, o una combinación de los mismos; R₁, R₂, y R₃ son independientemente grupos alquilo, arilo, alquilarilo, arilalquilo, alcoxilquilo o alcoxiarilo, conteniendo cada grupo hasta aproximadamente 18 átomos de carbono, y siendo preferentemente el número total de átomos de carbono para cada resto catiónico (es decir, la suma de átomos de carbono en R₁, R₂ y R₃) aproximadamente 20 o menos; y X es un ion contrario aniónico como se describió anteriormente.

ES 2 322 688 T3

Los polímeros catiónicos de celulosa preferidos son los polímeros que son disponibles de Amerchol Corp. (Edison, N.J., EE.UU.) en sus series de polímeros Polymer JR y LR, como sales de hidroxietil celulosa a las que se ha hecho reaccionar con epóxido sustituido con trimetil amonio, denominados en la industria (CTFA) como Poliquaternium 10. Otro tipo preferido de celulosa catiónica incluye las sales polímeras de amonio cuaternario de hidroxietil celulosa a las que se ha hecho reaccionar con epóxido sustituido con lauril dimetil amonio, denominado en la industria (CTFA) como Poliquaternium 24. Estos materiales son disponibles de Amerchol Corp. (Edison, N.J., EE.UU.) bajo el nombre comercial Polymer LM-200.

Otros polímeros catiónicos adecuados incluyen derivados catiónicos de goma guar, tales como cloruro de guar hidroxipropiltrimonio, cuyo ejemplos específicos incluyen la serie Jaguar disponible comercialmente de Rhone-Poulenc Incorporated. Los derivados catiónicos de goma guar preferidos incluyen Jaguar[®] C 13S y Jaguar[®] C 17 (ambos disponibles de Rhodia Company). Otros polímeros catiónicos adecuados incluyen éteres de celulosa que contienen nitrógeno cuaternario, algunos ejemplos de los cuales se describen en la patente de EE.UU. n° 3.962.418. Otros polímeros catiónicos adecuados incluyen copolímeros de celulosa eterificada, guar y almidón, algunos ejemplos de los cuales se describen en la patente de EE.UU. n° 3.958.581.

Otros polímeros catiónicos adecuados para su uso en composiciones antimicrobianas de la presente invención son copolímeros de monómeros de vinilo, que tienen funcionalidades de amina catiónica protonada o amonio cuaternario, que se hacen reaccionar con monómeros solubles en agua. Los ejemplos no limitantes de tales monómeros incluyen: acrilamida, metacrilamida, alquil y dialquil acrilamidas, alquil y dialquil metacrilamidas, acrilato de alquilo, metacrilato de alquilo, vinil caprolactona, vinil pirrolidona, y mezclas de los mismos. Los monómeros sustituidos con alquilo y dialquilo tienen preferentemente grupos alquilo de C₁ a C₇, más preferentemente grupos alquilo de C₁ a C₃. Otros monómeros adecuados incluyen ésteres de vinilo, alcohol vínico (obtenido por hidrólisis de acetato de polivinilo), anhídrido maleico, propilenglicol, etilenglicol, y mezclas de los mismos.

Los monómeros amino catiónicos protonados y amonio cuaternario adecuados, para su inclusión en los polímeros catiónicos de la composición antimicrobiana de la presente invención, incluyen compuestos de vinilo sustituidos con acrilato de dialquilaminoalquilo, metacrilato de dialquilaminoalquilo, acrilato de monoalquilaminoalquilo, metacrilato de monoalquilaminoalquilo, sal de trialquil metacriloxialquil amonio, sal de trialquil acriloxialquil amonio, sales de dialil amonio cuaternario; y monómeros de vinil amonio cuaternario que tienen anillos cíclicos catiónicos que contienen nitrógeno tales como piridinio, imidazolio, y pirrolidonas cuaternizadas, tales como las sales de alquil vinil imidazolio, alquil vinil piridinio, y alquil vinil pirrolidona. Las porciones alquilo de estos monómeros son preferentemente alquilos inferiores, tales como los alquilos C₁-C₃.

Los monómeros de vinilo sustituidos con amina adecuados para su uso en la presente invención incluyen dialquilaminoalquil acrilamida y dialquilaminoalquil metacrilamida, en las que los grupos alquilo son preferentemente hidrocarbilos C₁ a C₇, más preferentemente alquilos C₁ a C₃.

Otros polímeros catiónicos adecuados para su uso en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen: copolímeros de sal de 1-vinil-2-pirrolidona y 1-vinil-3-metilimidazolio (p. ej., sal cloruro), conocidos en la industria (CTFA) como Poliquaternium 16 (p. ej. Luviquat[®] FC 370, disponible de BASF Wyandotte Corporation); copolímeros de 1-vinil-2-pirrolidona y metacrilato de dimetilaminoetilo, conocidos en la industria (CTFA) como Poliquaternium 11 (p. ej. Gafquat[®] 755N, disponible de ISP Corporation); polímeros catiónicos que contienen dialil amonio cuaternario, incluyendo, por ejemplo, homopolímero de cloruro de dimetildialilamonio, conocidos en la industria (CTFA) como Poliquaternium 6; copolímeros de acrilamida y cloruro de dimetildialilamonio, conocidos en la industria (CTFA) como Poliquaternium 7; y sales de ácido mineral de amino-alquil ésteres de homopolímeros y copolímeros de ácidos carboxílicos insaturados C₃ a C₅, tales como los que se describen en la patente de EE.UU. n° 4.009.256.

Hay otros polímeros catiónicos para su uso en las composiciones antimicrobianas de la presente invención que son proteínas catiónicas modificadas, tales como laurildimonio hidroxipropil colágeno (p. ej. Croquat[®] L, disponible de Croda Corporation), o queratina de cabello hidrolizada con cocodimonio hidroxipropilo (p. ej. Croquat[®] HH, disponible de Croda Corporation). Otros polímeros catiónicos incluyen la sal cuaternaria polímera preparada por la reacción de ácido adípico y dimetilaminopropilamina, reaccionada con dicloroetil éter, conocidos en la industria (CTFA) como Poliquaternium 2 (p. ej. Mirapol[®] AD-1, disponible de Rhodia), y la sal polímera cuaternaria preparada por la reacción de ácido azelaico y dimetilaminopropil éter, conocida en la industria (CTFA) como Poliquaternium 18 (p. ej. Mirapol[®] AZ-1, disponible de Rhodia Corporation).

Otros polímeros catiónicos adecuados para ser usados en la presente invención son la serie Arquad[®] de sales de amonio cuaternario, disponible de Akzo Nobel. Otros polímeros catiónicos preferidos para su uso en la presente invención incluyen: Polímero KG30M (poliquaternium 10 y celulosa cuaternizada), Incroquat[®] behenil trimonio metosulfato (cetearil alcohol y behenil trimonio metosulfato), disponible de Croda; Merquat[®] 5 (resina de amonio cuaternario) disponible de Calgon; Gafquat[®] serie 440 (copolímeros catiónicos cuaternizados) disponible de ISP; Akypoquat[®] 131, disponible de Kao; Salcare[®] SC 60 (resina de amonio cuaternario), o Salcare[®] SC95 o SC96 (espesantes de dispersión líquidos catiónicos), todos ellos disponibles de Ciba; y Meadowquat[®] HG (PEG-2-dimeadowfoamamido-etilmonio metosulfato), disponible de Fanning.

Los polímeros catiónicos de la presente invención pueden ser solubles en la composición antimicrobiana, o bien preferentemente son solubles en una fase de coacervado complejo de la composición, formado por un polímero ca-

tiónico y un componente de agente tensioactivo detergente aniónico descrito anteriormente en el presente texto. Los coacervados complejos del polímero catiónico puede también estar formado con otros materiales cargados en la composición antimicrobiana.

- 5 La formación de coacervado depende de diversos criterios tales como el peso molecular, la concentración del componente, y la relación de componentes iónicos interaccionantes, la fuerza iónica (incluyendo la modificación de la fuerza iónica, por ejemplo, mediante la adición de sales), la densidad de carga de los componentes catiónicos y aniónicos, pH, y temperatura. Los sistemas de coacervado y el efecto de estos parámetros han sido descritos, por ejemplo, por J. Caelles, *et al.*, "Anionic and Cationic Compounds in Mixed Systems", *Cosmetics and Toiletries*, Vol. 106, Abril
10 1991, pp 49-54, C. J. van Oss, "Coacervation, Complex-Coacervation and Flocculation", *J. Dispersion Science and Technology*, Vol. 9 (5,6), 1988-89, pp 561-573, y D. J. Burgess, "Practical Analysis of Complex Coacervate Systems", *J. of Colloid and Interface Science*, Vol. 140, No. 1, Noviembre 1990, pp 227-238.

D. Polímero para moldeado

- 15 Ciertas realizaciones de las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden incluir un polímero de moldeado del cabello insoluble en agua. Cuando está presente, las concentraciones de polímero de moldeado están en el intervalo de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 10%, preferentemente de aproximadamente 0,3% a aproximadamente 7%, más preferentemente de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 5% en peso de la composición. Estos polímeros de moldeado son especialmente útiles en realizaciones de champú de moldeado de la presente invención ya que proporcionan depósitos poliméricos sobre el pelo después de su aplicación desde una composición de champú. El polímero depositado en el pelo tiene resistencia de adhesión y cohesión y proporciona moldeado principalmente formando uniones entre las fibras del pelo al secarse, como conocen los expertos en la técnica.

- 25 Muchos de tales polímeros son conocidos en la técnica, incluyendo los polímeros orgánicos insolubles en agua y polímeros injertados con silicona insolubles en agua, todos los cuales son adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención, siempre y cuando tengan también los aspectos requeridos o las características descritas más adelante en el presente texto, y sean compatibles con los componentes esenciales de la invención. Tales polímeros pueden prepararse por técnicas de polimerización convencionales o de otra forma bien
30 conocidas en este campo, un ejemplo de las cuales incluye la polimerización por radicales libres.

Los ejemplos de polímeros orgánicos y de injerto de silicona adecuados para su uso en la composición antimicrobiana de la presente invención se describen con más detalle más adelante.

35 1. Polímero orgánico de moldeado

- Los polímeros para el moldeado del cabello adecuados para ser usados en la composición antimicrobiana de la presente invención incluyen polímeros orgánicos de moldeado del cabello bien conocidos en la técnica. Los polímeros orgánicos de moldeado pueden ser homopolímeros, copolímeros, terpolímeros u otros polímeros superiores, pero han
40 de comprender uno o más monómeros hidrófobos polimerizables para hacer entonces que el polímero de moldeado resultante sea hidrófobo e insoluble en agua, como se define en el presente texto. Por tanto los polímeros de moldeado pueden comprender además otros monómeros hidrófilos solubles en agua, siempre y cuando el polímero de moldeado resultante tenga la hidrofobicidad y la insolubilidad en agua requeridas.

- 45 Como se usa en el presente texto, la expresión "monómero hidrófobo" se refiere a monómeros orgánicos polimerizables que pueden formar con monómeros similares un homopolímero insoluble en agua, y la expresión "monómero hidrófilo" se refiere a monómeros orgánicos polimerizables que pueden formar con monómeros similares un homopolímero soluble en agua.

- 50 Los polímeros orgánicos de moldeado tienen preferentemente un peso molecular medio ponderado de al menos aproximadamente 20.000, preferentemente mayor que aproximadamente 25.000, más preferentemente mayor que aproximadamente 30.000, lo más preferentemente mayor que aproximadamente 35.000. No hay un límite superior para el peso molecular excepto el que limite la aplicabilidad de la invención por razones prácticas, tales como procesado, características estéticas, formulación, etc. En general, el peso molecular medio ponderado será menor que aproximadamente 10.000.000, más generalmente menor que aproximadamente 5.000.000, y típicamente menor que aproximadamente 2.000.000. Preferentemente, el peso molecular medio ponderado estará entre aproximadamente 20.000 y aproximadamente 2.000.000, más preferentemente entre aproximadamente 30.000 y aproximadamente 1.000.000, y lo más preferentemente entre aproximadamente 40.000 y aproximadamente 500.000.

- 60 Los polímeros orgánicos de moldeado también tienen preferentemente una temperatura de transición vítrea (T_g) o un punto de fusión cristalina (T_m) de al menos aproximadamente -20°C, preferentemente de aproximadamente 20°C a aproximadamente 80°C, más preferentemente de aproximadamente 20°C a aproximadamente 60°C. Los polímeros de moldeado que tienen estos valores de T_g o T_m forman películas moldeadoras sobre el pelo que no son indebidamente pegajosas al tacto. Como se usa en el presente texto, la abreviatura "T_g" se refiere a la temperatura de transición del esqueleto del polímero, y la abreviatura "T_m" se refiere al punto de fusión cristalina del esqueleto, si existe tal transición para un polímero dado. Preferentemente, tanto T_g como T_m, si los hay, están dentro de los intervalos citados anteriormente.

Los polímeros orgánicos de moldeo son cadenas carbonadas derivadas de la polimerización de monómeros hidrófobos, tales como monómeros insaturados etilénicamente, cadenas celulósicas u otras cadenas polímeras derivadas de carbohidratos. El esqueleto puede comprender grupos éter, grupos éster, grupos amida, uretanos, combinaciones de los mismos, y similares.

5

Los polímeros orgánicos de moldeo pueden comprender uno o más monómeros hidrófilos en combinación con los monómeros hidrófobos descritos en el presente texto, con la condición de que el polímero de moldeo resultante tenga el carácter hidrófobo y la insolubilidad en agua requeridos. Los monómeros hidrófilos adecuados incluyen, pero sin limitarse a ellos, ácido acrílico, ácido metacrílico, N,N-dimetilacrilamida, metacrilato de dimetil aminoetilo, metacrilato de dimetilaminoetilo cuaternizado, metacrilamida, N-t-butil acrilamida, ácido maleico, anhídrido maleico y sus hemiésteres, ácido crotonico, ácido itacónico, acrilamida, alcoholes de acrilato, metacrilato de hidroxietilo, cloruro de dialildimetil amonio, vinil pirrolidona, vinil éteres (tales como metil vinil éter), maleimidias, vinil piridina, vinil imidazol, otros vinil heterociclos polares, sulfonato de estireno, alil alcohol, vinil alcohol (tales como los producidos por hidrólisis de acetato de vinilo después de la polimerización), sales de cualquiera de los ácidos y aminos listados anteriormente, y mezclas de los mismos. Los monómeros hidrófilos preferidos incluyen ácido acrílico, N,N-dimetil acrilamida, metacrilato de dimetilaminoetilo, metacrilato de dimetil aminoetilo cuaternizado, vinil pirrolidona, sales de ácidos y aminos listados anteriormente, y combinaciones de los mismos.

