

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 443 967**

51 Int. Cl.:

<b>A61K 8/41</b>	(2006.01)	<b>A61Q 15/00</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/49</b>	(2006.01)	<b>A61Q 17/04</b>	(2006.01)
<b>A61Q 19/00</b>	(2006.01)	<b>C07C 213/10</b>	(2006.01)
<b>A61K 8/60</b>	(2006.01)	<b>A61Q 19/10</b>	(2006.01)
<b>A61Q 17/00</b>	(2006.01)	<b>C07C 215/10</b>	(2006.01)
<b>C11D 1/62</b>	(2006.01)		
<b>C11D 7/32</b>	(2006.01)		
<b>A61Q 1/02</b>	(2006.01)		
<b>A61Q 5/02</b>	(2006.01)		
<b>A61Q 5/12</b>	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.09.2010 E 10751925 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **11.12.2013 EP 2477596**

54 Título: **Compuestos de amonio catiónicos estabilizados con un formador de quelato y composiciones que los contienen**

30 Prioridad:  
**15.09.2009 US 559850**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**21.02.2014**

73 Titular/es:  
**UNILEVER NV (100.0%)  
Weena 455  
3013 AL Rotterdam, NL**

72 Inventor/es:  
**AU, VAN y  
MADISON, STEPHEN ALAN**

74 Agente/Representante:  
**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 443 967 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**

Compuestos de amonio catiónicos estabilizados con un formador de quelato y composiciones que los contienen

**Campo de la invención**

5 La presente invención está dirigida a compuestos de amonio catiónicos estabilizados. Más en particular, la invención está dirigida a compuestos de amonio catiónicos estabilizados con un formador de quelato basado en piridina, un formador de quelato basado en heteroceto o ambos, compuestos que no presentan desalquilación en, por ejemplo, un medio acuoso. Tales formadores de quelato son adecuados para uso en composiciones que, por ejemplo, se aplican tópicamente y para intensificar un beneficio para la piel.

**Antecedentes de la invención**

10 La piel seca es un problema de grado variable para la mayoría de consumidores. Esta afección es particularmente evidente en invierno. A la vista de este problema, normalmente se formulan productos para el cuidado personal tales como cremas para la piel, lociones, barras de jabón, geles de ducha y desodorantes con al menos un material para tratar la piel seca. En cierto grado, estos productos coadyuvan a modular síntomas tales como picores, formación de escamas y aspecto dérmico desagradable.

15 Entre las clases tradicionales de materiales usados para cuidar la piel seca y la hidratación de la piel figuran oclusivos tales como vaselina y aceites de silicona, así como agentes queratolíticos tales como alfa-hidroxiácidos. Otros materiales usados tradicionalmente para mejorar las afecciones de piel seca son los humectantes. Los materiales más frecuentemente usados a este fin son las sustancias generalmente clasificadas como sustancias orgánicas hidroxiladas monómeras y polímeras. Quizás la glicerina o glicerol es el humectante más popular empleado en composiciones tópicas.

20 Las nuevas tendencias en la humectación de la piel han conducido al uso de compuestos de amonio cuaternario en formulaciones para la piel. Los compuestos de amonio cuaternario preferidos comprenden un grupo trimetilamonio conocidos generalmente con la nomenclatura de INCI como grupo trimonio. Si bien tales compuestos son preferidos para los beneficios de humectación, tienden a ser inestables cuando, por ejemplo, está presente el agua. Esta inestabilidad da por resultado la generación de un grupo que comprende nitrógeno a partir del compuesto de amonio cuaternario. (esto es, una desalquilación y liberación del grupo trimonio característico) que puede producir un olor desagradable, puede disminuir la eficacia de humectación del compuesto, o ambos. La generación de un grupo que comprende nitrógeno a partir del compuesto de amonio cuaternario puede requerir también perfumes o fragancias más intensas en las composiciones de uso final. Además, tal generación de un grupo que comprende nitrógeno en una composición de uso final requiere almacenar el producto y distribuirlo a temperaturas frías de manera que se pueda prolongar la longevidad del producto.

30 Hay un interés creciente por desarrollar compuestos de amonio catiónicos para todas las aplicaciones y, especialmente, en las que se desea una hidratación. La presente invención, por tanto, está dirigida a compuestos de amonio catiónicos estabilizados. Los compuestos de amonio catiónicos se estabilizan con un formador de quelato basado en piridina, un formador de quelato basado en heteroceto, o ambos e, inesperadamente, se impide la generación de un grupo que comprende nitrógeno en, por ejemplo, un medio acuoso. Tales compuestos estabilizados son adecuados para uso en aplicaciones tópicas, incluidas composiciones permanentes y composiciones eliminables por lavado, e incluso aplicaciones asociadas con del cuidado oral, el cuidado en lavanderías y el cuidado doméstico.

**Información adicional**

35 Se ha dado cuenta de esfuerzos para desarrollar composiciones para el cuidado personal con compuestos de amonio cuaternario. En los documentos U.S. 7.087.560. U.S. 7.176.172 y U.S. 7.282.471 se describen sales de amonio cuaternario.

40 Se ha dado cuenta también de otros esfuerzos para hacer composiciones para del cuidado personal. En el documento U.S. 7.175.836 se describen emulsiones cosméticas.

45 Se ha dado cuenta de otros esfuerzos para composiciones para del cuidado personal. En el documento U.S. 2008/0299054 A1 se describen composiciones para el cuidado personal con una fragancia intensificada.

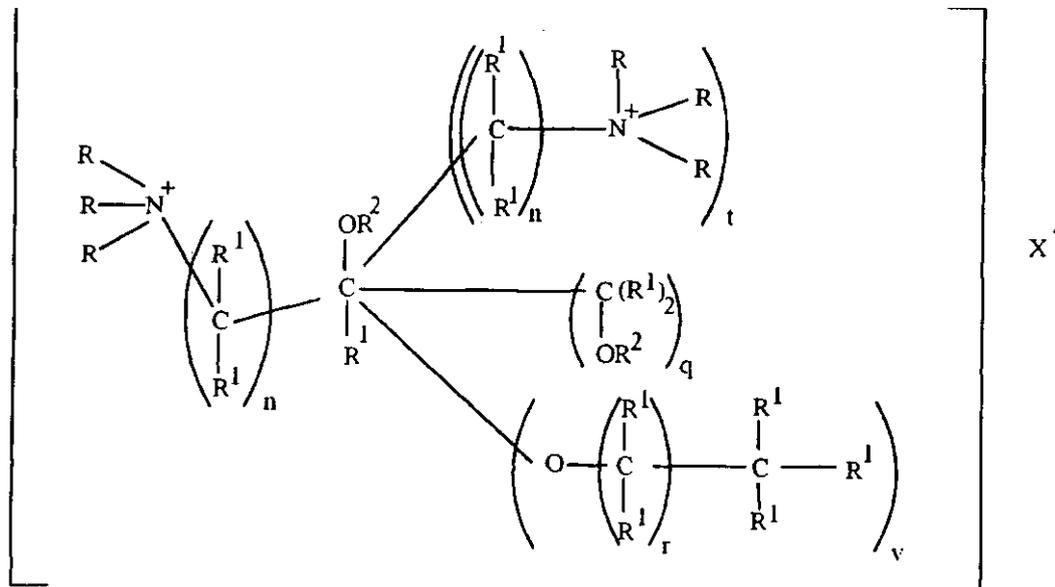
50 Ninguna información adicional citada en lo que antecede describe compuestos de amonio catiónicos adecuados para al menos aplicaciones cosméticas y que han sido estabilizados con un formador de quelato basado en piridina, un formador de quelato basado en heteroceto, o ambos.

