

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷
A61K 7/32
A61K 7/34 A61K 7/38
A61K 7/48



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 02805909.3

[43] 公开日 2004 年 5 月 5 日

[11] 公开号 CN 1494411A

[22] 申请日 2002.2.28 [21] 申请号 02805909.3
[30] 优先权
[32] 2001. 3. 5 [33] US [31] 09/799,367
[86] 国际申请 PCT/US2002/006156 2002.2.28
[87] 国际公布 WO02/069914 英 2002.9.12
[85] 进入国家阶段日期 2003.9.2
[71] 申请人 宝洁公司
地址 美国俄亥俄
[72] 发明人 T·A·斯卡沃内
B·S·施拉格黑克

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利
商标事务所
代理人 黄淑辉

权利要求书 1 页 说明书 19 页

[54] 发明名称 包含固体 D - 泛酸盐的无水止汗剂和除臭剂组合物

[57] 摘要

本发明公开了无水止汗剂和除臭剂组合物，该组合物包括按重量计：约 0.1% 至约 30% 的腋下活性组分(止汗剂和/或除臭剂活性组分)；约 0.01% 至约 10% 的固体水溶性 d - 泛酸盐，比如泛酸钙；约 0.1% 至约 40% 的悬浮剂；和约 10% 至约 99% 的无水液体载体。 本发明还公开了通过将腋下活性组分和固体泛酸盐局部应用于腋窝，尤其是剃刮过的腋窝以控制出汗湿度和/或气味的方法。 所述无水组合物对皮肤作用温和，并有助于抚慰或治疗受刺激或损伤的腋下皮肤，尤其是由于偶尔或经常剃刮腋窝所造成的刺激和损伤。

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

1. 无水止汗剂和除臭剂组合物，该组合物包括：
 - (a) 按重量计0.1% 至30% 的腋下活性组分；
 - (b) 按重量计0.01% 至10% 的固体水溶性d-泛酸盐；
 - (c) 按重量计0.1% 至40% 的悬浮剂；和
 - (d) 按重量计10% 至99% 的无水液体载体。
2. 如权利要求1所述的无水组合物，其中所述d-泛酸盐选自钙盐、钠盐、钾盐、镁盐、锌盐，及其组合。
3. 如权利要求2所述的无水组合物，其中所述d-泛酸盐为泛酸钙。
4. 如权利要求2或3中任一项所述的无水组合物，其中所述d-泛酸盐按组合物重量计为 0.1% 至 5%。
5. 如前述任一项权利要求所述的无水组合物，其中所述组合物包含按重量计少于 1% 的自由水或附加水。
6. 如权利要求2、3、4或5中任一项所述的无水组合物，其中腋下活性组分包括选自下列物质的固体止汗剂活性组分：含锆活性组分、含铝活性组分，及其组合物，且其中所述固体止汗剂活性组分占无水组合物重量的 5% 至 30%。
7. 如权利要求2所述的无水组合物，其中所述腋下活性组分包括抗微生物除臭剂活性组分，且其中该抗微生物除臭剂活性组分按组合物的重量计为 0.1% 至 5%。
8. 如前述任一项权利要求所述的无水组合物，其中所述无水载体包括挥发性环二甲基硅氧烷，其按组合物的重量计为 5% 至 80%。
9. 如前述任一项权利要求所述的无水止汗剂组合物，其中所述d-泛酸盐的平均粒径为3 μm 至100 μm 。
10. 控制腋下出汗湿度或气味的方法，所述方法包括对于腋窝的局部应用如前述任一项权利要求所述的组合物，其用量为每个腋窝应用0.1克至20克。