10

15

Los monómeros hidrófobos adecuados para su uso en el polímero orgánico de moldeo incluyen, pero sin limitarse a ellos, ésteres de ácido acrílico o metacrílico de alcoholes C₁-C₁₈, tales como metanol, etanol, metoxi etanol, 1-propanol, 2-propanol, 1-butanol, 2-metil-1-propanol, 1-pentanol, 2-pentanol, 3-pentanol, 2-metil-1-butanol, 1-metil-1-butanol, 3-metil-1-butanol, 1-metil-1-pentanol, 2-metil-1-pentanol, 3-metil-1-pentanol, t-butanol(2-metil-2-propa-
 25 nol), ciclohexanol, neodecanol, 2-etil-1-butanol, 3-heptanol, bencil alcohol, 2-octanol, 6-metil-1-heptanol, 2-etil-1-hexanol, 3,5-dimetil-1-hexanol, 3,5,5-trimetil-1-hexanol, 1-decanol, 1-dodecanol, 1-hexadecanol, 1-octadecanol, y similares, los alcoholes que tienen de aproximadamente 1 a aproximadamente 18 átomos de carbono, preferentemente de aproximadamente 1 a aproximadamente 12 átomos de carbono; estireno; macrómero de poliestireno; acetato de vinilo; cloruro de vinilo; cloruro de vinilideno; propionato de vinilo; alfa-metilestireno; t-butilestireno; butadieno; ciclohexadieno; etileno; propileno; vinil tolueno; y mezclas de los mismos. Los monómeros hidrófobos preferidos incluyen metacrilato de n-butilo, metacrilato de isobutilo, acrilato de t-butilo, metacrilato de t-butilo, metacrilato de 2-etilhexilo, metacrilato de metilo, acetato de vinilo, y mezclas de los mismos, más preferentemente acrilato de t-butilo, metacrilato de t-butilo, o combinaciones de los mismos.

20

25

30

Cuando los hay, los polímeros de moldeo que se usan en las composiciones antimicrobianas comprenden preferentemente de aproximadamente 20% a 100%, más preferentemente de aproximadamente 50% a aproximadamente 100%, incluso más preferentemente de aproximadamente 60% a aproximadamente 100% en peso de los monómeros hidrófobos, y pueden comprender además de cero a aproximadamente 80% en peso de monómeros hidrófilos. La selección y combinación de monómeros en particular para la incorporación al polímero de moldeo ayudará a determinar sus propiedades de formulación. Por selección apropiada y combinación, por ejemplo, de monómeros hidrófilos e hidrófobos, el polímero de moldeo puede ser optimizado en cuanto a la compatibilidad física y química con los otros componentes de la composición antimicrobiana.

35

40

Los ejemplos de polímeros orgánicos de moldeo preferidos incluyen copolímeros de acrilato de t-butilo y acrilato de 2-etilhexilo que tienen una relación peso/peso de monómeros de aproximadamente 95/5, aproximadamente 90/10, aproximadamente 80/20, aproximadamente 70/30, aproximadamente 60/40, y aproximadamente 50/50; copolímeros de acrilato de t-butilo y metacrilato de 2-etilhexilo que tienen una relación peso/peso de monómeros de aproximadamente 95/5, aproximadamente 90/10, aproximadamente 80/20, aproximadamente 70/30, aproximadamente 60/40, y aproximadamente 50/50; copolímeros de metacrilato de t-butilo y acrilato de 2-etilhexilo que tienen una relación peso/peso de monómeros de aproximadamente 95/5, aproximadamente 90/10, aproximadamente 80/20, aproximadamente 70/30, aproximadamente 60/40, y aproximadamente 50/50; copolímeros de metacrilato de t-butilo y metacrilato de 2-etilhexilo que tienen una relación peso/peso de monómeros de aproximadamente 95/5, aproximadamente 90/10, aproximadamente 80/20, aproximadamente 70/30, aproximadamente 60/40, y aproximadamente 50/50; copolímeros de etacrilato de t-butilo y metacrilato de 2-etilhexilo que tienen una relación peso/peso de monómeros de aproximadamente 95/5, aproximadamente 90/10, aproximadamente 80/20, aproximadamente 70/30, aproximadamente 60/40, y aproximadamente 50/50; copolímeros de vinil pirrolidona y acetato de vinilo que tienen una relación peso/peso de monómeros de aproximadamente 10/90, y aproximadamente 5/95; y mezclas de los mismos.

45

50

55

Polímeros especialmente preferidos son los copolímeros de acrilato de t-butilo y metacrilato de 2-etilhexilo que tienen una relación peso/peso de monómeros de aproximadamente 95/5, aproximadamente 90/10, aproximadamente 80/20, aproximadamente 70/30, aproximadamente 60/40, y aproximadamente 50/50; copolímeros de metacrilato de t-butilo y metacrilato de 2-etilhexilo que tienen una relación peso/peso de monómeros de aproximadamente 95/5, aproximadamente 90/10, aproximadamente 80/20, aproximadamente 70/30, aproximadamente 60/40, y aproximadamente 50/50; y mezclas de los mismos.

60

65

Ejemplos de otros polímeros de moldeo adecuados se describen en la patente de EE.UU. n° 5.120.531, de Wells *et al.*, expedida el 9 de junio de 1992, la patente de EE.UU. n° 5.120.532, de Wells *et al.*, expedida el 9 de junio de 1992, la patente de EE.UU. n° 5.104.642, de Wells *et al.*, expedida el 14 de abril de 1992, la patente de EE.UU. n° 4.272.511, de Papantoniou *et al.*, expedida el 9 de junio de 1981, la patente de EE.UU. n° 5.672.576, de Behrens *et*

al., expedida el 30 de septiembre de 1997, y la patente de EE.UU. nº 4.196.190, de Gehman *et al.*, expedida el 1 de abril de 1980.

5 2. Polímero de moldeado injertado con silicona

Otros polímeros de moldeado adecuados para su uso en la composición antimicrobiana de la presente invención son las resinas para el moldeado del pelo injertadas con silicona. Estos polímeros pueden ser usados solos o en combinación con los polímeros orgánicos de moldeado descritos en el presente texto anteriormente. Muchos de tales polímeros adecuados para ser usados en la composición antimicrobiana de la presente invención son conocidos en la técnica. Estos polímeros se caracterizan por restos de polisiloxano unidos covalentemente y colgando de un esqueleto polimérico basado en carbono.

El esqueleto del polímero injertado con silicona es preferentemente una cadena carbonada derivada de la polimerización de monómeros insaturados etilénicamente, pero también pueden ser cadenas celulósicas u otras cadenas poliméricas derivadas de carbohidrato de las que cuelgan restos de polisiloxano. El esqueleto puede también incluir grupos éter, grupos éster, grupos amida, grupos uretano y similares. Los restos de polisiloxano pueden estar sustituidos en el polímero o pueden ser preparados por copolimerización de monómeros polimerizables que contienen polisiloxano (p. ej. monómeros insaturados etilénicamente, éteres, y/o epóxidos) con monómeros polimerizables que no contienen polisiloxano.

Los polímeros de moldeado injertados con silicona para su uso en la composición antimicrobiana comprenden monómeros "que contienen silicona" (o "que contienen polisiloxano"), que forman el macrómero de silicona colgante del esqueleto, y monómeros "que no contienen silicona", que forman el esqueleto orgánico del polímero.

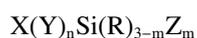
Los polímeros injertados con silicona preferidos comprenden un esqueleto orgánico, preferentemente un esqueleto carbonado derivado de monómeros insaturados etilénicamente, tales como un esqueleto polimérico de vinilo, y un macrómero de polisiloxano (especialmente preferidos son polidialquilsiloxano, lo más preferentemente polidimetilsiloxano) injertado con el esqueleto. El macrómero de polisiloxano debe tener un peso molecular medio ponderado de al menos aproximadamente 500, preferentemente de aproximadamente 1.000 a aproximadamente 100.000, más preferentemente de aproximadamente 2.000 a aproximadamente 50.000, lo más preferentemente de aproximadamente 5.000 a aproximadamente 20.000. Los esqueletos orgánicos contemplados incluyen aquellos que se derivan de monómeros polimerizables insaturados etilénicamente, entre los que se incluyen monómeros de vinilo, y otros monómeros de condensación (p. ej., aquellos que se polimerizan para formar poliamidas y poliésteres), monómeros de apertura de anillo (p. ej., etil oxazolína y caprolactona), etc. También se contemplan esqueletos basados en cadenas celulósicas, esqueletos que contienen éter, etc.

Los polímeros injertados con silicona preferidos para su uso en la composición antimicrobiana comprenden unidades de monómero derivadas de: al menos un monómero o monómeros insaturados etilénicamente polimerizables por radicales libres y al menos un monómero o monómeros insaturados etilénicamente que contienen polisiloxano polimerizables por radicales libres.

Los polímeros injertados con silicona adecuados para ser usados en la composición antimicrobiana comprenden generalmente de aproximadamente 1% a aproximadamente 50%, en peso de unidades de monómero que contienen polisiloxano y de aproximadamente 50% a aproximadamente 99% en peso de monómeros que no contienen polisiloxano. Las unidades de monómero que no contienen polisiloxano pueden derivarse de las unidades de monómeros hidrófilos y/o hidrófobos descritos anteriormente en el presente texto.

El polímero de moldeado para su uso en la composición antimicrobiana puede comprender por tanto combinaciones de las unidades de monómero hidrófobos y/o que contienen polisiloxano descritas en el presente texto, con o sin comonómeros hidrófilos como se describen en el presente texto, siempre y cuando el polímero de moldeado resultante tenga las características requeridas como se describe en el presente texto.

Los monómeros polimerizables que contienen polisiloxano adecuados incluyen, pero sin limitarse a ellos, los monómeros que se ajustan a la fórmula:

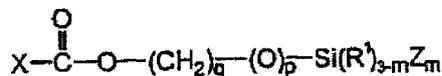


en la que X es un grupo etilénicamente insaturado copolimerizable con los monómeros hidrófobos descritos en el presente texto, tales como un grupo vinilo; Y es un grupo de unión divalente; R es un hidrógeno, hidroxilo, alquilo inferior (p. ej. C₁-C₄), arilo, alcarilo, alcoxi, o alquilamino; Z es un resto siloxano monovalente polimérico que tiene peso molecular medio numérico de al menos aproximadamente 500, que es esencialmente no reactivo bajo las condiciones de copolimerización, y es un resto colgante del esqueleto polímero de vinilo descrito anteriormente; n es 0 ó 1; y m es un número entero de 1 a 3. Estos monómeros polimerizables que contienen polisiloxano tienen un peso molecular medio ponderado como se describió anteriormente.

ES 2 322 688 T3

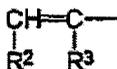
Un monómero que contiene polisiloxano preferido se ajusta a la fórmula:

5



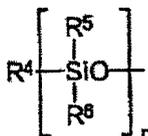
10 en la que m es 1, 2 ó 3 (preferentemente m = 1); p es 0 ó 1; q es un número entero de 2 a 6; R¹ es hidrógeno, hidroxilo, alquilo inferior, alcoxi, alquilamino, arilo, o alcarilo (preferentemente R¹ es alquilo); X se ajusta a la fórmula

15



20 en la que R² es hidrógeno o -COOH (preferentemente R² es hidrógeno); R³ es hidrógeno, metilo o -CH₂COOH (preferentemente R³ es metilo); Z se ajusta a la fórmula:

25

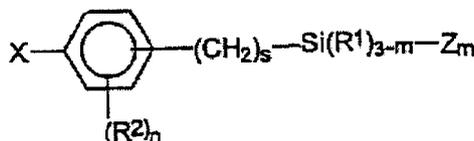


30 en la que R⁴, R⁵ y R⁶ son independientemente alquilo inferior, alcoxi, alquilamino, arilo, arilalquilo, hidrógeno o hidroxilo (preferentemente R⁴, R⁵ y R⁶ son alquilos); y r es un número entero de aproximadamente 5 o mayor, preferentemente de aproximadamente 10 a aproximadamente 1500 (lo más preferentemente r es de aproximadamente 100 a aproximadamente 250). Lo más preferentemente R⁴, R⁵ y R⁶ son metilo, p = 0, y q = 3.

35

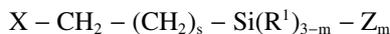
Otro monómero de polisiloxano preferido se ajusta a una de las fórmulas siguientes

40



45

o



50

en la que: s es un número entero de 0 a aproximadamente 6, preferentemente 0, 1, ó 2, más preferentemente 0 ó 1; m es un número entero de 1 a 3, preferentemente 1; R² es alquilo C1-C10 o alquilarilo C7-C10, preferentemente alquilo C1-C6 o alquilarilo C7-C10, más preferentemente alquilo C1-C2; n es un número entero de 0 a 4, preferentemente 0 ó 1, más preferentemente 0.

55

Los polímeros de moldeado injertados con silicona adecuados para ser usados en la composición antimicrobiana comprenden preferentemente de aproximadamente 50% a aproximadamente 99%, más preferentemente de aproximadamente 60% a aproximadamente 98%, lo más preferentemente de aproximadamente 75% a aproximadamente 95% en peso del polímero, de unidades de monómero que no contienen silicona, p. ej. las unidades de monómero hidrófobo e hidrófilo totales descritos en el presente texto, y de aproximadamente 1% a aproximadamente 50%, preferentemente de aproximadamente 2% a aproximadamente 40%, más preferentemente de aproximadamente 5% a aproximadamente 25% de unidades de monómero de silicona que contienen macrómero, p. ej. las unidades de monómero que contienen polisiloxano descritas en el presente texto. El nivel de unidades de monómero hidrófilo puede ser de aproximadamente 0% a aproximadamente 70%, preferentemente de aproximadamente 0% a aproximadamente 50%, más preferentemente de aproximadamente 0% a aproximadamente 30%, lo más preferentemente de aproximadamente 0% a aproximadamente 15%; el nivel de unidades de monómero hidrófobo puede ser de 30% a aproximadamente 99%, preferentemente de aproximadamente 50% a aproximadamente 98%, más preferentemente de aproximadamente 70% a aproximadamente 95%, lo más preferentemente de aproximadamente 85% a aproximadamente 95%.