**Sumario de la invención**

En un primer aspecto, la presente invención está dirigida a composiciones que comprenden un compuesto de

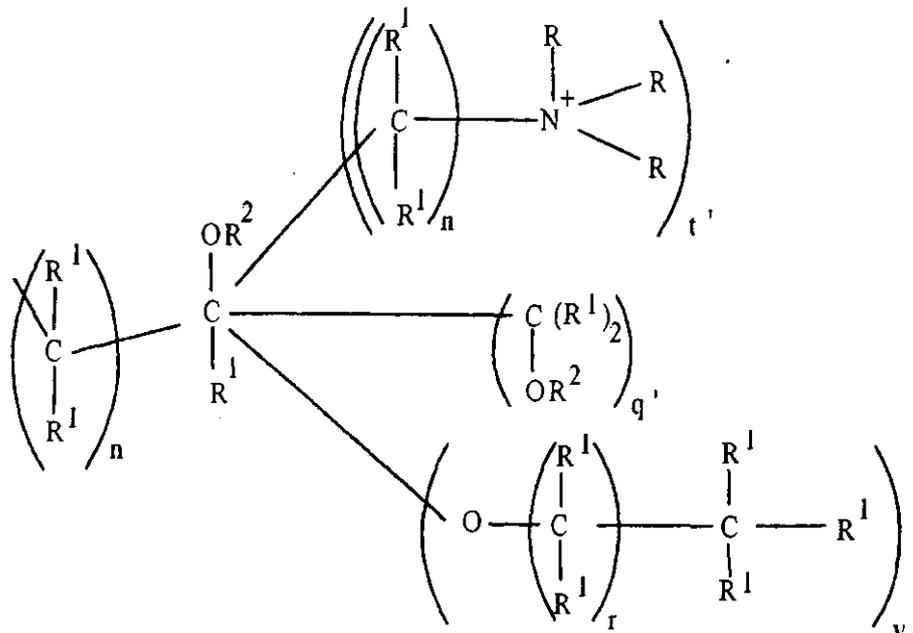
amonio catiónico y un formador de quelato basado en piridina, un formador de quelato basado en heteroceto, o ambos, siendo el formador de quelato uno que impide la generación de un grupo que comprende nitrógeno a partir del compuesto de amonio catiónico en la composición.

Dicho compuesto de amonio catiónico tiene la fórmula:



5

en la que q, t y v son, cada uno independientemente, 0 o 1, con la condición de que la suma de q, t y v sea igual a 1, cada R es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-12</sub>, hidroxialquilo C<sub>1-12</sub> o



10

en la que q', t' y v' son independientemente 0 o 1, con la condición de que la suma de q', t' y v' sea igual a 1, cada R<sup>1</sup> es independientemente un hidrógeno, alquilo C<sub>1-12</sub> o un hidroxialquilo C<sub>1-12</sub>, cada R<sup>2</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-3</sub>, monosacarilo, oligosacarilo o polisacarilo, cada n es independientemente un número entero de 1 a aproximadamente 12, r es un número entero de 0 a aproximadamente 5, X' es un contraión aniónico, estando estabilizado el compuesto de amonio catiónico con un formador de quelato basado en piridina, un formador de quelato basado en un grupo heteroceto, o ambos, siendo el formador de quelato ácido quelidámico.

15

En un segundo aspecto, la presente invención está dirigida a una composición para uso final que comprende la composición con el compuesto da amonio catiónico del primer aspecto de esta invención.

En un tercer aspecto, la presente invención está dirigida a un procedimiento para estabilizar un compuesto de amonio catiónico.

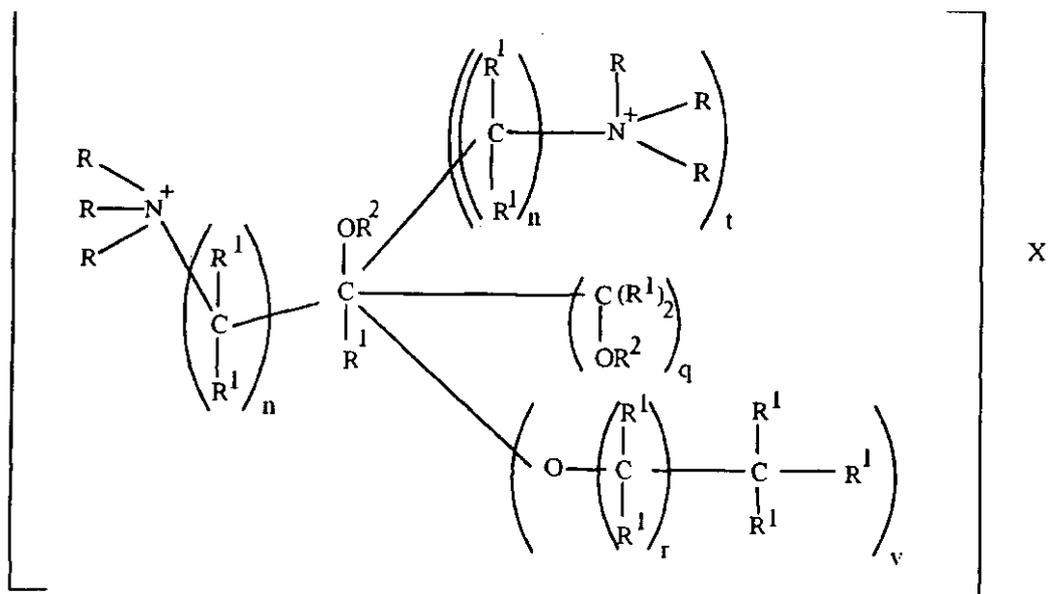
Todos los otros aspectos de la presente invención serán más fácilmente perceptibles al considerar la descripción detallada y los ejemplos siguientes.

- 5 Por composición de uso final se entiende una sustancia aplicada a un cuerpo humano para mejora del aspecto, limpieza, control del olor y/o la estética general. Entre los ejemplos ilustrativos, pero no limitativos, figuran lociones y cremas permanentes para la piel, champúes, acondicionadores para el cabello, geles de ducha, barras de jabón, antitranspirantes, desodorantes, productos dentales, cremas de afeitar, depiladores, barras de labio, bases, mascarillas, bronceadores, y lociones filtros solares. El término composición de uso final incluye también un
- 10 producto asociado con el cuidado oral o el cuidado de lavandería, o el cuidado doméstico, tal como detergente para lavanderías, acondicionador de tejido, o un limpiador potente de superficies. En una realización preferente, sin embargo, la composición de uso final es una composición que se aplica al cuerpo humano y especialmente a la piel. Estabilizado, tal como se usa aquí, significa que impide la generación de un compuesto que comprende nitrógeno, tal como una amina, un compuesto trimonio y/o amoniaco, especialmente en un medio acuoso.
- 15 Que comprende, tal como se usa aquí, significa que está constituido, esencialmente, por, y que está constituido por. Todos los intervalos identificados aquí incluyen todos los intervalos subsumidos en ellos, si, por ejemplo, no se hace referencia explícita a los mismos.

