

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[ 51 ] Int. Cl<sup>7</sup>  
**A61K 7/32**  
A61K 7/34 A61K 7/38  
A61K 7/36



[12] 发 明 专 利 说 明 书

[21] ZL 专利号 96198417.1

[45] 授权公告日 2004 年 6 月 16 日 [11] 授权公告号 CN 1153564C

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                      |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------|
| <p>[22] 申请日 1996.9.9 [21] 申请号 96198417.1</p> <p>[30] 优先权</p> <p>[32] 1995. 9. 27 [33] US [31] 08/534,277</p> <p>[86] 国际申请 PCT/US1996/014465 1996.9.9</p> <p>[87] 国际公布 WO1997/011678 英 1997.4.3</p> <p>[85] 进入国家阶段日期 1998.5.19</p> <p>[71] 专利权人 喜莲公司</p> <p>地址 美国伊利诺伊州</p> <p>[72] 发明人 M·M·帕尼施</p> <p>审查员 周英姿</p> | <p>[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司</p> <p>代理人 孟八一 温宏艳</p> |
| 权利要求书 5 页 说明书 21 页                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                      |

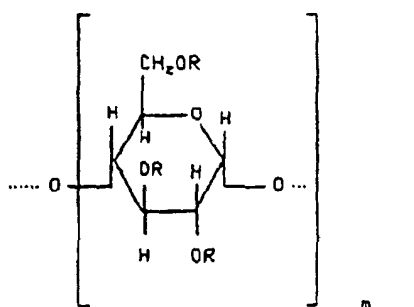
[54] 发明名称 抑汗除臭组合物

[57] 摘要

本发明公开了凝胶抑汗组合物，该组合物含有抑汗化合物、选自甾醇和淀粉水解产物 C<sub>8</sub> - C<sub>22</sub> 羧酸酯的胶凝剂、包括聚硅氧烷或烃类载体，此外，还可以选择性地含有脂肪醇、脂肪族酯、水或其混合物。 本发明还公开了气溶胶抑汗组合物。

I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

1. 凝胶抑汗组合物, 含有:
  - (a) 1%至 40% (重量) 的抑汗化合物;
  - (b) 2%至 15% (重量) 的胶凝剂, 所述胶凝剂选自含有 8 至 22 个碳原子的羧酸与淀粉水解产物形成的酯、甾醇及其混合物; 以及
  - (c) 10%至 90% (重量) 的载体, 包括聚硅氧烷、烃或其混合物。
2. 权利要求 1 的抑汗组合物, 还含有 0%至 30% (重量) 的水。
3. 权利要求 1 的抑汗组合物, 还含有 0%至 20% (重量) 的含 8 至 26 的碳原子的脂肪醇。
- 10 4. 权利要求 1 的抑汗组合物, 还含有 0%至 70% (重量) 的脂肪族酯。
5. 权利要求 1 的抑汗组合物, 还含有 0%至 30% (重量) 的水、0%至 20% (重量) 的含 8 至 26 个碳原子的脂肪酯、0%至 70% (重量) 的脂肪族酯及其混合物。
- 15 6. 权利要求 1 的抑汗组合物, 该组合物的透度计读数为 5 至 40。
7. 权利要求 1 的抑汗组合物, 其中的抑汗化合物是含有铝、锆、锌或其混合物的收敛盐。
8. 权利要求 1 的抑汗组合物, 其中的抑汗化合物选自水合氯化铝、水合四氯锆铝、与甘氨酸配合的水合多氯锆铝、水合三氯锆铝、水合八氯锆铝、水合倍半氯化铝、倍半氯代氢化脂肪酸铝 PG、氯化氢化脂肪酸铝 PEG、八氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物、五氯代氢化脂肪酸脂锆铝甘氨酸配合物、四氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物、三氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物、氯代氢化脂肪酸铝 PG、水合氯化锆、水合二氯化铝、二氯代氢化脂肪酸铝 PG、倍半氯代氢化脂肪酸铝 PG、氯化铝、水合五氯锆铝及其混合物。
- 20 9. 权利要求 1 的抑汗组合物, 其中的胶凝剂包括含有 8 至 22 个碳原子的羧酸与淀粉水解产物形成的酯。
10. 权利要求 9 的抑汗组合物, 其中的淀粉水解产物酯包括具有如下结构式的糊精脂肪酸酯:



其中，R 基团分别是氢原子或含有 8 至 22 个碳原子的酰基，条件是  
每个重复单元中至少有一个 R 基团是酰基，m 是 20 至 30 的整数。

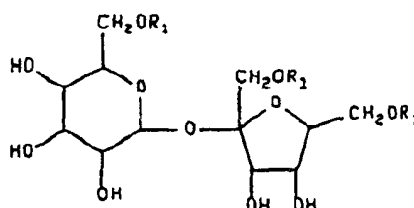
11. 权利要求 10 的抑汗组合物，其中至少有两个 R 基团是含有 8  
5 至 22 个碳原子的酰基。

12. 权利要求 10 的抑汗组合物，其中含有 8 至 22 个碳原子的酰基来自癸酸、壬酸、辛酸、十一酸、十一碳烯酸、月桂酸、肉豆蔻酸、十五酸、棕榈酸、十七酸、硬脂酸、十九酸、花生酸、油酸、亚油酸、亚麻酸或其混合物。

10 13. 权利要求 10 的抑汗组合物，其中的糊精脂肪酸酯包括糊精山箭酸酯、糊精月桂酸酯、糊精肉豆蔻酸酯、糊精棕榈酸酯、糊精硬脂酸酯或其混合物。

14. 权利要求 9 的抑汗组合物，其中的淀粉水解产物酯包括具有如下结构式的蔗糖脂肪酸酯：

15



其中，各 R<sub>1</sub> 基团分别是氢原子或含有 8 至 22 个碳原子的酰基，条件是至少一个 R<sub>1</sub> 基团是酰基。

15. 权利要求 14 的抑汗组合物，其中至少有两个 R<sub>1</sub> 基团是含有 8  
20 至 22 个碳原子的酰基。

16. 权利要求 14 的抑汗组合物，其中的蔗糖脂肪酸酯包括蔗糖二

硬脂酸酯、蔗糖可可酸酯、蔗糖二月桂酸酯、蔗糖油酸酯、蔗糖棕榈酸酯、蔗糖多月桂酸酯、蔗糖多亚油酸酯、蔗糖多油酸酯、蔗糖多硬脂酸酯、蔗糖蓖麻醇酸酯、蔗糖硬脂酸酯、蔗糖三山<sup>1</sup>箭酸酯、蔗糖三硬脂酸酯或其混合物。

- 5        17. 权利要求 9 的抑汗组合物，其中的淀粉水解产物选自单糖、二糖、三糖、多糖、环糊精及其混合物。

18. 权利要求 9 的抑汗组合物，其中的淀粉水解产物选自  $\alpha$ -环糊精、 $\beta$ -环糊精、 $\delta$ -环糊精、葡萄糖、果糖、甘露糖、蔗糖、麦芽糖、乳糖、麦芽三糖、棉子糖、松三糖、纤维素和壳多糖及其混合物。

- 10       19. 权利要求 1 的抑汗组合物，其中的胶凝剂包括甾醇。

20. 权利要求 19 的抑汗组合物，其中的甾醇包括二氢羊毛甾醇、羊毛甾醇、胆甾醇、谷甾醇、菜油甾醇、胆钙化甾醇、胆甾醇羟基硬脂酸酯、二氢胆甾醇、豆甾醇、 $\beta$ -谷甾醇、羊毛脂醇、大豆甾醇、浮油甾醇、鳄梨油不皂化物、橄榄油不皂化物、菜子油不皂化物、牛油树脂不皂化物、大豆油不皂化物或其混合物。

- 15       21. 权利要求 1 的抑汗组合物，其中的载体是挥发性聚硅氧烷化合物。

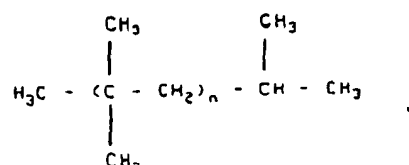
22. 权利要求 21 的抑汗组合物，其中的挥发性聚硅氧烷化合物是带有甲基、苯基的直链挥发性聚硅氧烷化合物或其混合物，其粘度为  
20    0.5 至 5 厘沱，常压下的沸点至高达 300℃。

23. 权利要求 21 的抑汗组合物，其中的挥发性聚硅氧烷化合物是平均每个分子具有 3 至 6 个  $[-O-Si(CH_3)_2-]$  重复基团单位的环状挥发性聚硅氧烷，其在常压下的沸点为 150℃至 250℃。