65

ES 2 322 688 T3

Más adelante se da una relación de ejemplos de algunos polímeros injertados con silicona adecuados para su uso en la composición antimicrobiana de la presente invención. Cada polímero listado va seguido de su composición de monómeros como partes en peso de los monómeros usados en la síntesis:

- 5 (i) t-butilacrilato/t-butil-metacrilato/2-etilhexil-metacrilato/macrómero PDMS -peso molecular del macrómero 20.000 31/27/32/10
- (ii) t-butilmetacrilato/2-etilhexil-metacrilato/macrómero PDMS -peso molecular del macrómero 15.000 75/10/15
- 10 (iii) t-butilmetacrilato/2-etilhexil-acrilato/macrómero PDMS -peso molecular del macrómero 10.000 65/15/20
- (iv) t-butilacrilato/2-etilhexil-acrilato/macrómero PDMS peso molecular del macrómero 14.000 77/11/12
- 15 (v) t-butilacrilato/2-etilhexil-metacrilato/macrómero PDMS - peso molecular del macrómero 13.000 81/9/10.

Ejemplos de otros polímeros injertados con silicona adecuados para su uso en la composición antimicrobiana de la presente invención se describen en la solicitud EPO 90307528.1, publicada como Solicitud EPO 0 408 311 A2 el 11 de enero de 1991, Hayama, *et al.*; la patente de EE.UU. n° 5.061.481, expedida el 29 de octubre de 1991, Suzuki *et al.*; la patente de EE.UU. n° 5.106.609, Bolich *et al.*, expedida el 21 de abril de 1992; la patente de EE.UU. n° 5.100.658, Bolich *et al.*, expedida el 31 de marzo de 1992; la patente de EE.UU. n° 5.100.657, Ansher-Jackson, *et al.*, expedida el 31 de marzo de 1992; la patente de EE.UU. n° 5.104.646, Bolich *et al.*, expedida el 14 de abril de 1992, EE.UU. Ser. No. 07/758.319, Bolich *et al.*, presentada el 27 de agosto de 1991, EE.UU. Ser. No. 07/758.320., Torgerson *et al.*, presentada el 27 de agosto de 1991.

25 E. Agente de extensión catiónico

Las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden comprender además materiales catiónicos seleccionados que actúan como agentes de extensión. Los agentes de extensión que se usan en la composición son compuestos de amonio cuaternario o amino protonados seleccionados, que se definen con más detalle más adelante en el presente texto. Estos agentes de extensión seleccionados son útiles para mejorar la morfología del depósito de polímero de moldeado sobre el pelo, de forma que una adhesión más eficiente entre las fibras del pelo tenga por resultado un mejor comportamiento del moldeado. La concentración en la composición de los agentes de extensión seleccionados se encuentra en el intervalo de aproximadamente 0,05% a aproximadamente 5%, preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 2%, más preferentemente de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 1,5% en peso de la composición antimicrobiana.

Los agentes de extensión seleccionados son compuestos amonio cuaternario o amino que tiene 2, 3 ó 4 radicales N, que son cadenas de hidrocarburo sustituido o no sustituido que tienen de aproximadamente 12 a aproximadamente 30 átomos de carbono, en donde los sustituyentes incluyen restos hidrófilos no iónicos elegidos entre alcoxi, polioxialquileno, alquilamido, hidroxialquilo, alquiléster y mezclas de los mismos. Los radicales que contienen hidrófilos adecuados incluyen, por ejemplo, compuestos que tienen restos hidrófilos no iónicos elegidos entre el grupo consistente en etoxi, propoxi, polioxietileno, polioxipropileno, etilamido, propilamido, hidroximetilo, hidroxietilo, hidroxipropilo, metiléster, etiléster, propiléster, o mezclas de los mismos. Los agentes de extensión elegidos son catiónicos y han de estar cargados positivamente al pH de las composiciones de champú. Generalmente, el pH de la composición de champú será menor que aproximadamente 10, típicamente de aproximadamente 3 a aproximadamente 9, preferentemente de aproximadamente 4 a aproximadamente 8.

Los agentes de extensión catiónicos que se usan en la composición incluyen aquellos que corresponden a la fórmula:



60 en la que R₁ y R₂ son independientemente una cadena de hidrocarburo saturado o no saturado, sustituido o no sustituido, lineal o ramificada, que tiene de aproximadamente 12 a aproximadamente 30 átomos de carbono, preferentemente de aproximadamente 18 a aproximadamente 22 átomos de carbono, y en la que la cadena de hidrocarburo puede contener uno o más restos hidrófilos elegidos entre los restos alcoxi, polioxialquileno, alquilamido, hidroxialquilo, alquiléster, y mezclas de los mismos; R₃ y R₄ son independientemente un hidrógeno, o una cadena de hidrocarburo saturado o no saturado, sustituido o no sustituido, lineal o ramificada, que tiene de aproximadamente 1 a aproximadamente 30 átomos de carbono, o un hidrocarburo que tiene de aproximadamente 1 a aproximadamente 30 átomos de carbono que contiene uno o más restos aromáticos, éster, éter, amido, amino presentes como sustituyentes o como

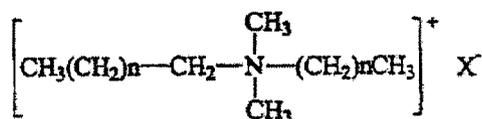
ES 2 322 688 T3

uniones en la cadena, y donde la cadena de hidrocarburo puede contener uno o más restos hidrófilos elegidos entre los restos alcoxi, polioxialquileo, alquilamido, hidroxialquilo, alquiléster, y mezclas de los mismos; y X es un anión formador de una sal soluble, elegido preferentemente entre los radicales halógeno (especialmente cloro), acetato, fosfato, nitrato, sulfonato, y alquilsulfato.

5

Un ejemplo de un agente de extensión seleccionado para su uso en la composición incluye los agentes que corresponden a la fórmula:

10



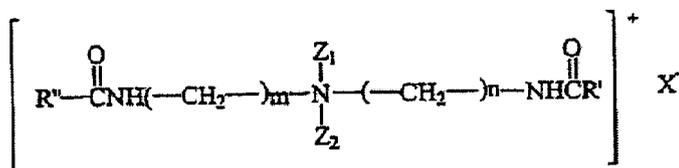
15

en la que n es de 10 a 28, preferentemente 16, y X es un anión que forma una sal soluble en agua (p. ej., Cl, sulfato, etc.).

20

Otros ejemplos de agentes de extensión catiónicos seleccionados para su uso en la composición incluyen aquellos que corresponden a la fórmula:

25



30

en la que Z₁ y Z₂ son independientemente un hidrocarburo saturado o no saturado, sustituido o no sustituido, de cadena lineal o ramificada, y preferentemente Z₁ es un grupo alquilo, más preferentemente metilo, y Z₂ es un hidroxialquilo de cadena corta, preferentemente hidroximetilo o hidroxietilo; n y m son independientemente números enteros de 1 a 4, inclusive, preferentemente de 2 a 3, inclusive, más preferentemente 2; R' y R'' son independientemente un hidrocarburo sustituido o no sustituido, preferentemente alquilo o alqueno C₁₂-C₂₀; y X es un anión que forma una sal soluble (p. ej., Cl, sulfato, etc.).

35

Entre los ejemplos no limitantes de agentes de extensión catiónicos adecuados se incluyen el cloruro de disebo (radicales del sebo) dimetilamonio, sulfato de disebodimetilamonio metilo, cloruro de dihexadecil dimetilamonio, cloruro de di-(sebo hidrogenado) dimetilamonio, cloruro de dioctadecil dimetilamonio, cloruro de dieicosil dimetilamonio, cloruro de didocosil dimetilamonio, acetato de di-(sebo hidrogenado) dimetilamonio, acetato de dihexadecil dimetilamonio, fosfato de disebo dipropilamonio, nitrato de disebo dimetilamonio, cloruro de di-(alquilo de coco) dimetilamonio, metosulfato de disebo amidoetil hidroxipropilamonio (disponible comercialmente como Varisoft 238), metosulfato de (alquilo de sebo dihidrogenado) amidoetil hidroxietilmonio (disponible comercialmente como Varisoft 110), metosulfato de di(alquilo de sebo) amidoetil hidroxietilmonio (disponible comercialmente como Varisoft 222), y metosulfato de di(alquilo de soja parcialmente endurecida)etil hidroxietilmonio (disponible comercialmente como Armocare EQ-S). El cloruro de di(alquilo de sebo) dimetilamonio, el metosulfato de di(alquilo de sebo)amidoetil hidroxipropilmonio, el metosulfato de alquilo de sebo dihidrogenado amidoetil hidroxietilmonio, el metosulfato de di(alquilo de sebo) amidoetil hidroxietilmonio, y el metosulfato de di(alquilo de soja parcialmente endurecida)etil hidroxietilmonio son agentes tensioactivos catiónicos de amonio cuaternario preferidos en particular, útiles en la presente invención.

50

Otros agentes tensioactivos catiónicos de amonio cuaternario adecuados se describen en M.C. Publishing Co., *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers*, (edición norteamericana 1979); Schwartz, *et al.*, *Surface Active Agents. Their Chemistry and Technology*, Nueva York: Interscience Publishers, 1949; la patente de EE.UU. n° 3.155.591, de Hilfer, expedida el 3 de noviembre de 1964, la patente de EE.UU. n° 3.929.678 de Laughlin *et al.*, expedida el 30 de diciembre de 1975, la patente de EE.UU. n° 3.959.461 de Bailey *et al.*, expedida el 25 de mayo de 1976, y la patente de EE.UU. n° 4.387.090 de Bolich Jr., expedida el 7 de junio de 1983.

55

60 F. Agente acondicionador de silicona

En algunas realizaciones, las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden incluir un agente acondicionador de silicona a concentraciones efectivas para proporcionar ventajas de acondicionamiento de la piel y/o del pelo. Cuanto está presente dicho agente, tales concentraciones están en el intervalo de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 10%, preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 8%, más preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 5%, lo más preferentemente de aproximadamente 0,2% a aproximadamente 3% en peso de las composiciones antimicrobianas.

65

ES 2 322 688 T3

Los agentes acondicionadores de silicona opcionales son insolubles en las composiciones antimicrobianas, y son preferentemente no volátiles. Tales agentes acondicionadores de silicona se usan preferentemente en realizaciones de champú de la presente invención. Típicamente el agente acondicionador de silicona estará entremezclado en la composición, estando en forma de una fase discontinua separada de partículas dispersas e insolubles, denominada también como gotículas. La fase de agente acondicionador de silicona opcional puede comprender un agente acondicionador de fluido de silicona tal como un fluido de silicona, y también puede comprender otros ingredientes, tales como una resina de silicona para mejorar la eficacia de deposición del fluido de silicona o potenciar el brillo del pelo (especialmente cuando se usan agentes acondicionadores de silicona de índice de refracción elevado (p. ej. por encima de aproximadamente 1,46) (p. ej. siliconas muy feniladas).

Ejemplos no limitantes de agentes acondicionadores de silicona adecuados, y agentes de suspensión opcionales para la silicona, se describen en la patente de EE.UU. reexpedición n° 34.584, la patente de EE.UU. n° 5.104.646, y la patente de EE.UU. n° 5.106.609.

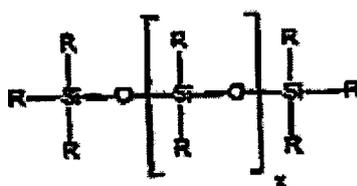
La fase opcional de agente acondicionador de silicona puede comprender silicona volátil, silicona no volátil, o combinaciones de las mismas. Típicamente, si hay presentes siliconas volátiles, será circunstancial para su uso como disolvente o vehículo para formas comercialmente disponibles de ingredientes de materiales de silicona no volátiles, tales como gomas y resinas de silicona.

Los agentes acondicionadores para el pelo de silicona opcionales, para su uso en las composiciones antimicrobianas, tienen preferentemente una viscosidad de aproximadamente 20 a aproximadamente 2.000.000 centistokes, más preferentemente de aproximadamente 1.000 a aproximadamente 1.800.000 centistokes, incluso más preferentemente de aproximadamente 50.000 a aproximadamente 1.500.000 centistokes, medida a 25°C.

Puede encontrarse material de base sobre siliconas que incluyen secciones que discuten fluidos, gomas y resinas de silicona, así como sobre la elaboración de siliconas, en la Encyclopedia of Polymer Science and Engineering, Volumen 15, Segunda Edición, pp 204-308, John Wiley & Sons, Inc., 1989.

Los fluidos de silicona opcionales incluyen aceites de silicona que son materiales de silicona fluidos que tienen una viscosidad menor que 1.000.000 centistokes, preferentemente entre aproximadamente 5 y 1.000.000 centistokes, más preferentemente entre aproximadamente 10 y aproximadamente 100.000 centistokes, a 25°C. Los aceites de silicona adecuados incluyen polialquil siloxanos, poliaryl siloxanos, polialquilaril siloxanos, copolímeros poliéter siloxano, y combinaciones de los mismos. También pueden usarse otros fluidos de silicona insolubles, no volátiles que tienen propiedades de acondicionadores del pelo.

Los aceites de silicona opcionales incluyen polialquil o poliaryl siloxanos que se ajustan a la fórmula (I) siguiente



en la que R es un grupo alifático, preferentemente alquilo o alquenilo, o arilo, R puede ser sustituido o no sustituido, y x es un número entero de 1 a aproximadamente 8.000. Los grupos R no sustituidos adecuados incluyen alcoxi, ariloxi, alcarilo, arilalquilo, arilalquenilo, alquilamina, y grupos alifáticos y arilo sustituidos con éter, sustituidos con hidroxilo, y sustituidos con halógeno. Los grupos R adecuados incluyen también grupos aminas catiónicas y amonio cuaternario.

Los grupos alifáticos o arilo sustituidos en la cadena de siloxano pueden tener cualquier estructura siempre y cuando las siliconas resultantes se mantengan fluidos a temperatura ambiente, sean hidrófobas, no sean irritantes, tóxicas ni perjudiciales de cualquier otra forma cuando se aplican al pelo, sean compatibles con los otros componentes de las composiciones antimicrobianas, sean estables químicamente bajo las condiciones normales de uso y almacenamiento, sean insolubles en las composiciones antimicrobianas de la presente invención, y sean capaces de depositarse en el pelo y acondicionarlo.

