

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 400 922**

51 Int. Cl.:

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 15/00 (2006.01)

C07D 211/46 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.06.2007 E 07729927 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.12.2012 EP 2032118**

54 Título: **Composiciones cosméticas que contienen compuestos de piperidinio**

30 Prioridad:

09.06.2006 US 449720

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

15.04.2013

73 Titular/es:

**BEIERSDORF AG (100.0%)
UNNASTRASSE 48
20253 HAMBURG, DE**

72 Inventor/es:

**SULZBERGER, MELANIE;
WÖHRMANN, MICHAEL;
TERSTEGEN, LARA y
MARTIN, ANNETTE**

74 Agente/Representante:

ISERN JARA, Jorge

ES 2 400 922 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 cosméticas que contienen compuestos de piperidinio

5 Antecedentes de la invención1. Ámbito de la invención

10 La presente invención se refiere a compuestos de piperidinio y en particular a su utilización en composiciones para la aplicación tópica, en particular antitranspirantes. El compuesto de piperidinio es el bromuro de 1,1-dimetil-4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-piperidinio. Su uso es ventajoso en composiciones cosméticas o terapéuticamente activas.

15 2. Discusión de la información de antecedentes

Por la patente US-6,482,837 se conocen varios compuestos químicos para tratar enfermedades de vejiga. En ella se describen entre otros compuestos de N-metil-4-piridinio sustituidos, un gran número de restos moleculares, combinaciones y variaciones de estos residuos. Los compuestos descritos en la patente US-6,482,837 tienen todos ellos finalidades médicas y en particular el tratamiento de enfermedades de la vejiga.

20 Por la bibliografía técnica se conocen además el 4-[ciclopentilhidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio que tiene el número CAS 807285-21-8 y el yoduro de 4-hidroxi-1,1-dimetilpiperidinio, el mandelato de α -ciclopentilo que tiene el número CAS 113569-69-0 y el bromuro de 1,1-dimetil-4-[3-metil-2-fenilvaleril)oxi]-piperidinio que tiene el número CAS 100337-30-2. Sin embargo, en la bibliografía técnica no se encuentran informaciones adicionales relativas a estos compuestos, en particular a sus posibles aplicaciones.

25 Los seres humanos tienen dos glándulas sudoríparas diferentes que participan en el desarrollo de la transpiración y el olor de la transpiración, que serán más o menos acusados en función de la zona del cuerpo. Las glándulas sudoríparas ecrinas segregan principalmente sal y agua y normalmente no contribuyen a la formación de olor. Las glándulas sudoríparas apocrinas producen olor, ya que segregan ácidos grasos, colesterol y otros compuestos. Estas sustancias se descomponen por acción de las bacterias de la piel, los productos de descomposición producen el olor típico de la transpiración.

30 Con el fin de suprimir el olor de la transpiración durante un largo período de tiempo es esencial el uso de preparaciones cosméticas. Los desodorantes cosméticos convencionales se basan en diferentes mecanismos de acción, que además pueden combinarse: por un lado los agentes desodorantes se emplean para suprimir el crecimiento de las bacterias que provocan el olor de la transpiración. Estos agentes antimicrobianos (bacteriostáticos) incluyen p.ej. al triclosano, clorhexidina y compuestos de origen natural, como el farnesol y fenoxietanol.

35 Por otro lado se emplean antitranspirantes que impiden la secreción de sudor bloqueando los conductos de las glándulas sudoríparas. En la gran mayoría de antitranspirantes se reduce la formación de transpiración empleando los llamados astringentes, sobre todo las sales de aluminio, por ejemplo el hidroxicloriguro de aluminio (clorhidrato de aluminio) o las sales de aluminio/circonio.

40 Es también habitual combinar en una misma composición los astringentes y las sustancias activas antimicrobianas. Se emplean también fragancias para enmascarar el olor de la transpiración.

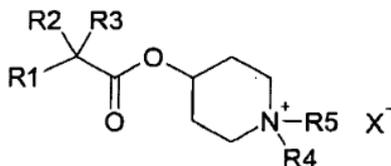
45 Sin embargo, el clorhidrato de aluminio empleado de modo conveniente como antitranspirante tiene varios inconvenientes debidos al carácter ácido y al mecanismo de acción, que abarcan desde la conocida tinte amarilla de los materiales textiles hasta la inestabilidad del perfume, lo cual limita la selección de las formulaciones. Para el usuario es un inconveniente especial que los restos puedan teñir la ropa de modo desagradable y el pH bajo (muy ácido) de la preparación cosmética tiene un impacto negativo en el equilibrio biológico de la piel.

50 Sería deseable proporcionar compuestos que sean toxicológicamente inocuos, que puedan incorporarse fácilmente sin complicaciones en las preparaciones cosméticas o terapéuticamente activas, que sean fáciles de sintetizar y además que tengan una o más propiedades ventajosas adicionales. Sería especialmente ventajoso proporcionar sustancias para emplear en composiciones cosméticas o terapéuticas, que tuvieran el efecto de reducir o de inhibir la transpiración.

55 Sería deseable proporcionar productos cosméticos eficaces y en especial antitranspirantes, que no tuvieran los inconvenientes de la técnica anterior y con preferencia que eliminaran la necesidad de usar los agentes antitranspirantes basados en compuestos de aluminio o que por lo menos permitieran reducir su cantidad.

Resumen de la invención

La presente invención proporciona composiciones cosméticas o dermatológicas, que contienen por lo menos el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio, que es una sal de piperidinio de la fórmula (I):



y un vehículo cosmética o dermatológicamente aceptable.

En la fórmula (I), los restos de R₁ a R₅ y X⁻ tienen los significados siguientes:

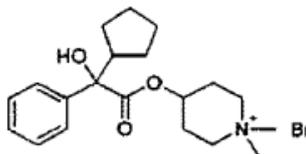
R₄ y R₅ significan con independencia H o alquilo C₁-C₆;

R₁ y R₃ significan con independencia cicloalquilo C₃-C₈ opcionalmente sustituido, fenilo opcionalmente sustituido o alquilo C₁-C₆ saturado o insaturado, opcionalmente sustituido;

R₂ significa H, OH y OR, y R significa o alquilo C₁-C₇ (lineal, ramificado, cíclico, saturado o insaturado, p.ej. metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, alilo, propargilo, n-butilo, ciclopentilo y ciclohexilo); y X⁻ significa un anión cosmética o dermatológicamente aceptable.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes, por ejemplo, en forma de isómeros individuales (p.ej. enantiómeros), o de cualquier mezcla de isómeros y en forma de racematos.

El bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio puede representarse con la siguiente fórmula:



En otro aspecto adicional, la composición de la presente invención puede contener el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio en una concentración comprendida entre aprox. el 0,001 % y el 15 % en peso, porcentajes referidos al peso total de la composición. Por ejemplo, la composición puede contener por lo menos una sal de la fórmula (I) en un concentración comprendida entre aprox. el 0,05 % y el 10 % en peso, o en una concentración comprendida entre aprox. el 0,1 % y el 5 % en peso.

En otro aspecto, la composición de la presente invención puede estar presente en una forma idónea para la aplicación tópica. Por ejemplo, la composición puede estar presente en forma de crema, loción, gel, ungüento, tintura, aceite para la piel, leche, bálsamo, venda impregnada con la composición, toalla impregnada con la composición, material textil impregnado con la composición, tampón (almohadilla) impregnado con la composición, pulverizador, aerosol, aplicador de bola (roll-on), lápiz (barra), sólido blando, polvo o pulverizador.

En otro aspecto, la composición de la presente invención puede estar presente en una forma adecuada para el uso como antitranspirante.

En otro aspecto, la composición puede contener además por lo menos una sustancia desodorante.

En otro aspecto, la composición de la presente invención puede contener además un compuesto de aluminio activo como antitranspirante. Por ejemplo, el por lo menos un compuesto de aluminio activo como antitranspirante puede estar presente en una concentración comprendida entre aprox. el 0,1 % y el 30 % en peso, p.ej. en una concentración comprendida entre aprox. el 1 % y el 15 % en peso, porcentajes referidos al peso total de la composición. El compuesto de aluminio activo como antitranspirante puede ser, p.ej. el clorhidrato de aluminio, cloruro de aluminio y/o un compuesto de aluminio y circonio.

En otro aspecto, la composición puede estar esencialmente libre de sustancias activas antitranspirante que sean diferentes de una sal de la fórmula (I). En particular, la composición puede estar sustancialmente libre de compuestos de aluminio.

En otro aspecto, la composición de la presente invención puede estar presente en forma de jabón líquido o jabón de tipo pastilla, aerosol, barra desodorante, crema, loción, tintura desodorante, producto de higiene íntima desodorante, champú desodorante, preparado desodorante para ducha o baño, polvo desodorante o pulverizador desodorante y/o la composición puede estar presente en combinación con un envase de aerosol, una botella aplastable (estrujable), un dispositivo de tipo bomba o un dispositivo de bola (roll-on).

La presente invención proporciona también un método para reducir o inhibir la formación de transpiración. El método consiste en la aplicación de una cantidad eficaz en sentido antitranspirante de una composición según la presente invención descrita previamente (incluidos los diferentes aspectos de la misma) sobre la piel (humana).

En un aspecto del método, la aplicación de la composición puede llevarse a cabo empleando ultrasonidos, un aparato de iontoforesis, microcanales y/o microagujas.

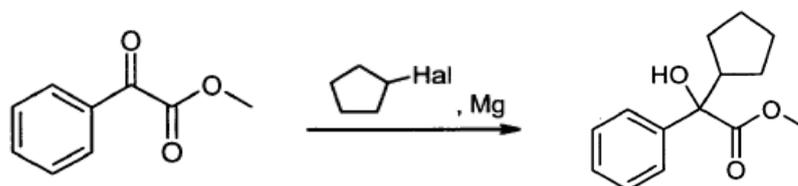
Descripción detallada de la invención

Los extremos concretos aquí descritos se presentan a título de ejemplo y con fines meramente de debate ilustrativo de las formas de ejecución de la presente invención, se presentan, pues, con el fin de proporcionar lo que se cree que es la descripción más útil y fácil de entender de los principios y aspectos conceptuales de la presente invención. En este sentido, no se pretende aportar aspectos de la presente invención con más detalle del que sea necesario para la comprensión de los fundamentos de la presente invención, en vistas de la descripción los expertos verán claramente las diversas formas de llevar a la práctica la presente invención. El objeto de la invención se define en las reivindicaciones.