包含固体 D-泛酸盐的无水止汗剂和除臭剂组合物

技术领域

本发明涉及在无水基质中包含d-泛酸盐的无水止汗剂和除臭剂组合物。该组合物能提供有利于皮肤健康的有益效果，比如促进伤口愈合和减少对皮肤的刺激。

发明背景

许多不同的止汗剂和除臭剂产品已知可用于控制或抑制腋下的出汗湿度和气味。这些产品呈各种形态，例如固体棒、软膏或霜膏、滚涂液体和气溶胶或非气溶胶喷剂。然而，大多数此类产品都有着类似的组成，其中包含止汗活化组分，比如铝盐和锆盐；悬浮剂或增稠剂；和适合的液相载体。

配制止汗剂和除臭剂时可以包含有助于缓和或最小化对腋下皮肤的刺激的材料，这特别适用于那些需要剃刮腋部并把止汗剂和除臭剂产品应用于该剃刮区域的消费者。剃刮腋部可能会刺激和损伤腋下皮肤，因此止汗剂和除臭剂偶尔配制有诸如芦荟、尿囊素和泛酸及相关材料，以最小化或治愈这类皮肤刺激和损伤。众所周知，泛酸及类似的其它材料在各种个人保健品，包括止汗剂和除臭剂中可用作伤口治愈剂。

泛酸及相关材料可与含水止汗剂或除臭剂活性组分一起配制，以提供治疗伤口和滋润皮肤等有益效果。这类皮肤抚慰材料的实施例包括泛酸和泛酸衍生物及其盐类，比如d-泛醇、dl-泛醇和泛酸盐，比如泛酸钙。泛酸盐尤其有助于提供治疗伤口和抚慰皮肤等有益效果，即使在与止汗剂和除臭剂混合使用时也是如此。这些高度优选的泛酸盐可配制到无水或含水的止汗剂产品基质中，其中所述盐类可以通过水或其它溶剂溶于产品基质中。然后将溶有泛酸盐的

产品基质应用于需要处理的皮肤区域，使被溶解的盐类扩散或流到应用表面上，帮助滋润或治疗应用区域内任意受刺激的皮肤区域。

现已发现，泛酸盐可以以固体分散颗粒的形式配制到无水止汗剂和除臭剂产品中，并仍能对腋下皮肤，特别是对是在剃刮腋部时受刺激或损伤的皮肤提供滋润和治疗效果。据信，这种固体泛酸盐能迅速地被腋下的汗液或其它水分所溶解，因此这些固体能在被应用后溶解掉。当产品基质应用到腋下区域时，这些固体泛酸盐就溶解到皮肤上的汗液或其它水分中，然后流到和扩散到腋下的应用表面上，以帮助缓和、治疗或减轻对腋下皮肤的刺激和损伤，特别是在剃刮腋部时造成的皮肤损伤或刺激。还据信，通过延迟泛酸盐的溶解直至产品被应用后，这些固体颗粒与溶解物与在应用前相比不易于与产品基质中的其它物质发生相互作用，包括与铝和锆的止汗剂活性组分或除臭剂活性组分的相互作用。

因此，本发明的一个目的就是提供新型无水止汗剂和除臭剂组合物，该组合物包含能抚慰或治疗受刺激的腋下皮肤，特别是在剃刮腋毛时被刺激和损伤的腋下皮肤的物质。本发明的另一目的是提供这样的组合物，该组合物含有固体泛酸盐，特别是固体泛酸钙盐，该固体泛酸盐用作无水止汗剂和除臭剂基质中的分散颗粒。

发明概述

本发明涉及无水止汗剂和除臭剂组合物，该组合物包括按重量计：约 0.1% 至约 30% 的止汗剂或除臭剂活化组分；约 0.01% 至约 10% 的固体水溶性 d-泛酸盐；约 0.1% 至约 40% 的悬浮剂和约 10% 至约 99% 的无水液体载体。这种无水止汗剂和除臭剂组合物对皮肤作用柔和，并能提供皮肤滋润或治疗效果，特别是在应用于剃刮后的腋部之时。

现已发现，d-泛酸盐能以固体颗粒形式配制到无水止汗剂或除臭剂组合物中，并仍能提供良好的腋下皮肤滋润和治疗效果。据信，这种固体d-泛酸盐有助于使组分不相容性达到最小，该组分不

