

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷
A61K 7/32
A61K 7/38



[12] 发 明 专 利 说 明 书

专利号 ZL 99810199.0

[45] 授权公告日 2005 年 11 月 30 日

[11] 授权公告号 CN 1229105C

[22] 申请日 1999.8.4 [21] 申请号 99810199.0
[30] 优先权
[32] 1998.9.4 [33] GB [31] 9819366.7
[86] 国际申请 PCT/EP1999/005613 1999.8.4
[87] 国际公布 WO2000/013657 英 2000.3.16
[85] 进入国家阶段日期 2001.2.27
[71] 专利权人 荷兰联合利华有限公司
地址 荷兰鹿特丹
[72] 发明人 G·C·霍格 D·T·帕罗特
J·H·S·伦尼
审查员 何 瑜

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司
代理人 钟守期

权利要求书 3 页 说明书 12 页

[54] 发明名称 防汗剂物质和含有它的组合物
[57] 摘要

固体颗粒防汗剂物质可以从含有聚二元醇醚和悬浮剂的制剂中沉降出来，从而形成难以再分散的紧密层。如果采用链烷醇胺如甲基丙醇胺对防汗剂物质进行表面处理，可以减轻或克服固体变实和难以再分散的问题。

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

1. 用 C_1 - C_{12} 链烷醇胺进行表面处理的颗粒防汗剂物质, 其中所述颗粒防汗剂物质包括铝、锆、铝和锆的混合物或钛的收敛剂化合物, 基于防汗剂计, 所述颗粒物质装载了 0.2%-8% 重量的链烷醇胺并且所述物质的平均颗粒尺寸为 10-70 μ m。

2. 根据权利要求 1 的颗粒防汗剂物质, 其特征在于所述链烷醇胺包括 C_1 - C_8 链烷醇。

3. 根据权利要求 2 的颗粒防汗剂物质, 其特征在于所述链烷醇为丙醇或丁醇。

4. 根据权利要求 1-3 中任一项的颗粒防汗剂物质, 其特征在于所述链烷醇胺为仲胺。

5. 根据权利要求 4 的颗粒防汗剂物质, 其特征在于所述链烷醇胺为甲基丙醇胺。

6. 根据权利要求 1 的颗粒防汗剂物质, 其特征在于所述颗粒物质装载了 0.4%-2.5% 重量的链烷醇胺。

7. 根据权利要求 1-3 中任一项的颗粒防汗剂物质, 其特征在于所述收敛剂化合物包括水合氯化铝或活性水合氯化铝。

8. 表面处理颗粒防汗剂物质的方法, 其特征在于: 使 C_1 - C_{12} 链烷醇胺以熔融形式或溶液形式与防汗剂物质接触直至至少部分链烷醇胺沉积或吸收在防汗剂物质的表面, 其中所述颗粒防汗剂物质包括铝、锆、铝和锆的混合物或钛的收敛剂化合物, 基于防汗剂计, 所述颗粒物质装载了 0.2%-8% 重量的链烷醇胺并且所述物质的平均颗粒尺寸为 10-70 μ m。

9. 包含防汗剂物质和含液体载体的液相的防汗剂组合物, 其中所述防汗剂物质包括铝、锆、铝和锆的混合物或钛的收敛剂化合物, 其特征在于: 所述防汗剂物质包括用 C_1 - C_{12} 链烷醇胺进行表面处理的颗粒防汗剂物质, 基于防汗剂计, 所述颗粒物质装载了 0.2%-8%

重量的链烷醇胺并且所述物质的平均颗粒尺寸为 10-70 μm ，所述液体载体包括聚 C₂-C₄ 二元醇醚，该聚二元醇醚和链烷醇胺的比例为 20:1-150:1。

10. 根据权利要求 9 的防汗剂组合物，其特征在于所述聚二元醇醚包括聚乙二醇醚、聚丙二醇醚或聚丁二醇醚。

11. 根据权利要求 10 的防汗剂组合物，其特征在于所述聚二元醇部分含有 5-24 个二元醇单元。

12. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其特征在于所述聚二元醇醚包括 C₃-C₈ 脂族醇的聚二元醇醚。