De modo sorprendente, el compuesto de piperidinio, el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio tiene una gran eficacia para inhibir la transpiración. El bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetilpiperidinio representa, pues, una alternativa a los agentes ya conocidos para inhibir o reducir la transpiración. El compuesto de piperidinio empleado según la presente invención, es decir, el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio puede emplearse, pues, con preferencia para inhibir o por lo menos reducir significativamente la transpiración. Es fácil de producir y puede incorporarse con facilidad a un gran número de formulaciones cosméticas o terapéuticamente activas.

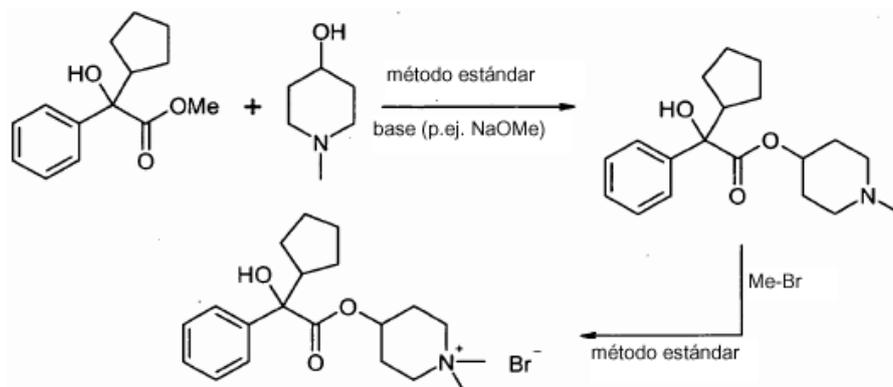
El compuesto de piperidinio empleado con arreglo a la presente invención puede obtenerse por una síntesis de pocos con materiales de partida que son productos comerciales. Un método de síntesis posible y preferido, descrito a título de ejemplo para las sales de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio parte del (2-ciclopentilmandelato) de metilo y la 4-hidroxil-N-metilpiperidina, que se someten a una reacción de esterificación. El último paso de la síntesis es la conversión en el correspondiente compuesto de piperidinio, es decir, la cuaternización del átomo de nitrógeno con reactivos empleados habitualmente para este fin, p.ej. el bromuro de metilo. El (2-ciclopentilmandelato) de metilo puede obtenerse, por ejemplo, aparte de muchas otras variantes imaginables, por un reacción de condensación (p.ej. una reacción de Grignard) de p.ej. el fenilgloxilato de metilo (CAS nº 15205-55-0) con haluros de ciclopentilo. Eligiendo oportunamente los compuestos de partida y las condiciones de reacción idóneas, el compuesto podrá obtenerse también en una forma enantioméricamente pura o enantioméricamente enriquecida, respectivamente. El siguiente esquema de reacción ilustra la síntesis recién descrita.

Reacción de Grignard



método estándar
Hal = Br, Cl

Se obtienen resultados especialmente ventajosos cuando la reacción de Grignard se realiza con el $ZnBr_2$ como aditivo.

Reacción de transesterificación y cuaternización

5 La presente invención abarca no solo el anterior compuesto de piperidinio en general y en particular, el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio, sino también los isómeros individuales y cualquier mezcla deseada de los mismos, incluso cuando por razones de simplificación estos compuestos se discutan en la presente solicitud sin más información estereoquímica. Es especialmente preferido el uso de mezclas racémicas. Si durante la reacción se forma una mezcla 1:1 de enantiómeros, entonces esta mezcla se llama racemato o mezcla racémica.

10 De modo sorprendente, el compuesto de piperidinio empleado según la presente invención, es decir, el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio, es toxicológicamente inocuo, lo cual no necesariamente era de esperar en base únicamente a las unidades estructurales químicas del mismo.

15 Es especialmente sorprendente la aplicabilidad del bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio en todas las formas concebibles de producto o de aplicación, que permite cualquier tipo de contacto con los humanos.

20 Además es sorprendente y ventajoso que las sales de fenilacetoxipiperidinio y, en particular, el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio, sean fácilmente soluble en agua. Es, pues, posible y preferida la incorporación en las composiciones ya conocidas de base acuosa.

25 Además de las formas de aplicación médica como agente terapéutico, es decir, como preparado farmacéutico, el uso de los presentes compuestos de piperidinio en cosmética es posible y preferido.

El bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio puede utilizarse, pues, como agente terapéutico, en un preparado farmacéutico y en este caso particular para reducir o inhibir la formación de transpiración.

30 En la presente descripción y en las reivindicaciones anexas, los términos "composición" y "agente" incluyen todas las formas de aplicación, preparaciones, medios o sustancias que pueden utilizarse en, sobre, dentro y/o con objetos, en métodos y/o para la aplicación sobre la piel humana.

35 Las últimas formas de aplicación se resumen en la presente como formas de aplicación tópica y consisten en particular en todas las formas de administración y aplicación externa a la piel humana. La aplicación tópica es, pues, preferida y abarca el uso o aplicación tópicos externos, por ejemplo la aplicación en forma de crema, loción, gel, ungüento, tintura, aceite para la piel, leche, bálsamo, por medio de emplasto, paño, material textil, almohadilla, en forma de pulverizador, atomizador, aerosol, aplicador de bola (roll-on), barra, sólido blando, polvo, pulverizador de polvo y demás formas conocidas de aplicación tópica, p.ej. la inserción en la piel con un aparato de iontoforesis, ultrasonidos, microcanales o microagujas y similares. Con los últimos métodos se consigue un refuerzo claro de penetración, que puede conducir a un efecto intensificado.

40 El compuesto de piperidinio de la presente invención, con preferencia en las formas de aplicación mencionadas anteriormente, y en forma de sustancias fácilmente solubles en agua, pueden mezclarse en cantidades relativamente grandes y por los métodos habituales de la producción cosmética para generar las preparaciones cosméticas y/o dermatológicas.

45 La concentración del bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio en una composición, de modo individual o en forma de mezcla, se sitúa normalmente por lo menos en torno al 0,001 % en peso, con preferencia por lo menos en el 0,05 % en peso, con preferencia especial por lo menos en el 0,1 % en peso, pero normalmente en una cantidad no superior al 15% en peso, con preferencia no superior al 10 % en peso, con preferencia especial no superior al 5 % en peso, porcentajes referidos al peso total de la composición.

Es, pues, preferido según la presente invención que las composiciones tópicas no incluyan productos o agentes farmacéuticos que tengan efectos terapéuticos. Por consiguiente, las composiciones de la presente invención con preferencia no contienen agentes terapéuticos. Sin embargo, si en las composiciones se incluyen agentes terapéuticos, estos se elegirán con preferencia entre los que se administran convencionalmente con una aplicación tópica a la piel, p.ej. los antimicóticos.

El uso de los compuestos de piperidinio de la presente invención, en particular de las sales de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio y del bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio, es preferido también para el cuidado de heridas y de la piel, como constituyentes de composiciones detergentes y composiciones limpiadoras, en productos cosméticos (con preferencia decorativos o de maquillaje) y, en particular, en composiciones desodorantes/antitranspirantes.

Como norma general, los productos cosméticos son cremas, ungüentos y otras composiciones que se aplican a la piel. Sirven para resaltar partes individuales del cuerpo, en la mayor parte de casos la cara (barra de labios, sombra de ojos o maquillaje) o para cubrir por ejemplo cicatrices, marcas de acné, etc. En general, los productos cosméticos se emplean con fines estéticos, pero no para fines terapéuticos.

De modo sorprendente, la presente invención aporta remedio a los inconvenientes descritos de los agentes antitranspirantes conocidos, en particular los compuesto de aluminios, ya que, debido al efecto antihidrótico del bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio, puede reducirse o eliminarse por completo la cantidad utilizada de agentes antitranspirantes, por ejemplo el ACH.

Además, el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio presenta buena tolerancia y con preferencia no inhibe de modo significativo la eficacia de los agentes antitranspirantes.

Otra ventaja posible, asociada con la presente invención, consiste en que el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio puede utilizarse en composiciones de desodorantes/antitranspirantes como sustancia antimicrobiana para reducir el olor no solo en combinación con desodorantes/agentes antitranspirantes estándar, p.ej. el clorhidrato de aluminio u otras sales de aluminio, sino también de forma totalmente libre de tales agentes estándar.

Es, pues, posible proporcionar composiciones de desodorante/antitranspirante que contengan con preferencia del 0,01 al 25 % en peso de agentes antitranspirantes de aluminio, en particular el clorhidrato de aluminio, en combinación con el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio.

Existe además la propiedad extraordinariamente ventajosa de la buena solubilidad en agua de los compuestos empleados con arreglo a la presente invención.

Debido a sus propiedades ventajosas, las preparaciones cosméticas de la presente invención pueden emplearse, por ejemplo, en forma de aerosoles, en tal caso las preparaciones pueden pulverizarse con envase de tipo aerosol, botellas estrujables o con un dispositivo de tipo bomba, o en forma de composiciones líquidas que pueden aplicarse con dispositivos de bola (roll-on) o con cepillo, en forma de barras desodorantes y en forma de emulsiones de agua en aceite (W/O) o de aceite en agua (O/W), p.ej. cremas o lociones que pueden aplicarse con botellas o envases normales o en forma de jabones líquidos o de tipo pastilla. Además, los desodorantes cosméticos pueden estar presentes con ventaja en forma de tinturas desodorantes, agentes limpiadores desodorantes para higiene femenina, champús desodorantes, preparaciones desodorantes para ducha o baño, polvos desodorantes o pulverizadores de polvos desodorantes.