Los dos grupos R en el átomo de silicio de cada unidad monómera de silicona pueden representar los mismos grupos o grupos diferentes. Preferentemente, los dos grupos R representan el mismo grupo.

Los sustituyentes alquilo y alquenilo preferidos son alquilos y alquenilos C₁-C₅, más preferentemente de C₁-C₄, lo más preferentemente de C₁-C₂. Las porciones alifáticas de otros grupos que contienen alquilo, alquenilo o alquinilo (tales como alcoxi, alcarilo, y alcamino) pueden ser de cadena lineal o ramificada y preferentemente tienen de uno a cinco átomos de carbono, más preferentemente de uno a cuatro átomos de carbono, incluso más preferentemente de

ES 2 322 688 T3

uno a tres átomos de carbono, lo más preferentemente de uno a dos átomos de carbono. Como se discutió anteriormente, los sustituyentes R del presente texto pueden contener también funcionalidades amino, p. ej. grupos alcámico, que pueden ser aminas primarias, secundarias o terciarias o amonio cuaternario. Estos incluyen grupos mono-, di- y tri- alquilamino y alcoxi-amino en los que la longitud de cadena de la porción alifática es preferentemente como se describió anteriormente. Los sustituyentes R pueden ser también sustituidos con otros grupos, tales como halógenos (p. ej. cloruro, fluoruro, y bromuro), grupos alifáticos o arilo halogenados, e hidroxilo (p. ej. grupos alifáticos sustituidos con hidroxilo). Los grupos R halogenados adecuados podrían incluir, por ejemplo, grupos alquilo trihalogenados (preferentemente fluoro) tales como $-R^1-C(F)_3$, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 . Entre los ejemplos de tales polisiloxanos se incluyen el polimetil -3,3,3 trifluoropropilsiloxano.

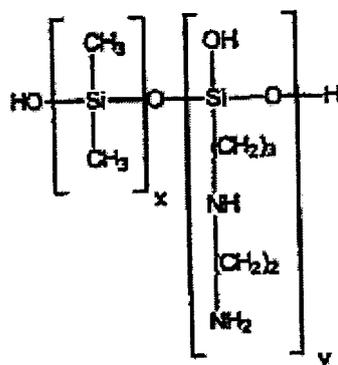
Los grupos R adecuados incluyen metilo, etilo, propilo, fenilo, metilfenilo y fenilmetilo. Las siliconas preferidas son polidimetilsiloxano, polidietilsiloxano, y polimetilfenilsiloxano. El polidimetilsiloxano es especialmente preferido. Otros grupos R adecuados incluyen metilo, metoxi, etoxi, propoxi, y ariloxi. Los tres grupos R en los remates terminales de la silicona pueden también representar el mismo grupo o diferentes grupos.

Los fluidos de polialquilsiloxano no volátiles que pueden ser usados incluyen, por ejemplo, polidimetilsiloxanos. Estos siloxanos son disponibles, por ejemplo, de la General Electric Company en sus series Viscasil R y SF 96, y de Dow Corning en su serie Dow Corning 200.

Los fluidos de polialquilaril siloxano que pueden ser usados incluyen también, por ejemplo, polimetilfenilsiloxanos. Estos siloxanos son disponibles, por ejemplo, de la General Electric Company como fluido metil fenil SF 1075 o de Dow Corning como fluido 556 de calidad para cosmética.

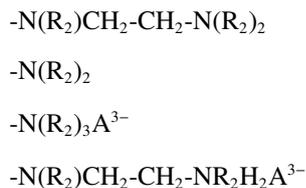
Los copolímeros de poliéter siloxano que pueden ser usados incluyen, por ejemplo, un polidimetilsiloxano modificado con poli(óxido de propileno) (p. ej., Dow Corning DC-1248) aunque también pueden usarse óxido de etileno o mezclas de óxido de etileno y óxido de propileno. Las concentraciones de óxido de etileno y poli(óxido de propileno) han de ser suficientemente bajas para evitar la solubilidad en agua y la presente composición.

Las siliconas sustituidas con alquilamino adecuadas incluyen aquellas que se ajustan a la estructura (II) siguiente



en la que x e y son números enteros. Este polímero se conoce también como "amodimeticona".

Los fluidos de silicona catiónica adecuados incluyen aquellos que se ajustan a la fórmula (III) $(R_1)_a G_{3-a} - \text{Si}(-\text{OSiG}_2)_n - (-\text{OSiG}_b(R_1)_{2-b})_m - \text{O}-\text{SiG}_{3-a}(R_1)_a$, en la que G se elige entre el grupo consistente en hidrógeno, fenilo, hidroxilo, alquilo C_1-C_8 y preferentemente metilo; a es 0 o un número entero que tiene un valor de 1 a 3, preferentemente 0; b es 0 ó 1, preferentemente 1; la suma n + m es un número de 1 a 2.000 y preferentemente de 50 a 150, pudiendo n denotar un número de 0 a 1.999 y preferentemente de 49 a 149, y pudiendo m denotar un número entero de 1 a 2.000 y preferentemente de 1 a 10; R_1 es un radical monovalente que se ajusta a la fórmula $C_q H_{2q} L$ en la que q es un número entero que tiene un valor de 2 a 8 y L se elige los grupos siguientes:



en las que R_2 se elige entre el grupo consistente en hidrógeno, fenilo, bencilo, un radical hidrocarburo saturado, preferentemente un radical alquilo que contiene de 1 a 20 átomos de carbono, y A es un ion haluro.

ES 2 322 688 T3

Los fluidos de polisiloxano de índice de refracción elevado contienen una cantidad suficiente de sustituyentes R que contienen arilo para aumentar el índice de refracción hasta el nivel deseado, que se describió anteriormente. Además, R y n han de elegirse de forma que el material sea no volátil, como se definió antes.

5 Los sustituyentes que contienen arilo contienen anillos arilo alicíclicos y heterocíclicos de cinco y seis miembros, y sustituyentes que contienen anillos de cinco o seis miembros fusionados. Los propios anillos arilo pueden ser sustituidos o no sustituidos. Los sustituyentes incluyen sustituyentes alifáticos, y también pueden incluir sustituyentes alcoxi, sustituyentes acilo, cetonas, halógenos (p. ej., Cl y Br), aminas, etc. Los ejemplos de grupos que contienen arilo incluyen arenos sustituidos y no sustituidos, tales como fenilo, y derivados de fenilo tales como fenilos con sustituyentes alquilo o alqueniilo C₁-C₅, p. ej., alilfenilo, metilfenilo y etilfenilo, vinilfenilos tales como estirenilo, y fenilalquinos (p. ej. fenil alquinos C₂-C₄). Los grupos arilo heterocíclico incluyen sustituyentes derivados de furano, imidazol, pirrol, piridina, etc. Los sustituyentes de anillos de arilo fusionados incluyen, por ejemplo, naftaleno, cumarina y purina.

15 En general, los fluidos de polisiloxano de índice de refracción elevado tendrán un grado de sustituyentes que contienen arilo de al menos aproximadamente 15%, preferentemente al menos aproximadamente 20%, más preferentemente al menos aproximadamente 25%, incluso más preferentemente al menos aproximadamente 35%, lo más preferentemente al menos aproximadamente 50%. Típicamente, aunque sin pretender limitar necesariamente la invención, el grado de sustitución con arilo será menor que aproximadamente 90%, más generalmente menor que aproximadamente 85%, preferentemente de aproximadamente 55% a aproximadamente 80%.

20 Los fluidos de polisiloxano se caracterizan también por tensiones superficiales relativamente elevadas como consecuencia de su sustitución con arilo. En general, los presentes fluidos de polisiloxano tendrán una tensión superficial de al menos aproximadamente 24 dinas/cm², típicamente al menos aproximadamente 27 dinas/cm². La tensión superficial, para los propósitos de la presente invención, se mide mediante un tensiómetro de anillo de de Nouy de acuerdo con el método Corporate Test Method CTM 0461 de Dow Corning, de 23 de noviembre de 1971. Los cambios de la tensión superficial pueden medirse de acuerdo con el método de ensayo anterior o de acuerdo con la norma ASTM Method D 1331.

30 Los fluidos de polisiloxano con índice de refracción elevado preferidos tienen una combinación de sustituyentes de fenilo o derivados de fenilo (preferentemente fenilo), sustituyentes alquilo, preferentemente alquilo C₁-C₄ (lo más preferentemente metilo), hidroxilo, alquilamino C₁-C₄ (especialmente -R¹NHR²NH₂ en donde cada R¹ y R² independientemente es un grupo alquilo, alqueniilo, y/o alcoxi C₁-C₃). Los polisiloxanos de índice de refracción elevado son disponibles de Dow Corning Corporation (Midland, Mich., EE.UU.) Huls America (Piscataway, N.J., EE.UU.), y General Electric Silicones (Waterford, N.Y., EE.UU.).

35 Cuando se usan siliconas de índice de refracción elevado en las realizaciones de champú anticaspa y acondicionador de las composiciones antimicrobianas de la presente invención, se usan preferentemente en solución con un agente de extensión, tales como una resina de silicona o un agente tensioactivo, para reducir la tensión superficial en una cuantía suficiente para mejorar la extensión y de esta forma mejorar el brillo (subsiguiente al secado) del pelo tratado con las composiciones. Generalmente, se usa una cantidad de agente de extensión que sea suficiente para reducir la tensión superficial del fluido de polisiloxano de índice de refracción elevado en al menos aproximadamente un 5%, preferentemente al menos aproximadamente un 10%, más preferentemente al menos aproximadamente un 15%, incluso más preferentemente al menos aproximadamente 20%, lo más preferentemente al menos aproximadamente 25%. La reducción de la tensión superficial de la mezcla de fluido de polisiloxano y agente de extensión puede mejorar el brillo del pelo.

45 Las referencias que describen ejemplos de algunos fluidos de silicona adecuados para su uso en composiciones de champú incluyen la patente de EE.UU. n° 2.826.551, la patente de EE.UU. n° 3.964.500, la patente de EE.UU. n° 4.364.837, la patente británica 849.433, y *Silicon Compounds*, Petrarch Systems, Inc. (1984).

50 Pueden incluirse resinas de silicona en el agente acondicionador de silicona. Estas resinas son sistemas de siloxano poliméricos altamente entrecruzados. El entrecruzamiento se introduce mediante la incorporación de silanos trifuncionales y tetrafuncionales con silanos monofuncionales o difuncionales, o ambos, durante la elaboración de la resina de silicona. Como es bien conocido en la técnica, el grado de entrecruzamiento que se requiere para que resulte una resina de silicona variará de acuerdo con las unidades específicas de silano incorporadas a la resina de silicona. En general, se considera que los materiales de silicona que tienen un nivel suficiente de unidades de monómero de siloxano trifuncional y tetrafuncional (y por tanto un nivel suficiente de entrecruzamiento) de forma que se sequen dando una película rígida o dura, son resinas de silicona. La relación de átomos de oxígeno a átomos de silicio es indicadora del nivel de entrecruzamiento en un material de silicona particular. Los materiales de silicona que tienen al menos aproximadamente 1,1 átomos de oxígeno por átomo de silicio serán generalmente resinas de silicona. Preferentemente, la relación de átomos de oxígeno:silicio es al menos aproximadamente 1,2:1,0. Los silanos usados en la manufactura de resinas de silicona incluyen monometil-, dimetil-, trimetil-, monofenil-, difenil-, metilfenil-, monovinil-, y metilvinilclorosilano, y tetraclorosilano, siendo los silanos sustituidos con metilo los más comúnmente utilizados. Las resinas preferidas son ofrecidas por General Electric como GE SS4230 y SS4267. Las resinas de silicona disponibles comercialmente serán suministradas generalmente en forma disuelta en un fluido de silicona volátil o no volátil de baja viscosidad. Las resinas de silicona para ser usadas en la presente invención deben ser suministradas e incorporadas en las presentes composiciones en tal forma disuelta, como será fácilmente evidente para un experto en la técnica.

Los materiales de silicona y las resinas de silicona en particular, pueden ser convenientemente identificadas de acuerdo con un sistema taquigráfico de nomenclatura, bien conocido por los expertos en la técnica como nomenclatura "MDTQ". Bajo este sistema, la silicona se describe de acuerdo con la presencia de varias unidades de monómero de siloxano que constituyen la silicona. De forma resumida, el símbolo M denota la unidad monofuncional $(\text{CH}_3)_3\text{SiO}_{0,5}$; D denota la unidad difuncional $(\text{CH}_3)_2\text{SiO}$; T denota unidad trifuncional $(\text{CH}_3)\text{SiO}_{1,5}$; y Q denota la unidad quadri- o tetra-funcional SiO_2 . Las primas de los símbolos de las unidades, p. ej. M', D', T', y Q', denotan otros sustituyentes distintos del metilo, y han de ser específicamente definidos para cada caso. Los sustituyentes alternativos típicos incluyen grupos tales como vinilo, fenilos, aminas, hidroxilos, etc. Las relaciones molares de las diversas unidades, bien sea en términos de subíndices de los símbolos que indican el número total de cada tipo de unidad en la silicona (o una media de la misma), o bien como relaciones indicadas específicamente en combinación con el peso molecular, completan la descripción del material de silicona bajo el sistema MDTQ. Unas cantidades molares relativas más altas de T, Q, T' y/o Q' respecto a D, D', M y/o M' en una resina de silicona son indicadoras de niveles de entrecruzamiento más altos. Sin embargo, como se discutió anteriormente, el nivel global de entrecruzamiento puede indicarse también por la relación de oxígeno a silicio.

Las resinas de silicona para ser usadas en la presente invención que se prefieren son las resinas MQ, MT, MTQ, MDT y MDTQ. Así, el sustituyente de silicona preferido es metilo. Son especialmente preferidas las resinas MQ en las que la relación M:Q es de aproximadamente 0,5:1,0 a aproximadamente 1,5:1,0 y el peso molecular medio de la resina es de aproximadamente 1000 a aproximadamente 10.000.

La relación en peso de fluido de silicona no volátil, que tiene un índice de refracción inferior a 1,46, al componente de resina de silicona, cuando se usa, es preferentemente de aproximadamente 4:1 a aproximadamente 400:1. Preferentemente esta relación es de aproximadamente 9:1 a aproximadamente 200:1, más preferentemente de aproximadamente 19:1 a aproximadamente 100:1, en particular cuando el componente de fluido de silicona es un fluido de polidimetilsiloxano o una mezcla de fluido de polidimetilsiloxano y goma de polidimetilsiloxano como se describió anteriormente. En tanto que la resina de silicona forma parte de la misma fase en las composiciones de la presente invención que el fluido de silicona, es decir el principio activo acondicionador, en la determinación del nivel de agente acondicionador de silicona en la composición debe incluirse la suma de fluido y resina.