24. 权利要求 1 的抑汗组合物，其中的载体是挥发性烃类化合物。

- 25       25. 权利要求 24 的抑汗组合物，其中的挥发性烃类化合物含有 10 至 26 的碳原子，其在常压下的沸点为 100℃至 300℃。

26. 权利要求 24 的抑汗组合物，其中的挥发性烃类化合物具有如下结构式：



其中  $n$  为 2 至 5。

27. 权利要求 24 的抑汗组合物，其中的挥发性烃类化合物包括异十六碳烯、1-癸烯二聚体和  $C_{13-14}$  异链烷烃或其混合物。

28. 权利要求 1 的抑汗组合物，其中的载体包括非挥发性烃、非挥发性聚硅氧烷或其混合物。

29. 权利要求 28 的抑汗组合物，其中的非挥发性聚硅氧烷包括聚二甲基硅氧烷化合物，而非挥发性烃包括矿物油。

30. 权利要求 3 的抑汗组合物，其中脂肪醇的含量为组合物重量的 1% 至 15%。

31. 权利要求 3 的抑汗组合物，其中的脂肪醇选自月桂醇、油醇、肉豆蔻醇、牛脂醇、鲸蜡醇、硬脂醇、鲸蜡基硬脂醇、辛醇、 $C_9-11$  醇、 $C_{12-13}$  醇、 $C_{12-15}$  醇、 $C_{12-16}$  醇、 $C_{14-15}$  醇、癸醇、异鲸蜡醇、异硬脂醇、棕榈仁醇、十三烷醇、山萘醇、癸基十四烷醇、庚基十一烷醇、辛基十二烷醇、十一碳烯醇、十一基十五烷醇及其混合物。

32. 权利要求 4 的抑汗组合物，其中脂肪族酯的含量为组合物重量的 3% 至 25%。

33. 权利要求 4 的抑汗组合物，其中的脂肪族酯衍生于含有 1 至 12 个碳原子的羧酸和含有 8 至 22 个碳原子的醇。

34. 权利要求 4 的抑汗组合物，其中的脂肪族酯衍生于含有 8 至 22 个碳原子的羧酸和含有 1 至 22 个碳原子的醇。

35. 权利要求 4 的抑汗组合物，其中的脂肪族酯衍生于含有 8 至 22 个碳原子的醇酯化苯甲酸产生的酯。

36. 权利要求 4 的抑汗组合物，其中的脂肪族酯选自鲸蜡醇硬脂酸酯、异鲸蜡醇硬脂酸酯、己二酸二异丙酯、二异硬脂醇富马酸酯、二鲸蜡醇己二酸酯、三异硬脂醇柠檬酸酯、季戊四醇四可可酸酯、季戊四醇四山萘酸酯、季戊四醇松脂酸酯、季戊四醇四辛酸酯、丙二醇二壬酸酯及其混合物。

37. 权利要求 1 的抑汗组合物，其中，所述组合物不含颗粒填充剂。

38. 权利要求 1 的凝胶抑汗组合物，含有：

(a) 5% 至 35% (重量) 的卤化铝、碱式卤化铝、二卤氧化锆、碱式二卤氧化锆、甘氨酸锆铝或其混合物；

(b) 3%至 12% (重量) 的胶凝剂, 所述胶凝剂选自蔗糖二硬脂酸酯、糊精棕榈酸酯、二氢羊毛甾醇、羊毛甾醇、鳄梨油不皂化物及其混合物; 以及

5 (c) 15%至 75% (重量) 的载体, 所述载体选自挥发性聚硅氧烷、挥发性烃及其混合物。

39. 权利要求 38 的抑汗组合物, 还含有 0%至 20% (重量) 的水, 0%至 15% (重量) 的选自山<sup>萜</sup>醇和硬脂醇的脂肪醇, 以及 2%至 50% (重量) 的选自肉豆蔻酸异丙酸、C<sub>12-15</sub> 烷基苯甲酸酯的脂肪族酯及其混合物。

10 40. 气溶胶抑汗组合物, 含有:

(a) 1 重量份的权利要求 1 的凝胶抑汗组合物, 和

(b) 0.5 至 3 重量份的烃类气雾剂基质。

41. 治疗或预防与人体出汗有关的恶臭的美容方法, 该方法包括向人体皮肤表面施用有效量的抑汗组合物, 所述组合物含有:

15 (a) 1%至 40% (重量) 的抑汗化合物;

(b) 2%至 15% (重量) 的胶凝剂, 所述胶凝剂选自含有 8 至 22 个碳原子的羧酸与淀粉水解产物形成的酯、甾醇及其混合物; 以及

(c) 10%至 90% (重量) 的载体, 包括聚硅氧烷、烃或其混合物。

42. 权利要求 40 的美容方法, 其中施用了没有肉眼可见的白色残留物的抑汗组合物于人体皮肤上。

20

## 抑汗除臭组合物

### 发明领域

5 本发明涉及抑汗组合物，所述组合物含有抑汗化合物，例如收敛盐；含胶凝剂，所述胶凝剂选自甾醇如羊毛甾醇、淀粉水解产物的C<sub>8</sub>-C<sub>22</sub>羧酸酯如糊精棕榈酸酯及其混合物；含载体，包括聚硅氧烷或烃；此外，该组合物还可以选择性地含有水、脂肪醇、脂肪族酯或其混合物。该抑汗组合物是粘稠的、凝胶化的组合物，该组合物不透明并且是相稳定的；能够有效地向皮肤释放抑汗化合物；外部使用后不会使皮肤和衣物变白及弄脏；并且具有非常好的感觉特性。该抑汗组合物还可以配制成气溶胶抑汗组合物。本发明还涉及抑汗组合物的使用方法。

### 发明背景

15 抑汗组合物是化妆品领域内所熟知的。理想的抑汗组合物应在组合物的保存期内是稳定的、能够有效地向皮肤释放抑汗化合物、不会在皮肤或衣物上留下可见的白色残留物，并且从美容的角度让使用者满意。

存在多种形式的抑汗组合物，例如气溶胶悬浮液；抽吸式喷雾剂；走珠（roll-on）粉末；乳液、洗剂或悬浮液；以及固体凝胶、蜡、霜剂或悬浮液。以前，通常将抑汗组合物制备成水包油乳液或油包水乳液。因此，任何类型的抑汗组合物一般都具有乳状或不透明的外观，但某些抑汗组合物是透明的。抑汗组合物通常均通过复杂的方法生产。乳液形式的抑汗组合物在涂抹于皮肤时通常会有湿润或油腻的感觉，并且当组合物中的载体蒸发后通常会很粘。此外，许多乳液型抑汗组合物与皮肤或衣物接触时会留下白色的污染痕迹。

走珠和凝胶化的乳液型抑汗组合物在使用时，通过在身体面如腋下擦抹而在皮肤上涂抹一层该组合物，由此减轻气味和/或出汗。走珠和凝胶抑汗组合物具有光滑、不油腻和不粘的美学特性。凝胶化的抑汗组合物还需要具有足够的坚实性以保持其形状。另一个非常需要但难以达到的美学特性是避免形成可见残留物，例如在使用抑汗组合物后在皮肤或衣物上留下的白色粉层。

非乳化的抑汗组合物也是本领域已知的。然而，非乳化的组合物通常需要在每次使用前振摇，以使从组合物中分离出来的不溶性抑汗化合物重新分散。无需在每次使用前振摇的非乳化抑汗组合物，例如抑汗膏霜或糊剂，通常含有较高百分比的悬浮剂如有机粘土。抑汗组合物中所含的有机粘土是使皮肤和衣物变白及弄脏的主要原因。

研究人员已经在寻找具有上述所需特性的抑汗组合物。走珠抑汗剂难以配制和生产，因为该组合物需要具有足够的粘度以粘附在皮肤上，不会从皮肤上滴落或流下，但同时又不发粘。凝胶抑汗组合物难以配制和生产是因为该组合物需要有足够的坚实性，以经得起在皮肤上进行摩擦，以向皮肤释放有效量的抑汗化合物。其它配制参数包括粘度控制、不脱水收缩和不发粘。

消费者非常需要其美学和功能特性相同于或优于目前可购买到的抑汗组合物的凝胶抑汗组合物。然而，提供商业可接受的凝胶抑汗组合物需要克服许多配制和生产的问题。

凝胶化的抑汗组合物掺有胶凝剂以建立组合物的固体结构或坚实性。固体抑汗组合物通常以含有 14 至 20 个碳原子的固体脂肪醇作为固化剂。此外，组合物中还含有非挥发性润肤剂，以使粘性降至最低并改善感觉特性，从而易于使用、美观并且改善使用者对其的评价。