Además de estas preparaciones y formas de aplicación, los expertos son también concededores de las tecnologías modernas de formulación de ingredientes activos para optimizar parámetros tales como la estabilidad, la solubilidad, el control de liberación y la biodisponibilidad. Las técnicas modernas de formulación incluyen, por ejemplo, la microencapsulación y la nanoencapsulación (principio de matriz), sistemas de membrana (p.ej. liposomas) así como las ciclodextrinas. Algunos de estos métodos se han descrito, p.ej. en el manual Pharmazeutische Technologie: Moderne Arzneiformen, 2ª ed., editorial Wiss. Verl.-Ges., 1998, cuyos autores son Rainer H. Müller y Gesine H. Hildebrand, esta publicación se incluye en la presente en su totalidad como referencia. Los ejemplos no limitantes de materiales para estas tecnologías de formulación incluyen: ceras, lípidos, fosfolípidos, polímeros naturales y sintéticos y también ciclodextrinas. Las dimensiones de estos sistemas se sitúan por lo general entre 0,01 µm y 50 µm.

El uso del compuesto de piperidinio de la presente invención, es decir, el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio, es igualmente preferido para vendajes de heridas y cuidado de la piel y como constituyente de preparaciones detergentes y composiciones limpiadoras.

Obviamente, los expertos ya conocen que las preparaciones cosméticas son normalmente inconcebibles sin la presencia de los agentes auxiliares y aditivos usuales. Las preparaciones cosméticas de la invención podrán, pues, contener también agentes auxiliares cosméticos empleados de modo convencional en las preparaciones de este

5 tipo, por ejemplo sustancias soporte (builder), conservantes, estabilizantes, cargas de relleno, perfumes, pigmentos con/sin efecto colorante, espesantes, sustancias tensioactivas, emolientes, humidificantes y/o humectantes, sustancias antiinflamatorias, agentes activos adicionales, por ejemplo vitaminas o proteínas, agentes de protección a la luz (filtros solares), repelentes de insectos, bactericidas, virucidas, agua, sales, sustancias antimicrobianas, proteolíticas o queratolíticas, medicamentos u otros ingredientes habituales de formulaciones cosméticas o dermatológicas, por ejemplo alcoholes, polioles, polímeros, estabilizadores de espuma, disolventes orgánicos y también electrolitos.

10 Las preparaciones cosméticas y/o dermatológicas según la presente invención pueden presentarse también en forma de geles, que además de una cantidad eficaz de los compuestos empleados según la presente invención y disolventes empleados normalmente en ellas, habitualmente y con preferencia agua, contienen también espesantes orgánicos y/o inorgánicos. Además, estos espesantes son un elemento constitutivo de las emulsiones cosméticas.

15 Como emulsionantes para producir las preparaciones de la presente invención, que pueden aplicarse con ventaja a las zonas deseadas de la piel en forma de preparaciones líquidas o sólidas, y que pueden utilizarse en pequeñas cantidades en las preparaciones, por ejemplo, del 1 % al 6 % en peso, se ha demostrado que los tipos no iónicos son adecuados, por ejemplo los éteres de alcoholes grasos y polioxietileno, por ejemplo el polietilenglicoléter del alcohol cetosteárico, que tiene de 12 a 20 unidades de óxido de etileno por molécula, los éteres de alcohol y sorbita y los compuestos éster de sorbita-óxido de etileno (por ejemplo, el monoestearato de sorbita y el monoestearato de sorbita/polioxietileno) y los poliglicoléteres grasos de cadena larga y peso molecular elevado. Pero además son también adecuados un gran número de emulsionantes adicionales o mezclas de emulsionantes, que se emplean habitualmente en las preparaciones cosméticas. Los ejemplos no limitantes de ellos incluyen el estearato-citrato de glicerilo, el estearato de PEG 40 o incluso el diestearato de poligliceril(3)-metilglucosa, el ácido esteárico, el steareth-2, steareth-21, isoestearato de glicerilo, el isoceteth-20 o también el cetareth-20.

25 La fase aceite (lípida) de las preparaciones que son preferidas según la presente invención se elige con ventaja entre los ésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales, que tienen una longitud de cadena comprendida entre 3 y 30 átomos de carbono y alcoholes saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales, que tienen una longitud de cadena de 3 a 30 átomos de carbono, entre los ésteres de ácidos carboxílicos aromáticos y alcoholes saturados y/o insaturados, ramificados y/o lineales, que tienen una longitud de cadena de 3 a 30 átomos de carbono. Tales aceites de tipo éster pueden elegirse con ventaja p.ej. entre el miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, estearato de isopropilo, oleato de isopropilo, estearato de n-butilo, laurato de n-hexilo, oleato de n-decilo, estearato de isooctilo, estearato de isononilo, isononanoato de isononilo, palmitato de 2-etilhexilo, laurato de 2-etilhexilo, estearato de 2-hexildecilo, palmitato de 2-octildodecilo, oleato de oleilo, erucato de oleilo, oleato de erucilo, erucato de erucilo y las mezclas sintéticas, semisintéticas y naturales de dichos ésteres, p.ej. el aceite de jojoba.

40 Además, la fase aceite puede elegirse con ventaja entre los hidrocarburos ramificados y lineales y las ceras de hidrocarburos, los aceites de silicona, los éteres de dialquilo, el grupo de los alcoholes saturados o insaturados, lineales o ramificados y los triglicéridos de ácidos grasos, a saber los ésteres de triglicerina con ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, lineales y/o ramificados que tienen una longitud de cadena de 8 a 24 átomos de carbono, en especial de 12 a 18. Los triglicéridos de ácidos grasos pueden elegirse con ventaja por ejemplo entre los aceites sintéticos, semisintéticos y naturales, p.ej. el aceite de oliva, aceite de girasol, aceite de soja, aceite de cacahuete, aceite de colza, aceite de almendra, aceite de palma, aceite de coco, aceite de palmiste y similares.

45 Puede utilizarse también con ventaja cualquier mezcla de dichos componentes aceite y cera para los fines de la presente invención.

50 La fase aceite puede contener también con ventaja aceites de silicona cíclicos o lineales o puede estar formada en su totalidad por aceites de este tipo, aunque es preferible utilizar una cantidad adicional de otros componentes de la fase aceite además del o de los aceites de silicona. La ciclometicona (octametilciclotetrasiloxano) o la dimeticona se emplean con ventaja como aceite de silicona para el uso en la presente invención. Sin embargo pueden utilizarse también con ventaja otros aceites de silicona para los fines de la presente invención, por ejemplo el hexametilciclotrisiloxano, el polidimetilsiloxano o el poli(metilfenilsiloxano).

55 La concentración de la fase aceite se situará con ventaja entre aprox. el 1 % y el 50 % en peso, porcentajes referidos al peso total de las preparaciones, con preferencia entre el 2,5 % y el 30 % en peso, con preferencia especial entre el 5 % y el 15 % en peso.

60 Los agentes gelificantes, también llamados espesantes, son macromoléculas que tienen una estructura principalmente lineal y tienen fuerzas de interacción intermolecular que permiten enlaces de valencia secundarios y primarios entre las moléculas individuales y de este modo dan lugar a la formación de estructuras de tipo retícula. Algunos de ellos son polímeros naturales o sintéticos solubles en agua, que forman geles o soluciones viscosas en sistemas acuosos. Aumentan la viscosidad del agua fijando moléculas de agua (hidratación) o bien absorbiendo y encapsulando agua dentro de sus macromoléculas entretejidas, con lo cual al mismo tiempo restringen la movilidad del agua.

65 Tales polímeros solubles en agua constituyen un gran grupo de polímeros naturales y sintéticos muy diferentes

desde el punto de vista química, cuya característica común es su solubilidad en agua o en medios acuosos. Un requisito indispensable para ello es que estos polímeros tengan un número suficiente de grupos hidrófilos para la solubilidad en agua y que no estén demasiado reticulados. Los grupos hidrófilos pueden ser de naturaleza no iónica, aniónica o catiónica.

Los espesantes ventajosos para preparaciones cosméticas son, por ejemplo, los copolímeros de acrilatos de alquilo C₁₀₋₃₀ y uno o varios monómeros de ácido acrílico, ácido metacrílico o ésteres de los mismos. La denominación INCI de tales compuestos es "acrylates/C10-30 alkyl acrylate crosspolymer". Son especialmente ventajosos los tipos de Pemulen[®] TR1, TR2 y TRZ de Goodrich (Noveon).

Los Carbopoles son también agentes gelificantes ventajosos para las preparaciones de la invención. Los Carbopoles son polímeros de ácido acrílico, en particular también copolímeros de acrilato-acrilato de alquilo. Los polímeros ventajosos son, por ejemplo, los tipos 980, 981, 984, 1342, 1382, 2984 y 5984, igualmente los tipos ETD 2001, 2020, 2050 y el Carbopol Ultrez 10, los polímeros cruzados de PVM/MA-decadieno (nombre comercial: Stabileze 06), el poli(metacrilato de glicerilo) y la poli(acrilamida). Son también agentes gelificantes ventajosos para tales preparaciones la goma xantano, la polivinilpirrolidona, los derivados de celulosa, en particular los éteres de celulosa, por ejemplo la hidroxipropilmetilcelulosa, el almidón y los derivados de almidón, el ácido hialurónico, la harina de algarroba, la sílice y los silicatos de aluminio.

El espesante estará presente habitualmente en un gel, una dispersión, una emulsión y similares en una concentración comprendida entre aprox. el 0,01 % y el 5 % en peso, con preferencia entre el 0,1 % y el 2 % en peso, porcentajes referidos al peso total de la composición.

Los polímeros AMPS pueden ser productos comerciales en forma de sustancia 100 % activa o en forma de espesantes inversos.

