



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК
A61K 8/18 (2006.01)
A61K 8/26 (2006.01)
A61K 8/28 (2006.01)
A61K 8/19 (2006.01)
A61K 8/44 (2006.01)
A61Q 15/00 (2006.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2008123790/15, 16.11.2006

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
16.11.2006(30) Конвенционный приоритет:
16.11.2005 US 60/737,207

(45) Опубликовано: 20.03.2010 Бюл. № 8

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: US 5653970 A, 05.08.1997. US 2005/0036967
A1, 17.02.2005. RU 2056833 C1, 27.03.1996. US
6375937 A, 23.04.2002. US 5968490 A,
19.10.1999. US 4025615 A, 24.05.1977. US
2005/0036969 A1, 17.02.2005. WO 2005092795
A1, 06.10.2005. WO 00/67726 A1, 16.11.2000.
WO 2004/089325 A1, 21.10.2004.(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 16.06.2008(86) Заявка РСТ:
US 2006/060987 (16.11.2006)(87) Публикация РСТ:
WO 2007/059530 (24.05.2007)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной

(72) Автор(ы):

МАТТАИ Джайрадж (US),
КИЛПАТРИК-ЛИВЕРМАН Латония (US),
ХОЛЕРКА Мэриан (US),
ТАН Сяохун (US)

(73) Патентообладатель(и):

КОЛГЕЙТ-ПАЛМОЛИВ КОМПАНИ (US)

(54) КОМПОЗИЦИИ АНТИПЕРСПИРАНТА

(57) Реферат:

Изобретение относится к области
медицины, в частности косметики. Композиция
антиперспиранта, содержащая продукт
смешения: (а) одной алюминиевой соли, одной
алюминиево-циркониевой соли, одного
алюминиевого солевого комплекса и одного
алюминиево-циркониевого солевого
комплекса, где алюминиевая соль или
алюминиевый солевой комплекс представляет
собой одну соль, выбранную из хлорида
алюминия, хлоргидрата алюминия,

секвихлоргидрата алюминия и дихлоргидрата
алюминия; (b) одной косметически приемлемой
альфа-гидроксикислоты; и (с) одного бетаина,
выбранного из внутренней соли гидроксида
1-карбокси-N,N,N-триметилметанаминия и
гидрохлорида внутренней соли гидроксида
1-карбокси-N,N,N-триметилметанаминия; где
количества компонентов (а), (b) и (с) являются
такими, что водный раствор данных
компонентов с теми же количествами, при 25%
концентрации (а)+(b), после хранения при 45°C
в течение 60 дней имеет скорректированную

площадь пика 1 эксклюзионной хроматографии SEC не более чем приблизительно 40%, скорректированную площадь SEC-пика 5 по крайней мере 30%, и скорректированную площадь SEC-пика 4 по

крайней мере 15%. Изобретение обеспечивает улучшение стабильности композиции при усилении противопотокового эффекта. 4 н. и 13 з.п. ф-лы, 1 табл.

R U 2 3 8 4 3 2 0 C 2

R U 2 3 8 4 3 2 0 C 2



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.
A61K 8/18 (2006.01)
A61K 8/26 (2006.01)
A61K 8/28 (2006.01)
A61K 8/19 (2006.01)
A61K 8/44 (2006.01)
A61Q 15/00 (2006.01)

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: **2008123790/15, 16.11.2006**
(24) Effective date for property rights:
16.11.2006
(30) Priority:
16.11.2005 US 60/737,207
(45) Date of publication: **20.03.2010 Bull. 8**
(85) Commencement of national phase: **16.06.2008**
(86) PCT application:
US 2006/060987 (16.11.2006)
(87) PCT publication:
WO 2007/059530 (24.05.2007)

Mail address:
**129090, Moskva, ul.B.Spasskaja, 25, str.3, OOO
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery",
pat.pov. E.E.Nazinoj**

(72) Inventor(s):
**MATTAI Dzhajradzhkh (US),
KILPATRIK-LIVERMAN Latonija (US),
KhOLERKA Mehrian (US),
TAN Sjaokhun (US)**
(73) Proprietor(s):
KOLGEJT-PALMOLIV KOMPANI (US)

(54) ANTIPERSPIRANT COMPOSITIONS

(57) Abstract:
FIELD: medicine.
SUBSTANCE: antiperspirant composition containing a product of mixing: (a) one aluminium salt, one aluminium-zirconium salt, one aluminium salt complex and one aluminium-zirconium salt complex, where aluminium salt or aluminium salt complex represents one salt chosen from aluminium chloride, aluminium hydrochloride, aluminium sesquihydrochloride and aluminium dihydrochloride; (b) one cosmetically acceptable alpha-hydroxyacid; and (c) one betaine chosen from inner salt of 1-carboxy-N,N,N-trimethylmethanaminium hydroxide

and hydrochloride of inner salt of 1-carboxy-N,N,N-trimethylmethanaminium hydroxide; where amounts of components (a), (b) and (c) are such that the aqueous solution of said components in the same quantities in 25% concentration of (a) + (b), having been stored at 45°C during 60 days, has a corrected peak area 1 in ion-exclusion chromatography SEC no more than approximately 40%, a corrected SEC-peak 5 area at least 30%, and the corrected SEC-peak 4 area at least 15%.
EFFECT: improved stability of the composition with intensifying the antisudorific effect.
17 cl, 1 tbl, 1 ex

RU 2 3 8 4 3 2 0 C 2

RU 2 3 8 4 3 2 0 C 2

Перекрестная ссылка на родственную заявку

Данная заявка претендует на приоритет по предварительной заявке на патент США №60/737207, поданной 16 ноября 2005, которая включена в настоящую заявку посредством ссылки.