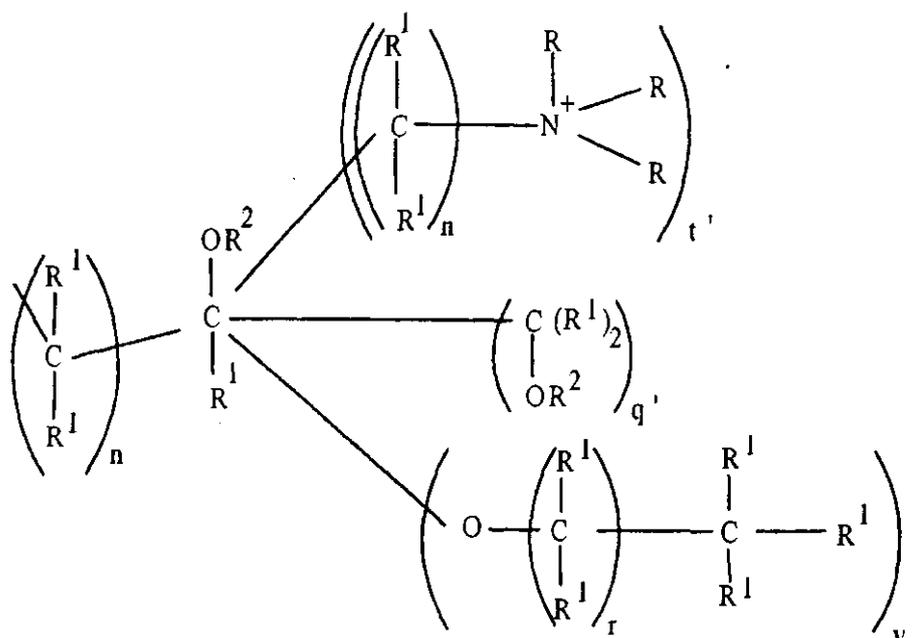
**Descripción detallada de realizaciones preferentes**

20 La única limitación respecto al compuesto de amonio catiónico que se puede emplear en esta invención es que se pueda usar el mismo en un producto para el consumidor y, preferiblemente, un producto tópico para la piel.

Los compuestos de amonio catiónicos que están estabilizados de acuerdo con esta invención tienen la fórmula



en la que q, t y v son, cada uno independientemente, 0 o 1 con la condición de que la suma de q, t y v sea igual a 1, cada R es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-12</sub>, hidroxialquilo C<sub>1-12</sub> o



5 en la que  $q'$ ,  $t'$  y  $v'$  son independientemente 0 o 1, con la condición de que la suma de  $q'$ ,  $t'$  y  $v'$  sea igual a 1, cada  $R^1$  es independientemente un hidrógeno, alquilo  $C_{1-12}$  o un hidroxialquilo  $C_{1-12}$ , cada  $R^2$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-3}$ , monosacarilo, oligosacarilo o polisacarilo, cada  $n$  es independientemente un número entero de 1 a aproximadamente 12,  $r$  es un número entero de 0 a aproximadamente 5,  $X'$  es un contraión aniónico.

10 Los contraiones aniónicos usados aquí pueden ser orgánicos o inorgánicos y deben ser cosméticamente aceptables cuando la composición de uso final se aplica al cuerpo. Entre los ejemplos ilustrativos de tales contraiones inorgánicos figuran haluros (especialmente cloruros), sulfatos, fosfatos, nitratos y boratos. Entre los contraiones orgánicos figuran metosulfato, sulfato de toluoilo, acetato, citrato, tartrato, lactato, gluconato y benzenosulfonato. Opcionalmente, una porción de tal contraión aniónico orgánico puede comprender el formador de quelato definido aquí. Se entiende que el término polisacarilo incluye una goma adecuada para uso en una composición tópica, un producto para el cuidado oral y/o un producto para el cuidado de lavandería o doméstico e incluye, por ejemplo, celulosa, xantano, agar, carrogeno, galactamananos como guar y/o goma de harina de algarrobo (de los que todos pueden formar radicales que forman parte de un enlace éter con el compuesto de amonio cuaternario). Entre los monosacarilos preferidos (esto es, azúcares simples) figuran glucosilo, fructosilo, galactosilo, xilosilo y ribosilo). Se entiende que el grupo de oligosacarilos incluye disacarilos, que pueden sacarosilo, trehalosilo, lactosilo, maltosilo o celubiosilo), así como fructo- o galatooligosacarilo.

15 Entre otros compuestos de amonio catiónicos preferidos adecuados para uso en este contexto figuran sales de sacáridos de hidroxipropiltri(alquil  $C_{1-3}$ )amonio monosustituídos, sales de polioles de hidroxipropiltri(alquil  $C_{1-3}$ ) amonio monosustituídos, sales de dihidroxipropiltri(alquil  $C_{1-3}$ )amonio, sales de dihidroxipropildi(alquil  $C_{1-3}$ )mono(hidroxietil)amonio, sales de guarhidroxipropiltrimonio, sales de 2,3-dihidroxipropiltri(alquilo o hidroxialquilo  $C_{1-3}$ )amonio, o mezclas de los mismos. En una realización muy preferida, el compuesto de amonio catiónico empleado en esta invención es el compuesto de amonio cuaternario cloruro de 1,2-dihidroxipropiltrimonio.

20 Tal compuesto de amonio catiónico inesperadamente se estabiliza con un formador de quelato basado en piridina, un formador de quelato basado en un grupo heteroceto o ambos, que impide(n) la generación de un grupo trimonio. Típicamente, la composición que comprende el compuesto de amonio catiónico y el formador de quelato comprende de aproximadamente 0,0001 a aproximadamente 10% y, preferiblemente, de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 8% y, muy preferiblemente, de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 5% de formador de quelato, en relación al peso total de compuesto de amonio catiónico y formador de quelato, e incluye todos los intervalos subsumidos. Si bien el compuesto de amonio catiónico descrito aquí se puede suministrar en solución (esto es, alcohol) o como polvo anhidro, en una realización especialmente preferida el compuesto de amonio catiónico se suministra como solución acuosa que comprende de aproximadamente 10 a aproximadamente 90% y, preferiblemente, de aproximadamente 20 a aproximadamente 85% y, muy preferiblemente, de aproximadamente 40 a aproximadamente 75% en peso en agua, en relación al peso total de la solución acuosa e incluidos todos los intervalos subsumidos. Las composiciones de uso final que comprenden la composición con compuesto de amonio catiónico estabilizado típicamente comprenden de aproximadamente 0,02 a aproximadamente 30% y, preferiblemente, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 25% y, muy preferiblemente, de aproximadamente 5

a aproximadamente 18% en peso de compuesto de amonio catiónico, en relación al peso total de la composición de uso final e incluidos todos los intervalos subsumidos.