13. 根据权利要求 12 的防汗剂组合物，其特征在于所述醇为丙醇或丁醇。

14. 根据权利要求 13 的防汗剂组合物，其特征在于所述聚二元醇醚包括含有 10-16 个聚丙二醇单元的聚丙二醇丁基醚。

15. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其特征在于所述聚(C₂-C₄ 二元醇)醚占液相的 5-95%重量。

16. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其特征在于所述聚二元醇醚占液相的 40-60%重量。

17. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其特征在于存在的所述聚二元醇醚和链烷醇胺的重量比为 30:1-120:1。

18. 根据权利要求 17 的防汗剂组合物，其中所述聚二元醇醚和链烷醇胺的重量比为 45:1-80:1。

19. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其特征在于所述载体含有挥发性或不挥发性硅油。

20. 根据权利要求 19 的防汗剂组合物，其特征在于所述液相包含 20-70%重量的挥发性硅油。

21. 根据权利要求 20 的防汗剂组合物，其中所述液相包含 40-70%重量的挥发性硅油。

22. 根据权利要求 19 的防汗剂组合物，其特征在于所述液相包

含 0.01-0.1%重量的不挥发性硅油。

23. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其含有粘土或二氧化硅悬浮剂。

5 24. 根据权利要求 23 的防汗剂组合物，其特征在于所述悬浮剂含有占组合物重量 2-6%的经疏水处理的粘土。

25. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其特征在于含有一种或多种悬浮助剂、润肤剂或香料。

26. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其特征在于所述液相占 90-50%重量，而颗粒防汗剂占 10-50%重量。

10 27. 根据权利要求 26 的防汗剂组合物，其中所述液相占 75-55%重量，而颗粒防汗剂占 25-45%重量。

28. 根据权利要求 9-11 中任一项的防汗剂组合物，其特征在于：使 95-1 份重量的组合物与 5-99 份重量的抛射剂接触从而形成气雾剂组合物。

15 29. 根据权利要求 28 的防汗剂组合物，其特征在于：使 40-5 份重量的组合物与 60-95 份重量的抛射剂接触从而形成气雾剂组合物。

30. 控制出汗的方法，其包括局部施用根据权利要求 9 的组合物于人类皮肤。

防汗剂物质和含有它的组合物

- 5 本发明涉及一种防汗剂物质、它的制备方法以及含有它的防汗剂组合物。

技术领域和现有技术

- 10 在防汗剂组合物一个重要方面，活性防汗剂物质以颗粒的形式存在。为便于配制，在许多这样的组合物中，通常在悬浮剂或助剂的帮助下，将活性物质悬浮或分散于液体载体相。如果防汗剂物质不宜悬浮，那么它容易从液体载体中分离出来，例如在贮存或在施用之间所述组合物沉降至容器的底部。当使用者易于重分散所述沉降物质时(如施用前通过使用者用手摇晃)，固体沉降只是带来较小的
- 15 不方便，而不是一个大问题。然而，当沉降生成极难或甚至根本不能用手重分散的紧密层时，这个问题变得很严重，因为非常需要避免或减少来自活性防汗剂物质制剂的有效性损失。显然，贮存时活性物质的损失使得所述组合物在施用时不均匀并具有随使用时间的不同具有不同组成的危险，这样不能有效或足够有效地控制汗的损失。
- 20 失。

- 人们已经发现：有利的皮肤感受性质可以通过在防汗剂组合物中以至少部分液相的形式加入的聚二元醇醚来获得。将颗粒防汗剂悬浮至液相载体中的实用方法包括：加入一种悬浮助剂(通常为无机物如粘土)。然而，人们进一步发现：当所述载体含有一种聚二元醇醚时，粘土或类似悬浮剂在载体液体中悬浮或再悬浮颗粒防汗剂物
- 25 质的能力显著下降。

 在其它领域对颗粒无机物质尤其颜料和防晒剂进行的表面处理为人们所熟悉，但这是用于其它目的。因此，例如，GB-A-1602428

中采用酯或胺对二氧化钛颜料进行表面处理，它影响了含有这种颜料的薄膜的干燥速率。在 EP-A-0559319 中，金属氧化物颗粒，尤其二氧化钛和氧化锌颗粒被表面包膜从而有助于它们在水乳液中的悬浮。这与本发明的基本无水的组合物无关。相似地在 US-A-5573753 5 中描述了在水乳液中分散经表面处理的颗粒二氧化钛和氧化锌。在 US-A-4318843(EP-A-0021262)中描述了对无机颜料进行表面处理(其中以二氧化钛为实例)从而改进其在涂料腻子中的光泽和分布。在 US-A-5776440 中，通过用许多有机化合物包覆它们，可以提高局部施用金属氧化物滤除 UV 辐射的有效性。以二氧化钛的处理进行了举例 10 说明。