Уровень техники

Композиции антиперспирантов, содержащие алюминиевые или алюминий-циркониевые соли, со временем склонны обнаруживать полимеризацию данных солей с образованием частиц с молекулярными массами в диапазоне от примерно 500 до примерно 500000 г/моль. В общем, частицы меньшей молекулярной массы обладают большим противопотовым эффектом, чем частицы большей молекулярной массы. Не ограничиваясь теорией, полагают, что молекулы меньшего размера легче и эффективнее закрывают потовые поры, оказывая тем самым желаемый противопотовый эффект. Таким образом, уменьшение размера полимеров усиливает противопотовый эффект и, более того, уменьшает количество соли с противопотовым действием, которое необходимо для контроля потоотделения. Возможность уменьшения количества соли с противопотовым действием в средстве без ухудшения эффективности обеспечила бы ряд преимуществ. Соли с противопотовым действием представляют собой относительно дорогостоящий компонент типичного противопотового средства. Таким образом, весьма желательно располагать композициями, в которых соли с противопотовым действием стабилизированы в целях уменьшения полимеризации.

Степень полимеризации антиперспиранта может быть измерена эксклюзионной хроматографией (SEC), также известной как гель-фильтрационная хроматография (GFC). Прохождение малых молекул через SEC-колонку замедлено, тогда как большие молекулы проходят через нее легче. Время элюирования полимерного вещества, перемещающегося по SEC-колонке, соотносится с размером полимерных молекул, и данное соотношение позволяет определить кажущуюся молекулярную массу полимера. В большинстве случаев с помощью SEC в композициях алюминиевых или алюминий-циркониевых солей можно идентифицировать от 4 до 6 хорошо определенных групп полимерных частиц, и данные группы обычно известны как пики 1, 2, 3, 4, 5 и 6 (6 присутствует не всегда). Пик 1 связан с циркониевыми частицами и, таким образом, присутствует только в случае алюминий-циркониевых солей. Пик 2 присутствует не всегда в случае алюминий-циркониевых солей. Пик 6 присутствует не всегда. Начальные пики (1, 2 и 3) соответствуют частицам большего размера, а поздние пики (4, 5 и 6) соответствуют меньшим и более желательным частицам. Пики соотносятся со средневзвешенными значениями молекулярной массы полимеров, но не с дискретными значениями.

В данной области продолжает существовать необходимость в улучшенных композициях антиперспирантов и/или дезодорантов. В частности, было бы желательно предоставить такие композиции, обладающие улучшенной стабильностью. Далее, было бы желательно предоставить такие композиции, обладающие усиленной противопотовой эффективностью. Далее, также было бы желательно предоставить такие композиции, в которых образование циркониевых и/или алюминиевых полимерных частиц более высокой молекулярной массы уменьшено или подавлено, особенно когда такое уменьшение или подавление ведет к повышению эффективности, например, относящейся к более эффективному закрытию потовых пор.

Сущность изобретения

Композиция антиперспиранта, содержащая продукт смешения:

(a) по крайней мере одной соли, выбранной из по крайней мере одной алюминиевой соли, по крайней мере одной алюминиево-циркониевой соли, по крайней мере одного алюминиевого солевого комплекса и по крайней мере одного алюминиево-циркониевого солевого комплекса;

(b) по крайней мере одной косметически приемлемой гидроксикислоты; и

(c) по крайней мере одного косметически приемлемого четвертичного аммонийного кислого соединения.

Подробное описание изобретения

Приведенные в настоящей заявке диапазоны использованы для сокращенной записи всех значений, которые входят в данный диапазон. Любое значение в рамках данного диапазона может быть выбрано в качестве конечное значение диапазона.

В одном осуществлении композиция антиперспиранта содержит продукт смешения:

(a) алюминиевой и/или алюминиево-циркониевой соли или ее комплекса;

(b) косметически приемлемой гидроксикислоты; и

(c) косметически приемлемого четвертичного аммонийного кислого соединения.

Компоненты композиции антиперспиранта могут присутствовать в свободной или солевой форме и, в зависимости от состава средства, могут быть осажденными или растворенными или же находится в форме сольватов.

Алюминиевые или алюминиево-циркониевые соли могут присутствовать, например, в форме хлорида или хлоргидрата, например хлорида алюминия, хлоргидрата алюминия, секвихлоргидрата алюминия, дихлоргидрата алюминия, трихлоргидрата алюминия-циркония, тетрахлоргидрата алюминия-циркония, пентахлоргидрата алюминия-циркония, октахлоргидрата алюминия-циркония или их смесей.

Необязательно, данные соли могут образовывать или могут быть предоставлены как комплексы с другими соединениями, например комплексы с гидроксикислотами и/или четвертичными аммонийными кислотами, как описано, и/или с аминокислотами, такими как глицин, и/или с многоатомными спиртами, например с этиленгликолем, полиэтиленгликолем, пропиленгликолем или полипропиленгликолем. Когда антиперспирант содержит алюминиево-циркониевую соль, соль может иметь мольное отношение алюминия к цирконию, например, в диапазоне от примерно 2 до примерно 10, например, от примерно 2 до примерно 5 или от примерно 5 до примерно 10. В некоторых осуществлениях, содержащих алюминиево-циркониевую соль, алюминиево-циркониевая соль может представлять собой, например, хлоргидрат алюминия-циркония или его комплекс, где мольное отношение (атомов алюминия и циркония) к атомам хлора находится в диапазоне от примерно 0,9 до примерно 2,1, например, в диапазоне от примерно 1,2 до примерно 1,8.