固体抑汗组合物分为三种主要类型，即压缩粉末棒、凝胶棒和蜡棒。这些类型中的每一种都有其优点，但每一种类型也具有各自的缺点。例如，压缩粉末棒通常脆而硬，并且在使用后留下美容不相宜的粉末状残留物。通常，蜡基质的产品在美容上不适用是因为硬、油腻和粘等因素。使用后留下的可见白色残留物也不美观。

凝胶型的固体抑汗组合物具有许多优于压缩粉末棒和蜡棒的优点。例如，凝胶抑汗组合物在皮肤上留下的残留物或粉末较少。凝胶抑汗组合物还易于在皮肤表面涂抹，从而使组合物的使用方便、舒适。

然而，制备有效和稳定的凝胶形式的抑汗组合物是困难的。例如，凝胶抑汗组合物中的关键成分是胶凝剂。许多现有的凝胶抑汗组合物均含有凝胶化的水醇溶液，该溶液中含有胶凝剂如硬脂酸钠以形成凝胶。然而，在含有酸性抑汗化合物时则不能使用常用的胶凝剂，因为胶凝剂是碱性的，可与抑汗化合物之间相互作用。

现有的凝胶抑汗组合物通常也可分为三种主要类型。其中一种是

光学透明的凝胶化乳液组合物。这些组合物含有水相和油相。通过使用足够量的一种或多种适宜的乳化剂将油相悬浮在水相中。所述乳液通常含有蜡、聚硅氧烷、粘土和润肤剂。关于光学透明的凝胶化乳液组合物的说明参见美国专利 4673570、4268499、4278655 和 4350605；  
5 EP 0450597；以及“除臭和抑汗配方手册”，化妆品和盥洗用品 (Cosmetics & Toiletries)，1985.12.12，第 100 卷，65-75 页。

光学透明的凝胶化乳液组合物通常有以下缺点：在贮藏过程中组合物的不稳定性；在贮藏过程中形成混浊或乳状外观；发粘、油腻以及其它不利的美学特性。此外，乳液凝胶组合物通常会在皮肤或衣物  
10 上留下白色粉层形式的可见残留物。光学透明的凝胶化乳液组合物的另一缺点是其制备方法复杂。该方法在混合过程中通常需要高剪切速率，需要高的加工温度以及一系列冷却和加热的加工步骤。

第二种类型的凝胶抑汗组合物是用 1,3:2,4-二亚苺基山梨醇 (DBS) 或 DBS 衍生物增稠的抑汗组合物。在美国专利 4822602 和  
15 4725430；欧洲专利公开说明书 0512770；WO 91/15191；以及 WO 92/19222 中公开了这种透明的抑汗组合物。

用 DBS 或 DBS 型化合物增稠的凝胶化抑汗组合物的主要缺点在于，当含有强酸性抑汗化合物时，该组合物在升高的温度下不稳定。其它缺点是，生产 DBS-增稠的组合物时需要高温(即，约 230°F 至约  
20 240°F)，并且使用后会在皮肤和衣物上留下可见的白色残留物。

第三种类型的凝胶抑汗组合物是酸基质的配合物凝胶。这种抑汗组合物是通过将活性抑汗化合物与羧酸盐相互作用来制备的。酸基质的配合物凝胶公开于，例如美国专利 3255082 和 2876163；以及欧洲公开号 0488278。

第三种类型的抑汗组合物的主要缺点在于，盐使得活性抑汗化合物部分减活，从而降低了抑汗化合物及相应抑汗组合物的效力。此外，得到的凝胶非常脆、粘和/或具有其它不利的美学特性，例如美国专利  
25 3255082 中公开的乳液或溶胶形式的组合物所具有的特性。

可以通过制备走珠抑汗剂来部分克服凝胶抑汗剂所存在的问题。  
30 走珠抑汗剂通常是粘稠液体或半固体。然而，走珠抑汗剂通常会产生发粘的感觉，而且仍然会在皮肤上留下难看的白色残留物。同样，气溶胶抑汗剂在使用后也会使皮肤产生油腻或发粘的感觉，或留下白色

残留物。

研究人员一直在寻找具有长期稳定性，及使用者认可的足够的美学和功能特性的凝胶抑汗组合物。这些美学和功能特性包括，适于皮肤应用的足够坚实性、不会使皮肤和衣物产生可观察到的白化、能够  
5 向皮肤有效地释放抑汗化合物而不会产生发粘的感觉。本发明涉及提供具有这些使用者认可的美学和功能特性的凝胶抑汗组合物，其中，所述组合物使用了非水载体和胶凝剂，所述胶凝剂选自甾醇和淀粉水解产物的  $C_8$ - $C_{22}$  羧酸酯。令人惊奇的是，可将该组合物与烃类气雾剂基质混合得到气溶胶抑汗剂。

10 凝胶化的非水液体是已知的。例如，日本专利公开说明书 3006283、1203379、64-207223、62-121764、62-143970 和 62-143971 中公开了通过加入糊精脂肪酸酯而凝胶化的非水液体。日本专利公开说明书 63-360955 公开了使用纤维素脂肪酸酯来凝胶化非水液体的方法。日本专利公开说明书 64-207223 公开了使用糊精脂肪酸酯和 N-酰  
15 基氨基酸的混合物作为非水溶剂的胶凝剂。

Saito 等在美国专利 3989087 和 WO 93/23008 中公开了使用 N-酰基氨基酸酰胺和 12-羟基硬脂酸的混合物凝胶化含有铝盐的非水系统的方法。然而，需要高的加工温度以达到凝胶化，产物难以从皮肤上洗掉，而且产物缺乏使用者可接受的效果。在 WO 94/24997 中公开了相似的产物，该产物掺入了聚氧乙烯醚化合物并且易于洗掉。但是，  
20 生产该组合物所需的高加工温度抵销了改进的效果。

EP 0440387 公开了使用经疏水处理的粘土和蔗糖牛脂酸酯的混合物凝胶化以  $C_1$ - $C_4$  醇为基质的抑汗组合物。但是，这些组合物的稳定性低，需加以改进才能得到使用者可接受的抑汗组合物。

25 涉及用于非水组合物或抑汗组合物的胶凝剂的其它专利，包括英国专利申请 GB 2253347，该专利公开了用含有通过酯键连接的多环芳香基团或甾族基团的化合物凝胶化的抑汗组合物；Tanner，美国专利 5019375；Orr，美国专利 4853214 和 5069897；欧洲专利申请公开号 0545002 和 WO 93/08840。Mori 等，美国专利 5013715 公开了蔗糖的  
30 脂肪酸酯凝胶化非水液体的用途。Mori 等，美国专利 4780145 公开了糊精脂肪酸酯凝胶化非水液体的用途。Berndt，美国专利 5338535 公开了含有淀粉和挥发性聚硅氧烷的无滑石爽身粉。

### 发明概述

本发明涉及具有改善效果和美学特性的凝胶抑汗组合物，以及该抑汗组合物的使用方法。本发明还涉及气溶胶抑汗组合物。更具体地讲，本发明涉及含有下列成分的凝胶抑汗组合物：抑汗化合物；胶凝剂，选自甾醇、淀粉水解产物的  $C_8-C_{22}$  羧酸酯及其混合物；载体，包括聚硅氧烷、烃或其混合物；此外，还可以选择性地含有水、脂肪醇、脂肪族酯或其混合物。

本文所用术语“凝胶”是指在室温(即约  $25^{\circ}\text{C}$ )下能够以自由形式(即无支持物)将其形状保持至少一小时的组合物。

具体地讲，该凝胶抑汗组合物含有：

- (a) 约 1% 至约 40% (重量) 的抑汗化合物，如收敛盐；
- (b) 约 2% 至约 15% (重量) 的胶凝剂，所述胶凝剂选自甾醇、淀粉水解产物的  $C_8-C_{22}$  羧酸酯及其混合物；
- (c) 约 10% 至约 90% (重量) 的载体，包括聚硅氧烷、烃或其混合物。

该凝胶抑汗组合物不含颗粒填充剂如滑石，因此，不会使皮肤和衣物弄脏和变白。通常将颗粒填充剂加到凝胶抑汗组合物中以使组合物具有一定的坚实。令人惊奇的是，在不含颗粒填充剂的条件下，本发明的抑汗组合物具有达到产品效果和使用者的美学特性所需的足够坚实性。该凝胶化的组合物还可以向皮肤有效地释放抑汗化合物，并且具有极好的、使用者认可的美学和功能特性，包括感觉特性。

