

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 533 090**

51 Int. Cl.:

A61Q 19/00 (2006.01)

A61K 8/44 (2006.01)

A61K 8/41 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **29.03.2010 E 10712050 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **31.12.2014 EP 2421500**

54 Título: **Compuestos de amonio catiónicos estabilizados y composiciones que los comprenden**

30 Prioridad:

20.04.2009 US 426448

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

07.04.2015

73 Titular/es:

**UNILEVER N.V. (100.0%)
Weena 455
3013 AL Rotterdam, NL**

72 Inventor/es:

**AU, VAN;
MADISON, STEPHEN ALAN y
THOMPSON, KATHERINE MARY**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 533 090 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 y composiciones que los comprenden

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 quelante de metal, por medio de lo cual, de forma inesperada, dichos compuestos de amonio catiónicos no presentan desalquilación en, por ejemplo, un medio acuoso. El quelante de metal es adecuado para su 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 adecuado 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 se incluyen 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. Las sustancias más frecuentemente usadas a este fin son las sustancias generalmente clasificadas como sustancias orgánicas hidroxiladas monoméricas y poliméricas. Quizás la glicerina, también conocida como glicerina o glicerol, es el humectante más popular empleado en composiciones tópicas.

25 Las nuevas tendencias en la humectación de la piel han conducido al uso de compuestos de amonio cuaternario en formulaciones tópicas para la piel. Los compuestos de amonio cuaternario preferidos comprenden un grupo trimetilamonio conocido generalmente con la nomenclatura de INCI como grupo trimonio. Si bien tales compuestos son preferidos para los beneficios hidratantes, tienden a ser inestables cuando, por ejemplo, está presente el agua. Esta inestabilidad da como 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 hidratante 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 de forma típica almacenar el producto y distribuirlo a 30 temperaturas frías de manera que se pueda prolongar la longevidad del producto.

35 Existe un interés creciente por desarrollar compuestos de amonio catiónicos estabilizados para todas las aplicaciones y, en especial, aplicaciones en las que se desea la humectación de la piel. La presente invención, por lo tanto, está dirigida a compuestos de amonio catiónicos estabilizados. Los compuestos de amonio catiónicos se estabilizan con un quelante de metal e, inesperadamente, se impide la generación de un grupo que comprende nitrógeno en, por ejemplo, un medio acuoso. Tales compuestos estabilizados son adecuados para usar en aplicaciones tópicas, incluyendo las composiciones permanentes y que se elimina por enjuagado, e incluso las aplicaciones relacionadas con el cuidado oral, el cuidado en lavado de la ropa y queaceros domésticos.

Información adicional

40 Se han desvelado esfuerzos para realizar composiciones para el cuidado personal con compuestos de amonio cuaternario. En los documentos US 7.087.560, US 7.176.172 y US 7.282.471 se describen sales de amonio cuaternario.

Se han desvelado también otros esfuerzos para fabricar composiciones para del cuidado personal. En el documento US 7.175.836 se describen emulsiones cosméticas.

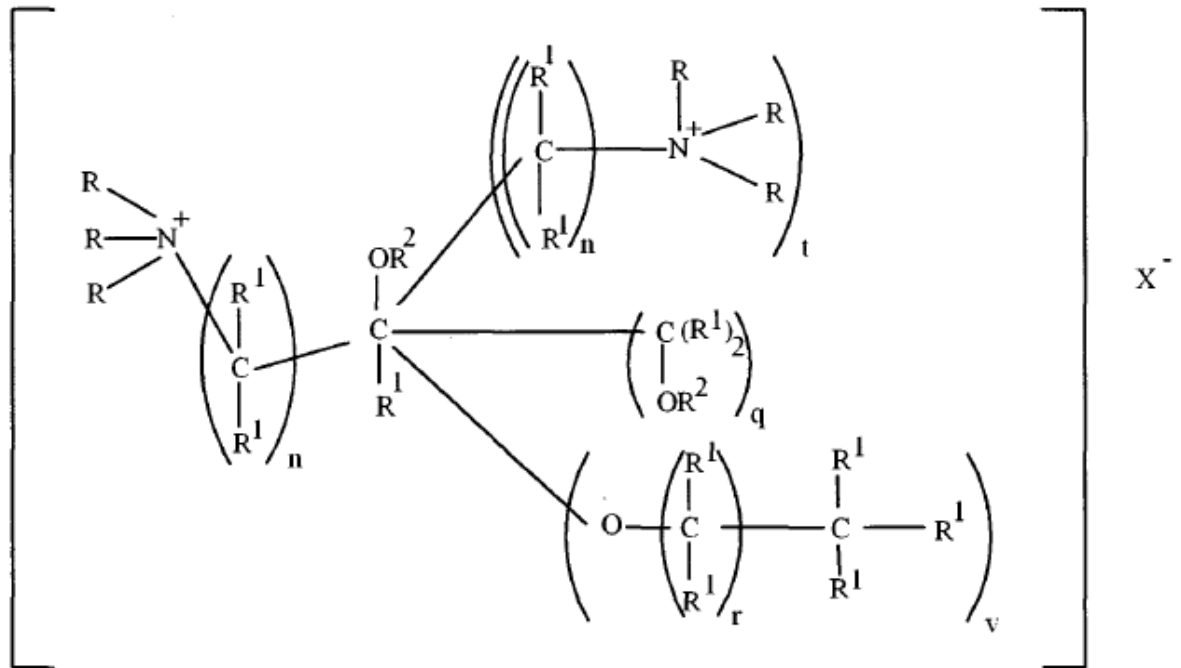
45 Se han desvelado además otros esfuerzos para composiciones para del cuidado personal. En el documento US 2008/0299054 A1 se describen composiciones para el cuidado personal con liberación de fragancia intensificada.

Ninguna de entre la información adicional citada anteriormente describe compuestos de amonio catiónicos adecuados para al menos aplicaciones cosméticas y que hayan sido estabilizados con un quelante de metal.

