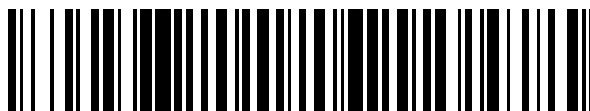


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 528 186**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/41** (2006.01)

**A61Q 19/00** (2006.01)

**C07C 213/04** (2006.01)

**C07C 217/28** (2006.01)

**A61Q 1/02** (2006.01)

**A61Q 5/02** (2006.01)

**A61Q 11/00** (2006.01)

**A61Q 15/00** (2006.01)

**A61Q 19/10** (2006.01)

**A61K 8/02** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **13.02.2007** **E 07703479 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.11.2014** **EP 1991198**

54 Título: **Composiciones de cuidado personal que contienen éter de dipropilo sustituido con trihidroxiamonio cuaternario**

30 Prioridad:

**07.03.2006 US 779858 P**

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

**05.02.2015**

73 Titular/es:

**UNILEVER N.V. (100.0%)**

**Weena 455**

**3013 AL Rotterdam, NL**

72 Inventor/es:

**HARICHIAN, BIJAN y**

**ROSA, JOSE GUILLERMO**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

ES 2 528 186 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 de cuidado personal que contienen éter de dipropilo sustituido con trihidroxi amonio cuaternario

## Antecedentes de la invención

La invención se refiere a composiciones de cuidado personal que proporcionan hidratación en entornos de humedad relativa alta y baja.

La piel seca es un problema en grado variable para la mayoría de los seres humanos. Esta condición es particularmente evidente en invierno. Los productos de cuidado personal tales como cremas/lociones cutáneas, champús/acondicionadores, pastillas de jabón/geles de ducha y antitranspirantes/desodorantes se formulan normalmente con al menos un material para tratar la piel seca. Síntomas tales como picor, descamación y una apariencia dérmica visualmente desagradable pueden ser modulados todos ellos en cierta medida.

Hay tres clases de materiales empleados contra el problema. Los elementos oclusivos tales como aceites de vaselina o de silicona sirven para inhibir la pérdida de humedad natural. Forman una barrera entre la epidermis y el medio ambiente. Otro enfoque es el uso de agentes queratolíticos para mejorar la tasa de exfoliación dérmica. Los ácidos alfa hidroxilo son los agentes más comunes para conseguir la exfoliación.

Un tercer enfoque para la piel seca es la aplicación tópica de humectantes. Generalmente, para este propósito, se usan sustancias orgánicas monoméricas y poliméricas hidroxiladas. La glicerina, conocida también como glicerol, es uno de los humectantes más eficaces.

Existen varias deficiencias en el rendimiento de los humectantes conocidos. Incluso el mejor humectante, tal como glicerina, requiere ser formulado a niveles relativamente altos para conseguir una buena humectación. En segundo lugar, los humectantes conocidos tienen un buen rendimiento en ambientes de humedad relativa alta; sin embargo, casi ninguna de estas sustancias proporciona eficacia a baja humedad relativa (es decir, menos del 20% de humedad a 20°C). La humedad relativa interior promedio durante el invierno es de aproximadamente el 13% en zonas tales como el noreste de Estados Unidos. Es bastante evidente que existe una necesidad real de una tecnología de hidratación mejorada.

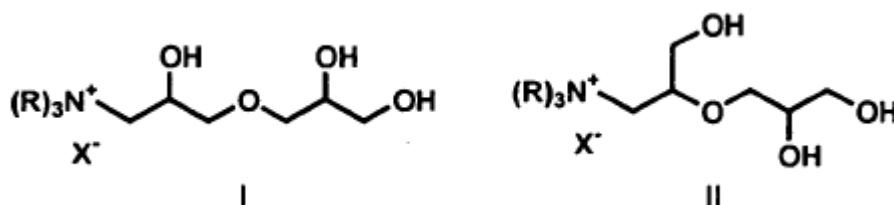
Se ha informado de que una crema hidratante conocida como Honeyquat 50 con el nombre INCI Miel Hidroxipropiltrimonio es un mejor humectante que la glicerina (véase el folleto de Arch/Brooks titulado "Cosmetic Ingredients & Ideas", Edición N° 2, Agosto de 2001). Honeyquat 50 se describe como derivado de la reacción de grupos hidroxilo pendientes (en el disacárido) de un grado "ligeramente" desodorizado de miel con un derivado de clorohidroxitrimetilamonio. Aunque esta sustancia tiene una excelente humectación, la hidratación a una humedad relativa baja sigue siendo una asignatura pendiente.

Por consiguiente, la presente invención busca identificar humectantes que sean operativos no solamente a alta humedad relativa sino también a baja humedad relativa, para su aplicación en productos de cuidado personal.

## Sumario de la invención

Se proporciona una composición para el cuidado personal que incluye:

- (i) de aproximadamente el 0,0000001 a aproximadamente el 10% en peso de un trihidroxi dipropil éter de amonio cuaternizado seleccionado de entre el grupo que consiste en la fórmula (I), (II) y sus mezclas.



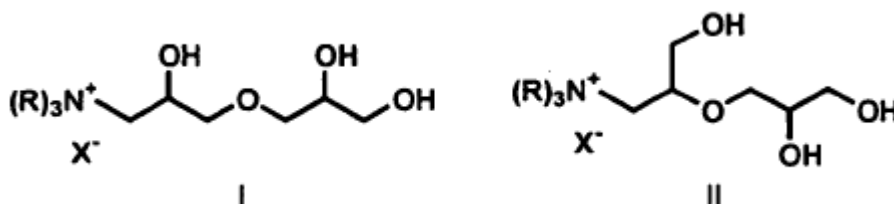
en la que R es el mismo o diferente grupo alquilo o hidroxialquilo C<sub>1-3</sub> y X<sup>-</sup> es un anión orgánico o inorgánico cosméticamente aceptable; y

- (ii) un vehículo cosméticamente aceptable.

## Descripción detallada de la invención

Ahora se ha encontrado que los éteres de dipropilo sustituidos con un amonio cuaternario y tres grupos hidroxilo son

excelentes hidratantes que proporcionan humectación en ambientes de humedad relativa alta y baja. Estos mono-éteres tienen la fórmula estructural (I) y (II):



en la que R es el mismo o diferente grupo alquilo C<sub>1-3</sub> o hidroxialquilo y X<sup>-</sup> es un anión orgánico o inorgánico cosméticamente aceptable.

Normalmente, el constituyente alquilo C<sub>1-3</sub> en el grupo amonio cuaternizado será metilo, etilo, n-propilo, isopropilo o hidroxietilo y sus mezclas. Particularmente preferente es un grupo trimetil amonio conocido a través de nomenclatura INCI como grupo "trimonio". Puede usarse cualquier anión en la sal de amonio cuaternario. El anión puede ser orgánico o inorgánico, con la condición de que el material sea cosméticamente aceptable. Los aniones inorgánicos típicos son haluros, sulfatos, fosfatos, nitratos y boratos. Los más preferentes son los haluros, especialmente cloruro. Los contraiones aniónicos orgánicos incluyen metosulfato, sulfato, acetato, citrato, tartrato, lactato, gluconato y bencenosulfonato de toluóilo.