Четвертичное аммонийное кислое соединение типично существует в цвиттер-ионной форме, образуя внутреннюю соль между катионной четвертичной аммонийной частью и анионной карбоксильной кислотной частью. Оно, однако, может присутствовать и в солевой форме, например в форме кислой аддитивной соли. Например, бетаин может быть предоставлен в форме гидрохлорида бетаина.

Катион дивалентного металла может быть предоставлен в солевой или оксидной форме, например, кальций может быть предоставлен в форме, например, хлорида кальция или оксида кальция.

В одном осуществлении композиции антиперспиранта соль с противопотовым действием представляет собой алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль, и

четвертичное аммонийное кислое соединение представляет собой бетаин, где отношение металла (алюминия и циркония) к хлориду равно от примерно 0,9 до примерно 2,1, отношение бетаина к цирконью равно от примерно 0,1 до примерно 2, и отношение бетаина к гидроксикислоте равно от примерно 0,2 до примерно 30.

5 В одном осуществлении композиция обнаруживает улучшенную стабильность по сравнению с аналогичными средствами, не содержащими гидроксикислоты или не содержащими гидроксикислоты и дивалентного катиона, например, как определено, по крайней мере, одним из показателей: (а) уменьшением образования полимерных
10 частиц большей молекулярной массы, содержащих алюминий и/или цирконий, на что указывает, по крайней мере, уменьшение площади SEC-пиков 2 и/или 3 и/или увеличение площади SEC-пиков 4 и/или 5; (b) уменьшением образования полимерных частиц большей молекулярной массы, содержащих цирконий, на что указывает, по
15 крайней мере, уменьшение площади SEC-пика 1; или (с) увеличением пика 5 по сравнению с пиком 4. Например, композиции, когда их анализируют с помощью SEC в виде 5% водного раствора с использованием условий, позволяющих достичь разрешения алюминиевых и/или циркониевых частиц, по крайней мере, на 4 последовательных пика, в одном осуществлении обнаруживают отношение
20 SEC-площади первого главного пика (пик 1, самый большой полимер) к SEC-площади последнего главного пика (обычно, пик 5) равное менее чем примерно 1 и в другом осуществлении - менее чем примерно 0,25.

Далее предоставлен способ контроля потоотделения, причем способ содержит нанесение на кожу эффективного для проявления противопотового действия
25 количества композиций антиперспирантов, определенных выше.

Кроме того, далее предоставлен способ получения стабилизированной композиции антиперспиранта или способ стабилизации алюминиевой или
алюминиево-циркониевой соли с противопотовым действием или ее комплекса,
30 причем способ содержит:

(i) смешение по крайней мере одной алюминиевой соли, по крайней мере одной
алюминиево-циркониевой соли, по крайней мере одного алюминиевого солевого
комплекса и/или по крайней мере одного алюминиево-циркониевого солевого
35 комплекса с по крайней мере одним четвертичным аммонийным кислым компонентом в водной среде; и

(ii) добавление к полученной смеси по крайней мере одной гидроксикислоты (и, необязательно, дивалентного катиона) с образованием композиции.

В другом осуществлении предоставлены композиции антиперспирантов,
40 полученные или получаемые вышеуказанным способом.

В другом осуществлении предоставлено противопотовое и/или дезодорирующее средство для местного применения, содержащее по крайней мере одну
стабилизированную композицию антиперспиранта в комбинации с косметически приемлемым носителем. Такие средства могут находиться, как известно в данной
45 области, например, в форме карандаша, геля, крема, жидкости в шариковом аппликаторе или аэрозоля для распыления. Примеры средств, содержащих стабилизированные композиции антиперспиранта изобретения, даны ниже.

Площади SEC-пиков используют как индикаторы размера, содержащего алюминий
50 и цирконий полимера в растворах соли с противопотовым действием. Не ограничиваясь теорией, предполагают, что повышенная эффективность антиперспиранта и/или дезодоранта соотносится с увеличением площади пика 4 и/или пика 5 относительно площади пика 2 и/или пика 3 и с уменьшением площади пика 1,

что указывает на меньшую степень полимеризации алюминиевых и циркониевых частиц, соответственно. Относительные площади пиков с 1 по 5 образуют “SEC-профиль”, в том смысле, как этот термин использован здесь, композиции антиперспиранта и/или дезодоранта. Стабилизированные композиции изобретения сохраняют во времени улучшенные SEC-профили, что указывает на меньшую степень полимеризации алюминиевых и/или циркониевых частиц после хранения по сравнению с нестабилизированными композициями, например композициями, не содержащими кальциевой соли и/или гидроксикислоты.

Площади пиков могут быть скорректированы на основе внутреннего стандарта, с использованием суммарной площади пиков алюминия (сумма пиков с 2 по 5) в качестве общего знаменателя. Это возможно, поскольку суммарная площадь пиков алюминия остается постоянной. Корректировка площадей пиков по внутреннему стандарту данным способом лучше отражает распределение полимеров в образце.