Ejemplos:

- copolímeros AMPS reticulados, en forma polvo: Aristoflex AVC (copolímero de acriloidimetiltaurato amónico/VP, de Clariant) Aristoflex HMB (copolímero de acriloidimetiltaurato amónico/metacrilato de beheneth-25, de Clariant)
- copolímeros AMPS reticulados, espesantes inversos: Simulgel (Seppic): copolímeros de acrilato de hidroxietilo /taurato de acriloidimetilo sódico/escualano/polisorbato.

Los polímeros ventajosos para utilizarse en la presente invención se describen, por ejemplo, en DE 100 29 462 A1.

El copolímero de acriloidimetiltaurato amónico/VP es un polímero de ácido acrilamidometilpropilsulfónico preferido para el uso en la presente invención.

Puede ser también preferido según la presente invención añadir agentes complejantes (secuestrantes) a las preparaciones descritas. Los agentes complejantes son compuestos auxiliares ya conocidos de por sí en cosmetología y en medicina galénica. Los agentes secuestrantes, en particular los agentes quelantes, forman complejos con átomos metálicos; en presencia de uno o más agentes secuestrantes mono- o polibásicos, es decir, agentes quelantes, estos complejos constituyen ciclos metálicos. Los agentes quelantes son compuestos, en los que un ligando individual ocupa más de un sitio de coordinación en un átomo central. En este caso, además, los compuestos que normalmente son lineales se cierran, dando lugar a formaciones complejas alrededor de un átomo o ion metálico, generando anillos. El número de ligandos unidos dependerá del número de coordinación del metal central. Un requisito previo para la formación de quelatos es que el compuesto, que reacciona con el metal, contenga dos o más grupos atómicas que actúen como dadores de electrones.

El o los agentes complejantes pueden elegirse con ventaja entre los compuestos habituales, dándose preferencia por lo menos a una sustancia elegida entre el ácido tartárico y sus aniones, el ácido cítrico y sus aniones, el ácido aminopolicarboxílico y sus aniones (por ejemplo, el ácido etilendiaminatetraacético (EDTA) y sus aniones y el ácido nitrilotriacético (NTA) y sus aniones.

El o los agentes complejantes están presentes con ventaja en las preparaciones cosméticas o dermatológicas en cantidades comprendidas entre el 0,01 % y el 10 % en peso, con preferencia entre el 0,05 % y el 10% en peso, con preferencia especial entre el 0,1 % y el 1,0 % en peso, porcentajes referidos al peso total de las preparaciones.

Los conservantes ventajosos para los fines de la presente invención son, por ejemplo, el alcohol bencílico, el ácido sórbico y sus sales, las fuentes de formaldehído (por ejemplo, la diazolidinilurea (nombre comercial Germall II de ISP), imidazolidinilurea (nombre comercial Germall 115) o la DMDM-hidantoína, que suministra, por ejemplo, la empresa Lonza con el nombre comercial de Glydant[™], la metilisotiazolinona y los derivados correspondientes (nombre comercial: Kathon CG), los butilcarbamatos de yodopropinilo (p.ej. los suministrados con los nombres comerciales de Glycacil-L, Glycacil-S por la empresa Lonza y/o Dekaben LMB por la empresa Jan Dekker), los

parabenos (es decir, p-hidroxibenzoatos de alquilo, por ejemplo el metil-, etil-, propil-, isopropil- y/o butil-parabeno), el fenoxietanol, etanol, triclosano, ácido benzoico y similares. Además, según la presente invención, el sistema de conservante contiene también habitualmente y con ventaja sustancias que mejoran la eficacia de los conservantes clásicos, por ejemplo el hexanodiol, pentanodiol, butilenglicol y metilpropanodiol.

5 Es ventajoso igualmente añadir antioxidantes a las preparaciones de la presente invención. Según la invención, todos antioxidantes que son adecuados y/o habituales en los usos cosméticos y/o dermatológicos, pueden utilizarse como antioxidantes favorables.

10 La concentración de los antioxidantes (uno o varios compuestos) en las preparaciones se situará con preferencia entre aprox. el 0,001 % y el 30 % en peso, con preferencia especial entre el 0,05 % y el 20% en peso, en particular entre el 1 % y el 10 % en peso, porcentajes referidos al peso total de la preparación.

15 Según invención es también posible y ventajoso utilizar sustancias protectoras contra la radiación, que absorben la radiación UV perteneciente a la región UVB. La concentración total de dichas sustancias filtro puede situarse con preferencia entre el 0,1 % en peso y el 30 % en peso, porcentajes referidos al peso total de la composición. Son preferidos los filtros UVB solubles en agua o solubles en aceite que son productos comerciales. Puede ser también ventajoso emplear en las preparaciones de la presente invención filtros UVA que se incluyen habitualmente en las preparaciones cosméticas y/o dermatológicas. Pueden emplearse en cantidades similares a las recién indicadas para los filtros UVB.

20 Las preparaciones cosméticas y/o dermatológicas de la invención pueden contener también pigmentos inorgánicos, que se emplean habitualmente en productos cosméticos para proteger la piel contra los rayos UV. Son normalmente óxidos de titanio, cinc, hierro, circonio, silicio, manganeso, aluminio y mezclas de los mismos. Son especialmente preferidos los pigmentos basados en dióxido de titanio, TiO₂, o en óxido de cinc, ZnO. Pueden utilizarse las cantidades indicadas para las combinaciones anteriores.

25 Los propelentes apropiados para las formulaciones cosméticas y/o dermatológicas de la invención, que pueden pulverizarse con envases de tipo aerosol incluyen los propelentes licuados, fácilmente volátiles, habituales ya conocidos, por ejemplo los hidrocarburos (propano, butano, isobutano), que pueden emplearse a título individual o en forma de mezclas. Puede emplearse también con ventaja el aire comprimido.

30 Obviamente, los expertos ya saben que hay gases propelentes que no son tóxicos de por sí y que en principio serían apropiados para la puesta en práctica de la presente invención en forma de preparaciones de tipo aerosol, pero que a pesar de ello deberían evitarse porque tienen un impacto inaceptable en el medio ambiente o por otras circunstancias concomitantes, en especial los hidrocarburos fluorados y los hidrocarburos clorofluorados (CFC).

35 Las composiciones cosméticas o dermatológicas de la presente invención pueden contener también minerales de tipo arcilla, por ejemplo los silicatos laminares y/o la sílice, que se emplean con frecuencia como auxiliares de suspensión en desodorantes cosméticos y antitranspirantes de base aceite.

40 Los silicatos laminares ventajosos, opcionalmente en forma modificada, para los fines de la presente invención incluyen la montmorillonita, caolinita, ilita, beidelita, nontronita, saponita, hectorita, bentonita y esmectita. Los ejemplos específicos no limitantes de silicatos laminares apropiados incluyen:

45

montmorillonita	$\text{Na}_{0,33}(\text{Al}_{1,67}\text{Mg}_{0,33})(\text{OH})_2(\text{Si}_4\text{O}_{10})$
o simplificado	$\text{Al}_2\text{O}_3 \cdot 4\text{SiO}_2 \cdot \text{H}_2\text{O} \cdot n\text{H}_2\text{O}$
caolinita	$\text{Al}_2(\text{OH})_4(\text{Si}_2\text{O}_5)$
ilita	$(\text{K},\text{H}_3\text{O})_y\text{Mg}_3(\text{OH})_2(\text{Si}_{4-y}\text{Al}_y\text{O}_{10})$ y $(\text{K},\text{H}_3\text{O})_y\text{Al}_2(\text{OH})_2(\text{Si}_{4-y}\text{Al}_y\text{O}_{10})$; en las que $y = 0,7-0,9$
beidelita	$(\text{Ca}, \text{Na})_{0,3}(\text{Al}_2(\text{OH})_2(\text{Al}_{0,5}\text{Si}_{3,5}\text{O}_{10}))$
nontronita	$\text{Na}_{0,33}(\text{Fe}_2(\text{OH})_2(\text{Al}_{0,33}\text{Si}_{3,67}\text{O}_{10}))$
saponita	$(\text{Ca}, \text{Na})_{0,33}((\text{Mg}, \text{Fe})_3(\text{OH})_2(\text{Al}_{0,33}\text{Si}_{3,67}\text{O}_{10}))$
hectorita	$\text{Na}_{0,33}((\text{Mg}, \text{Li})_3(\text{OH},\text{F})_2(\text{Si}_4\text{O}_{10}))$

La montmorillonita es el mineral principal del grupo de las bentonitas de origen natural.

50 Los silicatos laminares están bien documentados en la bibliografía técnica, véase p.ej. los manuales "Lehrbuch der anorganischen Chemie", A.F. Hollemann, E. Wiberg y N. Wiberg, ediciones 91^a-100^a, editorial Walter de Gruyter 1985, en varias páginas de este manual, y el "Lehrbuch der anorganischen Chemie", H. Remy, 12^a ed., editorial

Akademische Verlagsgesellschaft, Leipzig, 1965, en varias páginas de este manual. La estructura laminar de la montmorillonita se ha documentado por ejemplo en el diccionario Römpps Chemie-Lexikon, editorial Franckh'sche Verlagshandlung W. Keller & Co., Stuttgart, 8º ed., 1985, pp. 2668 y siguientes.

5 Las preparaciones de la presente invención pueden contener uno o varios tensioactivos. Los tensioactivos son sustancias anfífilas, que pueden disolver sustancias orgánicas no polares en agua. Como resultado de su estructura molecular específica, que tiene por lo menos un resto molecular hidrófilo y un resto molecular hidrófobo, son capaces de reducir la tensión superficial del agua, humedecer la piel, facilitar la eliminación y disolución de la suciedad, facilitar el enjuague y, si se desea, controlar la espumación.