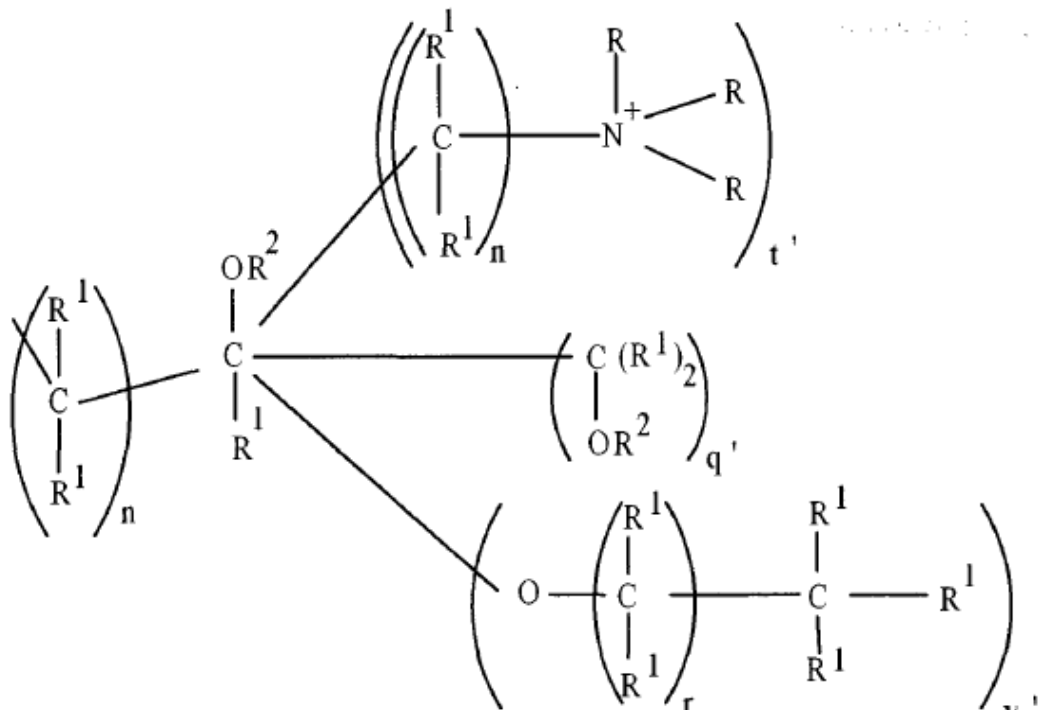
Sumario de la invención

50 La presente invención está dirigida a una composición que comprende un compuesto de amonio catiónico que

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 C₁₋₁₂, hidroxialquilo C₁₋₁₂ 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 R¹ es independientemente un hidrógeno, alquilo C₁₋₁₂ o un hidroxialquilo C₁₋₁₂, cada R² es independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₃, 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, estando estabilizado el compuesto de amonio catiónico con un quelante de metal que comprende grupos amino y al menos aproximadamente 5 grupos carboxilato, un quelante de metal que comprende grupos amino y al menos aproximadamente 4 grupos fosfonato o una mezcla de los mismos.

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

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

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

15 Como se usa en la presente memoria descriptiva, la composición de uso final se refiere a una sustancia aplicada a un cuerpo humano para mejora del aspecto, limpieza, control del olor y/o estética general. Entre los ejemplos ilustrativos, pero no limitantes, figuran lociones y cremas permanentes para la piel, champús, 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 producto relacionado con el cuidado oral o el cuidado de lavado de ropa, o queaceros domésticos, tal como detergente para lavado de ropa, acondicionador de tejido, o un limpiador potente de superficies. En una realización preferida, sin embargo, la composición de uso final es una composición que se aplica al cuerpo humano y especialmente por vía tópica a la piel. Estabilizado, tal como se usa en la

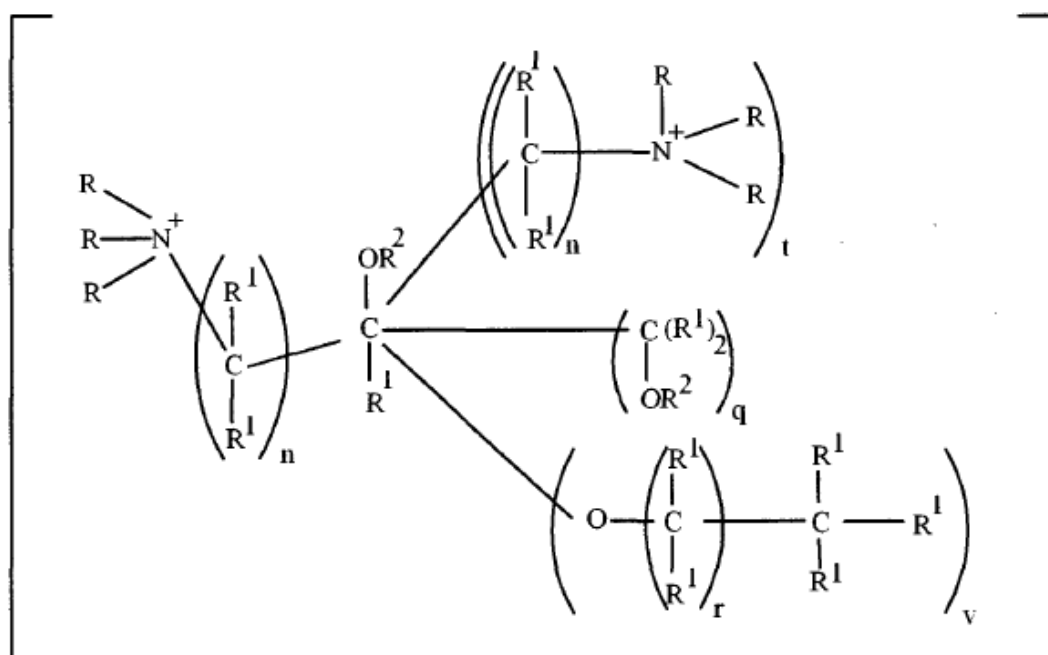
20 presente memoria descriptiva, significa que impide la generación de un compuesto que comprende nitrógeno, tal como una amina, un grupo trimonio y/o amoniaco, especialmente en un medio acuoso.