相容性与在止汗剂和除臭剂产品中溶解的泛酸盐的使用相关。

发明详述

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物包括作为必要组分的止汗剂或除臭剂活性组分、固体 d-泛酸盐、悬浮剂和无水液体载体。本发明的这些必要组分将分别在下文中进行更详细的描述。

本发明所用术语“无水的”是指本发明的止汗剂和除臭剂组合物与其中的必要或任选组分基本上不含有附加水或自由水。从制剂的角度来看，就是指本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物，按重量计优选地含有少于约5%、更优选少于约3%、甚至更优选少于1%、最优选为零百分比的自由水或附加水，这些水不包括在配制前典型地与任意颗粒固体相关的结合水。

除非另有说明，本发明所引用的所有熔点值都是根据众所周知的差示扫描量热法(DSC)技术测定的。用DSC技术测定各种物质熔点值的实施例记载于美国专利5,306,514(Letton等人)中，该文献引入本文以供参考。

除非另有说明，本发明所用术语“环境条件”是指周围条件为约1个大气压，相对湿度为约50%，温度为约25℃。除非另有说明，本发明所述的所有值、量和量度均是在环境条件下获得的。

本发明所用术语“挥发性的”是指在25℃时具有可测量的蒸汽压力的物质。这些可测蒸汽压力典型地为约0.01mmHg至约6mmHg，更典型地为约0.02mmHg至约1.5mmHg，并且其在一个大气压(atm)下的平均沸点小于约250℃，更典型地小于约235℃。相反地，术语“非挥发性的”是指本发明中所定义的不是“挥发性的”的物质。

本发明所用术语“皮肤温度”是指腋窝皮肤温度，其通常等于或稍微低于典型的体温37℃。

本发明所用术语“水溶性的”是指在不同的环境条件下在37℃时能溶于去离子水的物质，包括本文描述的水溶性皮肤活性物质，其形成的水溶液按重量计至少包含0.1%、优选至少约0.5%的溶解

物质。

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物可包括或基本上由本发明所述的必要成分和限制物质组成，也可以包含用于这些组合物中的已知的或其它有效的任何附加的或任选的成分、组分或限制物质。

除非另有说明，所有的百分数、份数和比率都是按组合物的总重量计算的。除非另有指明，与所列组分有关的所有这些重量均以具体组分的含量为基础，因此不包括在市售物质中可能包括的溶剂、载体、副产物、填充剂或其它微量组分。

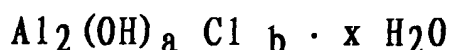
止汗剂活性组分

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物包括适用于人的皮肤的腋窝活性组分。腋窝活性组分的浓度应足以提供所选择的无水制剂所需的出汗湿度或气味控制，该腋窝活性组分可以是止汗剂活性组分和/或除臭剂活性组分。

本发明的无水止汗剂实施方案包括止汗剂活性组分，其浓度按组合物的重量计优选地为约 0.1% 至约 30%，更优选地为约 5% 至约 30%。这些重量百分数是在无水金属盐的基础上计算得到的，不包括水或任何络合剂，比如甘氨酸、甘氨酸盐或其它络合剂。止汗剂活性组分可以是已经溶解的或固体形式的，优选为分散的固体颗粒。配制在组合物中的止汗剂活性组分优选为分散的固体颗粒，其优选的平均粒径或直径小于约100 μm ，优选地为约1 μm 至约40 μm 。

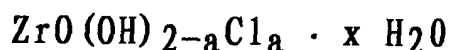
用于本发明的无水止汗剂实施方案中的止汗剂活性组分包括任何具有止汗剂活性的化合物、组合物或其它物质。优选的止汗剂活性组分包括金属盐收敛剂，特别是铝、镓和锌的无机盐和有机盐，及其混合物。尤其优选的是含铝和/或含锌的盐或物质，比如卤化铝、水合氯化铝、羟基卤化铝、氧镓基卤氧化物、氧镓基羟基卤化物，及其混合物。