10 Los restos hidrófilos de una molécula de tensioactivo son en su mayor partes grupos funcionales polares, por ejemplo $-\text{COO}^-$, $-\text{OSO}_3^{2-}$, $-\text{SO}_3^-$, mientras que los restos hidrófobos suelen ser hidrocarburos no polares. Los tensioactivos se clasifican en general con arreglo al tipo y carga del resto molecular hidrófilo. Cabe diferenciar al respecto entre cuatro grupos:

- 15
- tensioactivos aniónicos,
 - tensioactivos catiónicos,
 - tensioactivos anfóteros y
 - tensioactivos no iónicos.

20 Los siguientes son ejemplos ventajosos y no limitantes de composiciones de la presente invención.

Ejemplo 1: formulaciones transparentes aplicables con bola (roll-on)

	I (no es de la invención)	II	III
Materias primas (INCI)	% en peso		
alcohol desnaturalizado	20,000	30,000	20,000
hidroxietilcelulosa	0,400	0,300	0,400
polietilenglicol 400	3,000	2,000	3,000
aceite de ricino hidrogenado-polietilenglicol (2000)	2,000	3,000	2,000
aceite de aguacate	0,500	0,100	0,500
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,30	0,50
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--	--
perfume, antioxidantes	cantidad suficiente	c. suf.	c. suf.
agua,	hasta 100,00	h. 100,00	h. 100,00

25 Ejemplo 2: Macroemulsiones de crema desodorante

	I	II	III	IV
Materias primas (INCI)	% en peso			
esteariléter de polietilenglicol (21)	2,000	1,500	1,000	2,500
esteariléter de polietilenglicol (2)	2,500	2,500	2,200	1,500
esteariléter de polipropilenglicol (15)	3,000	4,000	4,000	3,000
éster 2-etilehexilo de ácidos grasos de coco	--	--	--	1,000
Na ₃ HEDTA (solución acuosa al 20 %)	1,500	1,500	1,500	1,500
aceite de aguacate	0,100	0,100	0,100	0,100
perfume, antioxidantes	cant. suf.	cant. suf.	cant. suf.	cant. suf.
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,05	0,3	0,1	0,5
agua, hasta completar	100,000	100,000	100,000	100,000

	V	VI (no es de la invención)	VII	VIII (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso			
esteariléter de polietilenglicol (21)	2,000	1,500	1,000	2,500
esteariléter de polietilenglicol (2)	2,000	3,000	2,500	3,000
esteariléter de polipropilenglicol (15)	3,000	3,000	3,000	3,000
éster 2-etilehexilo de ácidos grasos de coco	--	--	1,000	--
Na ₃ HEDTA (solución acuosa al 20 %)	1,500	1,500	1,500	1,500
aceite de aguacate	0,100	0,100	0,100	0,100
perfume, antioxidantes	cant. suf.	cant. suf.	cant. suf.	cant. suf.

ES 2 400 922 T3

bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,01	--	0,2	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,5	--	0,5
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	--	--
agua, hasta completar	100,000	100,000	100,000	100,000

Ejemplo 3: emulsión de aceite en agua (O/W)

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención) % en peso
diestearato de poligliceril-3-metil-glucosa	2,00	2,00
alcohol estearílico	2,00	2,00
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	3,00	3,00
dicaprilato/dicaprato de butilenglicol	2,00	2,00
ciclometicona	3,00	3,00
polideceno hidrogenado	2,00	2,00
dimetilpolisiloxano (dimeticona)	1,00	1,00
vaselina	1,00	1,00
TiO ₂	1,00	1,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	2,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,00
alantoína	0,10	0,10
fenoxietanol	0,40	0,40
carbamato de yodopropilbutilo	0,05	0,05
p-hidroxibenzoato de alquilo (parabeno)	0,20	0,20
goma xantano	0,10	0,10
Carbomer	0,10	0,10
butilenglicol	3,00	3,00
aditivos (talco, BHT)	0,50	0,50
perfume	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

5 Ejemplo 4

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención) % en peso
diestearato de poligliceril-3-metil-glucosa	3,00	3,00
alcohol cetílico	1,00	1,00
ciclometicona	3,00	3,00
éter de dicaprilo	2,00	2,00
parafina líquida	3,00	3,00
etilenodiaminatetraacetato trisódico	0,10	0,10
Carbomer	0,10	0,10
hidroxipropilmetilcelulosa	0,3	0,3
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,05
clorhidrato de aluminio	5,00	5,00
glicerina	3,00	3,00
NaOH	cantidad suf.	cantidad suficiente
conservantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
perfume	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

ES 2 400 922 T3

Ejemplo 5

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
diestearato de poligliceril-3-metil-glucosa	3,00	3,00
estearato de sorbita	1,00	1,00
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	2,00	2,00
éster de etilhexilo de ácidos grasos de coco	5,00	5,00
octametiltetrasiloxano (ciclometicona)	5,00	5,00
polideceno	1,00	1,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,00
tocoferol	0,10	0,10
EDTA	0,20	0,20
éster de alquil del ácido para-hidroxibenzoico (parabeno)	0,40	0,40
metilpropanodiol	3,00	3,00
etanol desnaturalizado	2,00	2,00
goma xantano	0,2	0,2
Carbomer	0,1	0,1
glicerina	5,00	5,00
cargas de relleno/aditivos (fosfato de dialmidón, talco)	2,00	2,00
perfume	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 6: emulsión de aceite en agua (O/W)

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
citrato-estearato de glicerilo	1,50	1,50
alcohol cetil-estearílico	1,00	1,00
triglicérido caprílico/cáprico	1,00	1,00
carbonato de dicaprililo	2,00	2,00
dimetilpolisiloxano cíclico (dimeticona)	4,00	4,00
Carbopol	0,15	0,15
copolímero de ácido acrílico/metacrilato de alquilo C10-30	0,25	0,25
dimeticona	0,75	0,75
aceite de jojoba	1,00	1,00
acetato de tocoferilo	0,75	0,75
glicerina	10,00	10,00
etanol	1,00	1,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,50	--
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,75
cargas de rellenos/ aditivos (fosfato de dialmidón, BHT, talco, almidón-octenilsuccinato de aluminio, ciclodextrina)	1,00	1,00
perfume	cantidad suf.	cantidad suficiente
conservantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100
se ajusta el pH a 6,0		

Ejemplo 7: emulsión de aceite en agua (O/W)

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
citrato-estearato de glicerilo	3,00	3,00
alcohol estearílico	1,00	1,00
triglicérido caprílico/cáprico	1,00	1,00
octildodecanol	1,00	1,00
éter de dicaprililo	1,00	1,00

bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,50
clorhidrato de aluminio	3,00	3,00
Carbomer	0,15	0,15
glicerina	3,00	3,00
perfume, conservantes, colorantes, antioxidantes, etc.	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100
se ajusta el pH a 5,5		

Ejemplo 8: Emulsión O/W

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
citrato-estearato de glicerilo	3,00	3,00
alcohol cetil-estearílico	1,00	1,00
ciclometicona	4,00	4,00
octildodecanol	1,00	1,00
dimeticona	1,00	1,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,00
alantoína	0,10	0,10
citrato sódico	0,10	0,10
etanol desnaturalizado	3,00	3,00
clorhidrato de aluminio y circonio	3,00	3,00
copolímero de acriloldimetiltaurato amónico/VP	0,30	0,30
glicerina	10,00	10,00
aditivos (fosfato de dialmidón, SiO ₂ , talco)	0,1	0,1
perfume, conservantes, antioxidantes, etc.	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100
se ajusta el pH a 5,5		

Ejemplo 9: Emulsión O/W

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)	III
	% en peso		
citrato-estearato de glicerilo	2,00	2,00	2,00
alcohol cetílico	1,00	1,00	1,00
ciclometicona	3,00	3,00	3,00
aceite de jojoba	0,30	0,30	0,30
parafina líquida	1,00	1,00	1,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,00	--	--
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,75	--
bromuro 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,75
quitosano	0,50	0,50	0,50
glicerina	3,00	3,00	3,00
serina	0,10	0,10	0,10
acetato de tocoferol	1,00	1,00	1,00
goma xantano	0,10	0,10	0,10
perfume, conservantes, colorantes, antioxidantes, etc.	c. suf.	cantidad suficiente	c. suf.
agua, completar hasta	100	100	100
se ajusta el pH a 6,0			

ES 2 400 922 T3

Ejemplo 10: Microemulsión transparente para aplicar con bola (roll-on)

	I	II (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso	
monoisoestearato de glicerina	1,00	1,00
isoesteariléter de poli(óxido de etileno)(20)	3,00	3,00
carbonato de di-n-octilo	3,00	3,00
2-octildodecanol	2,00	2,00
glicerina	3,00	3,00
aceite de jojoba	0,10	0,10
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,00
éter de 2-etilhexilo y glicerina	0,50	0,50
quitosano	0,50	0,50
perfume, antioxidantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, hasta completar	100	100

Ejemplo 11: Microemulsión traslúcida para aplicar con atomizador

	I	II (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso	
cetilesteariléter de poli(óxido de etileno) (20)	2,00	2,00
cetilesteariléter de poli(óxido de etileno) (12)	1,00	1,00
estearato de glicerina	2,50	2,50
alcohol cetilestearílico	0,50	0,50
palmitato de cetilo	0,50	0,50
ácido caprílico/cáprico	4,00	4,00
éter de di-n-octilo	8,00	8,00
glicerina	3,00	3,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,30	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,30
pentanodiol	2,50	2,50
perfume, antioxidantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 12: Macroemulsión para aplicar con bola (roll-on)

	I	II (no es de la invención)	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
esteariléter de polietilenglicol(21)	3,00	3,00	3,00
esteariléter de polietilenglicol(2)	2,00	2,00	2,00
esteariléter de polipropilenglicol(15)	2,00	2,00	2,00
EDTA	0,10	0,10	0,10
aceite de aguacate	0,10	0,10	0,10
perfume, antioxidantes	c. suf.	cantidad sufic.	cantidad sufic.
éter de 2-etilhexilo y glicerina (octoxiglicerina)	0,50	0,50	0,50
hexanodiol	3,00	3,00	3,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,50	--
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,50
clorhidrato de aluminio	3,00	3,00	3,00
agua, completar hasta	100	100	100