Como se usa en la presente memoria descriptiva, que comprende, significa que está constituido esencialmente por, y que comprende. Todos los intervalos identificados en la presente memoria descriptiva incluyen todos los intervalos subsumidos en ellos, si, por ejemplo, no se hace referencia explícita a los mismos.

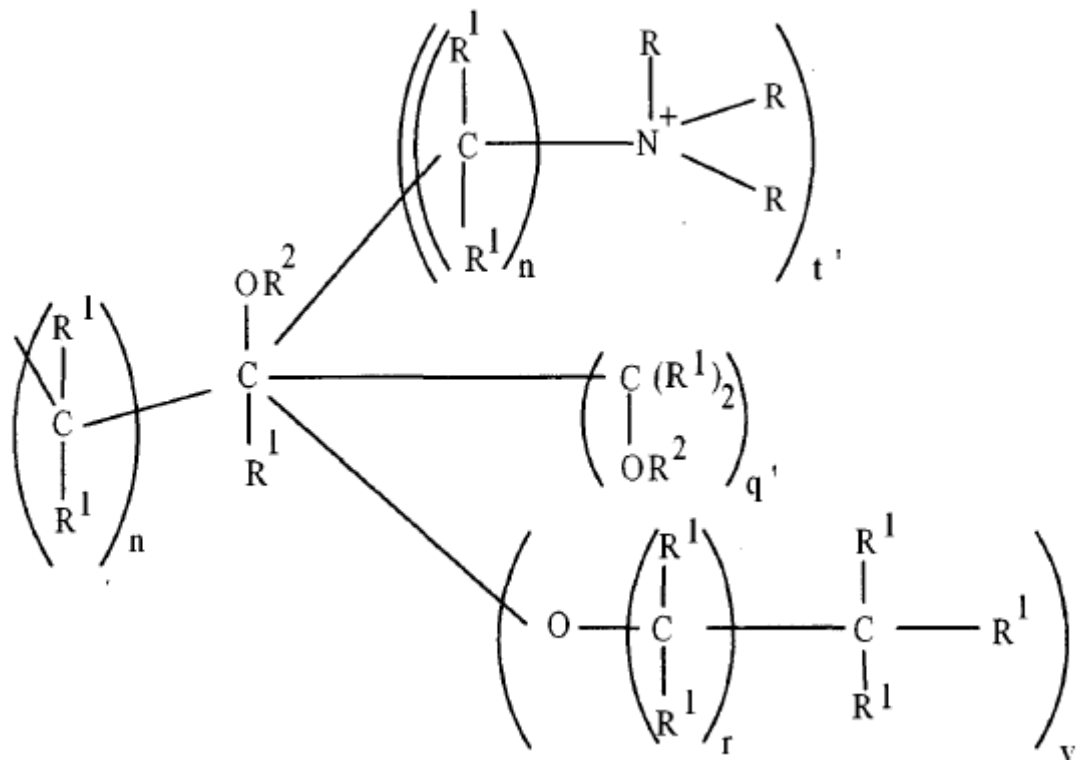
25 **Descripción detallada de realizaciones preferidas**

La única limitación con respecto a los compuestos de amonio catiónicos que se pueden emplear en esta invención es que los mismos se puedan usar en un producto para el consumidor y, preferiblemente, un producto tópico para la piel.

30 Los compuestos de amonio catiónicos preferidos 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 C₁₋₁₂, hidroxialquilo C₁₋₁₂ 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 R¹ es independientemente un hidrógeno, alquilo C₁₋₁₂ o un hidroxialquilo C₁₋₁₂, cada R² es independientemente hidrógeno, alquilo C¹⁻³, 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, estando estabilizado el compuesto de amonio catiónico con un quelante de metal que comprende grupos amino y al menos aproximadamente 5 grupos carboxilato, un quelante de metal que comprende grupos amino y al menos aproximadamente 4 grupos fosfonato o ambos.

Los contraiones aniónicos usados en la presente memoria descriptiva 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 aniónicos inorgánicos figuran haluros (especialmente cloruros), sulfatos, fosfatos, nitratos y boratos. Entre los contraiones aniónicos orgánicos figuran metosulfato, sulfato de toluilo, acetato, citrato, tartrato, lactato, gluconato y bencenosulfonato. Opcionalmente, una porción de tal contraión aniónico orgánico puede comprender el quelante de metal definido en la presente memoria descriptiva. 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 lavado de ropa o queaceros domésticos e incluye, por ejemplo, celulosa, xantano, agar, carrogenano, 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 los oligosacarilos incluyen disacarilos, que pueden ser sacarosilo, trehalosilo, lactosilo, maltosilo o celubiosilo), así como fructo- o galatooligosacarilo.

Con frecuencia, los compuestos de amonio catiónicos preferidos adecuados para uso en la presenta memoria descriptiva incluyen sales de sacáridos de hidroxipropiltri(alquil C₁₋₃)amonio monosustituidos, sales de polioles de hidroxipropiltri(alquil C₁₋₃) amonio monosustituidos, sales de dihidroxipropiltri(alquil C₁₋₃)amonio, sales de dihidroxipropildi(alquil C₁₋₃)mono(hidroxietyl)amonio, sales de guarhidroxipropiltrimonio, sales de 2,3-dihidroxipropiltri(alquilo o hidroxialquilo C₁₋₃)amonio, o mezclas de los mismos. En una realización más preferida, el compuesto de amonio catiónico empleado en esta invención es el compuesto de amonio cuaternario cloruro de 1,2-dihidroxipropiltrimonio.