G. Aceites de acondicionamiento orgánicos

Las composiciones antimicrobianas de la presente invención, en algunas realizaciones, pueden incluir de aproximadamente 0,05% a aproximadamente 3% en peso de la composición, preferentemente de aproximadamente 0,08% a aproximadamente 1,5%, más preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 1%, de al menos un aceite de acondicionamiento orgánico como agente acondicionador, bien sea solo o en combinación con otros agentes acondicionadores, tales como las siliconas descritas anteriormente.

Tales aceites acondicionadores pueden añadir brillo y lustre al pelo, mejorar el peinado en seco del cabello y/o mejorar la sensación seca de la piel o el pelo.

Los aceites orgánicos de acondicionamiento adecuados para ser usados como agente acondicionador en la presente invención son preferentemente líquidos insolubles en agua, de baja viscosidad, elegidos entre aceites de hidrocarburo, poliolefinas, ésteres grasos, y mezclas de los mismos. La viscosidad, medida a 40°C, de tales aceites orgánicos de acondicionamiento es preferentemente de aproximadamente 1 centipoise a aproximadamente 200 centipoises, más preferentemente de aproximadamente 1 centipoise a aproximadamente 100 centipoises, lo más preferentemente de aproximadamente 2 centipoises a aproximadamente 50 centipoises.

1. Aceites de hidrocarburo

Los aceites acondicionadores orgánicos adecuados para su uso como agentes acondicionadores en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen, pero sin limitarse a ellos, aceites de hidrocarburos que tienen al menos aproximadamente 10 átomos de carbono, tales como hidrocarburos cíclicos, hidrocarburos alifáticos de cadena lineal (saturados o no saturados), e hidrocarburos alifáticos de cadena ramificada (saturados o no saturados) incluyendo polímeros y mezclas de los mismos. Los aceites de hidrocarburo de cadena lineal son preferentemente de aproximadamente C_{12} a aproximadamente C_{19} . Los aceites de hidrocarburo de cadena ramificada, incluyendo polímeros e hidrocarburo, contendrán típicamente más de 19 átomos de carbono.

Los ejemplos específicos no limitantes de estos aceites de hidrocarburo incluyen aceite de parafina, aceite mineral, dodecano saturado e insaturado, tridecano saturado e insaturado, tetradecano saturado e insaturado, pentadecano saturado e insaturado, hexadecano saturado e insaturado, polibuteno, polideceno, y mezclas de los mismos. También pueden ser usados isómeros de estos compuestos de cadena ramificada, así como hidrocarburos de longitud de cadena más alta, entre cuyos ejemplos se incluyen alcanos saturados o no saturados altamente ramificados, tales como los isómeros sustituidos con permetilo, p. ej., los isómeros sustituidos con permetilo de hexadecano y eicosano, tales como 2,2,4,4,6,6,8,8-dimetil-10-metilundecano y 2,2,4,4,6,6-dimetil-8-metilnonano, disponibles de Permetil Corporation. Polímeros de hidrocarburo tales como polibuteno y polideceno. Un polímero de hidrocarburo preferido es el polibuteno, tal como el copolímero de isobutileno y buteno. Un material de este tipo disponible comercialmente es polibuteno L-14 de Amoco Chemical Corporation.

2. Poliolefinas

Los aceites acondicionadores orgánicos para su uso en las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden también incluir poliolefinas líquidas, más preferentemente poli- α -olefinas líquidas, lo más preferentemente poli- α -olefinas hidrogenadas líquidas. La poliolefinas para su uso en la presente invención se preparan por polimerización de monómeros olefínicos de C_4 a aproximadamente C_{14} , preferentemente de aproximadamente C_6 a aproximadamente C_{12} .

Los ejemplos no limitantes de monómeros olefínicos para su uso en la preparación de las poliolefinas líquidas de la presente invención incluyen etileno, propileno, 1-buteno, 1-penteno, 1-hexeno, 1-octeno, 1-deceno, 1-dodeceno, 1-tetradeceno, isómeros de cadena ramificada tales como 4-metil-1-penteno, y mezclas de los mismos. También son adecuados para la preparación de las poliolefinas líquidas materias primas o efluentes de refinería que contienen olefina. Los monómeros de α -olefina hidrogenada preferidos incluyen, pero sin limitarse a ellos: 1-hexeno a 1-hexadecenos, 1-octeno a 1-tetradeceno, y mezclas de los mismos.

3. Ésteres grasos

Otros aceites acondicionadores orgánicos adecuados para ser usados como agente acondicionador en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen, pero sin limitarse a ellos, ésteres grasos que tienen al menos 10 átomos de carbono. Estos ésteres grasos incluyen ésteres con cadenas hidrocarbilo derivados de ácidos o alcoholes grasos (p. ej. mono-ésteres, ésteres de alcohol polivalente, y ésteres de ácido di- y tri-carboxílico). Los radicales hidrocarbilo de estos ésteres grasos pueden incluir o tener unidos covalentemente a los mismos otras funcionalidades compatibles, tales como amidas y restos alcoxi (p. ej., uniones etoxi o éter, etc.).

Son adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención los alquil y alquencil ésteres de ácidos grasos que tienen cadenas alifáticas de aproximadamente C_{10} a aproximadamente C_{22} , y alquil y alquencil ésteres de ácido carboxílico de alcoholes grasos que tienen una cadena alifática alquilo y/o alquencil de C_{10} a aproximadamente C_{22} derivadas de alcohol, y mezclas de los mismos. Los ejemplos específicos de ésteres grasos preferidos incluyen, pero sin limitarse a ellos: isoestearato de isopropilo, laurato de hexilo, laurato de isohexilo, palmitato de isohexilo, palmitato de isopropilo, oleato de decilo, oleato de isodecilo, estearato de hexadecilo, estearato de decilo, isoestearato de isopropilo, adipato de dihexildecilo, lactato de laurilo, lactato de miristilo, lactato de cetilo, estearato de oleílo, oleato de oleílo, miristato de oleílo, acetato de laurilo, propionato de cetilo, y adipato de oleílo.

Otros ésteres grasos adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención son ésteres de ácido mono-carboxílico de fórmula general $R'COOR$, en la que R' y R son radicales alquilo o alquencil, y la suma de átomos de carbono en R' y R es al menos 10, preferentemente al menos 20. El éster de ácido mono-carboxílico no necesita obligatoriamente contener al menos una cadena con al menos 10 átomos de carbono; más bien el número total de átomos de carbono de la cadena alifática ha de ser al menos 10. Los ejemplos específicos no limitantes de ésteres de ácido mono-carboxílico incluyen: miristato de isopropilo, estearato de glicol, y laurato de isopropilo.

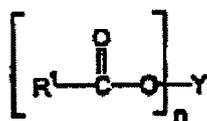
Otros ésteres grasos adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención son di- y tri-alquil y alquencil ésteres de ácidos carboxílicos, tales como ésteres de diácidos carboxílicos C_4 a C_8 (p. ej. ésteres C_1 a C_{22} , preferentemente C_1 a C_6 , de ácido succínico, ácido glutárico, ácido adípico, ácido hexanoico, ácido heptanoico, y ácido octanoico). Los ejemplos específicos no limitantes de di- y tri-alquil y alquencil ésteres de ácidos carboxílicos incluyen isocetil estearil estearato, adipato de diisopropilo, y citrato de tristearilo.

Otros ésteres grasos adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención son los conocidos como ésteres de alcohol polivalente. Tales ésteres de alcohol polivalente incluyen ésteres de alquencil glicol, tales como etilén glicol ésteres de mono y di-ácido graso, ésteres de mono- y di-ácido graso de dietilén glicol, ésteres de mono- y di-ácido graso de polietilén glicol, ésteres de mono- y di-ácido graso de propilén glicol, monooleato de polipropilenglicol, monoestearato de polipropilenglicol 2000, monoestearato de propilenglicol etoxilado, gliceril ésteres de mono- y di-ácido graso, ésteres de poliglicerol de poli-ácido graso, monoestearato de glicerilo etoxilado, monoestearato de 1,3-butilenglicol, diestearato de 1,3-butilén glicol, polioxietilén poliol éster de ácido graso, ésteres de sorbitán de ácido graso, y ésteres de polioxietilén sorbitán de ácido graso.

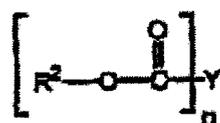
Otros ésteres grasos más, adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención, son glicéridos, incluyendo, pero sin limitarse a ellos, mono-, di-, y triglicéridos, preferentemente di- y triglicéridos, lo más preferentemente triglicéridos. Para su uso en las composiciones antimicrobianas descritas en el presente texto, los glicéridos son preferentemente los mono-, di-, y tri-ésteres de glicerol y ácidos carboxílicos de cadena larga, tales como los ácidos carboxílicos C_{10} a C_{22} . Puede obtenerse una diversidad de tipos de materiales a partir de aceites y grasas animales y vegetales, tales como aceite de ricino, aceite de cártamo, aceite de algodón, aceite de maíz, aceite de oliva, aceite de hígado de bacalao, aceite de almendra, aceite de aguacate, aceite de palma, aceite de sésamo, aceite de lanolina y aceite de soja. Los aceites sintéticos incluyen, pero sin limitarse a ellos, dilaurato de triolein y tristearin glicerilo.

ES 2 322 688 T3

Otros ésteres grasos adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas de la presente invención son ésteres grasos sintéticos insolubles en agua. Algunos ésteres sintéticos preferidos se ajustan a la Fórmula general (IX):



en la que R¹ es un grupo alquilo, alqueniilo, hidroxialquilo o hidroxialqueniilo C₇ a C₉, preferentemente un grupo alquilo saturado, más preferentemente un grupo alquilo lineal saturado; n es un número entero positivo que tiene un valor de 2 a 4, preferentemente 3; e Y es un grupo alquilo, alqueniilo, hidroxilo o alquilo o alqueniilo sustituido con carboxi, que tiene de aproximadamente 2 a aproximadamente 20 átomos de carbono, preferentemente de aproximadamente 3 a aproximadamente 14 átomos de carbono. Otros ésteres sintéticos preferidos se ajustan a la Fórmula general (X):



en la que R² es un grupo alquilo, alqueniilo, hidroxialquilo o hidroxialqueniilo C₈ a C₁₀; preferentemente un grupo alquilo saturado, más preferentemente un grupo alquilo lineal saturado; n e Y son como se definieron antes en la Fórmula (X).

Se cree que la inclusión de ésteres sintéticos puede proporcionar una mejor sensación de humedad al pelo, tal como en realizaciones de champú, en particular cuando son usados en combinación con un polímero catiónico (descrito más adelante). Estos ésteres sintéticos mejoran la sensación de pelo húmedo reduciendo la sensación limosa o excesivamente acondicionada de pelo húmedo que ha sido acondicionado por un polímero catiónico.

Los grasos sintéticos ésteres disponibles comercialmente para su uso en las composiciones antimicrobianas de la presente invención incluyen: "P-43" (triéster C₈-C₁₀ de trimetilolpropano), "MCP-684" (tetraéster de 3,3-dietanol-1,5 pentadiol), MCP 121 (diéster C₈-C₁₀ de ácido adípico), todos los cuales son disponibles de Mobil Chemical Company.

H. Otros agentes acondicionadores

También son adecuados para ser usados en las presentes composiciones los agentes acondicionadores descritos por la Procter and Gamble Company en la patente de EE.UU. n° 5.674.478 y n° 5.750.122. También son adecuados para ser usados en la presente invención los agentes acondicionadores descritos en la patente de EE.UU. n° 4.529.586 (Clairol), la patente de EE.UU. n° 4.507.280 (Clairol), la patente de EE.UU. n° 4.663.158 (Clairol), la patente de EE.UU. n° 4.197.865 (L'Oreal), la patente de EE.UU. n° 4.217.914 (L'Oreal), la patente de EE.UU. n° 4.381.919 (L'Oreal), y la patente de EE.UU. n° 4.422.853 (L'Oreal).

Algunos otros agentes acondicionadores de silicona preferidos para su uso en las composiciones de la presente invención incluyen: "ABIL[®] S 201" (copolímero de dimeticona y PG-propildimeticona tiosulfato sódico), disponible de Goldschmidt, "DC Q2-8220" (trimetilsilil amodimeticona) disponible de Dow Corning, "DC 949" (amodimeticona, cloruro de cetrimonio, y Trideceth-12), disponible de Dow Corning, "DC 749" (ciclometicona y trimetilsiloxisilicato), disponible de Dow Corning, "DC2502" (cetil dimeticona), disponible de Dow Corning, "BC97/004" y "BC 99/088" (microemulsiones de silicona funcionalizadas con amino), disponible de Basildon Chemicals, "GE SME253" y "SM2115-D2" y "SM2658" y "SF1708" (microemulsiones de silicona funcionalizadas con amino), disponible de General Electric, aceite de semillas de hierba de la pradera (*meadowfoam* o *limnanthes alba*) siliconado, disponible de Croda, y los agentes acondicionadores de silicona descritos por GAF Corp. en la patente de EE.UU. n° 4.834.767 (aminolactama cuaternizada), por Biosil Technologies en la patente de EE.UU. n° 5.854.319 (emulsiones de silicona reactivas que contienen amino ácidos), y por Dow Corning en la patente de EE.UU. n° 4.898.585 (polisiloxanos).

I. Polialquilenglicol

En algunas realizaciones, las composiciones antimicrobianas de la presente invención, especialmente realizaciones de champú para el acondicionamiento del pelo, pueden comprender además polialquilenglicoles seleccionados en cantidades efectivas para mejorar la sensación de acondicionamiento del pelo, para mitigar la sensación del pelo recubierto que resulta de la adición de un polímero de deposición catiónico, y para mejorar el comportamiento moldeador del champú moldeador del cabello. Las concentraciones efectivas de los polietilenglicoles elegidos están en el intervalo entre aproximadamente 0,025% y aproximadamente 1,5%, preferentemente de aproximadamente 0,05% a aproximadamente 1,0%, más preferentemente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 0,5% en peso de la composición de champú.