Las cantidades de estos éteres de dipropilo pueden variar desde aproximadamente el 0,0000001 a aproximadamente el 10%, preferentemente de aproximadamente el 0,00001 a aproximadamente el 8%, más preferentemente de aproximadamente el 0,0001 a aproximadamente el 5%, todavía más preferentemente de aproximadamente el 0,001 a aproximadamente el 3%, incluso más preferentemente de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 1% en peso de la composición.

La síntesis de los éteres de dipropilo (V) y (VI) preferentes se consigue mediante cualquiera de los procedimientos sintéticos descritos a continuación:

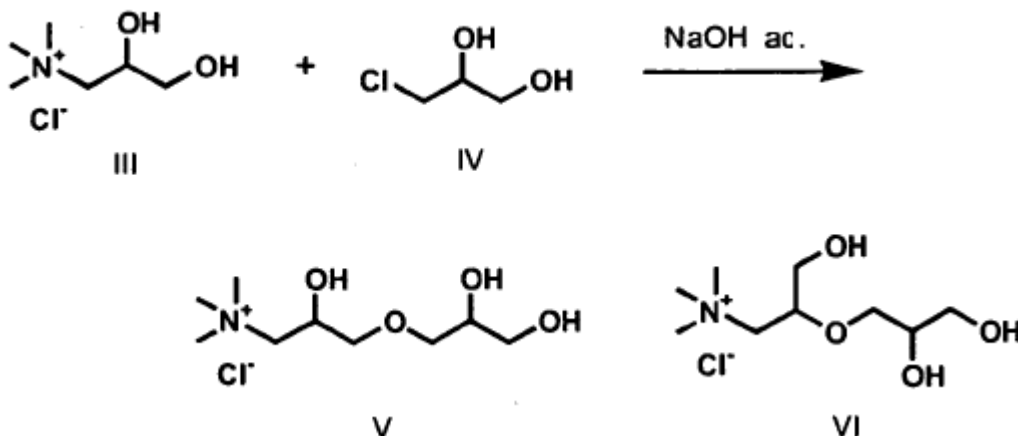
1) reacción de cloruro de 2,3-dihidroxiopropil trimetilamonio (III) con 1-cloro-2,3-dihidroxiopropano (IV) en presencia de hidróxido de sodio acuoso (NaOH ac.) (Esquema I);

2) tratamiento de cloruro de 2,3-dihidroxiopropil trimetilamonio (III) con hidruro de sodio (NaH) en N,N-dimetilformamida (DMF) o 1-metil-2-pirrolidinona (NMP), seguido de la adición de 1-cloro-2, 3-dihidroxiopropano (IV) (Esquema II);

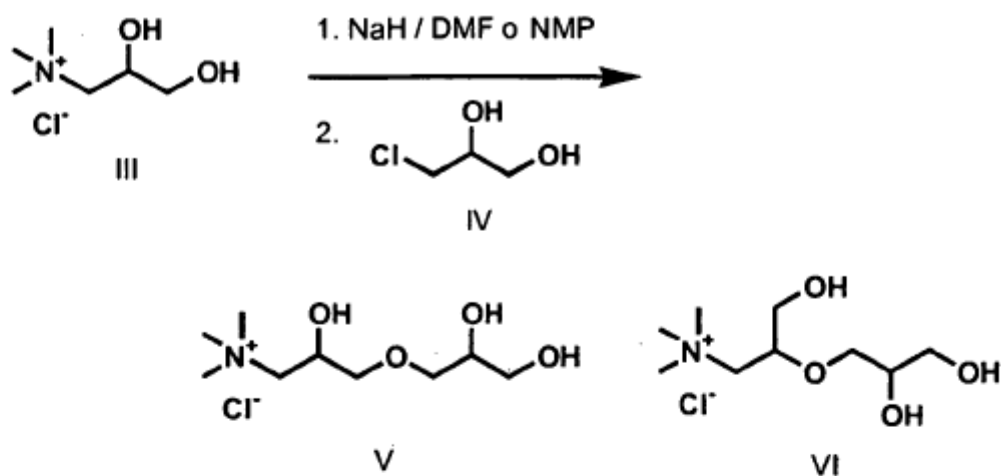
3) reacción de cloruro de 2,3-dihidroxiopropil trimetilamonio (III) con 4-clorometil-2,2-dimetil-1,3-dioxolano (VII) en medios de base acuosa, seguido de acidificación (Esquema III);

4) tratamiento de 2,2-dimetil-4-hidroximetil-1,3-dioxolano (VIII) con hidruro de sodio en N,N-dimetilformamida o 1-metil-2-pirrolidinona, seguido de la adición de 1,3-dicloro 2-propanol (IX) y la adición final de trimetilamina (X) (Esquema IV). Los esquemas de reacción para los procedimientos sintéticos descritos anteriormente se muestran a continuación.