本发明的目的是改进或克服一个或多个上述问题或缺陷。

发明综述

根据本发明，提供一种用链烷醇胺进行表面处理的颗粒防汗剂 15 物质。

根据本发明的相关方面，提供一种表面处理防汗剂物质的方法，其特征为：在液体介质中通过使防汗剂物质与链烷醇胺接触，并保持接触直至至少部分链烷醇胺沉积或吸收在防汗剂物质的表面。

采用链烷醇胺对颗粒防汗剂物质进行表面处理，人们已经发现 20 所得颗粒物质不易从含有聚二元醇醚和悬浮剂的液体载体中分离出来。

此处所述表面处理是指使表面处理剂与基材物质即防汗剂物质的表面或外层紧密接触，并且可以沉积于表面上，例如在基材表面上形成一处理剂层或包膜，或所述试剂的至少一部分可以被基材的 25 外层所吸收。

在本发明的另一方面，提供含有防汗剂物质和包含一种载体的液相的防汗剂组合物，其特征为：防汗剂物质包括一种用链烷醇胺进行表面处理的颗粒防汗剂物质。

在此，包括在全文中的组合物表明：除了本组合物中特别标明外，所述组合物可以含有一种或多种其它组分。

本发明详述

- 5 本发明提供一种经表面处理的颗粒防汗剂活性物和含有以上物质的防汗剂组合物，和尤其含有聚二元醇醚和悬浮剂的组合物。

防汗剂物质

- 10 防汗剂物质可以包括当局部施用于人的皮肤时可以减少或防止出汗的防汗剂物质。本发明涉及防汗剂活性物，当局部施用其渗透至外分泌腺和由此沉积其中，堵塞其导管并防止汗液的排出。因此，这种物质通常包括一种收敛剂盐。防汗剂通常包括铝盐、锆盐、混合的铝/锆盐以及钛盐，包括无机盐和有机盐以及络合物。优选的收敛剂盐包括铝盐、锆盐和卤化铝/锆以及水合卤化物盐如水合氯化物。一些特别优选的水合卤化物盐包括活性水合氯化铝，如描述于
- 15 EP-A-6739(Unilever NV 等)的那些物质，而其它活性物描述于 EP-A-28853。这两份说明书均在此加入以作参考。应该认识到：源于铝、锆、钛或锌的金属氧化物不能视为防汗剂。

- 20 收敛剂铝盐包括氯化铝和通式 $Al_2(OH)_xQ_y \cdot XH_2O$ 的水合卤化铝，其中 Q 代表氯、溴或碘，x 为 2-5 并且 $x+y=6$ ，x 和 y 为整数或非整数并且 X 为 0-6。

- 可以用于此处防汗剂组合物的许多锆盐可以用下面的经验通式来表征： $ZrO(OH)_{2n-nz}B_z$ ，其中 z 为 0.9-2.0 的整数或非整数，n 为 B 的化合价， $2-nz$ 至少为 0 并且 B 选自卤化物，其包括氯化物、
- 25 sulphamate、硫酸盐及其混合物。

应该认识到：可以大大简化用于铝盐和锆盐的上述公式并且包括具有不同数量的共配位和/或结合水的化合物以及聚合物、混合物和络合物。

基于上述收敛剂盐的防汗剂络合物已为人熟知并且可应用于本发明。实例有公开于 US-A3792068(Luedders 等)中的铝、锆和氨基酸如甘氨酸的络合物。具有相应结构的那些络合物在文献中通称为 ZAG。具有类似 ZAG 结构的一类所需络合物包括水合氯化铝，其包括与氨基酸或其它络合剂相络合的满足公式 $\text{Al}(\text{OH})_3\text{Cl}\cdot 2\text{H}_2\text{O}$ 的物质。具有类似 ZAG 结构的优选一类锆基络合物包括经验公式 $\text{ZrO}(\text{OH})_{2-a}\text{Cl}_2\cdot n\text{H}_2\text{O}$ 的水合氯化氧锆，其中 a 为 1.5-1.87 的非整数，n 为 1-7，它与氨基酸或其它络合剂络合。活性 ZAG 络合物可以用作本发明的防汗剂活性物，如公开于 USP 5486347(Callaghan 等)的物质。