在优选的实施方案中，所述凝胶抑汗除臭组合物含有：

- (a) 约 5% 至约 35% (重量) 的铝或锆收敛盐或其混合物；
- (b) 约 3% 至约 12% (重量) 的胶凝剂，所述胶凝剂选自甾醇、淀粉水解产物的  $C_8-C_{22}$  羧酸酯及其混合物；
- (c) 约 15% 至约 75% (重量) 的载体，所述载体选自聚硅氧烷、烃或其混合物。

在又一实施方案中，凝胶抑汗组合物包括 0% 至约 30% 重量水，0% 至约 20% 重量醇、0% 至约 70% 重量脂肪酯，或其混合物。

在另一个实施方案中，将含有(a)、(b)和(c)的抑汗组合物与烃类气雾剂混合以得到气溶胶抑汗组合物。所述气溶胶抑汗组合物含有 1 份重量的抑汗组合物和约 0.5 至约 3 份重量的烃类气雾剂基质。

本发明还涉及治疗或预防与人体出汗有关的恶臭、特别是腋臭的方法。该方法包括向人体皮肤局部施用有效量的本发明凝胶抑汗组合物。

通过以下对本发明优选实施方案的详细描述，上述及其它的优点以及本发明的新特点将变得明显。

#### 优选实施方案的详细描述

本发明的凝胶抑汗组合物含有抑汗化合物、胶凝剂、载体，并可选择性地含有水、脂肪醇、脂肪族酯或其混合物。具体地讲，该凝胶抑汗组合物含有：

10 (a) 约 1% 至约 40% (重量) 的抑汗化合物；

(b) 约 2% 至约 15% (重量) 的胶凝剂；

(c) 约 10% 至约 90% (重量) 的载体，包括聚硅氧烷、烃或其混合物。该凝胶组合物还可选择性地含 0% 至约 30% (重量) 的水；0% 至约 20% (重量) 的脂肪醇、0% 至约 70% (重量) 的脂肪族酯，或其混合物。

15 该凝胶抑汗组合物不含颗粒填充剂，例如滑石。

该凝胶抑汗组合物对于相分离是稳定的，并且具有非常好的美学和功能特性。该组合物坚实性好，不油腻、不发粘，能够有效地向皮肤释放抑汗化合物而不会在皮肤或衣物上留下可观察到的白色残留物，即，基本不会使其变白。还可将该抑汗组合物用烃类气雾剂稀释

20 以得到气溶胶抑汗组合物。

本发明的凝胶抑汗组合物含有本领域已知的任何抑汗化合物，例如收敛盐。所述收敛盐包括铝、锆、锌的有机和无机盐及其混合物。收敛盐的阴离子可以是，例如硫酸根、氯、氯羟基、明矾、甲酸根、乳酸根、苄基磺酸根或苯磺酸根。抑汗收敛盐的典型种类包括，卤化

25 铝、碱式卤化铝、二卤氧化锆、碱式二卤氧化锆及其混合物。

例证性的铝盐包括氯化铝和通式为  $Al_2(OH)_xQ_y \cdot XH_2O$  的碱式卤化铝，其中 Q 是氯、溴或碘；x 是约 2 至约 5；x+y 是约 6，其中 x 和 y 不一定是整数；X 是约 1 至约 6。例证性的锆化合物包括锆氧盐和锆羟基盐，也称为氧锆基盐和氧锆基羟基盐，可将其用经验式  $ZrO(OH)_{2-nz}L_z$  表示，其中 z 可在约 0.9 至约 2 的范围内改变且不一定是整数；n 是 L 的化合价；2-nz 大于或等于 0；L 选自卤、硝酸根、磺酸根、硫酸根及其混合物。

30

以组合物的重量计，凝胶化的抑汗组合物中抑汗和除臭化合物的含量为约 1% 至约 40%，优选约 5% 至约 35%。为达到本发明的全部优点，抑汗化合物的含量为抑汗组合物重量的约 10% 至约 30%。

抑汗化合物的例子包括但不限于，水合溴化铝、明矾、氯羟基乳酸铝钠、硫酸铝、水合氯化铝、水合四氯锆铝、与甘氨酸配合的水合多氯锆铝、水合三氯锆铝、水合八氯锆铝、水合倍半氯化铝、倍半氯代氢化脂肪酸(chlorohydrax)铝 PG、氯代氢化脂肪酸铝 PEG、八氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物、五氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物、四氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物、三氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物、氯代氢化脂肪酸铝 PG、水合氯化锆、水合二氯化铝、二氯代氢化脂肪酸铝 PEG、二氯代氢化脂肪酸铝 PG、倍半氯代氢化脂肪酸铝 PG、氯化铝、水合五氯锆铝及其混合物。在 WO 91/19222 及“化妆品和盥洗用品香料手册”(化妆品、盥洗用品和香料联合公司，华盛顿特区，第 56 页，1989，下文称为 CTFA 手册)中列出了多种其它有用的抑汗化合物，上述文献引入本文作为参考。

优选的抑汗化合物是与氨基酸，如甘氨酸配合的氯化锆铝和水合氯化铝。优选的氯化锆铝甘氨酸配合物具有约 1.67: 约 12.5 的铝(Al)锆(Zr)比，总金属(Al+Zr)与氯的比(金属: 氯)为约 0.73: 约 1.93。

以组合物的重量计，除抑汗化合物外，本发明的凝胶抑汗组合物还含有约 2% 至约 15%，优选约 3% 至约 12% 的胶凝剂。为达到本发明的全部优点，胶凝剂的含量为组合物重量的约 3.5% 至约 10%。

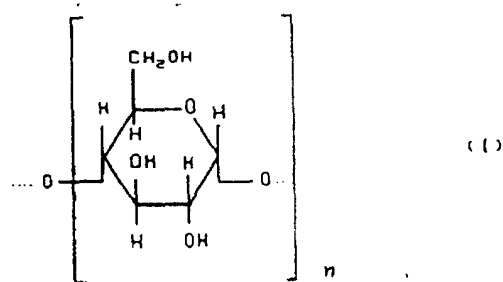
所述胶凝剂选自含有约 8 至约 22 个碳原子的脂肪酸(即  $C_8-C_{22}$  羧酸)与淀粉水解产物形成的酯、甾醇及其混合物。胶凝剂可以起到粘度改性剂或增稠剂的作用，可提供有效的和使用者认可的坚实性，同时不会使皮肤或衣物变白。

含抑汗化合物如氯化锆铝甘氨酸配合物和胶凝剂的凝胶抑汗组合物是粘的或凝胶化的组合物。可通过选择性地加入脂肪酸酯和/或选择性地加入脂肪醇来调节组合物的粘度和凝胶稠度，以得到可商用的产品。

在一个实施方案中，胶凝剂是淀粉水解产物的  $C_8-C_{22}$  羧酸酯。这些胶凝剂是通过将淀粉水解产物与含有约 8 至约 22 个碳原子的脂肪酸在酯化条件下反应得到淀粉水解产物的脂肪酸酯而制得的。

淀粉水解产物是含有如下重复单元之淀粉的水解产物:

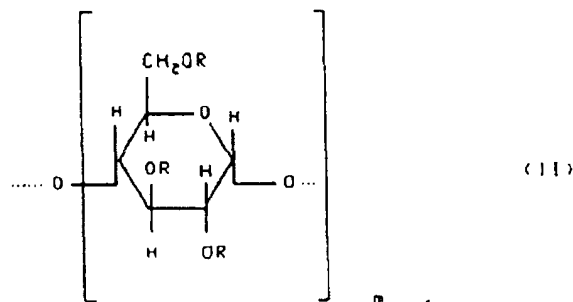
5



其中  $n$  是从 1 至约 50 的数。淀粉水解产物带有可被脂肪酸酯化的羟基。本文所用的淀粉水解产物可以是直链或环状的, 例如环糊精。

例证性的淀粉水解产物的  $\text{C}_8\text{-C}_{22}$  脂肪酸酯是糊精脂肪酸酯, 可将其用结构式 II 说明:

15

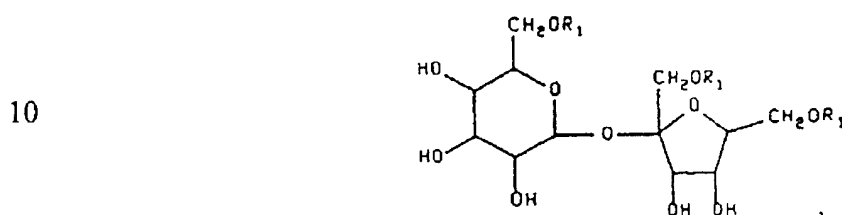


其中, 各  $R$  基团分别是氢原子或含有约 8 至约 22 个碳原子的酰基, 条件是每个葡萄糖单元中至少有一个  $R$  基团是酰基,  $n$  是约 20 至约 30 的整数。糊精脂肪酸酯可以是偏酯, 即至少有一个  $R$  基团是氢; 或者糊精被完全酯化, 即所有的  $R$  基团均是  $\text{C}_8\text{-C}_{22}$  酰基。在优选的实施方案中, 其中  $R$  基团是  $\text{C}_8\text{-C}_{22}$  烷基的取代程度至少是 2 (即至少有两个  $R$  基团是  $\text{C}_8\text{-C}_{22}$  酰基)。

与淀粉水解产物反应的  $\text{C}_8\text{-C}_{22}$  脂肪酸可以是饱和或不饱和酸, 包括, 例如癸酸、壬酸、辛酸、十一酸、十一碳烯酸、月桂酸、肉豆蔻酸、十五酸、棕榈酸、十七酸、硬脂酸、十九酸、花生酸、油酸、亚油酸、亚麻酸、类似的酸及其混合物。Mori 等在美国专利 4780145 (该文献引入本文作为参考) 中公开了糊精的脂肪酸酯, 这些物质可以从 Chiba Flour Milling Co., Ltd. (Japan) 以 RHEOPEARL 的商标名得到。糊精脂肪酸酯的一个例子是糊精棕榈酸酯, 可以从例如 Chiba

Flour Milling Co., Ltd. 以 RHEOPEARL KL 和 RHEOPEARL FL 得到。淀粉水解产物的  $C_8$ - $C_{22}$  脂肪酸酯的具体、但非限定性的例子是，糊精山萸酸酯、糊精月桂酸酯、糊精肉豆蔻酸酯、糊精棕榈酸酯、糊精硬脂酸酯及其混合物。

- 5 另一种代表性的淀粉水解产物脂肪酸酯是蔗糖脂肪酸酯。蔗糖脂肪酸酯具有如下结构式：



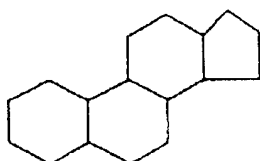
- 15 其中，各  $R_1$  基团分别是氢原子或含有约 8 至约 22 个碳原子的酰基，条件是至少有一个  $R_1$  基团是酰基。因此，有一个、两个或三个蔗糖甲羟基（即  $CH_2OH$  基团）被  $C_8$ - $C_{22}$  脂肪酸酯化。优选的蔗糖脂肪酸酯具有两个或三个酯化的甲羟基，即蔗糖的二酯或三酯。还包括其中蔗糖的一个或多个氢原子被乙酰基代替，并且至少带有一个  $R_1$  基团的蔗糖衍生物。

- 20 蔗糖脂肪酸酯的例子包括（但不限于），蔗糖二硬脂酸酯、蔗糖可可酸酯、蔗糖二月桂酸酯、蔗糖油酸酯、蔗糖棕榈酸酯、蔗糖多月桂酸酯、蔗糖多亚油酸酯、蔗糖多油酸酯、蔗糖多硬脂酸酯、蔗糖蓖麻醇酸酯、蔗糖硬脂酸酯、蔗糖三山萸酸酯、蔗糖三硬脂酸酯及其混合物。蔗糖酯可以从 Croda Inc., Parsippany (New Jersey) 以
- 25 CRODESTA 糖酯系列购买到。

- 更广义地讲，淀粉水解产物的脂肪酸酯可以是任何能够凝胶化聚硅氧烷或烃的糖类或碳水化合物脂肪族  $C_8$ - $C_{22}$  羧酸酯。除蔗糖和糊精外，其它可用来酯化  $C_8$ - $C_{22}$  羧酸的淀粉水解产物包括，但不限于，单糖，例如葡萄糖、果糖和甘露糖；二糖，例如蔗糖、麦芽糖和乳糖；三糖，
- 30 例如麦芽三糖、棉子糖和松三糖；多糖，例如纤维素和壳多糖；以及环糊精，例如  $\alpha$ 、 $\beta$  和  $\gamma$ -环糊精。

除淀粉水解产物脂肪酸酯外，也可使用甾醇作为本发明抑汗组合

物的胶凝剂。具体地讲，所述甾醇是具有如下四环甾环骨架(III)的碳环化合物：



(III)

5

所述甾醇可以含有羟基或酮基、环不饱和度以及甲基或脂族侧链。例证性但非限定性的甾醇包括，二氢羊毛甾醇、羊毛甾醇、胆甾醇、谷甾醇、菜油甾醇、胆钙化甾醇、胆甾醇羟基硬脂酸酯、二氢胆甾醇、豆甾醇、 $\beta$ -谷甾醇、羊毛脂醇、大豆甾醇和浮油甾醇。

甾醇是称为“不可皂化物”化合物的主要成分。不可皂化物是将天然脂类如大豆油皂化后所剩余的化合物。因此，术语“不可皂化物”是指天然油脂中不能水解，并且在碱水解后仍溶于脂类溶剂中的脂类成分。不可皂化物包括烃、复杂的脂肪醇和醚。甾醇、枞醇、鲨肝醇和角鲨烯是在不可皂化物中发现的一些化合物。可在本发明抑汗组合物中用作胶凝剂的不可皂化物包括（但不限于），鳄梨油不皂化物、橄榄油不皂化物、菜子油不皂化物、牛油树脂不皂化物、大豆油不皂化物及其混合物，或与甾醇的混合物。

甾醇和不可皂化物是可购买到的产品，例如 NIKKOL<sup>®</sup> Isocholesterol EX(二氢羊毛甾醇和羊毛甾醇)，Nikko Chemicals Co., Tokyo, Japan 生产；CRODAROM Avocadin(鳄梨油不可皂化物)，Croda Inc., Parsippany, New Jersey 生产。CRODAROM Avocadin 含有 $\beta$ -谷甾醇、菜油甾醇和豆甾醇。

以组合物的重量计，本发明的凝胶抑汗组合物还含有约 10% 至约 90%，优选约 15% 至约 75% 的载体。为达到本发明的全部优点，该组合物含有约 30% 至约 60% (重量) 的载体。

所述载体是非水的，其中含有挥发性聚硅氧烷、挥发性烃非挥发性聚硅氧烷、非挥发性烃或其混合物。优选所述载体含有挥发性聚硅氧烷、挥发性烃或其混合物。

在优选的实施方案中，挥发性聚硅氧烷是低分子量聚二甲基硅氧烷，其在 25℃ 的粘度为约 0.5 至约 5 厘沱(cs)，在常压下的沸点至高

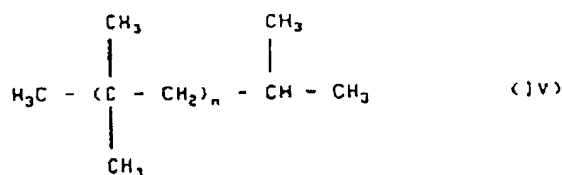
约 300℃。也可将带有苯基取代基的低分子量聚二甲基硅氧烷用于本发明的组合物。此外，低分子量聚二甲基硅氧烷化合物可以是直链或环状聚二甲基硅氧烷化合物。

用于本发明组合物和方法的直链低分子量挥发性聚二甲基硅氧烷化合物是六甲基乙硅氧烷，该物质可从 Dow Corning Corp., Midland, Michigan 以 DOW CORNING 200 FLUID 商标购买到。六甲基乙硅氧烷的粘度为 0.65 cs (厘沓)，是高挥发性的，不油腻，不会在皮肤上留下粘的感觉。也可将其它直链聚二甲基硅氧烷，如十甲基丁硅氧烷(常压下的沸点为约 195℃，粘度为 1.5 厘沓)、八甲基丙硅氧烷和十二甲基戊硅氧烷用于本发明的组合物。