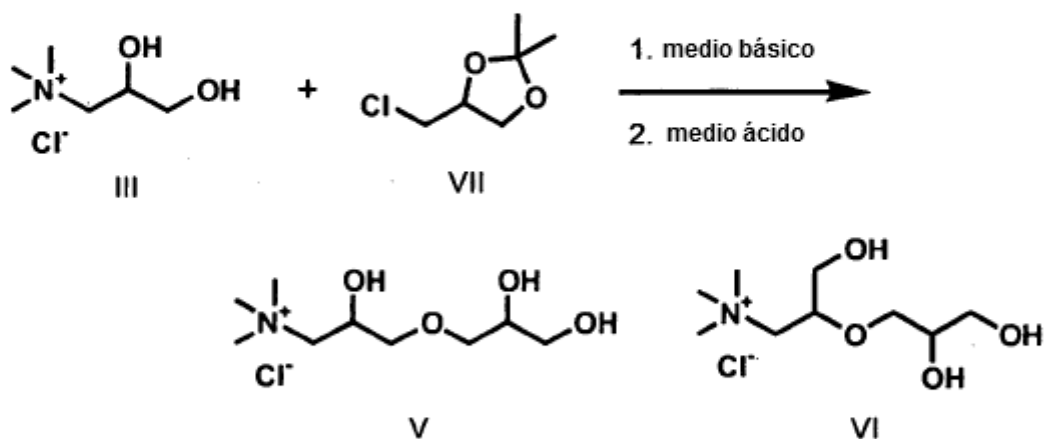
#### Esquema I



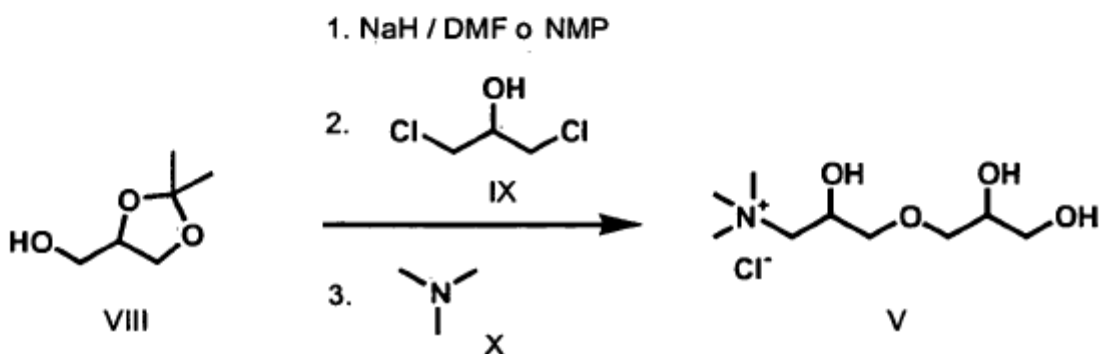
Esquema II



Esquema III



Esquema IV



De esta manera, la presente invención proporciona también nuevos materiales identificados por las estructuras (V) y (VI) y un proceso de fabricación según se ha indicado anteriormente. El proceso, en su forma general, hace reaccionar 1-cloro-2,3-dihidroxiopropano con sal de 2,3-dihidroxiopropil-1-tri(C<sub>1-3</sub>) amonio en una relación molar relativa que varía de aproximadamente 3:1 a aproximadamente 1:3, preferentemente de aproximadamente 1:1. La reacción se realiza en presencia de un material alcalino que puede ser hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de litio, óxido de calcio, hidróxido de calcio o carbonato de sodio. La reacción puede ser realizada en un medio prótico o aprótico. Preferentemente, el medio es prótico, especialmente agua. Sin embargo, otros disolventes útiles incluyen éter dietílico,

tetrahidrofurano, etanol, metanol, N,N-dimetilformamida, 1-metil-2-pirrolidinona y cualquiera de sus mezclas. De manera alternativa, la reacción puede realizarse pura, sin ningún disolvente. Las temperaturas del proceso pueden variar de 5°C a 200°C, preferentemente en el rango de 20 a 50°C.

5 De manera ventajosa, las composiciones de la presente invención pueden incluir también sales de 2,3-dihidroxipropil tri(alquilo  $C_{1-3}$  o hidroxialquilo) amonio, en el que el alquilo y la sal corresponden a R y X de la fórmula (I) y/o (II). El más preferente para la sal no-éter de amonio cuaternario es el cloruro de 2,3-dihidroxipropil trimetil amonio. Cuando el éter dipropílico y las sales no-éter cuaternarias se formulan juntos, pueden estar presentes en una relación en peso que varía de aproximadamente 1:1 a aproximadamente 1:10.000, preferentemente de aproximadamente 110 a aproximadamente 1:5.000, más preferentemente de aproximadamente 1:100 a aproximadamente 1:1000.

10 La expresión composición de cuidado personal hace referencia a cualquier sustancia aplicada a un cuerpo humano para mejorar la apariencia, la limpieza, el control de olores o la estética general. Los ejemplos no limitativos de composiciones de cuidado personal incluyen lociones y cremas para la piel sin aclarado, champús, acondicionadores, geles de ducha, jabones de tocador, antitranspirantes, desodorantes, productos dentales, cremas de afeitar, depilatorios, barras de labios, bases de maquillaje, rimel, bronceadores sin sol y lociones de protección solar.

15 Las composiciones de la presente invención incluirán también un vehículo cosméticamente aceptable. Las cantidades del vehículo pueden variar de aproximadamente el 1 a aproximadamente el 99,9%, preferentemente de aproximadamente el 70 a aproximadamente el 95%, óptimamente de aproximadamente el 80 a aproximadamente el 90% en peso de la composición. Entre los vehículos útiles están agua, emolientes, ácidos grasos, alcoholes grasos, espesantes y sus combinaciones. El vehículo puede ser acuoso, anhidro o una emulsión. Preferentemente, las composiciones son acuosas, especialmente emulsiones de agua y aceite de la variedad agua/aceite o aceite/agua o triple agua/aceite/agua. Cuando está presente, el agua puede estar en cantidades que varían desde aproximadamente el 5 a aproximadamente el 95%, preferentemente de aproximadamente el 20 a aproximadamente el 70%, óptimamente de aproximadamente el 35 a aproximadamente el 60% en peso.

20 Los materiales emolientes pueden servir como vehículos cosméticamente aceptables. Estos pueden estar en forma de aceites de silicona, ésteres naturales o sintéticos e hidrocarburos. Las cantidades de los emolientes pueden variar en cualquier lugar de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 95%, preferentemente de aproximadamente el 1 a aproximadamente el 50% en peso de la composición.

25 Los aceites de silicona pueden dividirse en la variedad volátil y la variedad no volátil. El término "volátil", tal como se usa en la presente memoria, se refiere a aquellos materiales que tienen una presión de vapor medible a temperatura ambiente. Los aceites de silicona volátiles se eligen preferentemente entre polidimetilsiloxanos cíclicos (ciclometicona) o lineales que contienen de 3 a 9, preferentemente de 4 a 5, átomos de silicio.

30 Los aceites de silicona no volátiles útiles como un material emoliente incluyen polialquilsiloxanos, copolímeros de polialquilarilsiloxanos y poliéter siloxano. Los polialquilsiloxanos esencialmente no volátiles útiles en la presente memoria incluyen, por ejemplo, polidimetil siloxanos con viscosidades de aproximadamente  $5 \times 10^{-6}$  a  $0,1 \text{ m}^2/\text{s}$  a 25°C. Entre los emolientes no volátiles preferentes útiles en las presentes composiciones están los polidimetilsiloxanos que tienen viscosidades de aproximadamente  $1 \times 10^{-5}$  a aproximadamente  $4 \times 10^{-4} \text{ m}^2/\text{s}$  a 25°C.

35 Otra clase de siliconas no volátiles incluyen elastómeros de silicona emulsionantes y no emulsionantes. El representante de esta categoría es un polímero cruzado dimeticona/vinil dimeticona (disponible como Dow Corning 9040, General Electric SFE 839, y Shin-Etsu KSG-18). Las ceras de silicona tales como Silwax WS-L (laurato de dimeticona copoliol) también pueden ser útiles.

40 Entre los emolientes éster están:

a) Ésteres de alquilo de ácidos grasos saturados que tienen de 10 a 24 átomos de carbono, cuyos ejemplos incluyen neopentanoato de behenilo, isononanoato de isononilo, miristato de isopropilo y estearato de octilo.

b) Éter-ésteres tales como ésteres de ácidos grasos de alcoholes grasos saturados etoxilados.

45 c) Ésteres de alcoholes polihidroxilados, tales como mono y di-ésteres de ácidos grasos de etilenglicol, mono y di-ésteres de ácidos grasos de dietilenglicol, mono y di-ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol (200-6000), mono y di-ésteres de ácidos grasos de propilenglicol, monoestearato de propilenglicol 2000, monoestearato de popilenglicol etoxilado, mono y di-ésteres de ácidos grasos de glicerilo, poli ésteres de ácidos grasos de poliglicerol, monoestearato de glicerilo etoxilado, monoestearato de 1,3-butilenglicol, diestearato de 1,3-butilenglicol, éster de ácido graso de poliol polioxietileno, ésteres de ácidos grasos de sorbitán y ésteres de ácidos grasos de polioxietileno sorbitán, en particular ésteres de pentaeritritol, trimetilolpropano y neopentilglicol de alcoholes  $C_{1-C_{30}}$ .