用于本发明的无水止汗剂实施方案中的优选的铝盐包括符合下式的物质：



其中，a为约2至约5；a与b之和为约6；x为约1至约6；且其中a、b和x可以不是整数。尤其优选的羟基氯化铝指“5/6碱性羟基氯化物”，其中a等于5，和“2/3碱性羟基氯化物”，其中a等于4。制备铝盐的方法公开在如下文献中：公布于1975年6月3日的Gilman的美国专利 3,887,692；公布于1975年9月9日的Jones等人的美国专利3,904,741；公布于1982年11月16日的Gosling等人的美国专利4,359,456；和公布于1980年12月10日的Fitzgerald等人的英国专利说明2,048,229，所有这些专利均引入本文以供参考。铝盐混合物记载于1974年2月27日公布的Shin等人的英国专利说明1,347,950中，该文也引入本文以供参考。

用于本发明的无水止汗剂实施方案的优选的锌盐包括符合下式的物质：



其中，a为约1.5至约1.87；x为约1至约7；且其中a和x都可以不是整数。这些锌盐记载于1975年8月4日公布的Schmitz的比利时专利825,146中，该文引入本文以供参考。尤其优选的锌盐是那些另外含有铝和甘氨酸的络合物，通常称为ZAG络合物。这些ZAG络合物包含符合上述化学式的氯化铝氢氧化物和羟基氧锆基氯化物。这些ZAG络合物记载于如下文献中：公布于1974年2月12日的Luedders等人的美国专利3,679,068；公布于1985年3月20日的Callaghan等人的大不列颠专利申请2,144,992；和公布于1978年10月17日的Shelton的美国专利4,120,948，所有这些参考文献均引入本文以供参考。

适用于本组合物的止汗剂活性组分包括：水合氯化铝、水合二氯化铝、水合倍半氯化铝、碱式氯化(chlorohydrate)铝的丙二醇络合物、碱式二氯化铝的丙二醇络合物、碱式倍半氯化铝的丙二醇

络合物、碱式氯化铝的聚乙二醇络合物、碱式二氯化铝的聚乙二醇络合物、碱式倍半氯化铝的聚乙二醇络合物、水合三氯化铝锆、水合四氯化铝锆、水合五氯化铝锆、水合八氯化铝锆、碱式三氯化铝锆的甘氨酸络合物、碱式四氯化铝锆的甘氨酸络合物、碱式五氯化铝锆的甘氨酸络合物、碱式八氯化铝锆的甘氨酸络合物、氯化铝、硫酸铝缓冲剂及其组合物。

抗微生物的除臭剂活性组分

本发明的止汗剂和除臭剂组合物也可以配制有抗微生物除臭物质形式的腋窝活性组分，该活性组分被加入到或替代止汗剂活性组分。在组合物中除臭剂活性组分的浓度按组合物的重量计可以为约0.1%至约30%，优选地为约0.1%至约10%、甚至更优选为约0.1%至约3%。这些除臭剂活性组分包括任何已知的或其它安全有效的抗微生物除臭剂活性组分，所述抗微生物除臭剂活性组分可局部应用于人的皮肤，并且可以有效防止或消除由于出汗而引起的恶臭。