可以用作本发明生产和/或配制的组合物的合适成分的其它活性物包括颗粒钛盐如羟基羧酸盐如柠檬酸盐或乳酸盐。

尤其当所述防汗剂盐以气雾剂的形式施用时，优选采用没有锆的盐，如铝盐或可以为钛盐，尤其包括水合氯化铝(ACH)和活性水合氯化铝(AACH)。

此处所用防汗剂盐的颗粒尺寸通常为 1-200 微米。在许多需要的制剂中，尤其以气雾剂形式进行施用时，防汗剂盐的平均颗粒尺寸为 5-50 μm ，尤其 15-30 μm 。

20 链烷醇胺

链烷醇胺可以包括含有胺和羟基官能团的脂族化合物。希望它具有低分子量，例如含有至高达 12 的碳原子，其可以包括直链或支链的烷基。链烷醇部分优选包括 C_3 或 C_4 烷基，如羟基丙胺或羟基丁胺。所述胺可以为伯胺、仲胺或叔胺。所有胺取代基可以含有链烷醇取代基，或在仲胺或叔胺中，分别一个或者一个或两个取代基可以含有一个烷基，如 C_1 - C_4 。伯胺的实例包括丙醇胺，仲胺包括甲基丙醇胺，叔胺的实例包括三异丙醇胺。在许多例子中，链烷醇胺包含单个胺，在其它例子中包括 1-3 个羟基，尽管在具体的链烷醇中通

常含有不超过两个的羟基取代基。也可应用两种或更多种这些链烷醇胺的混合物。通过以流体形式与链烷醇胺接触，可方便地对防汗剂物质进行表面处理。例如如果需要的话，可以将链烷醇胺加热至大于其熔点，或者溶于合适的溶剂。所述溶剂可以含有疏水性液体如硅油或烃油。需要使防汗剂和链烷醇胺进行接触直至防汗剂保留所需重量的链烷醇胺(通常作为防汗剂的表层或包膜或被吸收至防汗剂的外层)。将链烷醇胺以溶液形式用于防汗剂时，如果需要，可以使所述溶液永久性地与防汗剂接触，而不是被分离开来，这时所述防汗剂载有所需量的链烷醇胺，其中用于链烷醇胺的溶剂随后充当液体载体或防汗剂组合物中的一个组分。在这些组合物中，一部分链烷醇胺可以保留在液体载体内。

我们应当认识到：可以单独步骤的形式实施防汗剂固体的表面处理(例如在将防汗剂活性物加入防汗剂组合物之前)，或者可以原地形成，条件是所述组合物含有存在于流体介质中的链烷醇胺和防汗剂活性物，流体介质使它们能够相互接触。

防汗剂物质通常与 0.2-8%(重量)的链烷醇胺接触，并且在许多例子中，所选的链烷醇胺比例为防汗剂重量的 0.4-2.5%(重量)。尤其方便的范围可以为：链烷醇胺为防汗剂的 0.75-1.5%(重量)。

通常将表面处理的防汗剂物质加入含有液体载体的组合物中。防汗剂物质的比例通常以无水盐的重量计，即排除结合水或也可能存在的络合剂的重量并且排除任意表面处理的重量。

液体载体

在本发明的一个重要方面，液体载体包括聚二元醇醚，后者优选包含 5-95%(重量)的液相，具体为 30-75%，尤其为 40-60%。这种组合物为一种便利的基础组合物，它本身便能够被施用或用作一种可以加入其它组分的基础组合物，例如用来形成一种气雾剂组合物。当所述组合物局部施用于人类皮肤时，聚二元醇醚的存在有利地赋