ES 2 400 922 T3

Ejemplo 13: Macroemulsión - crema

	I	II	III (no es de la invención)	IV (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso			
monoestearato de glicerina	5,00	5,00	5,00	5,00
monoestearato de polietilenglicol(2000)	2,00	2,00	2,00	2,00
alcohol estearílico	3,00	3,00	3,00	3,00
ciclometicona	4,00	4,00	4,00	4,00
aceite de parafina	6,00	6,00	6,00	6,00
EDTA	0,20	0,20	0,20	0,20
quitosano	0,50	0,50	0,50	0,50
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,80	0,75	--	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,80	--
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)-oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	--	0,80
2-metilpropanodiol	3,00	3,00	3,00	3,00
éter de 2-etilhexilo y glicerina	0,50	0,50	0,50	0,50
antimicótico (clotrimazol o terbenafina)	--	0,005	--	--
perfume, antioxidantes	c. suf.	c. suf.	cantidad suf.	cantidad suf.
agua, completar hasta	100	100	100	100

Ejemplo 14: Solución alcohólica para aplicar con bola (roll-on)

	I	II (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso	
alcohol desnat.	25,00	25,00
hidroxietilcelulosa	0,50	0,50
polietilenglicol 400	5,00	5,00
aceite de ricino hidrogenado-polietilenglicol (2000)	4,00	4,00
aceite de macadamia	0,20	0,20
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,30	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,30
pentanodiol	5,00	5,00
éter de 2-etilhexilo y glicerina	0,50	0,50
perfume, antioxidantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 15: Pulverizador de aerosol de tipo A

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
2-octildodecanol	0,50	0,50	0,50
1,2-propilenglicol	1,00	1,00	1,00
ácido butiloctanoico	0,25	0,25	0,25
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	0,50	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,50
antimicótico (clotrimazol o terbenafina)	--	0,005	--
perfume	cant. suf.	cant. suf.	cantidad suficiente
etanol, completar hasta	100	100	100

Se prepara la fase líquida mezclando entre sí los ingredientes en cuestión, se vierte en el envase de aerosol con una mezcla de propano-butano (2,7) en una proporción de 29:61.

ES 2 400 922 T3

Ejemplo 16: Pulverizador de aerosol de tipo B

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
clorhidrato de aluminio	45,00	25,00	25,00
palmitato de isopropilo	25,00	30,00	30,00
ciclometicona	--	0,30	0,30
isoparafina, completar hasta	100,00	100,00	100,00
talco	-	10,00	10,00
ácido 2-hexildecanoico	0,25	0,30	0,25
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	0,20	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,25	--	0,20
perfume	cant. suf.	cant. suf.	cantidad suficiente

Se prepara la fase líquida mezclando entre sí los ingredientes en cuestión, se vierte en el envase de aerosol con una mezcla de propano-butano (2,7) en una proporción de 17:83.

Ejemplo 17: Emulsión O/W

	I	II (no es de la invención)	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
estearato-citrato de glicerilo	2,00	2,00	2,00
alcohol cetilestearílico	2,00	2,00	2,00
ciclometicona	3,00	3,00	3,00
triglicéridos de ácidos caprílico/cáprico	4,00	4,00	4,00
octildodecanol	1,00	1,00	1,00
dimeticona	2,00	2,00	2,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,50	--
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,50
citrato sódico	0,10	0,10	0,10
etanol desnaturalizado	3,00	3,00	3,00
copolímero de acriloldimetiltaurato amónico/VP	0,30	0,30	0,30
glicerina	3,00	3,00	3,00
cargas de rellenos (fosfato de dialmidón, talco)	0,10	0,10	0,10
perfume, cargas de rellenos	cant. suf.	cantidad suf.	cantidad suf.
agua, completar hasta	100	100	100

Ejemplo 18: Emulsión O/W

	I	II (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso	
estearato de PEG-40	2,00	2,00
estearato de glicerilo	2,00	2,00
alcohol estearílico	0,50	0,50
alcohol cetílico	2,00	2,00
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	2,00	2,00
triglicéridos de ácidos caprílico/cáprico	1,00	1,00
ciclometicona	3,00	3,00
carbonato de dicaprililo	2,00	2,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,75	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,75
tartrato sódico	0,10	0,10
fenoxietanol	0,40	0,40
diazolidinil-urea	0,20	0,20

etanol desnaturalizado	8,00	8,00
copolímero de acriloldimetiltaurato amónico/VP	0,80	0,80
glicerina	5,00	5,00
cargas de rellenos, (fosfato de dialmidón, BHT, talco)	0,10	0,10
perfume, colorantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 19: Microemulsión

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención) % en peso
lecitina	1,00	1,00
Oleth-15	5,00	5,00
fenoxietanol	0,50	0,50
hexamidinilurea	0,10	0,10
carbamato de yodopropinilbutilo	0,25	0,25
polímero cruzado de acrilatos/acrilato de alquilo C ₁₀₋₃₀	0,30	0,30
Poliuretano-4 (Avalure UR-445)	0,50	0,50
copolímero AMPS hidrofobizado	0,20	0,20
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,00
clorhidrato de aluminio	--	--
glicerina	6,00	6,00
perfume	cantidad suf.	cantidad suficiente
cargas de rellenos, (fosfato de dialmidón, SiO ₂ , talco, estearato de aluminio)	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 20: Microemulsión

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención) % en peso
lecitina	1,00	1,00
Oleth-15	5,00	5,00
fenoxietanol	0,50	0,50
hexamidinilurea	0,10	0,10
carbamato de yodopropinilbutilo	0,25	0,25
polímero cruzado de acrilatos/acrilato de alquilo C ₁₀₋₃₀	0,30	0,30
Poliuretano-4 (Avalure UR-445)	0,50	0,50
copolímero AMPS hidrofobizado	0,20	0,20
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,00
glicerina	6,00	6,00
perfume	cantidad suf.	cantidad suficiente
cargas de rellenos, (fosfato de dialmidón, SiO ₂ , talco, estearato de aluminio)	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 21: Microemulsión transparente para aplicar con bola (roll-on)

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención) % en peso
monoisoestearato de glicerina	1,00	1,00
isoesteariléter de polioxietileno(20)	2,00	2,00
carbonato de di-n-octilo	3,00	3,00
2-octildodecanol	1,00	1,00
pantenol	1,00	1,00
aceite de jojoba	0,10	0,10

ES 2 400 922 T3

hidroxiethylcelulosa modificada hidrófoba	0,20	0,20
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,50
2-fenoxietanol	0,50	0,50
perfume, antioxidantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 22: Microemulsión traslúcida para atomizador

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
cetilestearyléter de poli(óxido de etileno) (20)	2,00	2,00
cetilestearyléter de poli(óxido de etileno) (12)	1,00	1,00
estearato de glicerina	2,00	2,00
alcohol cetilestearílico	0,50	0,50
palmitato de cetilo	0,50	0,50
ésteres de ácidos caprílico/cáprico	3,00	3,00
éter de di-n-octilo	7,00	7,00
glicerina	3,00	3,00
carragenano	0,2	0,2
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,50
2-fenoxietanol	0,50	0,50
perfume, antioxidantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 23: Macroemulsión para aplicar con bola (roll-on)

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)	III (no es de la invención)
	% en peso		
esteariléter de polietilenglicol(21)	3,00	3,00	3,00
esteariléter de polietilenglicol(2)	2,00	2,00	2,00
esteariléter de polipropilenglicol(15)	2,00	2,00	2,00
EDTA	0,1	0,1	0,1
taurato de acriloldimetilo	0,4	0,4	0,4
aceite de macadamia	0,10	0,10	0,10
perfume, antioxidantes	cant. suf.	cantidad suf.	cantidad suf.
2-fenoxietanol	0,5	0,5	0,5
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,50	--	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,00	--
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	1,00
agua, completar hasta	100	100	100

Ejemplo 24: Atomizador de bomba

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
etanol	55,00	55,00
aceite de ricino hidrogenado-PEG-40	2,00	2,00
glicerina	1,00	1,00
ácido 2-butiloctanoico	0,20	0,20
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-	--	0,50

ES 2 400 922 T3

dimetil-piperidinio		
perfume	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100,00	100,00

Ejemplo 25: Gel para aplicar con bola (roll-on)

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
etanol	50,00	50,00	50,00
aceite de ricino hidrogenado-PEG-40	2,00	2,00	2,00
hidroxiethylcelulosa	0,50	0,50	0,50
ácido 2-butiloctanoico	0,20	0,30	0,30
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,10	0,20	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,20
clorhidrato de aluminio	--	10,00	10,00
perfume	cant. suf.	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100	100

Ejemplo 26: Emulsión para aplicar con bola (roll-on)

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
clorhidrato de aluminio	--	10,00	10,00
esteariléter de polipropilenglicol(15)	5,00	5,00	5,00
esteariléter de polietilenglicol(100)	1,00	1,00	1,00
esteariléter de polietilenglicol(2)	4,00	4,00	4,00
ácido 2-hexildecanoico	0,20	0,30	0,30
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,00	3,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	3,00
perfume, conservantes	cant. suf.	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100,00	100,00	100,00

Ejemplo 27: Barra desodorante de tipo A

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
estearato sódico	7,00	7,00	7,00
1,2-propilenglicol	48,00	48,00	48,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,20	0,30	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,30
ácido 2-butiloctanoico	--	0,10	0,10
ácido 2-hexildecanoico	0,20	--	--
perfume, conservantes	cant. suf.	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100	100

Ejemplo 28: Barra desodorante de tipo B

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
estearato sódico	8,00	8,00	8,00
1,2-propilenglicol	45,00	45,00	45,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,20	0,30	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,30
ácido 2-butiloctanoico	--	0,50	0,50