ES 2 322 688 T3

Los polialquilenglicoles adecuados para ser usados en las composiciones antimicrobianas se caracterizan por la fórmula general:



en la que R es hidrógeno, metilo o mezclas de los mismos, preferentemente hidrógeno, y n es un número entero que tiene un valor medio de aproximadamente 1.500 a aproximadamente 25.000, preferentemente de aproximadamente 2.500 a aproximadamente 20.000, y más preferentemente de aproximadamente 3.500 a aproximadamente 15.000. Cuando R es hidrógeno, estos materiales son polímeros de óxido de etileno, que también son conocidos como poli(óxidos de etileno), polioxietilenos, y polietilenglicoles. Cuando R es metilo, estos materiales son polímeros de óxido de propileno, que también son conocidos como poli(óxidos de propileno), polioxipropilenos, y polipropilenglicoles. Cuando R es metilo, se entiende también que pueden existir varios isómeros de posición de los polímeros resultantes.

Los ejemplos específicos de polímeros de polietilenglicol adecuados incluyen “PEG-14 M” en el que R es hidrógeno y n tiene un valor medio de aproximadamente 14.000 (el “PEG-14 M” se conoce también como “POLIOX WSR® N-3000”, disponible de Union Carbide), y “PEG-23 M” en el que R es hidrógeno y n tiene un valor medio de aproximadamente 23.000 (“PEG-23 M” se conoce también como “POLIOX WSR® N-12K”, disponible de Union Carbide).

Los polímeros de polialquileo adecuados incluyen polipropilenglicoles y polietilen y polipropilenglicoles mixtos.

J. Otros ingredientes opcionales

En algunas realizaciones, las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden comprender además componentes opcionales adicionales conocidos o por otra parte efectivos para su uso en productos para el cuidado del cabello o el cuidado personal. La concentración de tales ingredientes opcionales está generalmente en el intervalo de cero a aproximadamente 25%, más típicamente de aproximadamente 0,05% a aproximadamente 25%, incluso más típicamente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 15% en peso de la composición. Tales componentes opcionales deben ser también física y químicamente compatibles con los componentes esenciales descritos en el presente texto, y no deben perjudicar de forma excesiva la estabilidad, la estética o el rendimiento del producto.

Los ejemplos no limitantes de componentes opcionales para su uso en la composición antimicrobiana incluyen agentes anti-estáticos, agentes de refuerzo de la espuma, agentes anticasca, además de los agentes anticasca descritos en el presente texto, agentes de ajuste de la viscosidad y espesantes, agentes de ajuste del pH (p. ej. citrato sódico, ácido cítrico, ácido succínico, ácido fosfórico, hidróxido sódico, y carbonato sódico), conservantes (p. ej. DMDM hidantoína), agentes antimicrobianos (p. ej. triclosan o triclocarbon), colorantes, disolventes orgánicos o diluyentes, coadyuvantes nacarados, perfumes, alcoholes grasos, proteínas, agentes para la piel, pantallas solares, vitaminas (tales como retinoides entre los que se incluyen propionato de retinilo, vitamina E tal como acetato de tocoferol, pantenol, y compuestos de vitamina B3 incluyendo niacinamida), emulsionantes y pediculicidas.

Pueden ser usados agentes antiestáticos opcionales, tales como agentes tensioactivos catiónicos insolubles en agua, típicamente en concentraciones que se encuentran en el intervalo de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 5% en peso de la composición. Tales agentes antiestáticos no deben interferir excesivamente con el rendimiento y los beneficios finales de la composición antimicrobiana; en particular, el agente antiestático no debe interferir con el agente tensioactivo aniónico. Un ejemplo no limitante específico de un agente antiestático adecuado es el cloruro de tricetil metil amonio.

Los agentes reforzantes de espuma opcionales para su uso en las composiciones antimicrobianas descritas en el presente texto incluyen mono- y di- (C₁-C₅, especialmente C₁-C₃) alcanolamidas de ésteres grasos (p. ej. C₈-C₂₂). Ejemplos específicos no limitantes de tales agentes reforzantes de la espuma incluyen monoetanolamida de ácidos grasos de coco, dietanolamida de ácidos grasos de coco, y mezclas de las mismas.

Pueden ser usados agentes de modificación de la viscosidad y espesantes opcionales, típicamente en cantidades efectivas para las composiciones antimicrobianas de la presente invención para que tengan generalmente una viscosidad global de aproximadamente 1.000 csk a aproximadamente 20.000 csk, preferentemente de aproximadamente 3.000 csk a aproximadamente 10.000 csk. Los ejemplos específicos no limitantes de tales agentes modificadores de la viscosidad y espesantes incluyen: cloruro sódico, sulfato sódico, y mezclas de los mismos.

Métodos de elaboración

Las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden ser preparadas por cualquier técnica conocida o cualquier otra que sea efectiva, adecuada para proporcionar una composición antimicrobiana, siempre y cuando la composición resultante proporcione las excelentes ventajas antimicrobianas descritas en el presente texto. Los métodos

para preparar las realizaciones de champú anticaspa y acondicionador de la presente invención incluyen técnicas convencionales de formulación y mezcla. Podría emplearse un método tal como el que se describe en la patente de EE.UU. n° 5.837.661, en el que el agente antimicrobiano de la presente invención se añadiría típicamente en la misma etapa en la que se añade la premezcla de silicona en la descripción de 5.837.661 citada.

5

Métodos de uso

Las composiciones antimicrobianas tópicas de la presente invención pueden ser usadas en aplicación directa a la piel o de una manera convencional para la limpieza de la piel y el pelo, y el control de la infección microbiana (incluyendo infecciones fúngicas, víricas o bacterianas) sobre la piel o el cuero cabelludo. Las composiciones aplicadas directamente, tales como polvos, se usan aplicando una cantidad efectiva de la composición, típicamente de aproximadamente 1 g a aproximadamente 20 g, por ejemplo a los pies. Las presentes composiciones de limpieza son útiles para limpiar el pelo y el cuero cabelludo, y otras zonas del cuerpo tales como las zonas de las axilas, los pies y las ingles, y para cualquier otra zona de la piel que precise tratamiento. Una cantidad efectiva de la composición, típicamente de aproximadamente 1 g a aproximadamente 50 g, preferentemente de aproximadamente 1 g a aproximadamente 20 g de la composición, para la limpieza del pelo, la piel y otras zonas del cuerpo, se aplica tópicamente al pelo, la piel u otras zonas que preferentemente han sido mojadas, generalmente con agua, y después se aclaran. La aplicación al cabello incluye típicamente frotar la composición de champú por todo el cabello.

Un método preferido para proporcionar eficacia antimicrobiana (especialmente anticaspa) con una realización de champú comprende las etapas de: (a) mojar el pelo con agua, (b) aplicar al pelo una cantidad efectiva de la composición antimicrobiana de champú, y (c) aclarar del pelo la composición antimicrobiana de champú usando agua. Estas etapas pueden repetirse tantas veces como se desee para conseguir la limpieza, el acondicionamiento y los beneficios antimicrobianos y anticaspa buscados.

25

También se contempla que cuando el principio activo antimicrobiano empleado es piritiona de zinc, y/o si se emplean otros agentes reguladores del crecimiento del cabello opcionales, las composiciones antimicrobianas de la presente invención pueden proporcionar la regulación del crecimiento del pelo. El método de usar regularmente tales composiciones de champú comprende repetir las etapas a, b, y c (anteriores).

30

Se contempla también que las presentes composiciones pueden ser empleadas como composiciones para dejar puestas (*leave-on*). Este método para proporcionar eficacia antimicrobiana a la piel o al pelo comprende las etapas de (A) aplicar una cantidad efectiva de la composición de champú a la piel o al cabello, y (B) dejar el producto sobre el cabello durante una cantidad de tiempo suficiente para permitir eficacia. El producto que queda puede entonces ser más tarde aclarado del pelo con agua o cepillado con cualquier instrumento habitual o con las manos.

35

Ejemplos

La composición de la invención puede prepararse mezclando una o más fuentes de iones metálicos seleccionadas y una o más sales metálicas de piritiona en un medio o vehículo apropiado, o añadiendo los componentes individuales separadamente a las composiciones para limpieza de la piel o el pelo. Los vehículos útiles se discuten de forma más pormenorizada más adelante.

40

Los ejemplos que siguen se proponen para ilustrar, pero de ningún modo para limitar el alcance de la presente invención. Todas las partes y porcentajes son en peso y todas las temperaturas son en grados Celsius, a menos que se establezca explícitamente otra cosa.

45

Ejemplo 1

El efecto de la combinación de ZPT con iones metálicos sobre la concentración inhibidora mínima (MIC) de los iones metálicos

50

Se realizaron experimentos para investigar la eficacia de la composición de la presente invención para inhibir la supervivencia, el crecimiento y la proliferación de microorganismos en composiciones tópicas. El microorganismo de ensayo fue *Malassezia furfur*. El principio empleado para la prueba, la concentración inhibidora mínima (Minimum Inhibitory Concentration (MIC)), se discute más adelante y los resultados se presentan en la Tabla 1.

55

La concentración inhibidora mínima es indicativa de la eficacia antifúngica. Generalmente, cuanto más bajo es el valor de la composición, tanto mejor es su eficacia antifúngica, debido al aumento de la capacidad inherente del agente anticaspa para inhibir el crecimiento de los microorganismos.

60

La *Malassezia furfur* se desarrolló en un matraz que contiene medio mDixon (véase E. Gueho, *et al.* Antoine Leeuwenhoek (1996), n° 69, 337-55). Después se añadieron diluciones de principio activo antimicrobiano solubilizado a tubos de ensayo que contienen agar mDixon fundido. Se añadió inóculo de *M. furfur* a cada tubo de agar fundido, se agitó el tubo en vórtice, y el contenido se vertió en placas petri estériles separadas. Después de incubar las placas, se inspeccionaron para observar la presencia de desarrollo visible de *M. furfur*. La dilución de principio activo antimicrobiano más baja de las ensayadas que no da crecimiento se define como la Concentración Inhibidora Mínima (MIC, por sus siglas en inglés).

65

ES 2 322 688 T3

Equipo/reactivos

	Microbio	<i>Malassezia furfur</i> (ATCC 14521)
5	Matraz Erlenmeyer	250 mL
	Medio agar	9,5 ml agar Dixon por concentración por principio activo ensayado
	Disolvente	agua, dimetil sulfonyl óxido (“DMSO”)
10	Piridinationa de zinc	ZFI que tiene un tamaño medio de partícula de aproximadamente 2,5 μm , conservado en “DARVAN TM ”, disponible de Arch
15	Tubos de ensayo	2 tubos por principio activo antimicrobiano por concentración por principio activo ensayado, esterilizados, tamaño 18 mm x 150 mm
	Placas Petri	2 placas por principio activo antimicrobiano por concentración por principio activo ensayado, esterilizados, tamaño 18 mm x 150 mm

20

Procedimiento experimental

- 1) Se desarrolló *Malassezia furfur* en un matraz Erlenmeyer de 250 ml que contiene 100 ml de medio “mDIXON”, a 320 rpm y 30°C hasta obtener turbidez.
- 2) Usando una serie de dilución apropiada, se prepararon las diluciones seleccionadas del principio activo antimicrobiano, o combinación, en un disolvente, que permitió que la muestra activa se solubilizase antes de la adición al agar de ensayo final. Para cada concentración de las muestras de ZPT, el disolvente fue “DMSO”; para otras muestras, el disolvente fue agua o “DMSO” u otros disolventes adecuados.
- 3) Se añadieron 0,25 ml de diluciones de principio activo antimicrobiano a los tubos de ensayo que contienen 9,5 ml de agar “mDIXON” fundido (mantenidos a 45°C en un baño de agua).
- 4) Se añadieron 0,25 ml de inóculo de *M. furfur* (ajustado a 5×10^5 cfu (unidades formadoras de colonias)/ml por recuento directo) a cada tubo de ensayo de agar fundido.
- 5) Cada tubo se agitó en vórtice, y el contenido se vertió en placas petri separadas.
- 6) Una vez solidificado el agar, las placas se invirtieron y se incubaron a 30° durante 5 días.
- 7) Después se inspeccionaron las placas para observar un crecimiento visible de *M. furfur*.

45 La Tabla 1 muestra los resultados de experimentos que ensayan la eficacia de ZPT en combinación con varias fuentes diferentes de iones metálicos frente al microorganismo *M. furfur*.

50 Como se muestra en la Tabla 1, se requirieron al menos 50 ppm de iones metálicos solos para inhibir el crecimiento de hongos. Cuando se usa ZPT se precisan 8 ppm para inhibir el crecimiento de hongos. Niveles de ZPT por debajo de la MIC fueron ensayados en combinación con varios metales para determinar la MIC del ión metálico resultante. Como se indica claramente en la Tabla 1, la adición de iones metálicos sirvió para potenciar el ZPT, consiguiéndose así valores de MIC con niveles de ZPT sub-MIC. Por ejemplo, se muestra que una combinación de 4 ppm de ZPT con menos de 0,005 ppm de iones cobre consiguió la MIC. Sin embargo, ni 4 ppm de ZPT ni 0,005 ppm de ion cobre conseguirían el nivel de MIC solos.

55

60

65

ES 2 322 688 T3

Datos de concentración inhibidora mínima (MIC)

TABLA 1

Datos de Cu^{2+} , Zn^{2+} , Ni^{2+} , Hg^{2+} solos y en combinación con ZPT

	MIC (ppm de ion metálico)			
	Solo	+ 4 ppm de ZPT*	+ 2 ppm de ZPT*	+ 0,5 ppm de ZPT*
Cobre (2^+)	5000	< 0,005	< 0,5	5000
Zinc (2^+)	5000	5	50	500
Níquel (2^+)	500	50		
Mercurio (2^+)	50	5		

*MIC_{ZPT} = 8 ppm

20 Ejemplo 2

El efecto de los iones metálicos sobre los resultados de la "Kill Rate" (tasa de destrucción) de la piritona de zinc

Se llevaron a cabo experimentos para investigar la eficacia de la composición de la presente invención para inhibir la supervivencia, el crecimiento y la proliferación de microorganismos en composiciones tóxicas. El microorganismo de ensayo fue *Malassezia furfur*. El principio de ensayo empleado, la prueba de la tasa de destrucción, Kill Rate Test (KRT)), se discute más adelante, y los resultados son tabulados en las Tablas 2(a) y 2(b).