Tal compuesto de amonio catiónico inesperadamente se estabiliza con quelante de metal que impide la generación

de un grupo trimonio. De forma típica, la composición que comprende el compuesto de amonio catiónico y el quelante de metal comprende desde aproximadamente el 0,0001% hasta aproximadamente el 10% y, preferiblemente, desde aproximadamente el 0,01% hasta aproximadamente el 8% y, más preferiblemente, desde aproximadamente el 0,01% hasta aproximadamente el 5% en peso del quelante de metal en base al peso total del compuesto de amonio catiónico y el quelante, e incluye todos los intervalos subsumidos en él. Si bien el compuesto de amonio catiónico descrito en la presente memoria descriptiva se puede suministrar en solución (esto es, alcohol) o como polvo anhidro, en una realización especialmente preferida, el compuesto de amonio catiónico se suministra en forma de solución acuosa que comprende desde aproximadamente el 10% hasta aproximadamente el 90% y, preferiblemente, desde aproximadamente el 20% hasta aproximadamente el 85% y, más preferiblemente, desde aproximadamente el 40% hasta aproximadamente el 75% en peso en agua, en base al peso total de la solución acuosa e incluidos todos los intervalos subsumidos en él. Las composiciones de uso final que comprenden la composición con compuesto de amonio catiónico estabilizado típicamente comprenden desde aproximadamente el 0,02% hasta aproximadamente el 30% y, preferiblemente, desde aproximadamente el 0,1% hasta aproximadamente el 25% y, más preferiblemente, desde aproximadamente el 5% hasta aproximadamente el 18% en peso de compuesto de amonio catiónico, en base al peso total de la composición de uso final e incluidos todos los intervalos subsumidos en él.

Los compuestos de amonio catiónicos preferidos adecuados para uso en esta invención se pueden preparar por medio de técnicas reconocidas en la materia. Por ejemplo, se pueden preparar haciendo reaccionar halodihidroxialcanos primarios y trialkilaminas en un exceso estequiométrico, a lo que sigue la eliminación del exceso y una reducción del pH con el fin de recuperar el compuesto de amonio catiónico deseado. En los documentos US 2007/0212324 A1 y US 2007/0299284 A1, así como en US 7.176.172 B2 y US 7.282.471 B2 se describen otras técnicas y compuestos.

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

Los quelantes adecuados para uso en esta invención preferiblemente comprenden grupos amino y al menos aproximadamente cinco grupos carboxilato, grupos amino y al menos aproximadamente cuatro grupos fosfato o una mezcla de los mismos. En una realización preferida, los quelantes adecuados para su uso comprenden al menos aproximadamente tres grupos amino y al menos aproximadamente cinco grupos carboxilato, al menos aproximadamente dos grupos amino y al menos aproximadamente cuatro grupos fosfonato, o una mezcla de los mismos. La mayoría de los quelantes preferidos adecuados para su uso en esta invención incluyen ácido dietilentriaminopentaacético, así como ácido trietilentetraamino hexacético, ácido hexametildiaminotetrametilen fosfónico (por ejemplo Dequest 2054) o mezclas de los mismos. En una realización especialmente preferida, el quelante de metal empleado en esta invención es ácido dietilentriaminopentaacético. También se pueden emplear derivados tales como sales de los quelantes.

El quelante típicamente constituye desde aproximadamente el 0,01% hasta aproximadamente el 5%, y preferiblemente desde aproximadamente el 0,03% hasta aproximadamente el 4%, y más preferiblemente desde aproximadamente el 0,03% hasta aproximadamente el 3,5% en peso del peso total de la composición de uso final incluyendo todos los intervalos incluidos en el mismo.

Los quelantes adecuados para su uso en la presente memoria descriptiva están disponibles en el mercado de suministradores como Dequesa Corporation, GFS Chemicals, así como Brenntag N.V.

Las composiciones de uso final de esta invención preferiblemente incluirán un vehículo cosméticamente aceptable. La cantidad de vehículo puede variar desde aproximadamente el 1% hasta aproximadamente el 99,9%, preferiblemente desde aproximadamente el 70% hasta aproximadamente el 95%, óptimamente desde aproximadamente el 80% hasta aproximadamente el 90% en peso de la composición. Entre los vehículos útiles están agua, emolientes, ácidos grasos, alcoholes grasos, espesantes y combinaciones 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 aceite de la variedad agua/aceite o aceite/agua, o triple agua/aceite/agua. El agua, cuando está presente, puede estar en cantidades que varían desde aproximadamente el 20% hasta aproximadamente el 70%, óptimamente desde aproximadamente el 35% hasta aproximadamente el 60% en peso de la composición de uso final.

Los materiales emolientes pueden actuar como vehículos cosméticamente aceptables. Pueden estar en forma de aceites de silicona, ésteres naturales o sintéticos e hidrocarburos. La cantidad de emoliente puede variar en cualquier punto desde aproximadamente el 0,1% hasta aproximadamente el 95%, preferiblemente entre aproximadamente el 1% y aproximadamente el 50% en peso de la composición.

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

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

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

15 Entre los emolientes éster están:

1. Ésteres de alquilo de ácidos grasos saturados que tienen de 10 a 24 átomos de carbono. Entre los ejemplos de los mismos se incluye neopentanoato de behenilo, isononanoato de isononilo, miristato de isopropilo y estearato de octilo.

2. Éter ésteres tales como ésteres de ácido graso de alcoholes grasos saturados etoxilados.

20 3. Ésteres de alcoholes polihidroxílicos. Son ésteres de alcoholes polihidroxílicos satisfactorios, los 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 copoliol y ácido graso, ésteres de sorbitano y ácido graso, y ésteres de polioxietileno sorbitano y ácido graso. Son particularmente útiles ésteres de pentaeritritol, trimetilolpropano y neopentilglicol de alcoholes $\text{C}_1\text{-C}_{30}$.

4. Ésteres de cera tales como cera de abeja, cera de espermaceti y cera de tribehenina.