ES 2 400 922 T3

ácido 2-hexildecanoico	0,50	--	--
ceteariléter de polietilenglicol(25)	3,00	3,00	3,00
etanol	20,00	20,00	20,00
perfume, conservantes	cant. suf.	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100	100

Ejemplo 29: Pulverizador de aerosol

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,6	0,5	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,50
lactato de quitosano	0,50	0,30	--
ciclometicona	8,50	--	12,80
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	3,00	5,00	--
carbonato de dicaprililo	--	2,00	--
isohexadecano	--	9,10	--
polidimetilsiloxano	0,90	1,00	2,00
Disteardimonium hectorite	0,60	--	0,40
dióxido de silicio	--	1,10	0,30
talco	--	--	3,00
perfume	0,90	1,00	1,00
mezcla de gases propelentes	85,00	80,00	80,00
total	100,00	100,00	100,00

Ejemplo 30: Barra (stick)

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,5	1,0	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,5
clorhidrato de quitosano	0,5	0,5	--
ciclometicona	51,0	45,0	45,2
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	--	15,0	10,0
butiléter de PPG-14	15,0	5,0	--
polidimetilsiloxano	--	--	10,0
Disteardimonio hectorite	1,0	--	1,0
dióxido de silicio	--	1,0	0,8
alcohol estearílico	20,0	20,0	18,0
aceite de ricino hidrogenado	1,0	1,5	1,5
talco	10,0	10,0	12,0
perfume	1,0	1,0	1,0
total	100,0	100,0	100,0

Ejemplo 31: Desodorante de rodillo (roller)

	I	II	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,5	1,0	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	1,0
acetato de quitosano	0,3	0,4	0,4
ciclometicona	82,2	76,0	76,0
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	2,0	5,0	5,0
poliisobuteno	0,5	2,0	2,0
isohexadecano	10,0	5,0	5,0
Quaternium-90 bentonite	2,5	2,8	2,8

ES 2 400 922 T3

aceite mineral	--	5,0	5,0
carbonato de propileno	0,5	0,8	0,8
agua	0,5	1,0	1,0
perfume	1,0	1,0	1,0
total	100,0	100,0	100,0

Ejemplo 32: Microemulsión transparente aplicable con bola (roll-on)

	I	II (no es de la invención)	III (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso		
monoisoestearato de glicerina	2,00	2,00	2,00
isoesteariléter de polioxietileno(20)	4,00	4,00	4,00
carbonato de di-n-octilo	2,00	2,00	2,00
2-octildodecanol	2,00	2,00	2,00
glicerina	3,00	3,00	3,00
aceite de aguacate	0,10	0,10	0,10
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,05	--	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,05	--
bromuro de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	0,05
quitosano	0,50	0,50	0,50
ácido láctico	0,13	0,13	0,13
perfume, antioxidantes	cant. suf.	cantidad suf.	cantidad suf.
agua, completar hasta	100	100	100

Ejemplo 33: Microemulsión traslúcida para atomizador

	I	II (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso	
cetilesteariléter de poli(óxido de etileno) (20)	3,00	3,00
cetilesteariléter de poli(óxido de etileno) (12)	0,50	0,50
estearato de glicerina	3,00	3,00
alcohol cetil-estearílico	0,50	0,50
palmitato de cetilo	0,50	0,50
ésteres de ácido caprílico/cáprico	5,00	5,00
éter de di-n-octilo	5,00	5,00
glicerina	4,00	4,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,15	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,15
lactato de quitosano	0,30	0,30
perfume, antioxidantes	cantidad suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 34: Macroemulsión para aplicar con bola (roll-on)

	I	II (no es de la invención)
Materias primas (INCI)	% en peso	
esteariléter de polietilenglicol(21)	2,00	2,00
esteariléter de polietilenglicol(2)	2,50	2,50
esteariléter de polipropilenglicol(15)	3,00	3,00
sal trisódica del ácido etilendiaminatetraacético (solución acuosa al 20%)	1,50	1,50
aceite de aguacate	0,10	0,10
perfume, antioxidantes	cant. suf.	cantidad suficiente
ácido láctico	0,1	0,1
quitosano	0,5	0,5
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-	0,25	--

ES 2 400 922 T3

dimetil-piperidinio		
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,25
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 35: Solución alcohólica para aplicar con bola (roll-on)

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención) % en peso
alcohol desnat.	20,00	20,00
hidroxietilcelulosa	0,40	0,40
polietilenglicol 400	3,00	3,00
aceite de ricino hidrogenado-polietilenglicol (2000)	2,00	2,00
aceite de aguacate	0,50	0,50
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,05	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,05
clorhidrato de quitosano	0,2	0,2
perfume, antioxidantes	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 36: Gel crema O/W

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención) % en peso
citrato-estearato de glicerilo	1,25	1,25
alcohol cetilestearílico	0,75	0,75
triglicérido caprílico/cáprico	1,00	1,00
carbonato de dicaprilo	2,00	2,00
dimetilpolisiloxano cíclico (dimeticona)	4,00	4,00
Carbopol	0,15	0,15
copolímero de ácido acrílico/metacrilato de alquilo C10-30	0,25	0,25
dimeticona	0,75	0,75
aceite de jojoba	1,00	1,00
miristato de miristilo	1,00	1,00
acetato de tocoferilo	0,75	0,75
glicerina	10,00	10,00
etanol	1,00	1,00
lactato de quitosano	0,80	0,80
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,50	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,50
perfume	cant. suf.	cantidad suficiente
conservantes	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100
se ajusta el pH a 5,0		

Ejemplo 37: Emulsión O/W

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención) % en peso
citrato-estearato de glicerilo	3,00	3,00
alcohol estearílico	1,00	1,00
triglicérido caprílico/cáprico	1,00	1,00
octildodecanol	1,00	1,00
éter de dicaprilo	1,00	1,00
ácido láctico	0,08	0,08
quitosano	0,30	0,30
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--

ES 2 400 922 T3

bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,50
Carbomer	0,15	0,15
glicerina	3,00	3,00
perfume, conservantes, colorantes, antioxidantes, etc.	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100
se ajusta el pH a 5,5		

Ejemplo 38: Emulsión O/W

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
diestearato de poligliceril-3-metil-glucosa	3,00	3,00
alcohol estearílico	3,00	3,00
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	3,00	3,00
dicaprilato/dicaprato de butilenglicol	2,00	2,00
triglicéridos de ácidos caprílico/cáprico	3,00	3,00
polideceno hidrogenado	2,00	2,00
dimetilpolisiloxano (dimeticona)	1,00	1,00
ácido láctico	0,25	0,25
quitosano	1,00	1,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	2,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	2,00
ascorbil-fosfato sódico	0,10	0,10
fenoxietanol	0,40	0,40
carbamato de yodopropinilbutilo	0,05	0,05
p-hidroxibenzoato de alquilo (parabeno)	0,20	0,20
goma xantano	0,10	0,10
Carbomer	0,10	0,10
butilenglicol	2,00	2,00
aditivos (talco, BHT)	0,50	0,50
perfume	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 39: Emulsión O/W

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
estearato de PEG-40	2,00	2,00
estearato de glicerilo	2,00	2,00
alcohol estearílico	0,50	0,50
alcohol cetílico	2,00	2,00
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	2,00	2,00
triglicéridos de ácidos caprílico/cáprico	1,00	1,00
ciclometicona	3,00	3,00
carbonato de dicaprililo	2,00	2,00
ácido láctico	0,25	0,25
quitosano	1,00	1,00
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,75	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,75
tartrato sódico	0,10	0,10
fenoxietanol	0,40	0,40
diazolidinil-urea	0,20	0,20
etanol desnaturalizado	8,00	8,00
copolímero de acriloldimetiltaurato amónico/VP	0,80	0,80
glicerina	5,00	5,00
cargas de rellenos (fosfato de dialmidón, SiO ₂ , talco, estearato de aluminio)	0,10	0,10

ES 2 400 922 T3

perfume, colorantes	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 40: Microemulsión

Materias primas (INCI)	I	II (no es de la invención)
	% en peso	
lecitina	1,00	1,00
Oleth-15	5,00	5,00
fenoxietanol	0,50	0,50
hexamidinilurea	0,10	0,10
butilcarbamato de yodopropinilo	0,25	0,25
goma xantano	0,10	0,10
Poliuretano-4 (Avalure UR-445)	0,50	0,50
copolímero AMPS hidrófobo	0,20	0,20
quitosano	0,30	0,30
ácido láctico	0,08	0,08
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	1,00	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	1,00
glicerina	6,00	6,00
perfume	cant. suf.	cantidad suficiente
cargas de rellenos (fosfato de dialmidón, SiO ₂ , talco, estearato de aluminio)	cant. suf.	cantidad suficiente
agua, completar hasta	100	100

Ejemplo 41: Pulverizador de aerosol

Materias primas (INCI)	I (no es de la invención)	II	III
	% en peso		
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	0,5	0,5
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,50	--	--
cicloteticona	9,0	--	12,8
benzoato de alquilo C ₁₂ -C ₁₅	3,0	5,0	--
carbonato de dicaprililo	--	2,0	--
isohexadecano	--	9,4	--
polidimetilsiloxano	0,9	1,0	2,0
Disteardimonium hectorite	0,6	--	0,4
dióxido de silicio	--	1,1	0,3
talco	--	--	3,0
perfume	0,9	1,0	1,0
mezcla de gases propelentes	85,0	80,0	80,0
total	100,0	100,0	100,0

Ejemplo 42: Barras (sticks)

Materias primas (INCI)	I	II	III
	% en peso		
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,5	1,0	0,5
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenil-acetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,5	1,0	-
cicloteticona	51,5	45,5	45,5
benzoato de alquilo C ₁₂ -C ₁₅	--	15,0	10,0
butiléter de PPG-14	15,0	5,0	--
polidimetilsiloxano	--	--	10,0
Disteardimonium hectorite	1,0	--	1,0
dióxido de silicio	--	1,0	0,5
alcohol estearílico	20,0	20,0	18,0