予了润肤性能, 并且可以减少可见的沉积物。

聚二元醇醚通常由低分子量的二元醇即通常 C_2 - C_4 二元醇如乙二醇、丙二醇或丁二醇衍生而来, 并且尤其为聚丙二醇醚。希望聚二元醇部分含有 5-24 个二醇单元, 许多优选醚含有 10-16 个二元醇单元, 尤其 10-16 个丙二醇单元。所述醚部分优选为脂族, 由低分子量脂族醇并尤其含有至高达 8 个的碳原子, 具体为 3-8 个碳原子的链烷醇衍生而来。所述链烷醇通常为丙醇或丁醇。其中聚二元醇部分含有 10-16 个丙二醇单元(如 13 或 14)的聚丙二醇丁基醚尤其合适。

实际上, 正如上面所述的那样, 希望组合物中聚二元醇醚和链烷醇胺的比例为 20:1-150:1, 尤其 30:1-120:1, 优选 45:1-80:1。

通过在上述比例范围和尤其在所述优选范围内选择聚二元醇醚和链烷醇胺的相对比例, 在悬乳剂的存在下, 可以提高颗粒防汗剂物质在聚二元醇醚载体流体中的悬浮性能。无链烷醇胺时, 这些组合物中的各层颗粒物质在贮存时易于沉降出来, 非常难或不可能通过用手摇晃得到重分散。通过加入链烷醇胺, 如使其与防汗剂接触紧密接触, 可以抑制或基本消除这些重分散性极差的层的形成。将链烷醇胺加入组合物时, 在一定程度上一些或所有颗粒物质会沉降出来, 但可以较容易地被重分散(例如通过用手摇晃)。

我们应该认识到: 链烷醇胺可以防汗剂物质的表面处理的形式存在于所述组合物中, 并且其一部分还可以液体载体的形式保留于溶液中。

在本发明许多特别需要的实施方案中, 提供了包括颗粒防汗剂物质、链烷醇胺和含有聚二元醇醚的液体载体和悬浮剂的防汗剂组合物。

悬浮剂

在这种组合物中, 悬浮剂宜为无机物, 尤其粘土或二氧化硅。所述粘土通常为蒙脱土, 并且有利地可以用有机物如胺进行表面处

理以赋予其疏水性。蒙脱土的实例包括膨润土、锂蒙脱石和胶体硅
酸铝镁。尤其适用的表面处理粘土包括表面处理的膨润土，它们可
由商标名 Rheox 从 Rhox 获得供应，如 Bentone 27、Bentone 34、
Bentone38 和 Bentone LT。合适的二氧化硅包括煅制二氧化硅并尤其
5 具有极细颗粒尺寸的那些二氧化硅，如商标名为 Cab-O-sil 和
AEROSIL 的商品。非常希望所述悬浮剂为疏水表面处理的粘土。

所述悬浮剂的加入量通常为此处所述组合物的 0.1-15%(重量)，
具体为基础组合物(即在用如抛射剂配制生成气雾剂之前的只含有防
汗剂活性物、载体液体、链烷醇胺和悬浮剂的组合物)的 3-10%。在
10 本发明的优选制剂中，防汗剂与悬浮剂的重量比通常为 2.5:1-20:1。

其它组分

液体载体通常为无水物质，也就是说不含任何游离水并尤其不
含水相。实际上，它是指含有这些载体的制剂为无水物质。除了聚
15 二元醇醚外，液体载体还可含有一种或多种疏水流体，包括硅油和
液体烃。所述液体载通常含有 5-80%(重量)的组合物。当所述组合物
组成基础制剂(用抛射剂配制以形成气雾剂组合物)时，液体载体的比
例尤其为基础制剂的 30-70%(重量)。液体载体或载体混合物通常组
成基础制剂液相的 70-99%，尤其为 80-95%，我们应当认识到：以润
20 肤剂加入的液体组分也充当载体。聚二元醇醚与其它载体总和之比
通常为 10:1-1:10，在许多优选的组合物中为 2:1-1:2。

硅油为所述组合物的优选组分，此处所用的这些油通常选自聚
硅氧烷和尤其聚烷基硅氧烷或 silicone glycols。所述油可以为挥发性
或不挥发性或两者的混合物，但优选挥发性油组成硅油的主要部分。

25 挥发性硅氧烷通常选自式 $[-SiRR']_n$ - 的环状聚硅氧烷，其中 R
和 R' 代表烷基，优选甲基，并且 n 为 3-8，并尤其为 4 或 5，也称为
环甲基硅酮。其它合适的挥发性硅氧烷可以选自低分子量的式
 $SiRR'R''-[-SiRR']_m-SiRR'R''$ 的直链聚硅氧烷，其中 R、R' 和 R'' 各自