5. Ésteres de azúcares tales como polibehenato de sacarosa y policotoseato de sacarosa.

30 Los emolientes éster natural están basados principalmente en mono-, di- y triglicéridos. Entre los glicéridos representativos se incluye el aceite de semilla de girasol, aceite de semilla de algodón, 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 alazor, 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.

35 La cantidad de los ésteres naturales puede variar entre aproximadamente el 0,1% hasta aproximadamente el 20% en peso de las composiciones de uso final.

Entre los hidrocarburos que son vehículos cosméticamente adecuados aceptables se incluye la vaselina, aceite mineral, isoparafinas C_{11-13} , polibutenos y especialmente isohexadecano, disponible en el mercado como Permethyl 101A de Presperse Inc.

40 También pueden ser adecuados como vehículos cosméticamente aceptables los ácidos grasos que tienen de 10 a 30 átomos de carbono. Son ilustrativos de esta categoría los ácidos pelargónico, láurico, mirístico, palmítico, esteárico, isoestéarico, oleico, linoleico, lionoléico, hidroxiestéarico 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 el alcohol de estearilo, alcohol de laurilo, alcohol de miristilo alcohol de oleilo y alcohol de cetilo.

45 Se pueden usar espesantes como parte del vehículo cosméticamente aceptable de composiciones de uso final de acuerdo con la presente invención. Entre los espesantes típicos se incluyen los acrilatos reticulados (por ejemplo Carbopol 982®), acrilatos hidrófobamente modificados (por ejemplo Carbopol 1382®), poliacrilamidas (por ejemplo Sepigel 305®), polímeros y copolímeros del ácido acriloilmetilpropanosulfónico / sal acriloilmetilpropanosulfónica (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 se incluye

5 guar, xantano, esclerocio, carrogenano, pectina y combinaciones de estas gomas. También se pueden usar como espesantes 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 espesante puede variar del 0,0001% al 10%, normalmente del 0,001% al 1%, óptimamente del 0,01% al 0,5% en peso de la composición.

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

15 En las composiciones de uso final de la presente invención pueden estar también presentes tensioactivos. La concentración total del tensioactivo cuando está presente puede variar aproximadamente del 0,1% a aproximadamente el 90%, preferiblemente aproximadamente del 1 a aproximadamente el 40%, óptimamente aproximadamente del 1% a aproximadamente el 20% en peso de la composición, dependiendo mucho del tipo de producto para el cuidado personal. El tensioactivo se puede seleccionar entre el grupo que comprende activos aniónicos, no iónicos, catiónicos y anfóteros. Los tensioactivos no iónicos particularmente preferidos son los que tienen un alcohol graso C₁₀-C₂₀ o ácido hidrófobo condensado con 2 a 100 moles de óxido de etileno u óxido de propileno por mol de hidrófobo; alquilfenoles C₂₋₁₀ 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 C₈-C₂₀, y polioxidetilensorbitano, así como las combinaciones de los mismos. También son tensioactivos no iónicos adecuados los poliglucósidos de alquilo y amidas grasas de sacáridos (por ejemplo metilgluconamidas) y óxidos de trialquilamina.

25 Entre los tensioactivos aniónicos preferidos se incluye jabón, sulfatos y sulfonatos de alquil éter, alquilbencensulfonatos, sulfosuccinatos de alquilo y de dialquilo, isetonatos de acilo C₈-C₂₀, fosfatos de éteres de alquilo C₈-C₂₀, sarcosinatos C₈-C₂₀, lactatos de acilo C₈-C₂₀, sulfoacetatos y combinaciones de los mismos.

Entre los tensioactivos anfóteros se incluye cocoamidopropilbetaína, trialquil C₁₂₋₂₀ betaínas, lauroamfoacetato de sodio y laurdianfoacetato de sodio.

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

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

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

45 En las composiciones de uso final de la presente invención se pueden incluir también agentes de filtros solares. Son particularmente preferidos los materiales tales como p-metoxicinamato de etilhexilo, disponible como Parsol MCX®, Avobenceno, disponible como Parsol 1789® y benzofenona-3, también conocida como Oxibenzona. También se pueden emplear activos de filtros solares inorgánicos tales como dióxido de titanio y óxido de cinc. Las cantidades de los agentes de filtros solares cuando están presentes pueden variar generalmente del 0,1% al 30%, preferiblemente del 2% al 20%, óptimamente del 4% al 10% en peso de la composición de uso final.

50 Las composiciones antitranspirantes y desodorantes de la presente invención contendrán de forma ordinaria activos astringentes. Entre los ejemplos se incluye clorhidrato de aluminio, clorhidrex de aluminio, glicina clorhidrex de aluminio-circonio, sulfato de aluminio, sulfato de cinc, clorhidroglicinato de circonio y de aluminio, hidroxiclورو de circonio, lactato de circonio y aluminio, fenosulfonato de cinc y combinaciones de los mismos. Las cantidades de los astringentes pueden variar en cualquier punto desde aproximadamente el 0,5% hasta aproximadamente el 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 se incluye fluoruro sódico, fluoruro

estannoso y monofluorofosfato sódico. La cantidad de estos materiales estará determinada por la cantidad de fluoruro liberable, que debería variar entre aproximadamente 500 y aproximadamente 8800 ppm de la composición. Otros componentes de los dentífricos pueden incluir agentes desensibilizadores tales como nitrato potásico y nitrato de estroncio, edulcorantes tales como sacarina de sodio, aspartamo, sucralosa y acesulfamo potásico. Normalmente estarán también presentes espesantes, agentes opacificantes, abrasivos y colorantes.

De manera deseable, se pueden incorporar conservantes en las composiciones de uso final de esta invención para proteger contra el crecimiento de microorganismos potencialmente dañinos. Los conservantes particularmente preferidos son fenoxietanol, metilparaben, propilparaben, imidazolidinil urea, dimetiloldimetilhidantoína, sales de ácido etilendiaminotetraacético (EDTA), deshidroacetato de sodio, metilcloroisotiazolinona, metilisotiazolinona, yodopropinbutilcarbamatato 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 que varían entre el 0,01% y el 2% en peso de la composición de uso final.