5 Los compuestos de amonio catiónicos adecuados para uso en esta invención pueden prepararse mediante métodos reconocidos en la técnica. Por ejemplo, se pueden preparar haciendo reaccionar halodihidroalcanos primarios y trialquilaminas en un exceso estequiométrico, a lo que sigue la eliminación del exceso y una reducción del pH con el fin de recuperar del deseado compuesto de amonio catiónico. En los documentos U.S. 2007/0212324 A1 y U.S. 2007/0299284 A1, así como en U.S. 7.176.172 B2 y U.S. 7.282.471 B2 se describen otras técnicas y compuestos.

10 Los compuestos de amonio catiónicos adecuados para uso en esta invención están disponibles comercialmente. Entre los suministradores de los mismos figuran Dow Chemical, HallStar, Rhodia Group, Colonial Chemical Company así como Evonik Degussa.

15 El formador de quelato de la presente invención es el ácido quelidámico (ácido 1,4-dihidro-4-oxo-2,6-piridincarboxílico). El formador de quelato normalmente representa de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 7% y, preferiblemente, de aproximadamente 0,03 a aproximadamente 4% y, muy preferiblemente, de aproximadamente 0,03 a aproximadamente 3,5% en peso del peso total de la composición de uso final e incluidos todos los intervalos subsumidos.

El formador de quelato usado en la presente invención puede adquirirse comercialmente de suministradores tales como Sigma-Aldrich y Alfa Aesar GmbH.

20 Las composiciones de uso final de esta invención preferiblemente incluirán un vehículo cosméticamente aceptable. La cantidad de vehículo puede variar de aproximadamente 1 a aproximadamente 99,9%, preferiblemente de aproximadamente 70 a aproximadamente 95%, óptimamente de aproximadamente 80 a aproximadamente 90% en peso de la composición. Entre los vehículos útiles están agua, emolientes, ácidos grasos, alcoholes grasos, espesativos y mezclas de los mismos. El vehículo puede ser acuoso, anhidro o una emulsión. Preferiblemente, las composiciones de uso final son acuosas, en especial emulsiones de agua y emulsiones de aceite de la variedad agua/aceite o aceite/agua, o de la variedad triple agua/aceite/agua. El agua, cuando está presente, puede estar en cantidades que varían de aproximadamente 20 a aproximadamente 70%, óptimamente de aproximadamente de 35% a aproximadamente 60% en peso de la composición de uso final.

30 Los materiales emolientes pueden actuar como vehículos aceptables. Pueden estar en forma de aceites de silicona, ésteres naturales o sintéticos e hidrocarburos. La cantidad de emoliente puede ser una cualquiera entre aproximadamente 0,1 y aproximadamente 95%, preferiblemente entre aproximadamente 1 y aproximadamente 50% en peso de la composición.

35 Los aceites de silicona se pueden dividir en las variedades volátil y no volátil. El término "volátil" tal como se usa aquí se refiere a los materiales que tienen una presión de vapor medible a temperatura ambiente. Los aceites de silicona volátiles se seleccionan preferiblemente entre ciclometicona cíclica o polidimetilsiloxanos lineales que contienen de 3 a 9, preferiblemente, de 4 a 5 átomos de silicio.

40 Entre los aceites de silicona no volátiles útiles como emolientes figuran polialquilsiloxanos, polialquilarilsiloxanos y copolímeros de poliéter siloxano. Entre los polialquilsiloxanos esencialmente no volátiles figuran, por ejemplo, polidimetilsiloxanos con viscosidades de aproximadamente  $5 \times 10^{-6}$  a  $0,1 \text{ m}^2/\text{s}$  a  $25^\circ\text{C}$ . Entre los emolientes no volátiles preferidos, útiles en la presente composición de uso final están polidimetilsiloxanos que tienen viscosidades de aproximadamente  $1 \times 10^{-5}$  a aproximadamente  $4 \times 10^{-4} \text{ m}^2/\text{s}$  a  $25^\circ\text{C}$ .

Otra clase de siliconas no volátiles son elastómeros de silicona emulsivos y no emulsivos. Es representativo de esta categoría el polímero reticulado de dimeticona/vinildimeticona, adquirible como Dow Corning 9040 y Shin-Etsu KSG-18. También pueden ser útiles ceras de silicona tales como Silwax WS-L (laurato de dimeticonapoliol).

Entre los emolientes éster están:

45 (a) ésteres de alquilo de ácidos grasos saturados que tienen de 10 a 24 átomos de carbono. Entre los ejemplos de los mismos figuran neopentanoato de behenilo, isononanoato de isononilo, miristato de isopropilo y estearato de octilo.

(b) éter ésteres tales como ésteres de ácido graso de alcoholes grasos etoxilados.

50 (c) ésteres de alcoholes polihidroxílicos. Son ésteres de alcoholes polihidroxílicos satisfactorios, ésteres de etilenglicol y mono- y diácido graso, ésteres de dietilenglicol y mono- y diácido graso, ésteres de polietilenglicol (200-6000) y mono- y diácido graso, ésteres de propilenglicol y mono- y diácido graso, monostearato de polipropilenglicol 2000, monoestearato de polipropilenglicol etoxilado, ésteres de glicerilo y mono- y diácido graso, ésteres poligrasos de poliglicerol, monoestearato de glicerilo etoxilado, monoestearato de 1,3-butilenglicol,

diestearato de 1,3-butilenglicol, éster de polioxietileno y ácido graso, ésteres de sorbitano y ácido graso, y ésteres de polioxietilensorbitano y ácido graso. Son particularmente útiles ésteres de pentaeritritol, trimetilolpropano y neopentilglicol de alcoholes C<sub>1-30</sub>.

(d) ésteres de cera tales como cera de abeja, cera de espermaceti y cera de tribehenina.

5 (e) ésteres de azúcares tales como polibehenato de sacarosa y policotoseo de sacarosa.

Los emolientes éster natural están basados en mono-, di- y triglicéridos. Entre los glicéridos representativos figuran aceite de semilla de girasol, aceite de borraja, aceite de semilla de borraja, aceite de onagra, aceites de ricino y aceites de ricino hidrogenados, aceite de salvado de arroz, aceite de soja, aceite de oliva, aceite de alazhar, manteca de karité, aceite de jojoba y combinaciones de los mismos. Los emolientes derivados de animales están representados por aceite de lanolina y derivados de lanolina. La cantidad de los ésteres naturales puede ser de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 20% en peso de las composiciones de uso final.

10

Entre los hidrocarburos que son vehículos adecuados cosméticamente aceptables figuran vaselina, aceite mineral, isoparafinas C<sub>11-13</sub>, polibutenos y especialmente isohexadecano, adquirible comercialmente como Permethyl 101A de Presperse Inc.

15 También pueden ser adecuados como vehículos cosméticamente adecuados los ácidos grasos que tienen de 10 a 30 átomos de carbono. Son ilustrativos de esta categoría los ácidos pelargónico, láurico, mirístico, palmítico, esteárico, isoesteárico, oleico, linoleico, lionolénico, hidroxiesteárico y behénico.

Otra categoría útil de vehículos cosméticamente aceptables son los alcoholes grasos que tienen de 10 a 30 átomos de carbono. Son representativos de esta categoría alcohol estearílico, alcohol laurílico, alcohol miristílico alcohol oleílico y alcohol cetílico.