代表烷基, 优选甲基, 并且 m 为 1-7 并尤其为 2 或 3。通常挥发性硅油在 25℃ 下的粘度为约 1-10 厘沱。挥发性硅油的实例为 Dow Corning 225、244、245、344、345、1732、5732、5750(全部购自 Dow Corning Corp.)和硅氧烷 GE7207、GE7158、SF1202、SF1173、SF-96 和 SF-1066(全部购自通用电气公司, 美国)。

适合加入此处组合物中的不挥发性硅油可以含有聚烷基硅氧烷、聚烷芳基硅氧烷或聚醚硅氧烷共聚物, 通常其在 25℃ 下的粘度大于 10 厘沱。通常许多不挥发性硅油的粘度高达约 2000 厘沱, 其它则具有更高的粘度, 如高达约 10^6 - 5×10^6 厘沱。合适的非挥发性聚烷基硅氧烷的实例为可由 Dow Corning 200 系列获得供应的聚烷基硅氧烷。合适的聚烷芳基硅氧烷包括 25℃ 下粘度约 15-65 厘沱的聚甲基苯基硅氧烷, 如 Dow Corning 提供的 556 流体。合适的聚醚硅氧烷包括二甲基聚氧亚烷基(dimethylpolyoxyalkylene)醚共聚物(聚二甲基硅氧烷共聚物), 其在 25℃ 下的粘度通常为 1200-1500 厘沱, 如聚硅氧烷二元醇醚共聚物。而其它合适的非挥发性硅油包括或含有聚二甲基硅氧烷/醇聚合物(聚二甲基硅氧烷醇)。

如果需要, 液体载体可以包括液体烃, 如矿物油、石蜡油、矿物脂或烃油。

此处组合物的液相还可包含其它液体润肤剂, 如通常含有约 12-25 个碳原子的液体酯, 其含有长链(通常含有至少 12 个碳原子)和短链烷基(通常含有 2-6 个碳原子), 可以由酸和醇衍生而来, 或者反之亦然, 如肉豆蔻酸异丙酯或棕榈酸异丙酯。其它合适的酯包括芳基二或三羧酸的短链烷基酯, 如邻苯二甲酸二乙酯或二丁酯。其它液体润肤剂包括通常具有约 200-350 分子量的液体脂肪醇, 如辛基十二醇或异鲸蜡醇。

所述组合物还可含有一种或多种悬浮助剂, 例如碳酸丙烯酯, 其量为悬浮剂的 0-50%(重量)。所述组合物中的其它任选组分包括抗氧化剂或防腐剂, 其有时占所述组合物的 0-0.5%, 尤其 0.01-0.15%(重

量)。

5 尽管任选，但香料仍是根据本发明的许多抗汗剂组合物的一种重要组分。可以将香料以油溶性形式和/或被包囊的形式加入。在本发明的许多组合物中，香料含量为 0.1-3%(重量)。在基础制剂即用液化抛射剂进行稀释的那些制剂中，香料通常可以占较高的比例，如 1.5-8%。

10 本组合物的其它任选组分可以包括颗粒填料，优选极细的颗粒填料如滑石粉或微细淀粉或琥珀酸淀粉衍生物(干 FloTM)或极细的颗粒聚乙烯(AcumistTM)，其用量方便地为基础制剂的 0-20%，尤其为配制制剂的 0-5%。其它任选的组分可以包括杀微生物剂如杀菌剂，在一些组合物中的加入量为 0.1-1%(重量)。合适的杀微生物剂包括双胍盐如可供商品 CosmosilTM(商标)和氯化芳族化合物，包括氯化苯基醚和双胍衍生物，其被称为三氯羟基二苯醚、TriclorbanTM 以及特别提到的授权的洗必泰。

15 此处所述的抗汗剂组合物可以通过混合各种组分来制备，例如采用常规的设备来混合颗粒物质与一种或多种液体。它们特别适合通过喷雾或通过辊涂(roll-on)来施用。