此外，也可将环状低分子量的挥发性聚二甲基硅氧烷用于本发明的组合物和方法，化妆品、盥洗用品和香料联合会(CTFA)将该物质命名为环聚二甲基硅氧烷。环聚二甲基硅氧烷是低分子量的水不溶性环状化合物，该化合物每个分子平均有约 3 至约 6 个  $-\text{[O-Si(CH}_3)_2\text{]}-$  重复基团单位，其在常压下的沸点为约 150℃ 至约 250℃。适宜的环聚二甲基硅氧烷可从 General Electric, Waterford, New York 以商标名 SILICONE SF-1173(八甲基环丁硅氧烷)和 SILICONE SF-1202(十甲基环戊硅氧烷)以及从 Dow Corning Corporation, Midland, Michigan 以商标名 SILICONE 344 FLUID 和 SILICONE 345 FLUID 购买到，在每种情况下，都首先列出四聚体。可将挥发性环状聚硅氧烷与直链挥发性聚硅氧烷结合使用，也可将挥发性聚硅氧烷与非挥发性聚硅氧烷或烃结合使用。

除挥发性聚硅氧烷外，在组合物中还可含有挥发性烃，所述烃是单独的或与其它非水载体一起包含在组合物中。挥发性烃，例如含有约 10 个碳原子至约 26 个碳原子的烃具有足够的挥发性，从而可以避免在皮肤上留下粘的感觉。因此，挥发性烃提供了与挥发性聚硅氧烷基本相同的优点。

优选的挥发性烃是含有约 12 至约 24 个碳原子的脂族烃，其沸点为约 100℃ 至约 300℃。用结构通式(IV)描述了代表性的挥发性烃，其中  $n$  为 2 至 5。



5

可用于本发明组合物的挥发性烃的实例是可从 Presperse, Inc., South Plainfield, New Jersey 购买到的市售化合物如 PERMETHYL 102A 或 PERMETHYL 99A 以及 PERMETHYL 101A, 所述化合物相当于结构通式(IV)的化合物, 其中  $n$  分别是 2 和 3. 其它挥发性烃包括异十六碳烯、1-癸烯二聚体和  $\text{C}_{13-14}$  异链烷烃。可将挥发性烃在凝胶抑汗组合物中单独使用, 或与另一挥发性或非挥发性烃结合, 或与挥发性或非挥发性聚硅氧烷结合使用。

在另一实施方案中, 凝胶抑汗组合物含有包含非挥发性聚硅氧烷的载体, 如聚二甲基硅氧烷化合物。优选的非挥发性聚硅氧烷化合物包括具有下列通式的直链和支链聚二甲基硅氧烷:



其中  $n$  为 25 至约 200, 优选约 50 至约 100. 也可使用苯基取代的聚硅氧烷。本发明组合物所用的聚硅氧烷液体可从许多商业途径得到, 所述途径包括 General Electric Company, Waterford, NY, 和 Dow Corning Corp., Midland, MI. 非挥发性聚二甲基硅氧烷化合物是非功能性硅氧烷, 在  $25^\circ\text{C}$ , 其粘度为约 5 至约 1000 cs, 优选约 25 至约 350 cs.

25

在本发明组合物中可含有的另一种适宜载体是非挥发性烃, 例如矿物油。所述非挥发性烃提供了许多与聚硅氧烷调理剂相同的益处, 而且可与聚硅氧烷调理剂同时包含在所述组合物中。

除必需的成分外, 本发明的凝胶抑汗组合物还可含有通常在抑汗组合物中包含的选择性成分。这些选择性成分包括(但不限于), 染料、香料、防腐剂、抗氧化剂、减粘剂、除臭剂以及相似类型的化合物。抑汗组合物中, 这些选择性成分的含量通常为组合物重量的约 0.01%-约 10%.

30

根据本发明的一个重要特征，所述凝胶抑汗组合物不含有表面活性剂和颗粒填充剂如滑石。抑汗化合物、胶凝剂以及载体的组合提供了具有足够坚实性以作为凝胶使用的抑汗组合物，因此，可以不含颗粒填充剂。本发明的抑汗组合物很容易涂到皮肤上，因此，不需要表面活性剂。因此，本发明的抑汗组合物消除了颗粒填充剂造成的在皮肤或衣物上产生难看白色残留物。

但是，可将其它选择性成分加到凝胶抑汗组合物中以改善组合物的美学特性，从而使使用者更易于接受。这些选择性成分包括水、脂肪醇、脂肪酸酯或其混合物。

以组合物的重量计，抑汗组合物中所含的水为0%至约30%，优选0%至20%左右。为达到本发明的全部优点，水应占组合物重量的0%至约10%。水的含量应使组合物的感觉特性没有不利影响，同时组合物又不会在皮肤上留下粘的感觉。向组合物中加入水会形成油包水微乳液，这有助于减少因水在皮肤上产生的粘的感觉。

凝胶抑汗组合物中所含有的另一选择性成分是脂肪醇。以组合物的重量计，脂肪醇的量为0%至约20%，优选0%至约15%。为了达到本发明的全部优点，脂肪醇应占组合物重量的约1%至约15%。脂肪醇有助于将抑汗组合物的坚实性调整到所需的水平并提高相稳定性。脂肪醇的量超过约20%（重量）以上会使组合物太坚实而难以涂到皮肤上。

脂肪醇含有约8至约26个碳原子，优选约12至约22个碳原子。术语“约”是意识到脂肪醇常常是以醇的混合物得到的，该混合物中含有主要的一种或两种脂肪醇以及少量的数种其它脂肪醇。因此，例如含有8个碳原子的市售脂肪醇通常包含多于和少于8个碳原子的醇。脂肪醇的实例包括但不限于，月桂醇、油醇、肉豆蔻醇、牛脂醇(tallow alcohol)、鲸蜡醇、硬脂醇、鲸蜡基硬脂醇(cetearyl alcohol)、辛醇、C<sub>9-11</sub>醇、C<sub>12-13</sub>醇、C<sub>12-15</sub>醇、C<sub>12-16</sub>醇、C<sub>14-15</sub>醇、椰子醇、癸醇、异鲸蜡醇、异硬脂醇、棕榈仁醇、十三烷醇、山萘醇、癸基十四烷醇、庚基十一烷醇、辛基十二烷醇、十一碳烯醇、十一基十五烷醇及其混合物。

另一选择性成分是脂肪族酯，以组合物的重量计，其含量为0%至约70%，优选2%至约50%。为了达到本发明的全部优点，脂肪族

酯含量应为组合物重量的约3%至约25%。抑汗组合物中所含的脂肪族酯作为软化剂可以改善组合物的美学特性，特别是涂抹时的感觉和容易程度。

脂肪族酯是液体或固体化合物。优选脂肪族酯是液体化合物。脂肪族酯的脂肪部分可来自脂肪酸或脂肪醇或二者的结合。另外，所述脂肪族酯可以是直链脂肪族酯如肉豆蔻酸异丙酯；支链脂肪族酯，如Purcellin油；苯甲酸酯如C<sub>12-15</sub>醇苯甲酸酯；或其混合物。

一类有用的脂肪族酯衍生于含有1至约12个碳原子的羧酸，包括支链和直链羧酸。通常，将C<sub>1</sub>至C<sub>12</sub>羧酸用含有约8至约22个碳原子的脂肪醇酯化以得到可用于本发明的C<sub>1</sub>至C<sub>12</sub>羧酸的脂肪族(C<sub>8</sub>至C<sub>22</sub>)酯。所述脂肪醇包括（但不限于），月桂醇、肉豆蔻醇、鲸蜡醇、鲸蜡基硬脂醇、硬脂醇、异硬脂醇、油醇、牛脂醇、山萵醇及其混合物。因此，可用于本发明组合物和方法的C<sub>1</sub>至C<sub>12</sub>羧酸的脂肪族(C<sub>8</sub>至C<sub>22</sub>)酯包括（但不限于），鲸蜡醇辛酸酯、硬脂醇庚酸酯、硬脂醇辛酸酯、月桂醇辛酸酯、肉豆蔻醇庚酸酯、油醇辛酸酯、肉豆蔻醇丙酸酯、鲸蜡醇乙酸酯、鲸蜡醇丙酸酯、鲸蜡醇辛酸酯、异癸醇新戊酸酯及其混合物。这些脂肪族酯可以是天然的或合成的。