ES 2 400 922 T3

aceite de ricino hidrogenado	1,0	1,5	1,5
talco	10,0	10,0	12,0
perfume	1,0	1,0	1,0
total	100,0	100,0	100,0

Ejemplo 43: Desodorante de rodillo (roller)

Materias primas (INCI)	I	II	III (no es de la invención)
	% en peso		
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,5	1,0	--
bromuro de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	--	--	1,0
ciclometicona	82,5	76,4	76,4
benzoato de alquilo C ₁₂₋₁₅	2,0	5,0	5,0
poliisobuteno	0,5	2,0	2,0
isohexadecano	10,0	5,0	5,0
Quaternium-90 bentonite	2,5	2,8	2,8
aceite mineral	--	5,0	5,0
carbonato de propileno	0,5	0,8	0,8
agua	0,5	1,0	1,0
perfume	1,0	1,0	1,0
total	100,0	100,0	100,0

Ejemplo 44: Geles limpiadores de la piel

Materias primas (INCI)	I	II	III	IV	V
	% en peso				
Sodium laureth sulfate	13,2	11	9,5	11	9,5
cocamidopropil-betaina	1,65	3,3	3,8	3,3	3,8
gliceril-cocoato de PEG-7	--	--	--	2,0	2,0
Laureth-2	--	--	--	0,1	--
gliceril-isoestearato de PEG-90	--	--	--	0,3	--
cocoil-glutamato sódico	1,25	0,75	2,5	0,75	0,75
aceite de ricino hidrogenado-PEG-40	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50
gliceril-palmitato hidrogenado-PEG-100	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50
bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio	0,025	0,025	0,05	0,02	0,1
Polyquaternium-10	0,2	--	0,20	--	--
benzoato sódico	0,45	0,45	0,45	0,45	0,45
salicilato sódico	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
ácido cítrico	0,50	0,50	0,5	0,50	0,50
perfume	c. suf.	c. suf.	c. suf.	c. suf.	c. suf.
agua, completar hasta	100	100	100	100	100

5 Ejemplo 45

Para comprobar la actividad antitranspirante de los compuestos de la presente invención, se compara el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio [Gpip] con el glicopirrolato, el 2-ciclopentil-2-hidroxi-2-fenilacetato de (1,1-dimetil-2,3,4,5-tetrahidropirrol-3-ilo) [GP] y el clorhidrato de aluminio [ACH]. Se toma el agua como patrón. De modo específico, cada uno de los anteriores compuestos ensayados se aplica al antebrazo de las personas en tres días sucesivos, durante cuatro horas cada uno. El 3er día, unas 6 horas después de la aplicación, las personas sometidas al ensayo entraron en una sauna y se toman sus huellas sobre silicona. Cada gota de sudor marca una huella en la composición de silicona y se analiza el número de huellas mediante un analizador de fotografía. Las áreas tratadas se normalizan automáticamente con respecto a una zona no tratada. Los resultados se expresan en forma de % residual de actividad de la glándula sudorípara y se representan gráficamente en la figura 1.

En la figura 2 se representan los resultados de un estudio "in vitro" basado en un ensayo de activación de receptor. Se emplea como control la estimulación de las células sin incubación previa con un compuesto de piperidinio.

20 Los resultados representados en las figuras 1 y 2 indican que el compuesto de piperidinio de la presente invención despliega una gran actividad antitranspirante, que es significativamente mayor que la de un antitranspirante estándar, por ejemplo el clorhidrato de aluminio, y todavía notablemente mayor que la del glicopirrolato, que difiere del

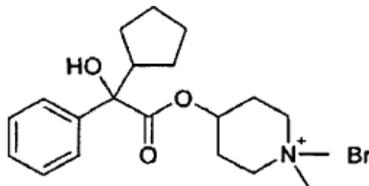
compuesto de la presente invención esencialmente solo por la presencia de un anillo pirrolidinio (de 5 eslabones) en lugar de un anillo piperidinio (de 6 eslabones) en su estructura molecular.

5 La presente solicitud reivindica la prioridad de la solicitud de patente US -11/449,720, depositada con fecha 9 de junio de 2006.

REIVINDICACIONES

1. Una composición cosmética o dermatológica que contiene por lo menos el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio de la fórmula

5



y un vehículo cosmética o dermatológicamente aceptable.

2. La composición de la reivindicación 1, en la que está presente por lo menos el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio en una concentración comprendida entre aprox. el 0,001 % y el 15 % en peso, porcentaje referido al peso total de la composición.

3. La composición de la reivindicación 2, en la que está presente por lo menos el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio en una concentración comprendida entre aprox. el 0,05 % y el 10 % en peso, porcentaje referido al peso total de la composición.

4. La composición de la reivindicación 3, en la que está presente por lo menos el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)oxi]-1,1-dimetil-piperidinio en una concentración comprendida entre aprox. el 0,1 % y el 5 % en peso, porcentaje referido al peso total de la composición.

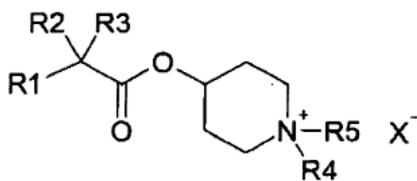
5. La composición de la reivindicación 1, dicha composición se presenta en forma de crema, loción, ungüento, tintura, aceite para la piel, leche, bálsamo, venda impregnada, paño impregnado, material textil impregnado, almohadilla impregnada, pulverizador, aerosol, formulación aplicable con bola (roll-on), barra (stick), sólido blando, polvo o pulverizador de polvo.

6. La composición de la reivindicación 1, dicha composición se presenta en una forma que es apropiada para el uso como antitranspirante.

7. La composición de la reivindicación 1, dicha composición contiene además por lo menos una sustancia desodorante.

8. La composición de la reivindicación 1, dicha composición está sustancialmente libre de sustancias activas anti-transpirante diferentes de la sal de la fórmula:

35



(I)

en la que:

9. La composición de la reivindicación 8, dicha composición está sustancialmente libre de compuestos de aluminio.

10. La composición de la reivindicación 1, dicha composición contiene también por lo menos un compuesto de aluminio activo como antitranspirante.

R₄ y R₅ significan con independencia H o alquilo C₁-C₆;
 R₁ y R₃ significan con independencia cicloalquilo C₃-C₈ opcionalmente sustituido, fenilo opcionalmente sustituido o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido;
 R₂ significa H, OH u OR, y R significa o alquilo C₁-C₇; y
 X⁻ significa un anión cosmética o dermatológicamente aceptable.

9. La composición de la reivindicación 8, dicha composición está sustancialmente libre de compuestos de aluminio.

10. La composición de la reivindicación 1, dicha composición contiene también por lo menos un compuesto de aluminio activo como antitranspirante.

- 5 11. La composición de la reivindicación 10, en la que por lo menos un compuesto de aluminio activo como antitranspirante está presente en una concentración comprendida entre aprox. el 0,1 y el 30 en peso, porcentaje referido al peso total de la composición.
12. La composición de la reivindicación 11, dicha composición contiene por lo menos un clorhidrato de aluminio opcionalmente activado, cloruro de aluminio o un compuesto de aluminio y circonio.
- 10 13. La composición de la reivindicación 1, dicha composición está presente en forma de jabón líquido o de pastilla de jabón, tintura desodorante, producto desodorante para la higiene femenina, champú desodorante, preparación desodorante para baño o ducha, polvo desodorante o pulverizador de polvo desodorante.
- 15 14. La composición de la reivindicación 1, dicha composición está presente en combinación con un envase de aerosol, una botella estrujable, un dispositivo de tipo bomba o un aplicador de bola (roll-on).
- 20 15. Un método no terapéutico para reducir o inhibir la transpiración, dicho método consiste en aplicar a la piel una cantidad eficaz en sentido antitranspirante de la composición de la reivindicación 1.
16. Un método para fabricar una composición dermatológica de la reivindicación 1 para reducir o inhibir la transpiración, dicha composición se aplica a la piel en una cantidad eficaz en sentido antitranspirante.

Figura 1

actividad residual glándula sudorípara [%]

Estudio de huellas (in vivo)

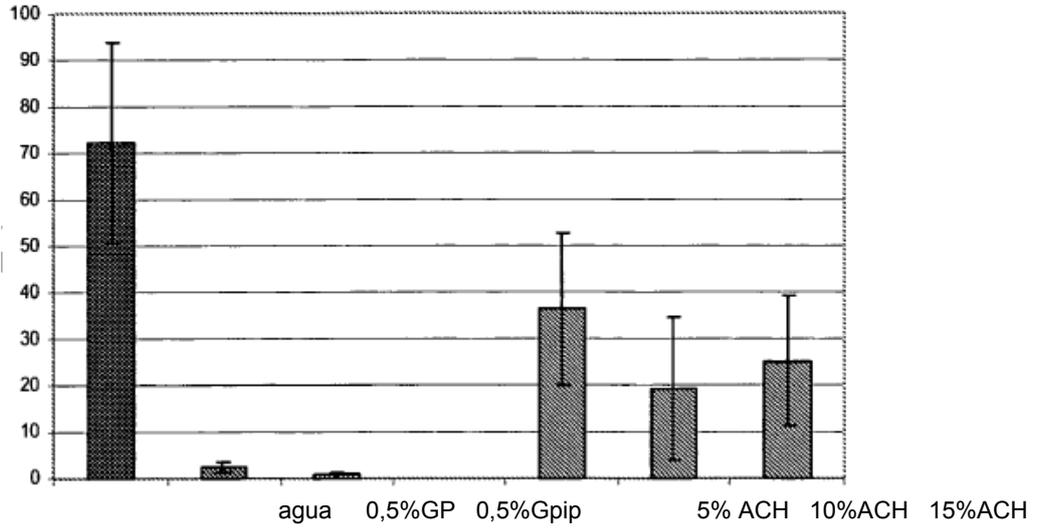


FIG. 2