气雾剂制剂

20 在本发明特别希望的一个方面，上述组合物用抛射剂进行稀释从而形成气雾剂制剂。所述气雾剂制剂通常包括 40-99 份(重量)、尤其 50-95 份(重量)的抛射剂，其余为防汗剂基础组合物(各自为 60-1 份并尤其为 50-5 份(重量))。

25 所述抛射剂通常选自液化烃或卤化烃气体，其沸点低于 10℃ 并尤其低于 0℃。特别优选采用液化烃气体，尤其 C₃-C₆ 烃，包括丙烷、异丙烷、丁烷、异丁烷、戊烷和异戊烷及其两种或更多种的混合物。优选抛射剂为异丁烷、异丁烷/异丙烷、异丁烷/丙烷以及异丙烷、异丁烷和丁烷的混合物。

可以加入的其它抛射剂包括烷基醚, 如二甲醚或压缩的非反应性气体如空气、氮或二氧化碳。

如果需要, 可以将常规量的防阻塞剂加入所述气雾剂制剂从而防止喷嘴的固体物堵塞。

5 通常采用常规的充装设备和条件, 将所述气雾剂制剂加入可以耐受由于所述制剂产生的压力的气雾罐。所述罐可以方便地为配有浸管、阀门和喷嘴(通过它们将所述制剂进行分配)的商品供应的金属罐。

10 可以将本发明的抗汗剂组合物局部施用于人类皮肤从而控制出汗。

以上对本发明进行了总体的描述, 以下仅通过实施例更详细地对其具体实施方案进行描述。

实施例 1

15 在这个实施例中, 通过将活性水合氯化铝(此后称为 AACH)(100g)导入配有搅拌设备的容器来获得经表面处理的颗粒抗汗剂物质, 在合适的控制条件下, 活性水合氯化铝由加热具有合适化学式的水合氯化铝来获得, 其颗粒尺寸为 10-70 μm 。此后, 加入熔融的甲基丙醇胺(1g)并在几分钟内与 AACH 进行充分混合。所得产物含有用甲基
20 丙醇胺进行过表面处理的 AACH。

实施例 2-8

25 在各个实施例中, 通过采用常规方法混合颗粒组分和液体组分, 获得适于用抛射剂稀释以形成气雾剂组合物的基础制剂。下面表 1 对所述组合物进行了综述:

组分	% (重量)									
	实施例号	2	3	4	5	6	7	8		
AACH		40		38.46	10	30.8	40	38.5		
ACH			48							
疏水性粘土 (Bentone 27)				7.7		3.9				
疏水性粘土 (Bentone 38)		4	4.8		3.5		4	3.8		
PPG13 丁基醚 (流体 AP)		24	20.76	23.07	50	27	24	23.1		
甲基丙醇胺 (AMP 100)		0.4	0.44	0.39	0.4	0.4	0.4	0.4		
挥发性硅氧烷 (DC245)		28	22				28.2	27.7		
挥发性硅氧烷 (DC345)				24.23						
挥发性硅氧烷 (DC1465)					29.55					
挥发性硅氧烷 (DC246)						34.8				
煅制二氧化硅 (AER-O-SIL 200)		0.4			0.05					
辛基十二醇		1.2								
肉豆蔻酸异丙酯						0.8				
碳酸丙烯酯				0.77						
聚癸烯 (Silkflo 364)					1.5					
邻苯二甲酸二乙酯						0.4				
硅胶 (Q2-1501)							0.8	1.5		
香料		2	4	5.38	5	1.9	2.6	5		

表 1 所述组合物在形成沉积压缩固体层方面显示出良好的抵抗力并且当用手摇晃时能很好地重分散沉积的固体。

实施例 9-15

5 在这些实施例中，通过采用常规方法，用液化烃抛射剂稀释基础制剂可以获得气雾剂制剂。将所述制剂充装至配有浸管、流量阀和喷头的普通吹制铝气雾罐中。下面表 2 综述了所述气雾剂制剂。CAP40 为丁烷、异丁烷和丙烷的混合物。

表 2

		% (重量)						
	实施例号	9	10	11	12	13	14	15
抛射剂 (CAP 40)		75	75	87	80	74.1	75	87
实施例 2 组合物		25						
实施例 3 组合物			25					
实施例 4 组合物				13				
实施例 5 组合物					20			
实施例 6 组合物						25.9		
实施例 7 组合物							25	
实施例 8 组合物								13

10