50 d) Ésteres de ceras tales como cera de abejas, cera de espermaceti y cera tribehenina; y

e) Éster de azúcar de ácidos grasos tales como polibehenato de sacarosa y polialgodonato de sacarosa.

Los emolientes de ésteres naturales se basan principalmente en mono-, di- y tri-glicéridos. Los glicéridos representativos incluyen 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 ricino hidrogenado, aceite de salvado de arroz, aceite de soja, aceite de oliva, aceite de cártamo, manteca de karité, aceite de jojoba y sus combinaciones. Los emolientes derivados de animales están representados por aceite de lanolina y derivados de lanolina. Las cantidades de los ésteres naturales pueden variar de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 20% en peso de las composiciones.

Los hidrocarburos que son vehículos cosméticamente aceptables adecuados incluyen vaselina, aceite mineral, isoparafinas C<sub>11</sub>-C<sub>13</sub>, polibutenos y especialmente isohexadecano (disponible comercialmente como Permethyl 101A en Presperse Inc).

Los ácidos grasos que tienen de 10 a 30 átomos de carbono pueden ser adecuados también como vehículos cosméticamente aceptables. Los ejemplos ilustrativos de esta categoría son los ácidos pelargónico, láurico, mirístico, palmítico, esteárico, isoesteárico, oleico, linoleico, linolénico, hidroxiesteárico y behénico.

Los alcoholes grasos que tienen de 10 a 30 átomos de carbono son otra categoría útil de vehículo cosméticamente aceptable. Son ilustrativos de esta categoría alcohol estearílico, alcohol laurílico, alcohol mirístico, alcohol oleílico y alcohol cetílico.

Pueden usarse espesantes como parte del vehículo cosméticamente aceptable de las composiciones según la presente invención. Los espesantes típicos incluyen acrilatos reticulados (por ejemplo, Carbopol 982<sup>®</sup>), acrilatos modificados hidrófobamente (por ejemplo, Carbopol 1382<sup>®</sup>), poliacrilamidas (por ejemplo, Sepigel 305<sup>®</sup>), polímeros y copolímeros de sal/ácido acrilóilmetilpropan sulfónico (por ejemplo, Aristoflex HMB<sup>®</sup> y AVC<sup>®</sup>), derivados celulósicos y gomas naturales. Entre los derivados celulósicos útiles están carboximetilcelulosa sódica, hidroxipropil metocelulosa, hidroxipropil celulosa, hidroxietil celulosa, etil celulosa e hidroximetil celulosa. Las gomas naturales adecuadas para la presente invención incluyen guar, xantano, sclerotium, carragenano, pectina y combinaciones de estas gomas. También pueden usarse espesantes inorgánicos como espesantes, particularmente arcillas tales como bentonitas y hectoritas, sílices de pirólisis, talco, carbonato de calcio y silicatos tales como silicato de magnesio y aluminio (Veegum<sup>®</sup>). Las cantidades del espesante pueden variar del 0,0001 al 10%, normalmente del 0,001 al 1%, óptimamente del 0,01 al 0,5% en peso de la composición.

Pueden emplearse humectantes adjuntos en la presente invención. Generalmente, estos son materiales de tipo alcohol polihídrico. Los alcoholes polihídricos típicos incluyen glicerol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, polietilenglicol, sorbitol, hidroxipropil sorbitol, hexilenglicol, 1,3-butilenglicol, glicol de isopreno, 1,2,6-hexanotriol, glicerol etoxilado, glicerol propoxilado y sus mezclas. La cantidad de humectante adjunto puede variar en cualquier lugar del 0,5 al 50%, preferentemente entre el 1 y el 15% en peso de la composición:

Las composiciones para el cuidado personal de la presente invención pueden estar en cualquier forma. Estas formas pueden incluir formulaciones aplicadas en lociones, cremas, formulaciones de tipo "roll-on", barras, espumas, aerosoles y no aerosoles y tela (por ejemplo, textil no tejido).

También puede haber tensioactivos presentes en las composiciones de la presente invención. La concentración total del tensioactivo, cuando está presente, puede variar de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 90%, preferentemente de aproximadamente el 1 a aproximadamente el 40%, óptimamente de aproximadamente el 1 a aproximadamente el 20% en peso de la composición, y siendo dicha concentración altamente dependiente del tipo de producto de cuidado personal. El tensioactivo puede ser seleccionado de entre el grupo que consiste en tensioactivos aniónicos, no iónicos, catiónicos y anfóteros activos. Los tensioactivos no iónicos particularmente preferentes son aquellos con un alcohol graso C<sub>10</sub>-C<sub>20</sub> o ácido hidrófobo condensado con de 2 a 100 moles de óxido de etileno u óxido de propileno por mol de hidrófobo; alquilo fenoles C<sub>2-10</sub> condensados con de 2 a 20 moles de óxido de alquilenos; mono- y di-ésteres de ácidos grasos de etilenglicol, monoglicérido de ácido graso; sorbitán, mono- y di- ácidos grasos C<sub>8-20</sub>; y polioxietilen sorbitán, así como sus combinaciones. Los poliglicósidos de alquilo y las amidas grasas de sacáridos (por ejemplo, metil gluconamidas) y óxidos de trialquilamina son también tensioactivos no iónicos adecuados.

Los tensioactivos aniónicos preferentes incluyen jabón, alquil éter sulfatos y sulfonatos, alquil sulfatos y sulfonatos, alquilbenceno sulfonatos, alquil y dialquil sulfosuccinatos, isetionatos de acilo C<sub>8-20</sub>, éter fosfatos de alquilo C<sub>8-20</sub>, sarcosinatos C<sub>8-20</sub>, lactilatos de acilo C<sub>8-20</sub>, sulfoacetatos y sus combinaciones.

Los tensioactivos anfóteros útiles incluyen cocoamidopropil betaína, trialquil betaínas C<sub>12-20</sub>, lauroanfoacetato de sodio, y laurodiafoacetato de sodio.

También pueden incluirse agentes de protección solar en las composiciones de la presente invención. Particularmente preferentes son los materiales tales como p-metoxicinamato de etilhexilo (disponible como Parsol MCX<sup>®</sup>), avobenceno (disponible como Parsol 1789<sup>®</sup>) y benzofenona-3 (conocida también como oxibenzona). Pueden emplearse filtros solares

inorgánicos activos, tales como dióxido de titanio microfino y óxido de zinc. Las cantidades de los agentes protectores solares, cuando están presentes, pueden variar generalmente en el intervalo del 0,1 al 30%, preferentemente del 2 al 20%, óptimamente del 4 al 10% en peso de la composición.