20

Se pueden usar espesativos como parte del vehículo cosméticamente aceptable de composiciones de uso final de acuerdo con la presente invención. Entre los espesativos típicos figuran acrilatos reticulados (por ejemplo Carbopol 982®), acrilatos modificados hidrófobamente (por ejemplo Carbopol 1382®), poliacrilamidas (por ejemplo Sepigel 305®), ácido acriloilmetilpropanosulfónico/polímeros y copolímeros de sales (por ejemplo Aristoflex HMB® y AVC®), derivados de celulosa y gomas naturales. Entre los derivados celulósicos útiles figuran carboximetilcelulosa sódica, hidroxipropilmetocelulosa, hidroxipropilcelulosa, hidroxietilcelulosa, etilcelulosa e hidroximetilcelulosa. Entre las gomas naturales adecuadas para la presente invención están guar, xantano, esclerocio, carrojenano, pectina y combinaciones de estas gomas. También se pueden usar como espesativos compuestos inorgánicos, en particular arcillas tales como bentonitas y hectoritas, sílices ahumadas, talco, carbonato cálcico y silicatos tales como silicato aluminomagnésico (Veegum®). La cantidad del espesativo puede variar de 0,0001 a 10%, usualmente de 0,001 a 1%, óptimamente de 0,01 a 0,5% en peso de la composición.

25

Además del ácido chelidámico se pueden usar formadores de quelatos metálicos tales como ácido trietilendiaminapentacético (DTPA), ácido trietilentetraaminahexacético, ácido hexametildiaminatetra- metilhexacético o mezclas de los mismos. Si se usan tales formadores de quelatos metálicos, se pueden emplear entre aproximadamente 1 y aproximadamente 45% en peso del peso total del formador de quelato empleado en la composición de uso final de esta invención.

35

En la presente invención se pueden emplear humectantes adjuntos. Generalmente estos son materiales de tipo alcohol polihidroxílico. Entre los típicos alcoholes polihidroxílicos figuran glicerol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, polietilenglicol, sorbitol, hidroxipropilsorbitol, hexilenglicol, 1,3-butilenglicol, isoprenilglicol, 1,2,6-hexanotriol, glicerol etoxilado, glicerol propoxilado y mezclas de los mismos. La cantidad de humectante adjunto puede variar entre 0,5 y 50%, preferiblemente entre 1 y 15% en peso de la composición.

40

En las composiciones de uso final de la presente invención pueden estar también presentes tensioactivos. La concentración total del tensioactivo cuando está presente puede ser de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 90%, preferiblemente de aproximadamente 1 a aproximadamente 40%, óptimamente de aproximadamente 1 a aproximadamente 20% en peso de la composición, dependiendo mucho del tipo de producto de cuidado personal. El tensioactivo se puede seleccionar entre el grupo constituido por activos aniónicos, no iónicos, catiónicos y anfóteros. Tensioactivos no iónicos particularmente preferidos son los que tienen un alcohol graso C<sub>10-20</sub> o ácido hidrófobo condensado con 2 a 100 moles de óxido de etileno u óxido de propileno por mol de hidrófobo; alquilfenoles C<sub>2-10</sub> condensados con 2 a 20 moles de óxido de alquileo; ésteres de mono- y di-ácido graso de etilenglicol; monoglicérido de ácido graso; sorbitano, mono- y di-ácidos grasos C<sub>8-20</sub>, y polioxidietilensorbitano, así como sus combinaciones. También son tensioactivos no iónicos adecuados alquilpoliglucósidos y amidas grasas de sacáridos (por ejemplo metilgluconamidas) y óxidos de trialkilamina.

50

Entre los tensioactivos aniónicos preferidos figuran jabón, alquiletersulfatos y sulfonatos, alquilbencenosulfonatos, alquil y dialquil sulfosuccinatos acil C<sub>6-20</sub> isetionatos, alquil C<sub>8-20</sub> éter fosfatos, sarcosinatos C<sub>8-20</sub>, acil C<sub>80-20</sub>

lactilatos, sulfoacetatos y combinaciones de los mismos.

Entre los tensioactivos anfóteros figuran cocoamidopropilbetaína, trialquil C<sub>12-20</sub> betaínas, lauroamfoacetato y laurodianfoacetato sódico.

5 En la composición tópica de esta invención se pueden usar perfumes. Entre los ejemplos no limitativos de los tipos de perfumes que se pueden usar figuran los que comprenden terpenos y derivados de terpeno como los descritos por Bauer y otros, *Common Fragrance and Flavour Materials*, VCH Publishers (1990).

Entre los ejemplos no limitativos de los tipos de fragancias que se pueden usar en esta invención figuran mirceno, dihidromireno, citral, tagetone, ácido cis-geránico, ácido citronélico, sus mezclas o similares.

10 Preferiblemente, la cantidad de fragancia empleada en las composiciones tópicas de esta invención está en el intervalo de aproximadamente 0,0% a aproximadamente 10%, más preferiblemente de aproximadamente 0,00001 a aproximadamente 5% en peso, muy preferiblemente de aproximadamente 0,0001 a aproximadamente 2%. Además, dado que la presente invención da menos grupos que contienen nitrógeno, hay disponibles más opciones de fragancia y no se requieren fragancias de altas características, pudiendo ser reemplazadas con perfumes duraderos.

15 En las composiciones de uso final de la presente invención se pueden incluir también agentes filtros solares. Son particularmente preferibles materiales tales como p-metoxicinamato de etilhexilo, adquirible como Parsol MCX®, Avobenzene, adquirible como Parsol 1789® y benzofenona-3, conocido también como Oxybenzone. Se pueden emplear activos filtros solares inorgánicos tales como dióxido de titanio microfino y óxido de zinc. Generalmente, la cantidad de agente filtro solar cuando está presente puede variar de 0,1 a 30%, preferiblemente de 2 a 20%,  
20 óptimamente de 4 a 10% en peso de la composición de uso final.

Las composiciones antitranspirantes y desodorantes de la presente invención contendrán ordinariamente activos astringentes. Entre los ejemplos figuran clorohidrato de aluminio, clorhidrex de aluminio, clorhidrex de aluminio-zirconiloglicina, sulfato de aluminio, sulfato de zinc, clorohidroglicinato de aluminio, hidroxiclورو de zirconio, lactato de zirconio y aluminio, fenosulfonato de zinc y combinaciones de los mismos. La cantidad de astringente  
25 puede variar entre aproximadamente 0,5 y aproximadamente 50% en peso de la composición de uso final.

Los productos orales formulados de acuerdo con la presente invención contendrán generalmente una fuente de fluoruro para evitar la caries dental. Entre los compuestos anticaries activos figuran fluoruro sódico, fluoruro estannoso y monofluorofosfato sódico. La cantidad de estos materiales estará determinada por la cantidad de fluoruro liberable, que debería estar entre aproximadamente 500 y aproximadamente 8800 ppm de la composición.  
30 Como otros componentes de los dentífricos pueden incluirse agentes desensibilizadores tales como nitrato potásico y nitrato de estroncio, edulcorantes tales como sacarina de sodio, aspartamo, sucralosa y acesulfam potásico. Normalmente estarán también presentes espesantes, agentes opacificantes, abrasivos y colorantes.