Las composiciones de uso final de la presente invención pueden incluir vitaminas. Son vitaminas ilustrativas la vitamina A (retinol), vitamina B₂, vitamina B₃ (niacinamida), vitamina B₆, vitamina C, vitamina E, ácido fólico y biotina. También se pueden emplear derivados de las vitaminas. Por ejemplo, entre los derivados de la vitamina se incluye tetraisopalmitato de ascorbilo, fosfato de magnesio ascorbilo y glucósido de ascorbilo. Entre los derivados de vitamina E se incluye acetato de tocoferilo, palmitato de tocoferilo y lionoleato de tocoferilo. También se puede emplear DL-pantenol y derivados. La cantidad total de vitaminas cuando están presentes en composiciones de acuerdo con la presente invención puede variar del 0,001% al 10%, preferiblemente del 0,01% al 1%, óptimamente del 0,1% al 5% en peso de la composición de uso final.

Otro tipo de sustancia útil puede ser el de una enzima tal como amilasas, oxidasas, proteasas, lipasas y combinaciones. Es particularmente preferida la superóxido dismutasa, disponible en el mercado como Biocell SOD de Brooks Company, EE.UU.

Se pueden incluir en las composiciones de la invención los compuestos que aclaran la piel. Son sustancias ilustrativas el extracto de placenta, ácido láctico, niacinamida, arbutina, ácido kóico, ácido ferúlico, ácido 12-hidroxiesteárico, resorcinol y derivados, entre los que se incluye resorcinoles 4-sustituidos, y combinaciones de los mismos. Las cantidades de estos agentes pueden variar de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 10%, preferiblemente de aproximadamente el 0,5% a aproximadamente el 2% en peso de la composición de uso final.

Pueden estar presentes promotores de la descamación. Son ilustrativos los ácidos alfa-hidroxicarboxílicos y beta-hidroxicarboxílicos. El término "ácido" se entiende que incluye no sólo el ácido libre, sino también las sales, y los ésteres de alquilo o arilo C₁-C₃₀ de los mismos, y lactonas generadas por la eliminación de agua para formar estructuras de lactona cíclicas o lineales. Los ácidos representativos son glicólico, láctico y málico. El ácido salicílico es representativo de los ácidos beta-hidroxicarboxílicos. La cantidad de estos materiales cuando están presentes puede variar de aproximadamente el 0,01% a aproximadamente el 15% en peso de la composición de uso final.

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, camomila, regaliz, aloe vera, semilla de uva, cítrico unshui, corteza de sauce, salvia, tomillo y romero.

También se pueden incluir materiales tales como ácido lipoico, retinoxitrimetilsilano (disponible de Clariant Corp. bajo la marca comercial Silcare 1 M-75), deshidroepiandrosterona (DHEA) y combinaciones de los mismos. También pueden ser útiles las ceramidas (incluidas Ceramida 1, Ceramida 3, Ceramida 3B y Ceramida 6), así como las pseudoceramidas. Las cantidades de estos materiales pueden variar desde aproximadamente el 0,000001% a aproximadamente el 10%, preferiblemente desde aproximadamente el 0,0001% a aproximadamente el 1% en peso de la composición de uso final.

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

Son aditivos especialmente preferidos, adecuados para uso con los compuestos de amonio cuaternario estabilizados de esta invención, agentes humectantes tales como ureas sustituidas como urea de hidroximetilo, urea de hidroxietilo, urea de hidroxipropilo; bis (hidroximetil) urea; bis (hidroxietil) urea; bis (hidroxipropil) urea; urea de N,N'- dihidroximetilo; urea de N, N'-dihidroxietilol; urea de N, N'-di-hidroxipropilo; urea de N, N, N'-tri-hidroxietilo; tetra (hidroximetil) urea; tetra (hidroxietil) urea; tetra (hidroxipropil urea; N-metilo, urea de N'-hidroxietilo; urea de N-etil-N'-hidroxietilo; urea de N-hidroxipropil-N'- hidroxietilo y urea de N,N'dimetil-N-hidroxietilo o mezclas de los

mismos. Cuando aparece el término hidroxipropilo, el significado es genérico para 3-hidroxi-n-propilo, 2-hidroxi-n-propilo, 3-hidroxi-i-propilo o radicales 2-hidroxi-i-propilo. El más preferido es urea de hidroxietilo. Esta última está disponible en forma de líquido acuoso al 50% de la National Starch & Chemical Division de ICI bajo la marca registrada Hydrovance.

5 Las cantidades de urea sustituida, cuando se usan, en la composición de uso final de esta invención, varían desde aproximadamente el 0,01% a aproximadamente el 20% y, preferiblemente, de aproximadamente el 0,5% a aproximadamente el 15% y, lo más preferiblemente, de aproximadamente el 2% a aproximadamente el 10% en base al peso total de la composición de uso final, e incluyendo todos los intervalos subsumidos en ella.

10 Cuando se usan el compuesto de amonio estabilizado y la urea sustituida, en una realización especialmente muy preferida se usa al menos aproximadamente desde el 0,01% hasta aproximadamente el 25% y, preferiblemente, de aproximadamente el 0,2% a aproximadamente el 20% y, más preferiblemente, de aproximadamente el 1% a aproximadamente el 15% de un humectante, como glicerina, en base al peso total de la composición de uso final e incluyendo todos los intervalos subsumidos en ella.