5 Las composiciones antitranspirantes y desodorantes de la presente invención contendrán normalmente activos astringentes. Los ejemplos incluyen cloruro de aluminio, clorohidrex de aluminio, clorohidrex glicina aluminio-circonio, sulfato de aluminio, sulfato de cinc, clorohidroglicinato de circonio y aluminio, hidroxiclورو de circonio, lactato de circonio y aluminio, fenolsulfonato de cinc y sus combinaciones. Las cantidades de los astringentes pueden variar de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 50% en peso de la composición.

10 Los productos dentales formulados según la presente invención contendrán generalmente una fuente de fluoruro para prevenir la caries dental. Los activos anti-caries típicos incluyen fluoruro sódico, fluoruro estannoso y monofluorofosfato de sodio. Las cantidades de estos materiales vendrán determinadas por la cantidad de fluoruro liberable que debería oscilar entre aproximadamente 500 y aproximadamente 8.800 ppm de la composición. Otros componentes de los dentífricos pueden incluir agentes desensibilizantes tales como nitrato de potasio y nitrato de estroncio, edulcorantes tales como sacarina sódica, aspartamo, sucralosa, acesulfamo de potasio. Normalmente, también puede haber presentes  
15 espesantes, agentes opacificantes, abrasivos y colorantes.

Idealmente, pueden incorporarse conservantes en las composiciones de cuidado personal de la presente invención para proteger contra el crecimiento de microorganismos potencialmente dañinos. Los conservantes particularmente preferentes son fenoxietanol, metil parabeno, propil parabeno, imidazolidinil urea, dimetiloldimetilhidantoína, sales de ácido etilendiaminotetraacético (EDTA), deshidroacetato de sodio, metilcloroisotiazolinona, metilisotiazolinona, iodopropinbutilcarbamato y alcohol bencílico. Los conservantes deberían ser seleccionados teniendo en cuenta el uso de la composición y las posibles incompatibilidades entre los conservantes y otros ingredientes. Los conservantes se emplean preferentemente en cantidades que varían del 0,01% al 2% en peso de la composición.

20 Las composiciones de la presente invención pueden incluir vitaminas. Las vitaminas ilustrativas son 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 pueden emplearse derivados de las vitaminas. Por ejemplo, los derivados de la vitamina C incluyen tetraisopalmitato de ascorbilo, ascorbil fosfato de magnesio y glucósido de ascorbilo. Los derivados de la vitamina E incluyen acetato de tocoferilo, palmitato de tocoferilo y linoleato de tocoferilo. También pueden emplearse DL-pantenol y sus derivados. Para los propósitos de la presente invención, cuando están presentes, las vitaminas no se consideran como materiales insaturados. La cantidad total de vitaminas, cuando están presentes en las composiciones según la presente invención,  
30 puede variar del 0,001 al 10%, preferentemente del 0,01% al 1%, óptimamente del 0,1 al 0,5% en peso de la composición.

Otro tipo de sustancia útil puede ser la de una enzima tal como amilasas, oxidasas, proteasas, lipasas y sus combinaciones. Particularmente preferente es la superóxido dismutasa (disponible comercialmente como Biocell SOD en Brooks Company, EE.UU.).

35 Pueden incluirse compuestos para aclarar la piel en las composiciones de la invención. Las sustancias ilustrativas son extracto de placenta, ácido láctico, niacinamida, arbutina, ácido kójico, ácido ferúlico, resorcinol y derivados que incluyen resorcinoles 4-sustituidos y sus combinaciones. Las cantidades de estos agentes pueden variar de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10%, preferentemente de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 2% en peso de la composición.

40 Puede haber presentes promotores de descamación. Son ilustrativos los ácidos alfa-hidroxicarboxílicos y los ácidos beta-hidroxicarboxílicos. El término "ácido" pretende incluir no sólo el ácido libre sino también sales y sus ésteres de alquilo o arilo C<sub>1-30</sub> y lactonas generadas a partir de la eliminación de agua para formar estructuras de lactona cíclicas o lineales. Los ácidos representativos son ácido glicólico, láctico y málico. El ácido salicílico es representativo de los ácidos beta-hidroxicarboxílicos. Las cantidades de estos materiales, cuando están presentes, pueden variar de aproximadamente el  
45 0,01 a aproximadamente el 15% en peso de la composición. Opcionalmente, pueden incluirse una diversidad de extractos de hierbas en las composiciones de la presente invención. Los extractos pueden ser solubles en agua o insolubles en agua transportados en un disolvente que es respectivamente hidrófilo o hidrófobo. El agua y el etanol son los disolventes de extracto preferentes. Los extractos ilustrativos incluyen los de té verde, manzanilla, regaliz, aloe vera, semillas de uva, satsuma, corteza de sauce, salvia, tomillo y romero.

50 También pueden incluirse materiales tales como ácido lipoico, retinoxitrimetilsilano (disponible en Clariant Corp. bajo la marca registrada Silcare 1M-75), dehidroepiandrosterona (DHEA) y sus combinaciones. Las ceramidas (incluyendo Ceramida 1, Ceramida 3, Ceramida 3B y Ceramida 6) así como las pseudoceramidas pueden ser también útiles. Las cantidades de estos materiales pueden variar de aproximadamente el 0,000001 a aproximadamente el 10%, preferentemente de aproximadamente el 0,0001 a aproximadamente el 1% en peso de la composición.

Pueden incluirse también colorantes, opacificantes y abrasivos en las composiciones de la presente invención. Cada una de estas sustancias puede variar de aproximadamente el 0,05 a aproximadamente el 5%, preferentemente entre el 0,1 y el 3% en peso de la composición.

5 Opcionalmente, las composiciones de la presente invención también pueden ser incorporadas a un sustrato insoluble para su aplicación a la piel, tal como en la forma de una toallita tratada.

Pueden emplearse una amplia variedad de envases para almacenar y suministrar las composiciones de cuidado personal. Frecuentemente, el envase depende del tipo de uso final para el cuidado personal. Por ejemplo, las cremas y lociones para la piel sin aclarado, champús, acondicionadores y geles de ducha emplean generalmente recipientes de plástico con una abertura en un extremo de dispensación cubierto mediante un cierre. Los cierres típicos son tapones de rosca, bombas sin aerosol y tapas articuladas de tipo volcable ("flip-top"). El envase para antitranspirantes, desodorantes y cremas depilatorias puede implicar un recipiente con una bola de tipo "roll-on" en un extremo de dispensación. De manera alternativa, estos tipos de productos de cuidado personal pueden ser suministrados en una formulación de composición de pastilla en un recipiente con un mecanismo de propulsión-repulsión en el que la pastilla se mueve sobre una plataforma hacia un orificio de dispensación. Las latas metálicas presurizadas por un propulsor y que tienen una boquilla de pulverización sirven como un envase para antitranspirantes, cremas de afeitado y otros productos para el cuidado personal. Las pastillas de jabón pueden tener un envase constituido por un envoltorio celulósico o plástico o dentro de una caja de cartón o incluso incluida en una protección de plástico retráctil.