Deseablemente, en las composiciones de uso final de la presente invención se pueden incluir conservantes para la protección frente a microorganismos potencialmente dañinos. Son conservantes particularmente preferidos fenoximetanol, metilparabeno, propilparabeno, imidazolilurea, dimetiloldimetilhidantoína, sales del ácido etilendiamina tetraacético (EDTA), dehidroacetato sódico, metilcloroisotiazolinona, metilisotiazolinona, yodopropinilbutilcarbamato y alcohol bencílico. Los conservantes se deben seleccionar teniendo en cuenta el uso de la composición y posibles incompatibilidades entre los conservantes y otros ingredientes. Preferiblemente los conservantes se usan en cantidades comprendidas entre 0,01% y 2% en peso de la composición de uso final.  
35

40 Las composiciones de uso final de la presente invención pueden incluir vitaminas. Son vitaminas ilustrativas vitamina A (retinol), vitamina B<sub>2</sub>, vitamina B<sub>3</sub> (niacinamida), vitamina B<sub>6</sub>, vitamina C, vitamina E, ácido fólico y biotina. También se pueden emplear derivados de las vitaminas. Por ejemplo, entre los derivados de la vitamina están tetraisopalmitato de ascorbilo, fosfato de magnesioascorbilo y glucósido de ascorbilo. Entre los derivados de vitamina E figuran acetato de tocoferilo, palmitato de tocoferilo y lionoleato de tocoferilo. También se pueden emplear DL-pantenol y derivados. La cantidad total de vitaminas cuando están presentes en composiciones de acuerdo con la presente invención puede ser de 0,001 a 10%, preferiblemente de 0,01% a 1%, óptimamente de 0,1% a 5% en peso de la composición de uso final.  
45

Otro tipo de sustancia útil puede ser el de enzimas tales como amilasas, oxidasas, proteasas, lipasas y combinaciones. Es particularmente preferida la superoxidodismutasa, adquirible comercialmente como SOD de Brooks Company, USA.  
50

Se pueden incluir en las composiciones de la invención compuestos que aclaran la piel. Son sustancias ilustrativas extracto de placenta, ácido láctico, niacinamida, arbutina, ácido kóico, ácido ferúlico, ácido 12-hidroxiesteárico, resorcinol y derivados, incluidos resorcinolos 4-sustituidos, y combinaciones de los mismos. Las cantidades de estos agentes pueden variar de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10%, preferiblemente de

aproximadamente 0,5 a aproximadamente 2% en peso de la composición de uso final.

5 Pueden estar presentes promotores de escamación. Son ilustrativos los ácidos alfa-hidroxicarboxílicos y beta-hidroxicarboxílicos. El término "ácido" se entiende que incluye no sólo el ácido libre, sino también sales, y sus ésteres de alquilo C<sub>1-30</sub> o arilo, y lactonas generadas por la eliminación de agua formando estructuras de lactona cíclicas o lineales. Son ácidos representativos los ácidos glicólico, láctico y málico. El ácido salicílico es representativo de los ácidos betahidroxicarboxílicos. La cantidad de estos materiales cuando están presentes puede variar de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 15% en peso de la composición de uso final.

10 Opcionalmente las composiciones de esta invención pueden incluir una variedad de extractos herbales. Los extractos pueden ser solubles en agua o insolubles en agua, dispuestos en un disolvente que respectivamente es hidrófilo o hidrófobo. Los disolventes del extracto preferidos son agua y etanol. Entre los extractos ilustrativos figuran los de té verde, plantas del género de aquileas, manzanilla, licorice, aloe vera, semilla de uva, mikan, corteza de sauce, salvia, tomillo y romero.

15 También pueden incluirse materiales tales como ácido lipoico, retinóxtrimetilsilano (asequible de Clarian Corp. Bajo la marca comercial Silcare 1M-75), dehidroepiandrosterona (DHEA) y combinaciones de los mismos. También pueden ser útiles ceramidas (incluidas Ceramide 1, Ceramide 3, Ceramide 3B y Ceramide 6), así como pseudoceramidas. Las cantidades de estos materiales pueden variar de aproximadamente 0,000001 a aproximadamente 10, preferiblemente de aproximadamente 0,0001 a aproximadamente 1% en peso de la composición de uso final.

20 En las composiciones de uso final de la presente invención se pueden incluir también colorantes, opacificantes y abrasivos. Cada una de estas sustancias puede estar en una cantidad entre aproximadamente 0,05 y aproximadamente 5%, preferiblemente entre 0,1 y 3% en peso de la composición.

25 Son aditivos especialmente preferidos, adecuados para uso con los compuestos de amonio cuaternario estabilizados de esta invención, agentes hidratantes tales como ureas sustituidas como hidroximetilurea, hidroxietilurea, hidroxipropilurea, bis(hidroximetil)urea, bis(hidroxietil)urea, bis(hidroxipropil)urea, N,N-dihidroximetil-urea, N,N'-dihidroxietilurea, N,N,N'-tri-hidroxietilurea, tetra(hidroximetil)urea, tetra(hidroxietil)urea y N,N'dimetil-N-hidroxietilurea, o mezclas de los mismos. Cuando aparece el término hidroxipropilo, el significado es genérico para los radicales 3-hidroxi-n-propilo, 2-hidroxi-n-propilo, 3-hidroxi-i-propilo o 2-hidroxi-i-propilo. Es muy preferida hidroxietilurea. La última es adquirible como líquido acuoso al 50% de National Starch & Chemical Division of ICI bajo la marca comercial Hydrovance.

30 Las cantidades de urea sustituida, cuando se usa, en la composición de uso final de esta invención, están en el intervalo de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20% y, preferiblemente, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 15% y, muy preferiblemente, de aproximadamente 2 a aproximadamente 10% en relación al peso total de la composición de uso final, e incluidos todos los intervalos subsumidos.

35 Cuando se usan compuesto de amonio estabilizado y urea sustituida, en una realización muy preferida se emplea como mínimo de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 25% y, preferiblemente, de aproximadamente 0,2 a aproximadamente 2% y, muy preferiblemente, de aproximadamente 1 a aproximadamente 15% % de un humectante, como glicerina, en relación al peso total de la composición de uso final e incluidos todos los intervalos subsumidos.

40 Se pueden emplear una amplia variedad de envases para almacenar y suministrar las composiciones de uso final. Con frecuencia el envasado depende del tipo de uso final de cuidado personal. Por ejemplo, generalmente, para las lociones y cremas permanentes para la piel, champúes, acondicionadores y geles de ducha se emplean envases de plástico con una abertura en el extremo desde el que se suministra al usuario, cubierta con un cierre.

45 Son cierres típicos cabezas atornilladas, bombas no de aerosol y tapas de bisagra. El envase para antitranspirantes, desodorantes y depiladores puede suponer un recipiente deslizable sobre bola en un extremo de suministro. Alternativamente, estos tipos de productos para el cuidado personal puede ser suministrados como formulación de producto en barra en un recipiente con un mecanismo propulsor en el que la barra se puede deslizar sobre una plataforma al orificio de dispensación. Como envase para antitranspirantes, cremas de afeitar y otros productos para el cuidado personal sirven botes metálicos que pueden estar a presión mediante un propulsor y que tienen una boquilla de proyección. Las barras para baño pueden tener un envase constituido por un material para envolver celulósico o plástico o una caja de cartón, o estar envueltas en una película de plástico encogible.