Los resultados de la prueba de la tasa de destrucción (KRT) son indicativos de eficacia anti-fúngica. Generalmente, cuanto mayor es la inhibición del desarrollo fúngico en esta prueba, tanto mejor es la eficacia antifúngica de los compuestos ensayados.

Un matraz que contiene medio de caldo mDixon (véase Gueho, *et al.* Antonie Leeuwenhoek (1996), no. 69, 337-55) fue inoculado con *Malassezia furfur*. Después se añadieron al matraz concentraciones específicas de principio o principios activos. Después se sacaron muestras del matraz en momentos especificados, se diluyeron en agua estéril, y se diseminaron por la superficie de una placa de agar de mDixon. Después de incubar las placas, fueron examinadas para observar crecimiento visible de *M. furfur* contando el número de colonias presentes y convirtiendo este número en unidades formadoras de colonias (CFU)/ml de caldo de mDixon.

Cuanto más bajo es el recuento de CFU/ml, tanto mejor es la actividad que el principio o los principios activos tienen contra *M. furfur*.

Equipo/reactivos

45	Microbio	<i>Malassezia furfur</i> (ATCC 14521)
	Matraz Erlenmeyer	250 mL, esterilizado, tapado, 2 para crecimiento de inóculo de <i>M. furfur</i> ; 1 para cada combinación de principios activos por concentración.
50	Disolvente	agua, dimetil sulfonil óxido ("DMSO")
	Caldo de cultivo	41 g de caldo mDixon por combinación activa por concentración; 42 g de caldo mDixon por control negativo.
55	Medio agar	10-15 ml agar mDixon por placa vertida; 18 placas por combinación activa por concentración.
	Piridinationa de zinc	ZPT que tiene un tamaño medio de partícula de aproximadamente 2,5 μ m, disponible de Arch
60	Placas Petri	18 placas por combinación activa por concentración, esterilizadas, tamaño 18 mm x 100 mm.

Procedimiento experimental

65 1) Se llevaron cultivos de *M. furfur* (ATCC 14521) a fase log durante la noche en 2 matraces Erlenmeyer (125 ml) cada uno de los cuales contenía 75 ml de caldo mDIXON.

ES 2 322 688 T3

- 2) Se prepararon 41,0 g de caldo mDixon en un matraz Erlenmeyer que contiene 0,05% ó 0,5% del ion metálico que se va a ensayar en combinación con ZPT.
- 3) Se prepararon 20 g de una solución de 500 ppm de ZPT en DMSO añadiendo 0,010 mg de ZPT a 19,990 g de DMSO.
- 4) Se añadió 1,0 g de la solución de 500 ppm de ZPT a los 41 g de caldo/principio activo de la etapa 2 anterior, dando 42 g en cada matraz.
- 5) Se prepararon 42 g de caldo mDixon en un matraz Erlenmeyer de 125 ml (para el testigo negativo).
- 6) Se prepararon 41 g de caldo mDixon + 1 g de solución de ZPT en un matraz Erlenmeyer de 125 ml (para el testigo de ZPT).
- 7) Del cultivo en fase log, se añadieron 8,0 g de inóculo de *M. furfur* a cada matraz, llevando el peso del conjunto de caldo/inóculo/principios activos a 50,0 g.
- 8) Se realizaron tomas de muestra de las 0 horas de acuerdo con la siguiente metodología:
 - a) Extraer 1,1 ml de caldo de cada matraz.
 - b) Extender 0,1 ml por la superficie de la placa de agar mDixon.
 - c) Realizar diluciones 10-1, 10-2, 10-3, 10-4 y 10-5 de la muestra y extender 0,1 ml de estas por placas de agar mDixon separadas. (Para las muestras correspondientes a los tiempos 0 y 4 horas, solamente se ponen en placa las diluciones 10-3, 10-4 y 10-5).
 - d) Invertir e incubar las placas 5 a 7 días a 30°C.
 - e) Determinar la viabilidad contando las colonias y convirtiendo la medida en CFU/ml.
9. Para Mg^{2+} , Ag^+ , Mn^{2+} , Bi^{3+} , y Na^+ se repitió la etapa 8 en los tiempos 24 y 48 horas. Para Zn^{2+} y Cu^{2+} , se repitió la etapa 8 en los tiempos 4, 24, y 48 horas.

La Tablas 2(a) y 2(b) muestran los resultados de experimentos en los que se ensaya la eficacia de fuentes de iones metálicos en combinación con ZPT frente al microorganismo *M. furfur*.

Como base de comparación en las Tablas 2(a) y 2(b), los resultados de ensayo para los materiales ensayados deben ser más bajos que el control negativo en cada valor del tiempo concreto para que muestre eficacia rápida. Cuanto más próximo a cero es el valor resultante para un valor del tiempo, tanto más rápida es la eficacia del material ensayado. Por consiguiente, a partir de los datos presentados está claro que, por ejemplo, 0,05% de sulfato de cobre en combinación con 10 ppm ZPT actúa con mayor rapidez y es por tanto más eficaz que el 0,05% de sulfato de cobre o el ZPT solos. Por consiguiente, los datos de KRT presentados más adelante indican claramente la potenciación del ZPT por la fuente de iones metálicos.

TABLA 2(a)

Datos para Mg^{2+} , Ag^+ , Mn^{2+} , Bi^{3+} , Na^+

	Area de placa colonizada (mm ²)		
	0 Horas	24 Horas	48 Horas
Control negativo	3,97E+06	1,44E+07	5,80E+06
10 ppm de ZPT	3,97E+06	2,52E+05	2,30E+03
0,05% de $MgSO_4$	3,97E+06	4,35E+06	9,68E+06
0,05% de $MgSO_4$ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	9,90E+04	1,41E+03
0,5% de $MgSO_4$	3,97E+06	1,81E+07	9,50E+06
0,5% de $MgSO_4$ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	1,47E+04	2,70E+02
0,05% de Ag_2SO_4	3,97E+06	7,46E+05	1,22E+05

ES 2 322 688 T3

	0,05% de Ag ₂ SO ₄ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	4,35E+06	8,85E+05
	0,5% de Ag ₂ SO ₄	3,97E+06	1,65E+06	1,00E+00
5	Ag ₂ SO ₄ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	2,66E+06	1,00E+00
	MnSO ₄	3,97E+06	1,97E+07	5,91E+06
10	MnSO ₄ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	3,72E+04	4,15E+03
	0,5% de MnSO ₄	3,97E+06	1,16E+05	2,35E+02
	0,5% de MnSO ₄ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	2,87E+04	5,00E+01
15	0,05% de BiCl ₃	3,97E+06	1,96E+07	3,03E+06
	0,05% de BiCl ₃ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	1,13E+07	1,00E+06
	0,5% de BiCl ₃	3,97E+06	1,11E+06	3,42E+05
20	0,5% de BiCl ₃ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	4,66E+03	1,00E+00
		0 Horas	24 Horas	48 Horas
	0,05% de Na ₂ SO ₄	3,97E+06	3,75E+07	3,42E+06
25	0,05% de Na ₂ SO ₄ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	3,43E+05	4,70E+03
	0,5% de Na ₂ SO ₄	3,97E+06	1,44E+07	2,95E+06
	0,5% de Na ₂ SO ₄ + 10 ppm de ZPT	3,97E+06	1,69E+05	3,60E+03

TABLA 2(b)

Datos para Zn²⁺, Cu²⁺

	Area de placa colonizada (mm ²)				
	0 Horas	4 Horas	24 Horas	48 horas	
40	Control Negativo	2,12E+07	2,44E+08	1,51E+08	7,00E+08
	10 ppm ZPT	2,12E+07	3,49E+07	6,44E+06	4,86E+05
	0,05% de ZnSO ₄	2,12E+07	8,14E+07	7,22E+07	3,44E+08
45	0,05% de ZnSO ₄ + 10 ppm de ZPT	2,12E+07	1,83E+07	1,20E+06	1,39E+05
	0,5% de ZnSO ₄	2,12E+07	2,21E+07	2,69E+06	1,86E+05
	0,5% de ZnSO ₄ + 10 ppm de ZPT	2,12E+07	1,63E+07	3,17E+05	1,00E+00
50	0,05% de CuSO ₄	2,12E+07	9,49E+07	1,81E+08	3,32E+08
	0,05% de CuSO ₄ + 10 de ppm ZPT	2,12E+07	2,22E+07	1,00E+00	1,00E+00
	0,5% de CuSO ₄	2,12E+07	1,00E+00	1,00E+00	1,00E+00
55	0,5% de CuSO ₄ + 10 ppm de ZPT	2,12E+07	1,00E+00	1,00E+00	1,00E+00

Ejemplos 3 a 26

60 *Composiciones tópicas*

Las composiciones expuestas en los Ejemplos 3 a 26 ilustran realizaciones específicas de las composiciones anti-microbianas tópicas de la presente invención, pero no se pretende que sean limitantes de la misma.

65 Todas las composiciones ejemplificadas pueden prepararse mediante técnicas convencionales de formulación y mezcla. Las cantidades de los componentes se presentan como porcentajes en peso y excluyen materiales minoritarios tales como diluyentes, cargas, etc. Las formulaciones listadas, por tanto, comprenden los componentes listados y

ES 2 322 688 T3

cualquier material minoritario asociado con tales componentes. Como se usa en el presente texto, “minoritarios” se refiere a aquellos componentes opcionales tales como conservantes, agentes modificadores de la viscosidad, modificadores del pH, aromas, agentes reforzantes de la espuma, y similares. Como resulta evidente para un experto en la técnica, la selección de estos componentes minoritarios variará dependiendo de las características físicas y químicas de los ingredientes seleccionados en particular. Estas realizaciones ejemplificadas de las composiciones de champú antimicrobiano, champú antimicrobiano para el moldeado, agente acondicionador antimicrobiano, tónico antimicrobiano para dejar puesto (*leave in*), y polvo antimicrobiano para los pies de la presente invención, proporcionan una excelente eficacia antimicrobiana.

10

Ejemplos 3-13 (Ejemplos de referencia)

Champú antimicrobiano

15

Un método adecuado para preparar las composiciones de champú antimicrobiano descritas en los Ejemplos 3 a 13 (más adelante) es el siguiente:

20

Aproximadamente un tercio de todo el lauril éter sulfato amónico (añadido en forma de solución al 25% en peso) se añade a un depósito de mezcla encamisado y se calienta de aproximadamente 60°C a aproximadamente 80°C con agitación lenta, para formar una solución de agente tensioactivo. Se añaden al depósito cocoamida MEA y alcoholes grasos (en su caso) y se dejan dispersar. Se añaden al depósito sales (p. ej. cloruro potásico) y agentes modificadores del pH (p. ej. ácido cítrico, citrato sódico) y se dejan dispersar. Se añade al recipiente de mezcla diestearato de etilenglicol (“EGDS”) y se deja que se funda. Una vez fundido y dispersado el EGDS, se añade el agente conservante a la solución de agente tensioactivo. La mezcla resultante se enfría a una temperatura entre aproximadamente 25°C y aproximadamente 40°C y se recoge en un depósito de acabado. Como resultado de esta etapa de enfriamiento, el EGDS cristaliza formando una red cristalina en el producto. El resto del lauril éter sulfato amónico y los demás componentes, incluyendo la silicona y el agente o agentes antimicrobianos, se añaden al depósito de acabado con agitación para asegurar una mezcla homogénea. El polímero catiónico se dispersa en agua en forma de una solución acuosa de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 10% y después se añade a la mezcla final. Una vez que todos los componentes han sido añadidos, pueden añadirse a la mezcla agentes modificadores de la viscosidad y del pH adicionales, según se precise, para ajustar la viscosidad y el pH del producto en la cuantía que se desee.

35

Componente	Porcentaje en peso					
	Ejemplo 3	Ejemplo 4	Ejemplo 5	Ejemplo 6	Ejemplo 7	Ejemplo 8
Lauret-3 sulfato amónico	9,90	9,90	9,90	9,90	9,90	6,00
Lauril sulfato amónico	6,00	6,00	6,00	6,00	6,00	10,00
Hidróxido potásico	0,86	0,86	0,86	0,86	0,86	0,86
Acido cítrico anhidro	1,84	1,84	1,84	1,84	1,84	1,84
Diestearato de etilenglicol	1,50	1,50	1,50	1,50	1,50	1,50
Cocoamida MEA	0,80	0,80	0,80	0,80	0,80	0,80
Alcohol cetílico	0,90	0,90	0,90	0,90	0,90	0,90
Sulfato de cobre pentahidrato	0,80	0,80	0,40	0,00	0,40	0,80
Sulfato de zinc	0,00	0,00	0,00	2,00	1,00	0,00
Perfume	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75
Hidróxido potásico	0,33	0,33	0,33	0,33	0,33	0,33
Citrato sódico dihidrato	0,40	0,40	0,40	0,40	0,40	0,40
Benzoato sódico	0,13	0,13	0,13	0,13	0,13	0,13
Kathon CG	0,02	0,02	0,02	0,02	0,02	0,02

65

ES 2 322 688 T3

Piritiona de zinc	1,00	2,00	1,00	1,00	1,00	1,00
Agua	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.

5

Componente	Porcentaje en peso				
	Ejemplo 9	Ejemplo 10	Ejemplo 11	Ejemplo 12	Ejemplo 13
Laureth-3 sulfato amónico	9,90	9,90	9,90	9,90	6,00
Lauril sulfato amónico	6,00	6,00	6,00	6,00	10,00
Hidróxido potásico	0,86	0,86	0,86	0,86	0,86
Acido cítrico anhidro	1,84	1,84	1,84	1,84	1,84
Diestearato de etilenglicol	1,50	1,50	1,50	1,50	1,50
Cocamida MEA	0,80	0,80	0,80	0,80	0,80
Alcohol cetílico	0,90	0,90	0,90	0,90	0,90
Sulfato de cobre Pentahidrato	0,80	0,80	0,40	0,00	0,80
Sulfato de zinc	0,00	0,00	0,00	2,00	0,00
Perfume	0,75	0,75	0,75	0,75	0,75
Hidróxido potásico	0,33	0,33	0,33	0,33	0,33
Citrato sódico dihidrato	0,40	0,40	0,40	0,40	0,40
Benzoato sódico	0,13	0,13	0,13	0,13	0,13
Kathon CG	0,02	0,02	0,02	0,02	0,02
Piritiona de zinc	0,50	1,00	0,50	1,00	1,00
Cetacozol	0,50	1,00	0,50	0,50	0,50
Agua	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.