15 Se puede 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, champús, acondicionadores y geles de ducha se emplean envases de plástico con una abertura en un extremo dispensador, cubierta con un cierre. Son cierres típicos las tapas de rosca, bombas sin aerosol y tapas de bisagra. El envase para antitranspirantes, desodorantes y depiladores puede suponer un recipiente con una bola deslizable en un extremo dispensador. De forma alternativa, estos tipos de
20 productos para el cuidado personal pueden ser suministrados como formulación de la composición en barra en un recipiente con un mecanismo propulsor en el que la barra se desliza sobre una plataforma hacia el orificio de dispensación. Como envase para antitranspirantes, cremas de afeitar y otros productos para el cuidado personal sirven botes metálicos presurizados mediante un propulsor y que tienen una boquilla nebulizadora. Las barras para baño pueden tener un envase constituido por un envoltorio celulósico o de plástico o una caja de cartón, o estar
25 envueltas en una película de plástico retractilado.

Las composiciones para uso final de la presente invención pueden tener cualquier forma. Estas formas pueden incluir lociones, cremas, formulaciones "roll-on", barras, espumas y nebulizadores con y sin aerosoles, y formulaciones que se aplican a telas (textiles no tejidos).

30 Se proporcionan los ejemplos siguientes para facilitar la comprensión de la presente invención. Los ejemplos no pretenden limitar el alcance de las reivindicaciones.

Ejemplo 1

35 Se combinaron soluciones acuosas que comprenden agua aproximadamente al 50% en peso y cloruro de dihidroxipropiltrimonio al 50% en peso con quelante de metal aproximadamente al 0,12% en peso y se agitaron para proporcionar una solución homogénea. Las soluciones se dividieron y almacenaron a 25°C y a 50°C durante periodos de hasta seis (6) meses. Se controló la generación de grupos trimonio (esto es, trimetilamina) y dicho control se pudo conseguir por medio de procedimientos conocidos empleando, por ejemplo, cromatografía de gases-espectrometría de masas o electroforesis de capilaridad con quimioluminiscencia generada.

Quelante de metal **

Porcentaje de generación de trimetilamina

40

Tabla 1

Solución de compuesto de amonio cuaternario al 50%*	Temperatura (°C)	DTPA	CDTA	EDTA	TTHA	HMDTP
1	25	43	125	--	70	--
2	25	6,7	--	120	--	70
3	25	Control				
1	50	66	120	108	87	
2	50	34	--	--	--	76

3	50	Control
<p>* Disponible en el mercado de Dow Chemical.</p> <p>** Velocidad de generación de trimetilamina = (velocidad de generación de trimetilamina con quelante de metal / velocidad de generación de trimetilamina sin quelante de metal) x 100.</p>		

Los resultados indican que la generación del grupo trimonio para los compuestos de amonio cuaternario se ve sorprendentemente obstaculizada cuando se usan quelantes de metal de acuerdo con esta invención.

5 DTPA = Ácido dietilentriaminopentaacético

CDTA = Ácido Ciclohexanodiaminotetraacético

EDTA = Ácido etilendiaminotetraacético

TTHA = Ácido trietilentetraminohexaacético

HMDTP = Fosfonato hexametilendiaminotetrametileno

10 **Ejemplo 2**

Se prepararon soluciones acuosas que comprenden cloruro de dihidroxipropiltrimonio al 50% y similares a las descritas en el Ejemplo 1. Los controles se almacenaron a 4°C y 25°C.

Tabla 2

Solución de compuesto de amonio cuaternario al 50%*	Quelante de metal	Temperatura (°C)	Velocidad de generación de trimetilamina * PPM / día
1	DTPA	25	0,0014
2	---	25	0,02
3	---	4	0,0038
* Determinado usando uno de los procedimientos conocidos descritos en el Ejemplo 1.			

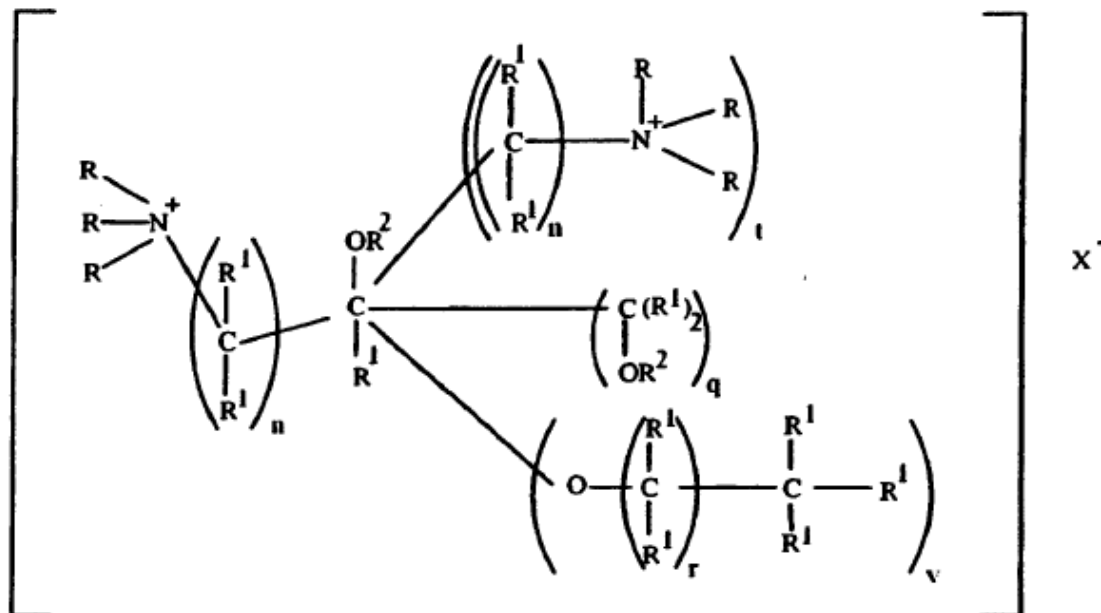
15

Los resultados indican que las composiciones realizadas de acuerdo con esta invención generan inesperadamente aproximadamente 14 veces menos trimetilamina por día que las composiciones sin quelantes y se almacenaron a la misma temperatura. Los resultados también indican que las composiciones realizadas de acuerdo con esta invención, inesperadamente, generan aproximadamente tres veces menos trimetilamina por día en comparación con composiciones sin quelantes aún almacenadas a temperaturas significativamente más frías. Por lo tanto, el transporte y el almacenamiento con estabilidad del producto se pueden lograr en ausencia de refrigeración cuando las composiciones se realizan de acuerdo con la presente invención.