20 La expresión "que comprende" no pretende limitar ningún elemento indicado posteriormente sino más bien pretende abarcar elementos no especificados de mayor o menor importancia funcional. En otras palabras, las etapas, los elementos o las opciones enumerados no necesitan ser exhaustivos. Siempre que se usan las expresiones "que incluye" o "que tiene", estas expresiones pretenden ser equivalentes a "que comprende", tal como se ha definido anteriormente.

Excepto en los ejemplos operativos y comparativos, o donde se indique explícitamente lo contrario, todos los números que indican cantidades de material en la presente descripción deberían entenderse como modificados por la palabra "aproximadamente".

25 Todos los documentos a los que se hace referencia en la presente memoria, incluyendo todas las patentes, solicitudes de patentes y publicaciones impresas, se incorporan por referencia en su totalidad a la presente divulgación.

Los ejemplos siguientes ilustrarán más completamente las realizaciones de la presente invención. Todas las partes, porcentajes y proporciones indicados en la presente memoria y en las reivindicaciones adjuntas son en peso, a menos que se indique lo contrario.

### 30 **Ejemplo 1a**

Este ejemplo informa de la síntesis de cloruro de éter 1-trimetilamonio-2,5,6-trihidroxidipropil y cloruro de éter de 1-trimetilamonio-2-hidroximetil-4,5-dihidroxipropil etilo. A una solución de cloruro de 2,3-dihidroxipropil trimetilamonio (500 mg, 2,95 mmol) en hidróxido de sodio acuoso (2,95 ml, 2,95 mmol) se añadió 1-cloro-2,3-dihidroxipropano (247 µL, 2,95 mmol). La solución resultante se agitó a temperatura ambiente hasta que el pH disminuyó a <9. La solución se lavó con éter y la capa acuosa se evaporó bajo presión reducida a 50°C dando un jarabe incoloro heterogéneo. Una filtración a través de lana de vidrio proporcionó una mezcla isomérica de cloruro de éter de 1-trimetilamonio-2,5,6-trihidroxidipropilo y cloruro de éter de 1-trimetilamonio-2-hidroximetil-4,5-dihidroxipropil etilo como un jarabe homogéneo.

### **Ejemplo 1b**

40 Este ejemplo informa de la síntesis de cloruro de éter 1-trimetilamonio-2,5,6-trihidroxidipropilo y cloruro de éter de 1-trimetilamonio-2-hidroximetil-4,5-dihidroxipropil etilo. El cloruro de 2,3-dihidroxipropil trimetilamonio (500 mg, 2,95 mmol) se añade a una suspensión de hidruro de sodio (2,95 mmol) en N,N-dimetilformamida o 1-metil-2-pirrolidona (3-10 ml) y la mezcla resultante se agita a temperatura ambiente hasta que cesa la evolución gaseosa. A continuación, esta mezcla se añade a 1-cloro-2,3-dihidroxipropano (247 µL, 2,95 mmol) y la mezcla resultante se agita a temperatura ambiente hasta que el pH disminuye a <9. El disolvente se elimina bajo presión reducida a 50°C y el residuo se disuelve en agua y se lava varias veces con éter. La eliminación del agua bajo presión reducida a 50°C, seguido por filtración a través de lana de vidrio proporciona una mezcla isomérica de cloruro de éter 1-trimetilamonio-2,5,6-trihidroxidipropilo y cloruro de éter de 1-trimetilamonio-2-hidroximetil-4,5-dihidroxipropil etilo como un jarabe homogéneo.

### **Ejemplo 1c**

50 Este ejemplo informa de la síntesis de cloruro de éter 1-trimetilamonio-2,5,6-trihidroxidipropilo y cloruro de éter de 1-trimetilamonio-2-hidroximetil-4,5-dihidroxipropil etilo. A una solución de cloruro de 2,3-dihidroxipropil trimetilamonio (500 mg, 2,95 mmol) en hidróxido de sodio acuoso (2,95 ml, 2,95 mmol) se añade 4-clorometil-2,2-dimetil-1,3-dioxolano (418 µL, 2,95 mmol). La solución resultante se agita a temperatura ambiente hasta que el pH disminuye a <9 y se lava



adicionalmente con éter. Se añade ácido acético glacial (8 ml) y la solución se agita a temperatura ambiente durante 16 horas. La solución se evapora bajo presión reducida a 50°C dando un jarabe incoloro heterogéneo. Una filtración a través de lana de vidrio proporciona una mezcla isomérica de cloruro de éter 1-trimetilamonio-2,5,6-trihidroxi-dipropilo y cloruro de éter de 1-trimetilamonio-2-hidroxi-metil-4,5-dihidroxi-propil etilo como un jarabe homogéneo.

#### 5 Ejemplo 1d

Este ejemplo informa de la síntesis de cloruro de éter 1-trimetil-2,5,6-trihidroxi-dipropilo. Se añade 2,2-dimetil-4-hidroxi-metil-1,3-dioxolano (367  $\mu$ l, 2,95 mmol) a una suspensión de hidruro de sodio (2,95 mmol) en N,N-dimetilformamida o 1-metil-2-pirrolidona (3 -10 ml) y la mezcla resultante se agita a temperatura ambiente hasta que cesa la evolución gaseosa. A continuación, esta mezcla se añade a 1,3-cloro-2-propanol (281  $\mu$ l, 2,95 mmol) y la mezcla resultante se agita a temperatura ambiente hasta que el pH disminuye a <9. El disolvente se elimina bajo presión reducida a 50°C y el residuo se disuelve en agua y se lava varias veces con éter. Una eliminación del agua bajo presión reducida a 50°C, seguida por filtración a través de lana de vidrio proporciona cloruro de éter 1-trimetilamonio-2,5,6-trihidroxi-dipropilo como un jarabe homogéneo.

#### Ejemplo 2

15 Una composición para el cuidado personal representativa de la presente invención en la forma de una loción cosmética se resume en la Tabla I.

Tabla I

INGREDIENTE	% EN PESO
FASE A	
Agua	Resto
EDTA disódico	0,05
Metilparabeno	0,15
Silicato de magnesio y aluminio	0,60
Trietanolamina	1,20
Sal de trihidroxi dipropiléter amonio cuaternizado del ejemplo 1c	1,00
FASE B	
Goma xantana	0,20
Natrosol® 250HHR (etilcelulosa)	0,50
Butilenglicol	3,00
Glicerina	2,00
FASE C	
Estearoil lactilato de sodio	0,10
Monestearato de glicerol	1,50
Alcohol estearílico	1,50
Palmitato de isostearilo	3,00
Fluido de silicona	1,00
Colesterol	0,25

(Cont.)

Estearato de sorbitan	1,00
Hidroxi tolueno butilado	0,05
Acetato de vitamina E	0,01
Estearato PEG-100	2,00
Ácido esteárico	3,00
Propil paraben	0,10
Parsol MCX <sup>®</sup>	2,00
Triglicérido caprílico/cáprico	0,50
Ácido hidroxicaprílico	0,01
Alquil octanoato C12-15	3,00
FASE D	
Palmitato de vitamina A	0,10
Bisabolol	0,01
Acetato de vitamina A	0,01
Fragancia	0,03
Retinol 50C	0,02
Ácido linoleico conjugado	0,50

**Ejemplo 3**

Una base de maquillaje de agua-en-aceite, líquida, tópica según invención se describe en la Tabla II dada a continuación.