В некоторых осуществлениях относительные количества компонентов (a), (b) и (c) описанной выше композиции антиперспиранта могут быть такими, что водный раствор данных компонентов с теми же относительными количествами, а именно при 25% концентрации (a)+(b), после хранения при примерно 45°C в течение примерно 60 дней имеет скорректированную площадь SEC-пика 1 не более чем примерно 40%, например не более чем примерно 20% или не более чем примерно 10%.

В качестве иллюстрации, относительные количества компонентов (a), (b) и (c), как описано выше, являются такими, что водный раствор данных компонентов с теми же относительными количествами, а именно при 25% концентрации (a)+(b), после хранения при примерно 45°C в течение примерно 60 дней имеет скорректированную площадь SEC-пика 5, по крайней мере, примерно 30%, например, по крайней мере, примерно 40%.

В некоторых осуществлениях относительные количества компонентов (a), (b) и (c), как описано выше, являются такими, что водный раствор данных компонентов с теми же относительными количествами, а именно при 25% концентрации (a)+(b), после хранения при примерно 45°C в течение примерно 60 дней имеет скорректированную площадь SEC-пика 4, по крайней мере, примерно 15%. Скорректированная площадь SEC-пика 4, необязательно, составляет не более чем примерно 25%.

В композиции по одному осуществлению изобретения относительные количества компонентов (a), (b) и (c), как описано выше, являются такими, что водный раствор данных компонентов с теми же относительными количествами, а именно при 25% концентрации (a)+(b), после хранения при примерно 45°C в течение примерно 60 дней имеет:

(i) скорректированную площадь SEC-пика 1 не более чем примерно 40%, например, не более чем примерно 20% или не более чем примерно 10%;

(ii) скорректированную площадь SEC-пика 5, по крайней мере, примерно 30%, например, по крайней мере, примерно 40%; и

(iii) скорректированную площадь SEC-пика 4, по крайней мере, примерно 15%.

В некоторых осуществлениях алюминиевая или алюминий-циркониевая соль композиций антиперспиранта изобретения может присутствовать в конечном средстве для местного применения в любом подходящем суммарном количестве, типично в количестве от примерно 4% до примерно 35%, например от примерно 10% до примерно 25% или от примерно 15% до примерно 20% по массе средства. Будет понятно, что несмотря на то, что в настоящем описании указаны количества алюминиевых солей, алюминий-циркониевых солей или их комплексов в разных

диапазонах, их меньшие количества могут быть использованы для содействия дезодорирующей активности дезодорирующих продуктов, которые не классифицируют как антиперспиранты.

5 Композиции антиперспирантов изобретения также включают четвертичное аммонийное кислое соединение, например альфа-(четвертичный аммоний)-карбовую кислоту, например бетаин. Бетаин представляет собой внутреннюю соль гидроксида 1-карбово-N,N,N-триметилметанамина (номенклатура IUPAC) и является цвиттер-ионным. Он встречается в природе во
10 многих продуктах питания, а также может быть синтезирован. Хотя иногда его ошибочно называют аминокислотой, будет понятно, что бетаин в действительности не является аминокислотой. “Бетаиновый компонент” в настоящей заявке может представлять собой бетаин или его соль. В некоторых осуществлениях бетаиновый компонент содержит бетаин, гидрохлорид бетаина или их смеси. Бетаиновый
15 компонент может, например, присутствовать в окончательном средстве для местного применения в суммарном количестве от примерно 0,5 до примерно 20%, например от примерно 5% до примерно 15% по массе. В одном осуществлении, когда композиция содержит алюминиево-циркониевую соль, мольное отношение бетаина к цирконии
20 может составлять от примерно 0,1 до примерно 2, например от примерно 0,1 до примерно 1.

Композиция изобретения может также необязательно включать по крайней мере один дивалентный катион, например, в форме соли. В одном осуществлении данный катион находится в составе соли или оксида кальция, например в составе хлорида
25 кальция, бромиды кальция, нитрата кальция, ацетата кальция, формиата кальция, глюконата кальция, аскорбата кальция, лактата кальция, глицината кальция, цитрата кальция, карбоната кальция, оксида кальция, гидроксида кальция, фосфата кальция, фосфоната кальция, пикролоната кальция, сульфата кальция, сульфоната кальция, сульфоцианата кальция, перрената кальция или их смесей. В некоторых
30 осуществлениях кальциевая соль содержит анион, имеющий линейную или разветвленную C₁₋₆₀-алкильную или C₁₋₆₀-алкенильную цепь и по крайней мере один функциональный фрагмент, способный связывать ион кальция. По крайней мере один функциональный фрагмент может представлять собой нитратный, сульфатный,
35 сульфонатный, карбонатный, карбонильный, фосфатный, фосфонатный или гидроксильный фрагмент. Анион может включать один или более гетероатомов, независимо выбранных из азота, кислорода и серы, причем такие гетероатомы представляют собой часть цепи и/или часть функционального фрагмента. В одном
40 осуществлении, когда дивалентный катион находится в форме соли, он может присутствовать в конечном средстве в суммарном количестве от примерно 0,2% до примерно 10%, например от примерно 2% до примерно 8% по массе. В одном осуществлении мольное отношение иона дивалентного металла к алюминию или (алюминию и цирконии) может равняться от примерно 0,02 до примерно 1,2,
45 например от примерно 0,1 до примерно 0,8.