10

15

20

25

30

35

40

Ejemplos 14-17 (Ejemplos de referencia)

Champú moldeador antimicrobiano

45

Un método adecuado para preparar las composiciones de champú moldeador antimicrobiano descritas en los Ejemplos 14 a 17 (más adelante) por técnicas convencionales de formulación y mezclado es el siguiente:

50

55

El polímero para el moldeado del cabello debe disolverse primero en el vehículo volátil. El principio activo antimicrobiano se añade después a esta premezcla de polímero moldeador y vehículo volátil. La premezcla de polímero moldeador, vehículo volátil y principio activo antimicrobiano puede ser entonces añadida a una premezcla de los agentes tensioactivos, o cierta parte de los agentes tensioactivos, y los componentes sólidos que han sido calentados para fundirlos, p. ej., a aproximadamente 87°C. Esta mezcla se bombea después a través de un molino de alta cizalladura y se enfría, y después se añaden y se mezclan los componentes restantes. Alternativamente, la premezcla de polímero moldeador/vehículo volátil/principio activo puede ser añadida a esta mezcla final, después de enfriar. La composición debe tener una viscosidad final de aproximadamente 2000 a aproximadamente 12.000 cps. La viscosidad de la composición puede ajustarse usando cloruro sódico o xilenosulfonato sódico, si se precisa.

60

65

ES 2 322 688 T3

Componente	Porcentaje en peso			
	Ejemplo 14	Ejemplo 15	Ejemplo 16	Ejemplo 17
Laureth-3 sulfato amónico	9,00	9,00	9,00	6,00
Lauril sulfato amónico	3,00	3,00	3,00	6,00
Perfume	0,85	0,85	0,85	0,85
PEG-14M	0,30	0,30	0,30	0,30
Cloruro de guar hidroxipropiltrimonio (2)	0,15	0,15	0,15	0,15
Lauroanfoacetato sódico	5,08	5,08	5,08	5,08
Piritiona de zinc	1,00	1,00	1,00	1,00
Metosulfato de (sebo dihidrogenado)-amidoetil hidroxietilamonio (1)	1,00	1,00	1,00	1,00
Polímero de TBA/EHM en isohehexadecano	2,70	2,70	2,70	2,70
Isoparafina C10-11	1,33	1,33	1,33	1,33
Acido cítrico anhidro	0,83	0,83	0,83	0,83
Diestearato de etilenglicol	0,57	0,57	0,57	0,57
Cloruro sódico	0,45	0,45	0,45	0,45
Dimeticona	0,25	0,25	0,25	0,25
Sulfato de cobre Pentahidrato	0,80	0,00	0,40	0,40
Sulfato de zinc	0,00	2,00	1,00	0,00
Polyquaternium-10	0,15	0,15	0,15	0,15
Trihidroestearina	0,15	0,15	0,15	0,15
Pantenol	0,05	0,05	0,05	0,05
Pantil etil éter	0,05	0,05	0,05	0,05
Agua	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.

(1) Disponible bajo el nombre comercial Varisoft 110 de Sherex Chemical Co. (Dublin, Ohio, EE.UU.)

(2) Disponible bajo el nombre comercial Jaguar C-17 de Rhone-Poulenc (Cranbury, New Jersey, EE.UU.)

Ejemplos 18 a 21

Composición para el acondicionamiento del cabello

Un método adecuado para preparar las composiciones antimicrobianas para acondicionamiento del cabello descritas en los Ejemplos 18 a 21 (más adelante) por técnicas convencionales de formulación y mezclado, es el siguiente:

Cuando se incluyen en la composición, los materiales poliméricos tales como el polipropileno glicol son dispersados en agua a temperatura ambiente para preparar una solución de polímero, y se calientan a una temperatura por encima de 70°C. Se añaden a la solución con agitación amidoamina y ácido, y, cuando están presentes, otros agentes tensioactivos catiónicos, aceite de éster de bajo punto de fusión. Después también se añade a la solución, con agitación, compuesto graso de alto punto de fusión y, cuando están presentes, otros aceites de bajo punto de fusión y alcohol bencílico. La mezcla así obtenida se enfría por debajo de 60°C, y los componentes restantes tales como piritiona de zinc, la fuente de iones metálicos, y el compuesto de silicona, se añaden con agitación, y se enfría más a aproximadamente 30°C.

Puede usarse un trimezclador y/o molino en cada etapa, si es necesario, para dispersar los materiales. Alternativamente, puede añadirse hasta el 50% del ácido después de enfriar por debajo de 60°C.

ES 2 322 688 T3

Las realizaciones descritas en el presente texto tienen muchas ventajas. Por ejemplo, pueden proporcionar una eficacia antimicrobiana efectiva, especialmente anti-caspa, al tiempo que no deterioran los beneficios de acondicionamiento tales como sensación de pelo húmedo, extensibilidad y aclarado, así como proporcionar brillo y peinado en seco.

5

10

15

20

25

30

35

40

Componente	Porcentaje en peso			
	Ejemplo 18	Ejemplo 19	Ejemplo 20	Ejemplo 21
Ciclopentasiloxano	3,57	3,57	3,57	3,57
Estearamidopropil dimetilamina	1,00	1,00	1,00	1,00
Piritiona de zinc	1,00	0,50	1,00	0,50
Pantenol	0,03	0,03	0,03	0,03
Pantenil Etil Éter	0,23	0,23	0,23	0,23
Alcohol cetílico	0,96	0,96	0,96	0,96
Quaternium-18	0,75	0,75	0,75	0,75
Alcohol estearílico	0,64	0,64	0,64	0,64
Dimeticone	0,63	0,63	0,63	0,63
PEG-2M	0,50	0,50	0,50	0,50
Sulfato de cobre pentahidrato	0,80	0,00	0,40	0,40
Sulfato de zinc	0,00	2,00	1,00	0,00
Polisorbato 60	0,50	0,50	0,50	0,50
Alcohol cetearílico	0,50	0,50	0,50	0,50
Alcohol bencílico	0,40	0,40	0,40	0,40
Alcohol oleílico	0,25	0,25	0,25	0,25
Estearato de glicerilo	0,25	0,25	0,25	0,25
Hidroxietilcelulosa	0,25	0,25	0,25	0,25
Perfume	0,25	0,25	0,25	0,25
Acido cítrico	0,13	0,13	0,13	0,13
EDTA	0,10	0,10	0,10	0,10
Niacinamida	0,05	0,05	0,05	0,05
Agua	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.

45 Ejemplos 22 a 25 (Ejemplos de referencia)

Tónico capilar antimicrobiano Leave-In

50 Un método adecuado para preparar las composiciones de tónico capilar antimicrobiano leave-in descritas en los Ejemplos 22 a 25 (más adelante) es el siguiente:

55 Se añade la mayor parte del agua de formulación; con agitación, se añade el carbómero y se mezcla hasta que esté totalmente dispersado. En un recipiente separado se añade etanol y después PEG-60 fundido, aceite de ricino hidrogenado y perfume. Se pasa esto al depósito de mezcla principal con agitación. Se añaden otros ingredientes solubles en agua, componentes minoritarios, piritiona de zinc y sales metálicas. Se añade lentamente estiril silicona y se agita. Se añade lentamente trietanolamina con agitación.

60

65

Componente	Porcentaje en peso			
	Ejemplo 22	Ejemplo 23	Ejemplo 24	Ejemplo 25
Carbómero	0,50	0,50	0,50	0,50
Trietanolamina	0,30	0,30	0,30	0,30
Etanol	25,00	25,00	25,00	25,00

ES 2 322 688 T3

	Piritiona de Zinc	0,10	0,10	0,10	0,10
	Alcanfor	0,05	0,05	0,05	0,05
5	Mentol	0,50	0,50	0,50	0,50
	Pantenol	0,05	0,05	0,05	0,05
	Pantil Etil Éter	0,05	0,05	0,05	0,05
	Sulfato de cobre pentahidrato	0,08	0,00	0,04	0,08
10	Sulfato de Zinc	0,00	0,20	0,20	0,20
	Acido láctico	0,05	0,05	0,05	0,05
	Estiril Silicona	0,50	0,50	0,50	0,50
15	Cetearet-20	0,15	0,15	0,15	0,15
	PEG-60 Aceite de ricino hidrogenado	0,15	0,15	0,15	0,15
	Perfume	0,50	0,50	0,50	0,50
20	Agua	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.

Ejemplo 26 (Ejemplo de referencia)

Polvo antimicrobiano para los pies

La composición de polvo para los pies del Ejemplo 26 se prepara mezclando intensamente los ingredientes en un recipiente de mezcla. El polvo puede entonces ser molido y/o cribado si es necesario.

Componente	Porcentaje en peso
Talco	73,25%
Propionato cálcico	15,0
Propionato de Zinc	5,0
Caprilato de Zinc	5,0
Acido propiónico	0,25
Sulfato de Zinc	0,50
Piritiona de Zinc	1,0
	100,00

REIVINDICACIONES

1. Una composición tópica para el tratamiento de microbios, con el fin de inhibir o prevenir el crecimiento de los mismos sobre la piel o el cuero cabelludo, **caracterizada** dicha composición porque comprende:

a) de 0,001% a 10% en peso de la composición, preferentemente de 0,1% a 2% en peso de la composición, de un principio activo antimicrobiano elegido entre el grupo que consiste en sales de metales polivalentes de piritiona, preferentemente piritiona de zinc;

b) de 0,001% a 10%, preferentemente de 0,1% a 2% en peso de la composición, de una fuente de iones metálicos elegida entre el grupo que consiste en sales de zinc, sales de cobre, sales de plata, sales de níquel, sales de cadmio, sales de mercurio y mezclas de las mismas; y

c) un vehículo tópico para el principio activo antimicrobiano y la sal metálica, preferentemente un agente tensioactivo detergente, más preferentemente un agente tensioactivo detergente aniónico;

en donde la relación en peso de la fuente metálica al principio activo antimicrobiano es de aproximadamente 5:100 a aproximadamente 5:1 y en donde al menos el 50%, preferentemente al menos el 99,99%, más preferentemente el 100% del principio activo antimicrobiano es insoluble en la composición, y en donde dicha composición comprende uno o más agentes quelantes de di- o poli-amina pero la relación de las sales de metal polivalente de piritiona a los agentes quelantes de di- o poli-amina es al menos de 5 a 1.

2. Una composición tópica según la reivindicación 1ª, en la que menos del 50%, preferentemente menos del 5% de la sal de metal polivalente se disocia en ion piritiona libre en la composición.

3. Una composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que la composición comprende además un principio activo antimicrobiano adicional elegido entre el grupo consistente en cetoconazol, itraconazol, alquitrán de carbón, sulfuro de selenio, y mezclas de los mismos.

4. Una composición tópica anticaspa según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** porque comprende:

a) de 0,1% a 2% en peso de la composición, de piritiona de zinc;

b) de 0,01% a 5%, preferentemente de 0,1% a 2% en peso de la composición, de una fuente de iones metálicos útiles para incrementar la eficacia de la piritiona de zinc, elegida entre el grupo consistente en sales de zinc, sales de cobre, sales de plata, sales de níquel, sales de cadmio, sales de mercurio, más preferentemente elegidas entre el grupo consistente en sulfato de cobre, sulfato de zinc y mezclas de los mismos;

c) un vehículo tópico, preferentemente un agente tensioactivo detergente, más preferentemente un agente tensioactivo detergente aniónico, para dicha piritiona de zinc y dicha fuente de iones metálicos,

en la que la relación en peso de la fuente metálica al principio activo antimicrobiano es de aproximadamente 5:100 a aproximadamente 5:1 y en la que al menos el 50%, preferentemente al menos el 99,99%, más preferentemente el 100% de la piritiona de zinc es insoluble en la composición.

5. Una composición de champú según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, y útil para mejorar el aspecto del cuero cabelludo que muestra síntomas de caspa, en la que dicha composición se **caracteriza** porque comprende:

a) de 0,1% a 5%, preferentemente de 0,3% a 2% en peso de la composición, de piritiona de zinc;

b) de 0,01% a 5%, preferentemente de 0,1% a 2% en peso de la composición, de una fuente de iones metálicos elegida entre el grupo consistente en acetato de zinc, óxido de zinc, carbonato de zinc, hidróxido de zinc, cloruro de zinc, sulfato de zinc, citrato de zinc, fluoruro de zinc, yoduro de zinc, lactato de zinc, oleato de zinc, oxalato de zinc, fosfato de zinc, propionato de zinc, salicilato de zinc, seleniato de zinc, silicato de zinc, estearato de zinc, sulfuro de zinc, tanato de zinc, tartrato de zinc, valerato de zinc, gluconato de zinc, undecilato de zinc, citrato de sodio y cobre, cobre trietanolamina, carbonato de cobre, carbonato cuproso amónico, hidróxido cúprico, cloruro de cobre, cloruro cúprico, complejo de cobre etilendiamina, oxiclورو de cobre, oxiclورو de cobre sulfato, óxido cuproso, tiocianato de cobre, y mezclas de los mismos;

c) un vehículo tópico para dicha piritiona de zinc y dicha fuente de iones metálicos; y

d) un agente tensioactivo detergente;

en la que la relación en peso de la fuente metálica al principio activo antimicrobiano es de aproximadamente 5:100 a aproximadamente 5:1 y en la que al menos el 50%, preferentemente el 100% de la piritiona de zinc es insoluble en la composición.

ES 2 322 688 T3

6. Una composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que la composición comprende además un vehículo cosmético sólido, preferentemente talco.

5 7. Una composición tópica según una cualquiera de las reivindicaciones 1ª a 3ª, para ser usada en el tratamiento del pie de atleta por un método que comprende la aplicación de una cantidad segura y efectiva de dicha composición tópica a los pies de una persona en necesidad de tal tratamiento.

10 8. Una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1ª a 6ª, para ser usada en el tratamiento de infecciones microbianas, preferentemente infecciones fúngicas, más preferentemente caspa, en la piel o en el cuero cabelludo, por un método que comprende aplicar a la piel de un mamífero en necesidad de tal tratamiento una cantidad segura y efectiva de dicha composición.

15 9. Un método no terapéutico para mejorar el aspecto del pelo o del cuero cabelludo, **caracterizado** dicho método porque comprende las etapas de aplicar tópicamente al pelo o al cuero cabelludo en necesidad de tal tratamiento una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1ª a 6ª.

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65