5

TABLA II

INGREDIENTE	% EN PESO
FASE A	
Ciclometicona	9,25
Oleato de oleilo	2,00
Copoliol dimeticona	20,00
FASE B	
Talco	3,38
Pigmento (óxidos de hierro)	10,51
Spheron L-1500 (Sílice)	0,50
FASE C	
Cera sintética Durachem 0602	0,10

(Cont.)

Behenato de araquidilo	0,30
FASE D	
Ciclometicona	1,00
Trihidroxiestearina	0,30
FASE E	
Laureth-7	0,50
Propil parabeno	0,25
FASE F	
Fragancia	0,05
FASE G	
Agua	Resto
Sal de trihidroxi dipropiléter amonio cuaternizado del ejemplo 1a	3,00
Metil parabeno	0,12
Propilenglicol	8,00
Niacinamida	4,00
Glicerina	3,00
Cloruro de sodio	2,00
Deshidroacetato de sodio	0,30

**Ejemplo 4**

5 Aquí se ilustra una crema para la piel que incorpora una sal dipropil éter de la presente invención y una sal no-éter de amonio cuaternario.

TABLA III

INGREDIENTE	% EN PESO
Glicerina	6,93
Niacinamida	5,00
Cloruro de 2,3-dihidroxipropil trimetil amonio	5,00
Permethyl 101A <sup>1</sup>	3,00
Sepigel 305 <sup>2</sup>	2,50
Q2-1403 <sup>3</sup>	2,00
Aceite de linaza	1,33
Arlatone 2121 <sup>4</sup>	1,00

(Cont.)

Alcohol cetílico CO-1695	0,72
Algodonato SEFA <sup>5</sup>	0,67
Acetato de tocoferol	0,50
Pantenol	0,50
Alcohol estearílico	0,48
Dióxido de titanio	0,40
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1a	0,10
EDTA disódico	0,10
Glydant Plus <sup>6</sup>	0,10
Estearato PEG-100	0,10
Ácido esteárico	0,10
Agua Purificada	Resto
<sup>1</sup> Isohexadecano (Presperse Incorporated, South Plainfield, NJ) <sup>2</sup> Poliacrilamida e isoparafina C <sub>13-14</sub> y Laureth-7 (Seppic Corporation, Fairfield, NJ) <sup>3</sup> Dimeticona y dimeticonol (Dow Corning Corporation, Midland, MI) <sup>4</sup> Monestearato y sucrococoato de sorbitán (ICI Americas Incorporated, Wilmington, DE) <sup>5</sup> Éster de ácidos grasos de sacarosa <sup>6</sup> Hidantoína DMDM y butilcarbamato de yodopropinilo (Lonza Incorporated, Fairlawn, NJ)	

#### Ejemplo 5

5 Ilustrativa de otra composición cosmética que incorpora una sal de éter de dipropilo según la presente invención es la fórmula de la Tabla IV.

TABLA IV

INGREDIENTE	% EN PESO
Polisilicona-11	29
Ciclometicona	59
Vaselina	11
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1a	0,2
Diometicona copoliol	0,3
Aceite de girasol	0,5

#### Ejemplo 6

10 Una composición relativamente anhidra que incorpora una sal de éter de dipropilo de la presente invención se indica en la Tabla V.

TABLA V

INGREDIENTE	% EN PESO
Ciclometicona	80,65
Dimeticona	9,60
Escualano	6,00
Ácido isoesteárico	1,90
Aceite de semilla de borraja	0,90
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1b	0,50
Palmitato de retinilo	0,25
Ceramida 6	0,10
Tocoferol	0,10

**Ejemplo 7**

- 5 Una espuma limpiadora envasada con aerosol con una sal de dipropil éter adecuada para la presente invención se describe en la Tabla VI.

TABLA VI

INGREDIENTE	% EN PESO
Aceite de semilla de girasol	20,00
Aceite de soja maleado	5,00
Uretano de silicona	1,00
Oleato de poliglicero-4	1,00
Sulfonato de olefina C14-16 de sodio	15,00
Lauril éter sulfato de sodio (25% activo)	15,00
Cocoamidopropilbetaina	15,00
DC 1784 <sup>®</sup> (Emulsión de silicona al 50%)	5,00
Polyquaternium-11	1,00
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1b	1,00
Agua	Resto

**Ejemplo 8**

- 10 Se describe un producto de toallita de cuidado personal de un solo uso, desechable, según la presente invención. Se prepara una toallita no tejida 70/30 poliéster/rayón con un peso de 1,8 gramos y dimensiones de 15 cm por 20 cm. Sobre esta toallita se impregna una composición con una sal de dipropil éter, tal como se indica en la Tabla VII dada a continuación.

TABLA VII

INGREDIENTE	% EN PESO
Cloruro de 2,3-dihidroxi trimetil amonio	5,00
Glicerina	2,00
Hexilenglicol	2,00
Capril anfodiacetato disódico	1,00
Gluconolactona	0,90
Microemulsión de silicona	0,85
Witch Hazel	0,50
Aceite de ricino hidrogenado PEG-40	0,50
Fragancia (mezcla de terpenoides)	0,20
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1c	0,05
Acetato de vitamina E	0,001
Agua	Resto

**Ejemplo 9**

Una pastilla de jabón ilustrativa de la presente invención se describe en la Tabla VIII.

5

TABLA VIII

INGREDIENTE	% EN PESO
Jabón de sodio (85/15 sebo/coco)	77,77
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1a	3,50
Glicerina	2,50
Cloruro de sodio	0,77
Dióxido de titanio	0,40
Fragancia	1,50
EDTA disódico	0,02
Etidronato de sodio	0,02
Fluorescente	0,024
Agua	Resto

**Ejemplo 10**

Una composición de champú útil en el contexto de la presente invención se describe en la Tabla IX a continuación.

TABLA IX

INGREDIENTE	% EN PESO
Laureth sulfato de amonio	12,00
Lauril sulfato de amonio	2,00
Cocoamidopropilbetaina	2,00
Lauroanfoacetato de sodio	2,00
Cloruro de 2,3-dihidroxipropil trimetil amonio	1,50
Diestearato de etilenglicol	1,50
Cocomonoetanolamida	0,80
Alcohol cetílico	0,60
Polyquaternium-10	0,50
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1a	0,50
Dimeticona	1,00
Piridintona de zinc	1,00
Citrato de sodio	0,40
Ácido cítrico	0,39
Sulfonato de sodio xileno	1,00
Fragancia	0,40
Benzoato de sodio	0,25
Kathon CG <sup>®</sup>	0,0008
Alcohol bencílico	0,0225
Agua	Resto

**Ejemplo 11**

Este ejemplo ilustra una fórmula antitranspirante/desodorante que incorpora los activos hidratantes según la presente invención.