50 Las composiciones para uso final de la presente invención pueden tener cualquier forma. Estas formas pueden incluir lociones, cremas, formulaciones que se aplican mediante deslizamiento con bola, lápices, espumas y proyecciones no aerosoles, y formulaciones que se aplican a productos textiles no tejidos.

Los ejemplos siguientes se aportan para facilitar la comprensión de la presente invención. Los ejemplos no limitan

el alcance de las reivindicaciones.

### Ejemplo 1

5 Soluciones acuosas que comprendían aprox. 50% en peso de agua y 50% en peso de cloruro de dihidroxipropiltrimonio se combinaron con aprox. 0,12% en peso de formador de quelato y se agitaron obteniéndose una solución homogénea. Las soluciones se almacenaron a 25°C durante hasta dos meses. Se controló la generación de grupo trimonio (esto es, trimetilamina) y tal control se hizo por métodos conocidos empleando, por ejemplo, cromatografía de gases-espectrometría de masas o electroforesis de capilaridad con quimioluminiscencia generada.

10 **Tabla 1**

Solución al 50 de amonio cuaternario*	Formador de quelato	Temperatura, °C	Velocidad de generación de trimetilamina**, ppm/día
1	DTPA	25	0,0014
2	Control	25	0,02
3	Ácido cheldámico	25	0,0009

\* Asequible comercialmente de Dow Chemical

\*\* Determinada usando la fórmula Velocidad de generación de trimetilamina = (velocidad de generación de trimetilamina con formador de quelato/velocidad de generación de trimetilamina sin formador de quelato) x 100.

15 Los resultados indican que las composiciones hechas de acuerdo con esta invención inesperadamente generan aproximadamente 20 veces menos trimetilamina por día que las composiciones exentas de quelato basado en piridina de esta invención y almacenadas a la misma temperatura.

### Ejemplo 2

20 Se prepararon soluciones que comprendían control y formador de quelato similares a las anteriores. Las soluciones se almacenaron a 50°C durante aproximadamente un mes. La estimación, después de almacenaje, reveló que después de veinte días, la solución que comprendía ácido chelidámico tenía aproximadamente 40% menos de trimetilamina que el control. Después de aproximadamente un mes, la solución con ácido chelidámico tenía aproximadamente 50% menos de trimetilamina que el control.

25

30

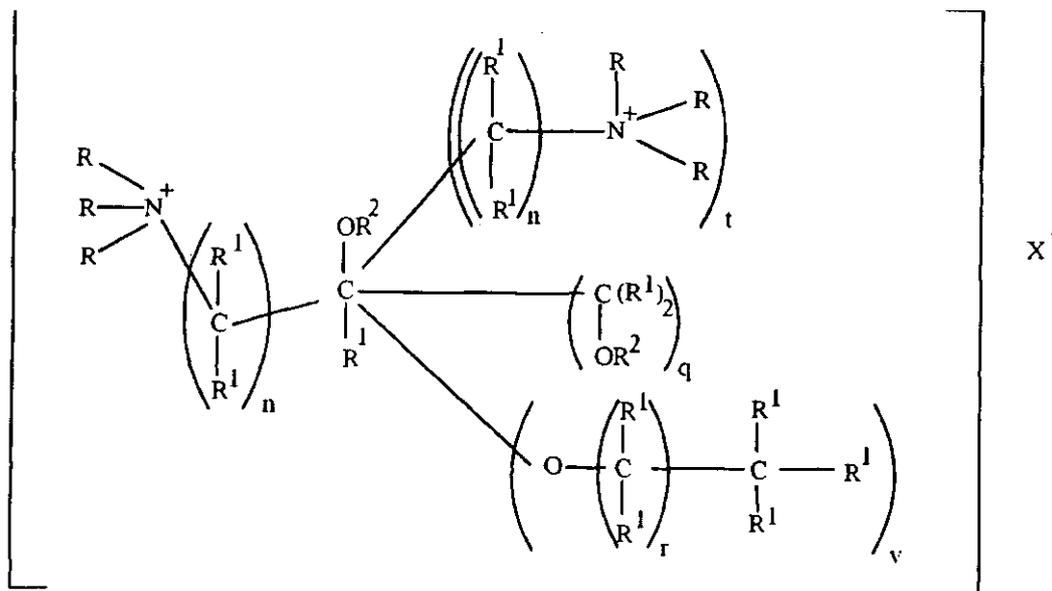
35

5

REIVINDICACIONES

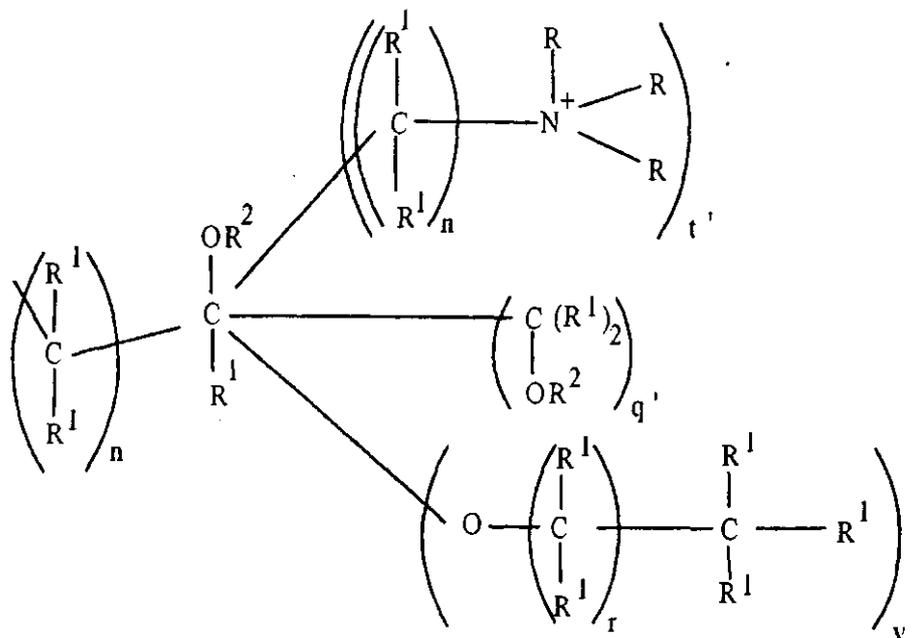
1. Una composición que comprende un compuesto de amonio catiónico y un formador de quelato basado en piridina, un formador de quelato basado en heteroceto, o ambos, siendo el formador de quelato uno que impide la generación de un grupo que comprende nitrógeno del compuesto de amonio catiónico de la composición,

en la que el compuesto de amonio catiónico tiene la fórmula:



10

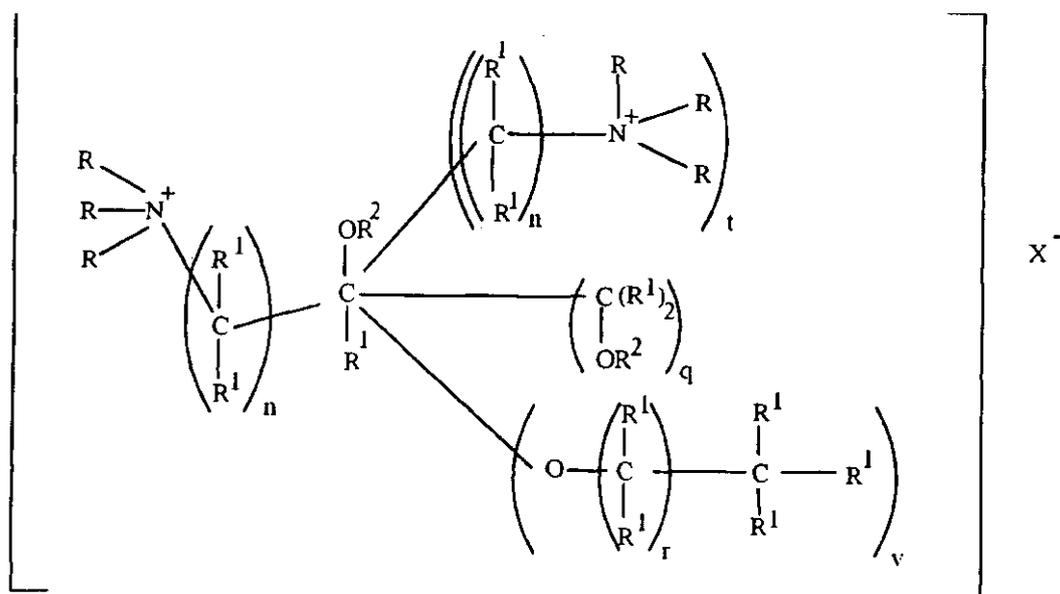
en la que q, t y v son, cada uno independientemente, 0 o 1, con la condición de que la suma de q, t y v sea igual a 1, cada R es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-12</sub>, hidroalquilo C<sub>1-12</sub> o



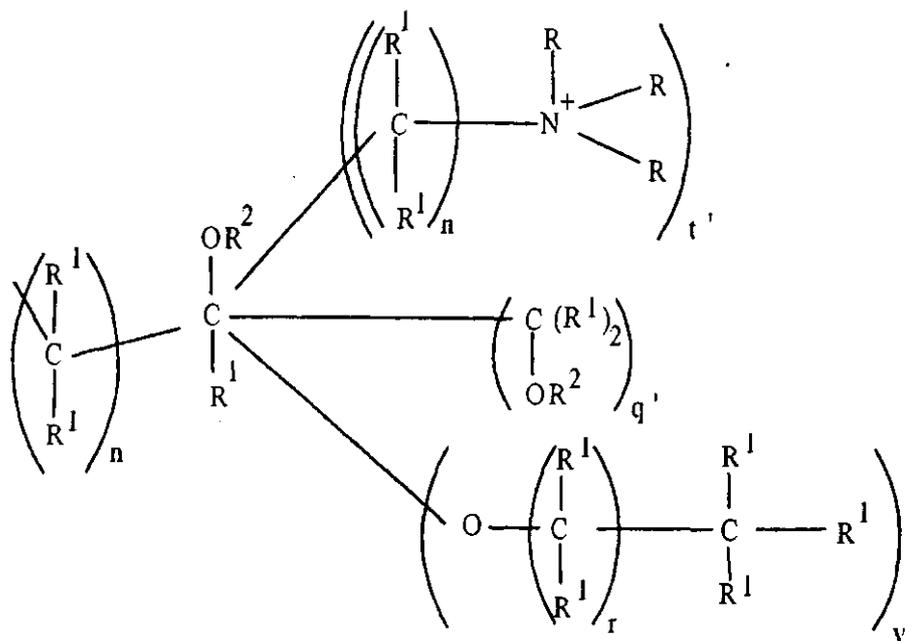
en la que q', t' y v' son cada uno independientemente 0 o 1, con la condición de que la suma de q', t' y v' sea igual

a 1, cada R<sup>1</sup> es independientemente un hidrógeno, alquilo C<sub>1-12</sub> o un hidroxialquilo C<sub>1-12</sub>, cada R<sup>2</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-3</sub>, monosacarilo, oligosacarilo o polisacarilo, cada n es independientemente un número entero de 1 a 12, r es un número entero de 0 a 5, X' es un contraión aniónico, en la que el quelato es ácido chelidámico.

- 5 2. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1, en la que el contraión aniónico es orgánico o inorgánico.
3. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en la que el compuesto de amonio catiónico se selecciona entre el grupo que consiste en una sal de sacárido de hidroxipropiltri(alquil C<sub>1-3</sub>)amonio monosustituido, una sal de poliol de hidroxipropiltri(alquil C<sub>1-3</sub>)amonio monosustituido, una sal de dihidroxipropiltri(alquil C<sub>1-3</sub>)amonio, una sal de dihidroxipropildii(alquil C<sub>1-3</sub>)mono(hidroxietil)amonio, una sal de guarhidroxipropiltrimonio, una sal de 2,3-dihidroxipropiltri(alquilo o hidroxialquilo C<sub>1-3</sub>)amonio, y mezclas de los mismos.
- 10 4. Una composición de acuerdo con la reivindicación 3, en la que el compuesto de amonio catiónico es cloruro de 1,2-dihidroxipropiltrimonio.
- 15 5. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes que adicionalmente comprende un vehículo cosméticamente aceptable.
6. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, composición que se aplica tópicamente al cuerpo.
7. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6, composición que es para que permanezca o que se elimina por enjuagado.
- 20 8. Una composición de acuerdo con la reivindicación 7, composición que es una composición hidratante.
9. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que la composición comprende de 0,02 a 30% p/p de compuesto de amonio catiónico y de 0,01 a 7% p/p de formador de quelato.
10. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que la composición comprende además un humectante.
- 25 11. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que la composición además comprende una urea sustituida.
12. Una composición de acuerdo con la reivindicación 10 o la reivindicación 11, en la que el humectante es glicerina.
- 30 13. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en la que el grupo que comprende nitrógeno es un grupo trimonio.
14. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes que comprende ácido dietilentriaminapentaacético.
15. Un procedimiento para estabilizar un compuesto de amonio catiónico que comprende las etapas de:
- 35 (a) poner en contacto el compuesto de amonio catiónico con un formador de quelato basado en piridina y/o basado en heteroceto, y
- (b) impedir la formación de un grupo que comprende nitrógeno,
- en el que el compuesto de amonio catiónico tiene la fórmula:



en la que  $q$ ,  $t$  y  $v$  son, cada uno independientemente, 0 o 1, con la condición de que la suma de  $q$ ,  $t$  y  $v$  sea igual a 1, cada  $R$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-12}$ , hidroalquilo  $C_{1-12}$  o



- 5 en la que  $q'$ ,  $t'$  y  $v'$  son cada uno independientemente 0 o 1, con la condición de que la suma de  $q'$ ,  $t'$  y  $v'$  sea igual a 1, cada  $R^1$  es independientemente un hidrógeno, alquilo  $C_{1-12}$  o un hidroalquilo  $C_{1-12}$ , cada  $R^2$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-3}$ , monosacarilo, oligosacarilo o polisacarilo, cada  $n$  es independientemente un número entero de 1 a 12,  $r$  es un número entero de 0 a 5,  $X'$  es un contraión aniónico, en la que el quelato es ácido quelidámico.