Композиция также содержит по крайней мере одну гидроксикислоту. Иллюстративные гидроксикислоты включают α-гидроксикислоты, β-гидроксикислоты и их смеси. В некоторых осуществлениях гидроксикислота выбрана из молочной
50 кислоты, гликолевой кислоты, лактобионовой кислоты, карнитина, салициловой кислоты и их смесей. В некоторых осуществлениях альфа-гидроксикислота имеет рK_a примерно 4,5 или меньше, от примерно 2,5 до примерно 4,5 или от примерно 3,5 до примерно 4,0.

В некоторых осуществлениях по крайней мере одна гидроксикислота присутствует в суммарном количестве от примерно 0,2% до примерно 10%, например от примерно 0,5% до примерно 9% или от примерно 2% до примерно 8% по массе. В некоторых осуществлениях мольное отношение четвертичного аммонийного кислого соединения к гидроксикислоте типично равно от примерно 0,2 до примерно 30, например от примерно 5 до примерно 25 или от примерно 10 до примерно 20.

В некотором осуществлении композиция имеет:

(i) мольное отношение (алюминия и циркония) к атомам галогена в по крайней мере одной алюминиево-циркониевой соли или ее комплексе от примерно 0,9 до примерно 2,1;

(ii) мольное отношение алюминия к цирконию от примерно 2 до примерно 10;

(iii) мольное отношение кальция к (алюминию и цирконию) от примерно 0,02 до примерно 1,2;

(iv) мольное отношение бетаина к цирконию от примерно 0,1 до примерно 2; и

(v) мольное отношение бетаина к гидроксикислоте от примерно 0,2 до примерно 30.

Необязательные ингредиенты, которые могут быть включены в противопотовое и/или дезодорирующее средство композиций антиперспирантов изобретения,

включают растворители; водорастворимые спирты, такие как C₂₋₈-спирты, включая этанол; гликоли, включая пропиленгликоль, дипропиленгликоль,

трипропиленгликоль и их смеси; глицериды, включая моно-, ди- и триглицериды;

органические кислоты, спирты и сложные эфиры от средне- до длинноцепных;

поверхностно-активные вещества, включая эмульгаторы и диспергаторы;

аминокислоты, включая глицин; структурирующие агенты, включая загустители и гелеобразующие агенты, например полимеры, силикаты и диоксид кремния;

мягчители; отдушки; и красящие вещества, включая красители и пигменты. Если

необходимо, помимо алюминиево-циркониевой соли или ее комплекса может быть

включен дополнительный противопотовый и/или дезодорирующий агент, например

агент уменьшения запаха, такой как осаждающий серу агент, например глюконат

меди, глюконат цинка, цитрат цинка и так далее.

Композиции антиперспиранта могут быть использованы для создания на их основе противопотовых и/или дезодорирующих средств местного применения, подходящих

для нанесения на кожу, среди которых в качестве иллюстрации упомянем карандаш,

гель, крем, шариковый аппликатор, пластичную твердую форму, порошок, жидкость,

эмульсию, суспензию, дисперсию или распыляемый материал. Композиция может

включать единственную фазу или может представлять собой многофазную систему,

например, систему, содержащую полярную фазу и масляную фазу, необязательно в

форме стабильной эмульсии. Композиция может быть жидкой, полутвердой или твердой. Следующие местные средства даны в целях иллюстрации:

В одном возможном примере средство находится в форме распыляемого материала, который содержит:

(a) по крайней мере одну алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль или ее комплекс в количестве от примерно 4% до примерно 25% по массе в сумме;

(b) по крайней мере один бетаиновый компонент в количестве от примерно 0,5 до примерно 20% по массе в сумме;

(c) по крайней мере одну соль кальция в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% по массе в сумме;

(d) по крайней мере одну гидроксикислоту в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% по массе в сумме;

(e) воду в количестве от примерно 35% до примерно 87% по массе;

(f) по крайней мере один водорастворимый смягчитель в количестве от примерно 3% до примерно 7% по массе в сумме; и

(g) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов простых полиэфиров и их смесей, в количестве от примерно 0,5% до примерно 3% по массе в сумме.

В другом возможном примере средство находится в форме шарикового аппликатора, который содержит:

(a) по крайней мере одну алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль или ее комплекс в количестве от примерно 4% до примерно 25% по массе в сумме;

(b) по крайней мере один бетаиновый компонент в количестве от примерно 0,5 до примерно 20% по массе в сумме;

(c) по крайней мере одну соль кальция в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% по массе в сумме;

(d) по крайней мере одну гидроксикислоту в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% по массе в сумме;

(e) воду в количестве от примерно 27% до примерно 88% по массе;

(f) по крайней мере один магниевый-алюминиевый силикат в количестве от примерно 0,5% до примерно 3% по массе в сумме;

(g) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов простых полиэфиров и их смесей, в количестве от примерно 0,5% до примерно 10% по массе в сумме; и

(h) по крайней мере один смешивающийся с водой растворитель в количестве от 0% до примерно 5% по массе в сумме.

В некоторых осуществлениях композиция антиперспиранта присутствует в средстве в полярной фазе, и средство далее содержит масляную фазу.