5

TABLA X

INGREDIENTE	% EN PESO
Ciclopentacicloxano	44
Dimeticona	20
Triclorohidrex glicinato de aluminio y circonio	15
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1c	5,0
Ácido triglicérico C <sub>18</sub> -C <sub>36</sub>	5,0

(Cont.)

Cera microcristalina	3,0
Glicerina	3,0
Sílice	2,5
Polímero cruzado de dimeticona	1,0
Fragancia	0,5
EDTA disódico	0,4
Hidroxitolueno butilado	0,3
Ácido cítrico	0,3

**Ejemplo 12**

Una pasta de dientes según la presente invención puede ser formulada con los ingredientes indicados en la Tabla XI.

5

TABLA XI

INGREDIENTE	% EN PESO
Zeodent 115 <sup>®</sup>	20,0
Glicerina	18,0
Goma xantana	7,00
Carboximetilcelulosa sódica	0,50
Bicarbonato de sodio	2,50
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1a	2,00
Laurilsulfato de sodio	1,50
Fluoruro de Sodio	1,10
Sacarina sódica	0,40
Dióxido de titanio	1,00
Pluronic F-127 <sup>®</sup>	2,00
FD & C Azul N° 1	3,30
Mentol	0,80
Nitrato de potasio	5,00
Agua	Resto

**Ejemplo 13**

Una loción hidratante de aceite-en-agua puede ser formulada con los ingredientes indicados en la Tabla XII.



TABLA XII

INGREDIENTE	% EN PESO
Agua	Resto
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1c	0,5
Glicerina	5,00
EDTA disódico	0,1
Metil parabeno	0,1
Niacinamida	0,5
Trietanolamina	0,25
D-pantenol	0,1
Deshidroacetato de sodio	0,1
Alcohol bencílico	0,25
GLW75CAP-MP <sup>1</sup>	0,5
Disetionato de hexamidina	0,1
Palmitoil pentapéptido <sup>2</sup>	0,0003
N-acetil glucosamina	1,0
Isoflavona de soja	0,5
Isohexadecano	3,0
Isostearato isopropílico	0,5
Alcohol cetílico	0,3
Alcohol estearílico	0,35
Alcohol behenílico	0,3
Estearato PEG-100	0,1
Glucósido cetearílico	0,1
Copolímero de acrilato de sodio / acriloldimetil tauarato de sodio / Isohexadecano / Polisorbato 80	3,0
Dimeticona/Dimeticonol	1,0
Polimetilsilsequioxano	0,5
Timiron Splendid Red <sup>3</sup>	1,0
<sup>1</sup> Dispersión de dióxido de titanio acuoso al 75% (disponible en Kobo)	
<sup>2</sup> Palmitoil-lisina-treonina-treonina-lisina-serina (disponible en Sederma)	
<sup>3</sup> Sílice y dióxido de titanio revestido con pigmento de interferencia rojo mica (disponible en Rona)	

**Ejemplo 14**

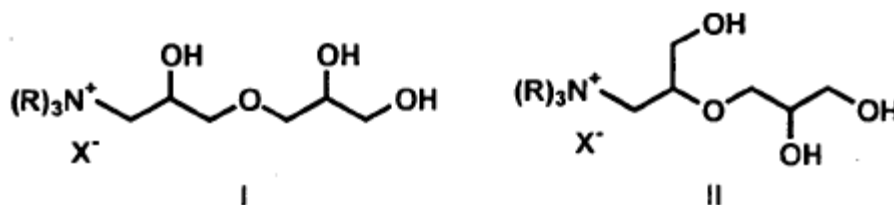
Aquí se ilustra una crema/loción hidratante de agua-en-silicona formulada con los ingredientes indicados en la Tabla XIII

TABLA XIII

INGREDIENTE	% EN PESO
Agua	Resto
Sal de trihidroxi dipropileter amonio cuaternizada del Ejemplo 1a	0,5
Alantoína	0,3
EDTA disódico	0,1
Etilparabeno	0,2
Propilparabeno	0,1
Cafeína	1,0
BHT	0,1
Dexpantenol	0,5
Glicerina	10,0
Niacinamida	2,0
Palmitoil pentapéptido <sup>1</sup>	0,0003
GLW75CAP-MP <sup>2</sup>	0,5
Timiron Splendid Red <sup>3</sup>	1,0
<sup>1</sup> Palmitoil-lisina-treonina-treonina-lisina-serina (disponible en Sederma)	
<sup>2</sup> Dispersión acuosa de dióxido de titanio al 75% (disponible en Kobo)	
<sup>3</sup> Sílice y dióxido de titanio revestido de pigmento de interferencia rojo mica (disponible en Rona)	

(i) del 0,0000001 al 10% en peso de un éter de trihidroxi dipropil amonio cuaternizado seleccionado de entre el grupo que consiste en la fórmula (I), (II) y sus mezclas

5



10 en la que R es el mismo o diferente grupo alquilo o hidroxialquilo  $C_{1-3}$  y X es un anión orgánico o inorgánico cosméticamente aceptable; y

2. Composición según la reivindicación 1, en la que R es un grupo metilo.

15 4. Composición según la reivindicación 1, que comprende además una sal de 2,3-dihidroxiopropil tri(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) amonio cuaternario.

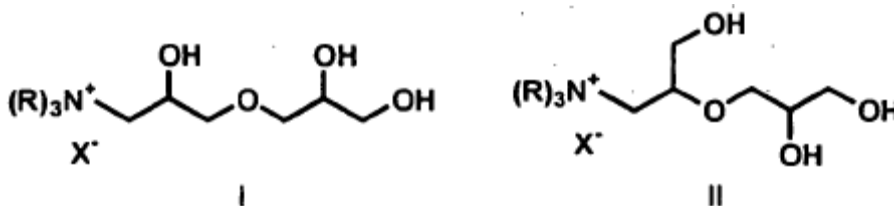
5. Composición según la reivindicación 4, en la que la relación de éter de trihidroxipropil amonio cuaternario a sal de 2,3-dihidroxipropil tri(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) amonio cuaternario varía de 1:1 a aproximadamente 1:10.000 en peso.

20 6. Composición según la reivindicación 5, en la que la relación varía de aproximadamente 1:10 a aproximadamente 1:5.000 en peso.

7. Composición según la reivindicación 5, en la que la relación varía de aproximadamente 1:100 a aproximadamente 1:1.000.

8. Composición según la reivindicación 4, en la que la sal de 2,3-dihidroxiopropil tri(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) amonio cuaternario es cloruro de 2,3-dihidroxiopropil trimetil amonio cuaternario.

25 9. Un compuesto que tiene la fórmula (I) o (II)



30

en la que R es el mismo o diferente grupo alquilo o hidroxialquilo  $C_{1-3}$  y X<sup>-</sup> es un anión orgánico o inorgánico cosméticamente aceptable.

10. Un compuesto según la reivindicación 9, en el que R es metilo y X<sup>-</sup> es cloruro.