可将含约8至约22个碳原子的脂肪酸用含约1至约22个碳原子的醇酯化得到的脂肪族酯，代替C<sub>1</sub>至C<sub>12</sub>羧酸的脂肪族(C<sub>8</sub>至C<sub>22</sub>)酯或与其混合，而用于本发明的组合物。这些脂肪族酯的例子包括（但不限于），肉豆蔻酸异丙酯、棕榈酸异丙酯、月桂酸异丙酯、亚油酸异丙酯、牛脂酸异丙酯(isopropyl tallowate)、蓖麻醇酸异丙酯、月桂酸甲酯、亚油酸甲酯、肉豆蔻酸甲酯、硬脂酸甲酯、蓖麻醇酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、棕榈酸甲酯、硬脂酸甲酯、山萵酸甲酯、大豆脂肪酸甲酯、牛脂酸甲酯、山萵酸异丙酯、异硬脂酸异丙酯、大豆脂肪酸异丙酯、油酸丙酯、油酸丁酯、硬脂酸丁酯、可可酸甲酯、猪脂酸甲酯(methyl lardate)、棕榈酸异丁酯、肉豆蔻酸丁酯、棕榈酸乙酯、肉豆蔻酸乙酯、油酸乙酯、硬脂酸乙酯、硬脂酸异丁酯、肉豆蔻酸异丁酯及其混合物。

可用于本发明组合物的另一类脂肪族酯是苯甲酸酯，所述苯甲酸酯可单独使用，或与上述脂肪族酯结合使用。适宜的苯甲酸酯包括，其中酯化的醇含有约8至约22个碳原子的苯甲酸酯。适宜苯甲酸酯的

实例包括（但不限于），市售产品 FINSOLV TN，用含有约 12 至约 15 个碳原子的脂肪醇酯化的苯甲酸；FINSOLV SB，异硬脂醇苯甲酸酯；FINSOLV P，PPG-15 硬脂基醚苯甲酸酯；或其混合物，以上产品均可从 Finetex Inc., Elmwood Park, New Jersey 购买到。

其它有用的脂肪族酯是，例如鲸蜡醇硬脂酸酯、异鲸蜡醇硬脂酸酯、己二酸二异丙酯、二异硬脂醇富马酸酯、二鲸蜡醇己二酸酯、三硬脂醇柠檬酸酯、季戊四醇四可可酸酯、季戊四醇四山萘酸酯、季戊四醇松脂酸酯、季戊四醇四辛酸酯、季戊四醇四异壬酸酯、季戊四醇四异硬脂酸酯、季戊四醇四月桂酸酯、季戊四醇四肉豆蔻酸酯、季戊四醇四油酸酯、季戊四醇四壬酸酯、季戊四醇四硬脂酸酯、季戊四醇三油酸酯、以及丙二醇二壬酸酯。其它的脂肪酸酯参见 CFTA 化妆品成分手册，第 1 版，化妆品、盥洗用品和香料联合公司，纽约，纽约（1988），23-26 页，该文献引入本文作为参考。

为了说明本发明的凝胶抑汗组合物，准备以下非限定性实例。本发明的抑汗组合物是软的固体凝胶，该组合物在涂抹后不会在皮肤或衣物上留下肉眼可见的白色残留物。该抑汗组合物还可含有烃类气雾剂基质、或可用烃类气雾剂基质稀释以得到两相的气溶胶抑汗组合物。

通常，本发明抑汗组合物的制备包括如下步骤：首先，将胶凝剂和载体的混合物加热至约 85℃，然后将该混合物保持在 85℃ 并搅拌至混合物成为均相，使胶凝剂溶解在载体中。将得到的均相溶液冷却至约 65℃，然后，如果需要的话，可将选择性成分脂肪醇和选择性成分脂肪酸酯加入到该溶液中。将得到的混合物搅拌至成为均相，然后将抑汗化合物和水（如果有的话）在连续搅拌的条件下加入到溶液中。将得到的抑汗组合物以约 20 至约 100 rpm 的中速搅拌，然后冷却至约 55℃ 至约 60℃ 搅拌至成为均相。然后将抑汗组合物装入模具中并冷却至室温。如果抑汗组合物中含有其它选择性的油溶性组分，将这些组分与任含的脂肪醇和脂肪族酯一起加入到该组合物中。如果抑汗组合物中含有其它任选的水溶性组分，将这些组分与任含的水一起加入到该组合物中。

本发明的抑汗组合物是软的不透明固体胶棒，其透度计读数为约 5 至约 40，优选约 10 至约 20。透度值根据 ASTM No. D937-58，“凡士林

的透入”测定。该抑汗组合物具有足够的坚实性，易于涂到皮肤上并且涂抹流畅。该抑汗组合物不含有颗粒填充剂如滑石，或固体无机胶凝剂如膨润土，因此，不会在皮肤或衣物上留下不美观的白色残留物。

正如以下实施例将要说明的，该抑汗组合物在产品的保存期内是相稳定的、足够坚实的(凝胶)，易于涂抹并能有效地向皮肤释放抑汗化合物，而且在使用后不会使皮肤或衣物变白。以下的每一实施例均是按照上述方法制备的。

| 实施例 1                   |                    |
|-------------------------|--------------------|
| 成分                      | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 水合氯化铝(ACH) <sup>2</sup> | 30                 |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>    | 10                 |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>4</sup>     | 10                 |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup>   | 50                 |

<sup>1</sup> 各成分的量用总组成的重量%表示，所有百分比表示组合物中的活性成分的量；

<sup>2</sup> CHLOROXYDROL 粉末，可从 Reheis, Inc., Berkeley Heights, New Jersey 购买到，为 100% 的活性物质；

<sup>3</sup> 任含的脂肪族酯；

<sup>4</sup> RHEOPEARL FL，可从 Chiba Flour Milling Co. Ltd., Chiba, Japan, 购买到，为 100% 的活性物质；

<sup>5</sup> 挥发性聚硅氧烷载体，DOW CORNING 245 FLUID，可从 Dow Corning Corp., Mid-land, Michigan 购买到，为 100% 的活性物质。

实施例 1 的组合物是不透明的(即白色)软凝胶组合物，该组合物很容易在皮肤上展开并迅速干燥，产生抑汗剂膜。在贮存稳定性试验中，实施例 1 的组合物于 80°F 和 120°F 下至少 2 个月内是相稳定的。在贮存试验过程中，未观察到固体抑汗化合物颗粒分离出。实施例 1 的组合物在施用后 30 或 120 分钟，未在皮肤上留下肉眼可见的白色残留物。

与抑汗剂相对，将含有相对少量(约 5% - 约 15% (重量))抑汗化合物的组合物称为除臭剂。也可通过将足量的胶凝剂掺入到该组合物中来制备除臭组合物。还可选择性地含有脂肪醇或脂肪酸酯以提高

组合物的美学特性。组合物中足量的凝聚剂，以及选择性的脂肪醇和/或脂肪酸酯(如果需要的话)，可产生具有所需稠度的凝胶组合物。产生所需组合物稠度的胶凝剂含量随组合物中载体的性质和数量而改变。

5

| 实施例 2                                  |                    |
|----------------------------------------|--------------------|
| 成分                                     | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 四氯代氢化脂肪酸铝甘氨酸配合物 <sup>6</sup>           | 15                 |
| C <sub>12-15</sub> 烷基苯甲酸酯 <sup>7</sup> | 62                 |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>8</sup>                    | 8                  |
| 矿物油 <sup>9</sup>                       | 15                 |

<sup>6</sup> REACH AZP-908SUF, 可从 Reheis, Inc., Berkeley Heights, New Jersey 购买到, 为 100% 的活性物质

<sup>7</sup> 脂肪族酯, RINSOLV TN, Finetex, Inc., Elmwood Park, New Jersey, 为 100% 的活性物质

10 <sup>8</sup> RHEOPEARL KL, 可从 Chiba Flour Milling Co., Ltd., Chiba, Japan 购买到, 为 100% 的活性物质;

<sup>9</sup> 非挥发性烃载体。

15 实施例 2 的组合物是不透明的、略带黄色的软固体。很容易将该组合物涂抹到皮肤上以有效地释放抑汗化合物, 而且不会使皮肤和衣物变白。在 80°F 和 120°F 完成的加速稳定性试验中, 该组合物在至少 2 个月内是稳定的。

| 实施例 3                 |                    |
|-----------------------|--------------------|
| 成分                    | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 水合氯化铝 <sup>2</sup>    | 30.0               |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>  | 6.0                |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>4</sup>   | 1.0                |
| 蔗糖二硬脂酸酯 <sup>10</sup> | 2.5                |
| 山萘醇 <sup>11</sup>     | 10.0               |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup> | 50.5               |

<sup>10</sup> CRODESTA F-10, 可从 Croda Inc., Parsippany, New Jersey

购买到, 为 100% 的活性物质; 和

<sup>11</sup> C<sub>22</sub> 脂肪醇, NACOL 22-98, 可从 Vista Chemical Co., Austin, Texas 购买到。

| 实施例 4                 |                    |
|-----------------------|--------------------|
| 成分                    | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 水合氯化铝 <sup>2</sup>    | 30                 |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>  | 9                  |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>4</sup>   | 10                 |
| 水                     | 5                  |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup> | 15                 |