В другом возможном примере средство находится в форме карандаша, в котором полярная фаза содержит по массе средства:

(a) по крайней мере одну алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль или ее комплекс в количестве от примерно 4% до примерно 30% в сумме;

(b) по крайней мере один бетаиновый компонент в количестве от примерно 0,5% до примерно 20% в сумме;

(c) по крайней мере одну соль кальция в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

(d) по крайней мере одну гидроксикислоту в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

(e) воду, один или более смешивающихся с водой растворителей или их смесь в количестве от примерно 5% до примерно 40% в сумме;

(f) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов

простых полиэфиров и их смесей, в количестве от 0% до примерно 5% в сумме;
и масляная фаза содержит, по массе средства:

(g) силоксановый полиамидный гелеобразующий агент в количестве от примерно 0,5% до примерно 8,0%;

(h) летучую органическую или основанную на силиконе жидкость в количестве от примерно 20% до примерно 60%;

(i) по крайней мере один косметический ингредиент, выбранный из жирных C_{8-22} -спиртов, жирных C_{12-36} -сложных эфиров, C_{8-18} -алкилбензоатов, линейных полисилоксанов и их смесей, в количестве от 0% до примерно 20% в сумме;

(j) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов простых полиэфиров и их смесей, в количестве от 0% до примерно 10% в сумме; и

(k) отдушку в количестве от 0% до примерно 3%.

В другом возможном примере средство находится в форме карандаша, в котором полярная фаза содержит по массе средства:

(a) по крайней мере одну алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль или ее комплекс в количестве от примерно 4% до примерно 30% в сумме;

(b) по крайней мере один бетаиновый компонент в количестве от примерно 0,5 до примерно 20% в сумме;

(c) по крайней мере одну соль кальция в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

(d) по крайней мере одну гидроксикислоту в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

(e) воду, один или более смешивающихся с водой растворителей или их смесь в количестве от примерно 5% до примерно 40% в сумме;

(f) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов простых полиэфиров и их смесей, в количестве от 0% до примерно 5% в сумме;

и масляная фаза содержит, по массе средства:

(g) один или более косметически приемлемых растворителей, выбранных из многоатомных C_{2-8} -спиртов, ненасыщенных жирных C_{8-22} -спиртов, разветвленных или линейных насыщенных жирных C_{8-22} -спиртов и их смесей, в количестве от примерно 20% до примерно 60% в сумме;

(h) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов простых полиэфиров и их смесей, в количестве от 0% до примерно 10% в сумме; и

(i) отдушку в количестве от 0% до примерно 3%; и

(j) полиамид на основе димера линолевой кислоты в количестве от примерно 5% до примерно 25% по массе.

В другом возможном примере средство находится в форме геля, в котором полярная фаза содержит по массе средства:

(a) по крайней мере одну алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль или ее

комплекс в количестве от примерно 4% до примерно 35% в сумме;

(b) по крайней мере один бетаиновый компонент в количестве от примерно 0,5 до примерно 20% в сумме;

5 (c) по крайней мере одну соль кальция в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

(d) по крайней мере одну гидроксикислоту в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

(e) воду в количестве от примерно 25% до примерно 60%;

10 (f) по крайней мере один смешивающийся с водой растворитель в количестве от примерно 5% до примерно 40% в сумме;

(g) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных
15 поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов простых полиэфиров и их смесей, в количестве от 0% до примерно 5% в сумме;

и масляная фаза содержит, по массе средства:

20 (g) летучую органическую жидкость в количестве от примерно 5% до примерно 20% по массе;

(h) сополиол диметикона в количестве от примерно 0,5% до примерно 2% по массе; и

(i) линейный силикон в количестве от примерно 5% до примерно 20% по массе.

В другом возможном примере средство находится в форме крема, в котором полярная фаза содержит по массе средства:

25 (a) по крайней мере одну алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль или ее комплекс в количестве от примерно 4% до примерно 30% в сумме;

(b) по крайней мере один бетаиновый компонент в количестве от примерно 0,5% до примерно 20% в сумме;

30 (c) по крайней мере одну соль кальция в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

(d) по крайней мере одну гидроксикислоту в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

35 (e) воду в количестве от примерно 40% до примерно 82%;

и масляная фаза содержит, по массе средства:

(f) летучую органическую жидкость в количестве от примерно 2% до примерно 10%;

(g) моноглицерид, диглицерид, триглицерид или их смесь в количестве от примерно 0,1% до примерно 3%;

40 (h) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов простых полиэфиров и их смесей, в количестве от примерно 4% до примерно 15% в
45 сумме; и

(i) по крайней мере один жирный C₈₋₂₂-спирт в количестве от примерно 3% до примерно 8% в сумме.

50 В другом возможном примере средство находится в форме шарикового аппликатора, в котором полярная фаза содержит по массе средства:

(a) по крайней мере одну алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль или ее комплекс в количестве от примерно 4% до примерно 25% в сумме;

(b) по крайней мере один бетаиновый компонент в количестве от примерно 0,5% до

примерно 20% в сумме;

(с) по крайней мере одну соль кальция в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

5 (d) по крайней мере одну гидроксикислоту в количестве от примерно 0,2% до примерно 10% в сумме;

(е) воду в количестве от примерно 30% до примерно 50%;

(f) по крайней мере один смешивающийся с водой растворитель в количестве от примерно 5% до примерно 40% в сумме; и

10 (g) по крайней мере одно косметически приемлемое поверхностно-активное вещество, выбранное из катионных поверхностно-активных веществ, неионогенных поверхностно-активных веществ, анионных поверхностно-активных веществ, амфотерных поверхностно-активных веществ, сополиолов диметикона, этоксилатов простых полиэфиров и их смесей, в количестве от 0% до примерно 2% в сумме;

15 и масляная фаза содержит, по массе средства:

(h) летучую органическую или основанную на силиконе жидкость в количестве от примерно 20% до примерно 50%; и

(i) сополиол диметикона в количестве от примерно 0,5% до примерно 2% по массе.