20

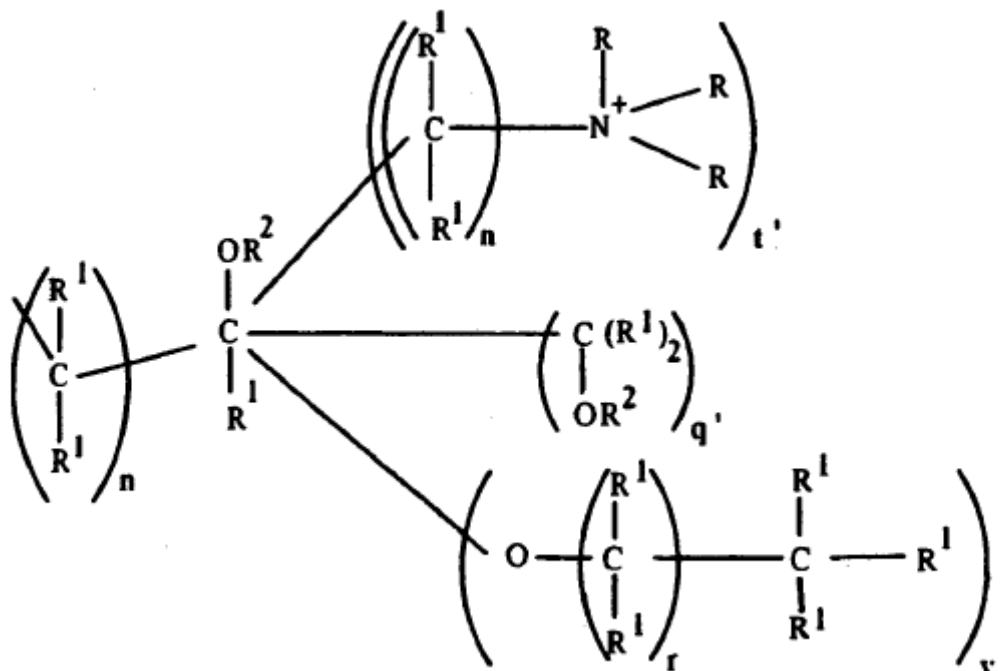
REIVINDICACIONES

1. Una composición que comprende un compuesto de amonio catiónico que 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 C₁₋₁₂, hidroxialquilo C₁₋₁₂ o



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 R¹ es independientemente un hidrógeno, alquilo C₁₋₁₂ o un hidroxialquilo C₁₋₁₂, cada R² es independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₃, 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, estando estabilizado el compuesto de amonio catiónico con un quelante de metal que comprende grupos amino y al menos aproximadamente 5 grupos carboxilato, un quelante de metal que comprende grupos amino y al menos

aproximadamente 4 grupos fosfonato o ambos.

2. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1 en la que el contraión aniónico es orgánico o inorgánico.

5 3. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1 en la que el quelante de metal comprende al menos tres grupos amino y al menos cinco grupos carboxilato, o al menos dos grupos amino y al menos cuatro grupos fosfonato o una mezcla de los mismos.

10 4. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1 en la que el compuesto de amonio catiónico se selecciona del grupo que comprende una sal de sacárido de hidroxipropiltri(alquil C₁-C₃)amonio monosustituido, una sal de polioles de hidroxipropiltri(alquil C₁-C₃) amonio monosustituidos, una sal de dihidroxipropiltri(alquil C₁-C₃)amonio, una sal de dihidroxipropildi(alquil C₁-C₃)mono(hidroxietyl)amonio, una sal de guarhidroxipropiltrimonio, sal de 2,3-dihidroxipropiltri(alquilo o hidroxialquilo C₁-C₃)amonio, y mezclas de los mismos.

5. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1 en la que el compuesto de amonio catiónico es cloruro de 1,2-dihidroxipropiltrimonio.

6. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, que además comprende un vehículo cosméticamente aceptable.

15 7. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6 en la que la composición es aplicada tópicamente al cuerpo.

8. Una composición de acuerdo con la reivindicación 7 en la que la composición es una composición permanente o que se elimina por enjuagado.

9. Una composición de acuerdo con la reivindicación 8 en la que la composición es una composición hidratante.

20 10. Una composición de acuerdo con la reivindicación 8 o la reivindicación 9 en la que la composición comprende del 0,02% al 30% en peso del compuesto de amonio catiónico y del 0,01% al 5% en peso de quelante.

11. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 10, en la que el quelante de metal es seleccionado del grupo que comprende ácido dietilentiaininopentaacético, ácido trietilentetraaminohexacético, ácido hexametilendiaminotetrametilen fosfónico, una sal de los mismos y una mezcla de los mismos.

25 12. Una composición de acuerdo con la reivindicación 11 en la que el quelante de metal es ácido dietilentiaininopentaacético.

13. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 12, en la que la composición comprende además un humectante.

30 14. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 13, en la que la composición comprende además una urea sustituida.

15. Una composición de acuerdo con la reivindicación 13 o la reivindicación 14 en la que el humectante es glicerina.

16. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 6 a 15, en la que el grupo que comprende nitrógeno es un grupo trimonio.

35 17. Un procedimiento para estabilizar un compuesto de amonio catiónico que comprende las etapas de:

- a) poner en contacto el compuesto de amonio catiónico con un quelante de metal; y
- b) impedir la formación de un grupo que comprenda nitrógeno,

40 en la que el quelante de metal comprende grupos amino y al menos cinco grupos carboxilato, grupos amino y al menos cuatro grupos fosfato o una mezcla de los mismos.