5

| 实施例 5 和 6             |                    |                    |
|-----------------------|--------------------|--------------------|
| 成分                    | 实施例 5 <sup>1</sup> | 实施例 6 <sup>1</sup> |
| 水合氯化铝 <sup>2</sup>    | 30.0               | 30.0               |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>  | 5.7                | 3.4                |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>4</sup>   | 1.0                | 1.0                |
| 蔗糖二硬脂酸酯 <sup>10</sup> | 4.7                | 2.8                |
| 山箭醇 <sup>11</sup>     | 9.5                | 5.7                |
| 水                     | 5.0                | 30.0               |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup> | 44.1               | 27.1               |

实施例 4-6 的组合物含有水, 是不透明的、具有良好相稳定性的软固体凝胶, 在施用后可有效地释放抑汗组合物。

| 实施例 7-9                                |                    |                    |                    |
|----------------------------------------|--------------------|--------------------|--------------------|
| 成分                                     | 实施例 7 <sup>1</sup> | 实施例 8 <sup>1</sup> | 实施例 9 <sup>1</sup> |
| 水合氯化铝 <sup>2</sup>                     | 15                 | 30                 | 30                 |
| C <sub>12-15</sub> 烷基苯甲酸酯 <sup>7</sup> | 60                 | 48                 | 25                 |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>                   | --                 | --                 | 5                  |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>8</sup>                    | 10                 | 10                 | 10                 |
| 矿物油 <sup>9</sup>                       | 15                 | 12                 | 5                  |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup>                  | --                 | --                 | 25                 |

| 实施例 10               |                    |
|----------------------|--------------------|
| 成分                   | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 水合氯化铝 <sup>2</sup>   | 30                 |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup> | 10                 |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>8</sup>  | 10                 |
| 异十六烷 <sup>12</sup>   | 50                 |

<sup>12</sup> 挥发性烃载体, PERMETHYL 101A, 可从 Persperse, Inc., South Plainfield, New Jersey 购买到, 为 100% 的活性物质。

含有挥发性烃载体的实施例 10 的组合物, 与含有挥发性聚硅氧烷载体的实施例 1 的组合物有相同的物理特征。实施例 10 的组合物在美学上是可接受的, 并可有效地向皮肤释放抑汗化合物。

| 实施例 11                         |                    |
|--------------------------------|--------------------|
| 成分                             | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 四氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物 <sup>13</sup> | 30                 |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>           | 10                 |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>8</sup>            | 2                  |
| 蔗糖二硬脂酸酯 <sup>10</sup>          | 10                 |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup>          | 48                 |

<sup>13</sup> REACH AZZ-902SUF, 可从 Reheis, Inc., Berkeley Heights, New Jersey 购买到, 为 100% 的活性物质。

10

| 实施例 12-14                      |                     |                     |                     |
|--------------------------------|---------------------|---------------------|---------------------|
| 成分                             | 实施例 12 <sup>1</sup> | 实施例 13 <sup>1</sup> | 实施例 14 <sup>1</sup> |
| 三氯代氢化脂肪酸锆铝甘氨酸配合物 <sup>14</sup> | 26.5                | 26.5                | --                  |
| 水合氯化铝 <sup>2</sup>             | --                  | --                  | 26.5                |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>           | 6.0                 | 6.0                 | 6.0                 |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>8</sup>            | 1.0                 | 1.0                 | 1.0                 |
| 蔗糖二硬脂酸酯 <sup>10</sup>          | 2.5                 | 2.5                 | 2.5                 |
| 山萘醇 <sup>11</sup>              | 10.0                | 12.0                | 10.0                |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup>          | 54.0                | 52.0                | 54.0                |

<sup>14</sup> WESTCHLOR ZR30BDMCP, 可从 Westwood Chemical Corp., Middletown, New York 购买到, 为 100% 的活性物质。

实施例 12-14 的组合物是稳定的软固体凝胶, 作为抑汗组合物使用效果良好。

5

| 实施例 15                        |                    |
|-------------------------------|--------------------|
| 成分                            | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 三氯代氢化脂肪酸铝甘氨酸配合物 <sup>14</sup> | 30                 |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>          | 10                 |
| 二氢羊毛甾醇和羊毛甾醇 <sup>15</sup>     | 10                 |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup>         | 50                 |

<sup>15</sup> NIKKOL® ISOCHOLESTEROL EX, 可从 Nikko Chemical Co., Ltd., Tokyo, Japan 购买到, 为含二氢羊毛甾醇和羊毛甾醇的 100% 的活性物质。

实施例 15 的组合物是软凝胶组合物, 该组合物在 80°F 和 120°F 至少 1 个月是稳定的。该固体凝胶组合物具有足够的坚实性, 可以作为抑汗组合物并将抑汗化合物有效地传递到皮肤, 而不会在皮肤上产生粘腻感觉, 并且不会在皮肤或衣物上留下白色残留物。

10

| 实施例 16                        |                    |
|-------------------------------|--------------------|
| 成分                            | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 三氯代氢化脂肪酸铝甘氨酸配合物 <sup>14</sup> | 26.50              |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>          | 6.00               |
| 二氢羊毛甾醇和羊毛甾醇 <sup>15</sup>     | 1.00               |
| 蔗糖二硬脂酸酯 <sup>10</sup>         | 1.25               |
| 山萘醇                           | 10.00              |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup>         | 55.25              |

| 实施例 17                        |                    |
|-------------------------------|--------------------|
| 成分                            | 重量百分比 <sup>1</sup> |
| 三氯代氢化脂肪酸铝甘氨酸配合物 <sup>14</sup> | 26.5               |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>          | 6.0                |
| 鳄梨油不皂化物 <sup>16</sup>         | 5.0                |
| 山萘醇 <sup>11</sup>             | 10.0               |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup>         | 52.5               |

<sup>16</sup> CRODAROM AVOCADIN, 可从 Croda, Inc., Parsippany, New Jersey 购买到, 为 100% 的活性物质。

实施例 16 和 17 的组合物是白色固体可消散的乳膏, 在 80°F 和 120°F 至少 1 个月是稳定的。实施例 16 和 17 的组合物可有效地向皮  
5 肤释放抑汗化合物。

如上所述, 可将一重量份的凝胶抑汗组合物与约 0.5-约 3 重量份的烃类气雾剂基质混合, 以得到气溶胶抑汗组合物。实施例 18 和 19 说明气溶胶抑汗组合物。

| 实施例 18-19              |                     |                     |
|------------------------|---------------------|---------------------|
| 成分                     | 实施例 18 <sup>1</sup> | 实施例 19 <sup>1</sup> |
| 水合氯化铝 <sup>2</sup>     | 10.0                | 10.00               |
| 肉豆蔻酸异丙酯 <sup>3</sup>   | 2.5                 | 2.50                |
| 糊精棕榈酸酯 <sup>4</sup>    | 1.0                 | 0.50                |
| 蔗糖二硬脂酸酯 <sup>10</sup>  | 2.5                 | 1.25                |
| 环聚二甲基硅氧烷 <sup>5</sup>  | 24.0                | 25.75               |
| 气雾剂基质混合物 <sup>17</sup> | 60.0                | 60.00               |

10 <sup>17</sup> 烃类气雾剂基质混合物含有约 61% (重量) 正丁烷, 约 22% (重量) 异丁烷和约 16% (重量) 的丙烷。

实施例 18 和 19 的气溶胶组合物是两相组合物, 可有效地分散加压的抑汗组合物。该气溶胶抑汗组合物是软而不腻的。在将该气溶胶组合物施用到皮肤上后, 当时会观察到略白的残留物, 但该白色残留  
15 物在 1-5 分钟内会消失。

如上实施例所说明的, 本发明的抑汗组合物具有极好的美学和功能特性, 如药物释放、粘度、坚实性和低粘性。该组合物在室温以及升高的温度下有极好的稳定性。

20 本发明的抑汗组合物在局部施用到皮肤上后有极好的感觉特性。改进的物理和感觉特性包括能够向皮肤有效释放抑汗化合物的稠度、贮存稳定性, 而且在外部施用后基本上不会使皮肤和衣物变白。

应理解, 前文的详细描述仅仅是为了进行说明。显然, 可以对前文所述的本发明进行许多修饰和改变而不会偏离其实质和范围, 因此, 本发明的范围仅由所附权利要求书限定。