20 Противопотовое и/или дезодорирующее средство может быть предоставлено в любом подходящем контейнере, таком как аэрозольный баллон, тубик или контейнер с пористым колпачком, шариковый контейнер, флакон, контейнер с открытым концом и так далее.

25 Способ изобретения контроля потоотделения содержит нанесение на кожу эффективного для оказания противопотового действия количества средства любого осуществления, включенного в настоящую заявку или конкретно описанного в ней.

30 Способ изобретения контроля запаха, возникающего вследствие потоотделения, содержит нанесение на кожу эффективного для оказания дезодорирующего действия количества средства любого осуществления, включенного в настоящую заявку или конкретно описанного в ней.

35 В способе изобретения получения композиции или средства антиперспиранта и/или дезодоранта по крайней мере одну алюминиево-циркониевую соль или ее комплекс смешивают с по крайней мере одним бетаиновым компонентом в водной среде; и по крайней мере одну соль кальция и по крайней мере одну гидроксикислоту добавляют к полученной смеси с образованием композиции. Выбор конкретных алюминиево-циркониевых, бетаиновых, кальциевых солевых и гидроксикислотных компонентов и количеств данных использованных компонентов может быть сделан в соответствии с приведенным выше описанием.

40 В способе изобретения стабилизации композиции или средства, содержащего алюминиево-циркониевую соль или ее комплекс, соль или комплекс смешивают с по крайней мере с одним бетаиновым компонентом в водной среде; и по крайней мере одну соль кальция и по крайней мере одну гидроксикислоту добавляют к полученной смеси. Выбор конкретных алюминиево-циркониевых, бетаиновых, кальциевых солевых и гидроксикислотных компонентов и количеств данных использованных компонентов может быть сделан в соответствии с приведенным выше описанием.

50 Если не указано другое, все процентные содержания компонентов композиции, приведенные в данном описании, даны по массе в расчете на суммарную массу композиции или средства, принятую за 100%.

Если конкретно не указано другое, в одном осуществлении, ингредиенты для применения в композициях и средствах настоящего представляют собой косметически

приемлемые ингредиенты. Под “косметически приемлемым” подразумевается подходящий для применения в средстве для местного нанесения на кожу человека эксципиент. Косметически приемлемый эксципиент, например, представляет собой эксципиент, который подходит для наружного нанесения в количествах и концентрациях, имеющих в виду в средствах данного изобретения, и содержит, например, эксципиенты, которые входят в “Перечень веществ, признанных полностью безвредными” (GRAS) Управления по надзору за качеством пищевых продуктов и медикаментов США.

В данной заявке рКа означает рКа в разбавленном водном растворе при комнатных температуре и давлении, например при приблизительно 25°C, который определен с использованием стандартных, общепринятых в данной области способов измерения. Для кислот, которые содержат более одного водорода, способного к диссоциации, и, таким образом, имеют несколько значений рКа, рКа в данной заявке относится к равновесию ионизации, относящемуся к стадии диссоциации первого водорода. Таким образом, для молочной кислоты в целях, которые определены в настоящей заявке, рКа равнялось бы примерно 3,86, а для гликолевой кислоты - равнялось бы примерно 3,83.

Композиции и средства, предоставленные настоящей заявкой, описаны и заявлены со ссылкой на составляющие их ингредиенты, как принято в данной области. Как было бы ясно специалисту в данной области, ингредиенты в некоторых случаях могут реагировать друг с другом так, что истинная композиция конечного средства может не соответствовать в точности указанным ингредиентам. Таким образом, следует понимать, что изобретение распространяется также на продукт объединения указанных ингредиентов.

Пример

Соединенные в варьирующихся количествах CaCl_2 и/или гидроксикислоты (молочная кислота или гликолевая кислота) прибавляли к 25% раствору циркониево-алюминиевого хлоргидрекса с бетаином (R309; здесь “ZAB”). Затем полученный раствор-образец хранили в течение двух месяцев при 45°C перед проведением анализа с помощью SEC, используя детектор показателя преломления. Таблица 1 иллюстрирует данные для SEC-пигов 1, 3, 4 и 5 для каждого раствора-образца. Скорректированная площадь рассчитана с использованием суммарной площади алюминиевых пигов (сумма пигов 2-5) в качестве общего знаменателя.

Таблица 1: Скорректированные площади SEC-пигов, полученные после хранения				
Раствор-образец	Пик 1	Пик 3	Пик 4	Пик 5
ZAB (R309)	25,74	52,37	22,44	25,19
ZAB+молочная кислота (2%)	8,57	46,24	11,58	42,18
ZAB+гликолевая кислота (2%)	42,32	44,66	10,01	45,32
ZAB+ CaCl_2 (2%)	31,92	42,02	32,91	25,07
ZAB+ CaCl_2 (2%)+молочная кислота (2%)	8,80	36,62	20,22	43,16
ZAB+ CaCl_2 (2%)+гликолевая кислота (2%)	37,86	37,99	18,92	43,09

Добавление 2% молочной кислоты уменьшает площадь пика 1 с 25,74% (только ZAB) до 8,57%, а в присутствии CaCl_2 - с 31,92% (ZAB+ CaCl_2) до 8,80%. Это указывает на то, что молочная кислота может уменьшать полимеризацию содержащих

цирконий частиц. Гликолевая кислота не уменьшает площадь пика 1 в данном исследовании.

Добавление 2% молочной кислоты увеличивает площадь пика 5 с 25,19% (только ZAB) до 42,18%, а в присутствии CaCl_2 - с 25,07% (ZAB+ CaCl_2) до 43,16%.

Подобно этому, добавление 2% гликолевой кислоты увеличивает площадь пика 5 с 25,19% (только ZAB) до 45,32%, а в присутствии CaCl_2 - с 25,07% (ZAB+ CaCl_2) до 43,09%. Данные результаты показывают, что гидроксикислоты, такие как молочная кислота и гликолевая кислота, могут уменьшать полимеризацию содержащих алюминий частиц.

Формула изобретения

1. Композиция антиперспиранта, содержащая продукт смешения:

(a) по крайней мере одной соли, выбранной из по крайней мере одной алюминиевой соли, по крайней мере одной алюминиево-циркониевой соли, по крайней мере одного алюминиевого солевого комплекса и по крайней мере одного алюминиево-циркониевого солевого комплекса, где алюминиевая соль или алюминиевый солевой комплекс представляет собой по крайней мере одну соль, выбранную из хлорида алюминия, хлоргидрата алюминия, секвихлоргидрата алюминия и дихлоргидрата алюминия;

(b) по крайней мере одной косметически приемлемой альфа-гидроксикислоты; и

(c) по крайней мере одного бетаина, выбранного из внутренней соли гидроксида 1-карбоксии-N,N,N-триметилметанамина и гидрохлорида внутренней соли гидроксида 1-карбоксии-N,N,N-триметилметанамина;

где относительные количества компонентов (a), (b) и (c) являются такими, что водный раствор данных компонентов с теми же относительными количествами, при 25% концентрации (a)+(b), после хранения при приблизительно 45°C в течение примерно 60 дней имеет скорректированную площадь пика 1 эксклюзивной хроматографии SEC не более чем приблизительно 40%, скорректированную площадь SEC-пика 5 по крайней мере 30% и скорректированную площадь SEC-пика 4 по крайней мере 15%.

2. Композиция по п.1, где соль представляет собой хлоргидрат, необязательно выбранный из пентахлоргидрата алюминия-циркония, октахлоргидрата алюминия-циркония, тетрахлоргидрата алюминия-циркония, трихлоргидрата алюминия-циркония и их смесей.

3. Композиция по п.1, где альфа-гидроксикислота выбрана из молочной кислоты, гликолевой кислоты и их смесей.

4. Композиция по п.1, где альфа-гидроксикислота имеет pK_a менее чем 4,5.

5. Композиция по п.1, где косметически приемлемая гидроксикислота содержит по крайней мере одну бета-гидроксикислоту, необязательно выбранную из карнитина, салициловой кислоты и их смесей.

6. Композиция по п.1, дополнительно содержащая катион дивалентного металла, необязательно представляющего собой кальций.

7. Композиция по п.6, где отношение кальция к металлу (алюминию и цирконию) по молям равно от приблизительно 0,02 до приблизительно 1,2.

8. Композиция по п.1, дополнительно содержащая соль кальция, выбранную из хлорида кальция, оксида кальция и их смесей.

9. Композиция по п.1, где алюминиевая или алюминиево-циркониевая соль содержит алюминиево-циркониевую хлоргидратную соль, где отношение металла

(алюминия и циркония) к хлориду по молям для соли равно от приблизительно 0,9 до приблизительно 2,1, необязательно отношение бетаина к цирконии по молям равно от приблизительно 0,1 до приблизительно 2 и/или необязательно отношение бетаина к гидроксикислоте по молям равно от приблизительно 0,2 до приблизительно 30.

5 10. Композиция по п.1, где композиция содержит менее чем 1% по массе аминокислоты.

11. Композиция по п.1, которая, когда ее анализируют с помощью эксклюзионной хроматографией в виде 5%-ного водного раствора с использованием условий,
10 позволяющих достичь разрешения содержащих алюминий и/или цирконий частиц, по крайней мере, на 4 последовательных пика, то отношение SEC-площади первого главного пика к SEC-площади последнего главного пика равно менее чем приблизительно 0,25.

12. Композиция, содержащая стабилизированную композицию антиперспиранта по п.1 в сочетании с косметически приемлемым носителем.

13. Способ контроля потоотделения, содержащий нанесение на кожу средства, содержащего эффективное для обеспечения противопотового действия количества композиции по п.1 или эффективное для обеспечения дезодорирующего действия
20 количества композиции по п.1.

14. Способ получения или стабилизации композиции антиперспиранта по п.1, содержащий:

i. смешение по крайней мере одной соли с по крайней мере одним бетаин-компонентом в водной среде; и

25 ii. добавление к полученной смеси по крайней мере одной гидроксикислоты с образованием композиции.

15. Композиция по п.1, где площадь SEC-пика 1 равна не более чем 10%.

16. Композиция по п.1, где площадь SEC-пика 5 равна по крайней мере 40%.

30 17. Композиция по п.1, где площадь SEC-пика 1 равна не более чем 10%, и площадь SEC-пика 5 равна по крайней мере 40%.

35

40

45

50