应用于本发明的止汗剂和除臭剂组合物中的优选抗微生物除臭剂活性组分的非限制性实施例包括：鲸蜡基三甲基溴化铵、鲸蜡基吡啶鎓氯化物、苜蓿素氯铵、二异丁基苯氧基乙氧基乙基二甲基苄基氯化铵、N-月桂基肌氨酸钠、N-palmethyl肌氨酸钠、月桂酰肌氨酸、N-肉豆蔻酰甘氨酸、N-月桂基肌氨酸钾、三甲基氯化铵、碱式氯化铝钠乳酸盐、三乙基柠檬酸盐、三鲸蜡基甲基氯化铵、2,4,4'-三氯代-2'-羟基二苯基醚（三氯生）、3,4,4'-三氯碳酰苯胺（三氯二苯脲）、二氨基烷基酰胺，比如L-赖氨酸鲸蜡基酰胺；柠檬酸、水杨酸和pir辛糖(octose)、及其混合酸的重金属盐，尤其是锌盐；吡硫鎓的重金属盐，尤其是吡硫鎓锌、苯酚硫酸锌、法呢醇；及其混合物。优选的活性组分为三氯生、三氯二苯脲，及其组合物。

适用于本发明的其它除臭剂活性组分记载于美国专利6,013,248 (Luebbecke等人)中，该文引入本文以供参考。

D-泛酸盐

本发明的无水止汗剂组合物包含固体颗粒，该固体颗粒可悬浮或以其它方式分散在整个组合物中，且其中固体颗粒是以固体颗粒形式存在于组合物中的水溶性 d-泛酸盐。用于本发明的止汗剂和除臭剂组合物中的固体 d-泛酸盐可包括任何 d-泛酸盐或 d-泛酸衍生物盐，只要这些 d-泛酸盐能以固体颗粒的形式存在于组合物中。

固体 d-泛酸盐的浓度按组合物的重量计为约 0.01% 至约 10%、优选地为约 0.05% 至约 5%，更优选地为约 0.1% 至约 1.0%。

用于本发明的无水组合物中的 d-泛酸盐必须在环境条件下以固体颗粒的形式存在于组合物中，并且必须同时是本文所定义的水溶性物质。在组合物中的这些固体颗粒的平均粒径优选为约 3 μm 至约 100 μm ，更优选地为约 5 μm 至约 40 μm 。

d-泛酸盐可以以纯的右旋对映体的形式获得和使用，或者可以以部分右型-左型外消旋混合物的形式使用，尽管据信可由这些物质产生的大部分或者全部的抚慰和治疗皮肤的有益效果来自于右旋物质，而不是活性相对较低的左旋物质。

用于本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物的优选泛酸盐包括钠盐、钾盐、钙盐、镁盐、锂盐，及其组合物。最优选的泛酸盐是泛酸钙。

悬浮剂

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物包括固体悬浮剂或增稠剂，以给组合物提供所需的粘度、流变性、纹理特性和/或产品硬度，或另外有助于分散的固体或液体悬浮在组合物中。

除非另有说明，本文所用术语“悬浮剂”是指那些已知的或其它能有效地为组合物提供悬浮、胶凝化、粘性化、固体化和/或增稠特性，或另外为最终产品提供结构形式的物质。这些悬浮剂包括胶凝剂和聚合的或非聚合的或无机的增稠剂或粘化剂。典型地，这类物质在环境条件下是固体，它们包括有机固体、聚硅氧烷固体、结

晶的或其它形式的胶凝剂、无机颗粒（比如粘土或二氧化硅），或其组合物。

所选择的用于本发明止汗剂和除臭剂组合物的悬浮剂的浓度和类型可能不同，这取决于产品所需的硬度、流变学性质、制剂类型（例如，止汗制剂或除臭制剂）和/或其它相关产品特性。对于适用于本发明的大多数悬浮剂，悬浮剂的总浓度按组合物的重量计为约 0.1% 至约 40%、更典型地为约 0.1% 至约 35%。悬浮剂浓度在液体实施方案（例如气溶胶、滚涂液等）中趋于偏低，而在半固体（例如软膏或霜膏）或固体棒实施方案中则偏高。

适合的悬浮剂的非限制性实施例包括氢化的蓖麻油（例如蓖麻蜡MP80、蓖麻蜡等）、脂肪醇（例如硬脂醇）、固体石蜡、甘油三酯和其它类似的固体悬浮酯或其它微晶蜡、聚硅氧烷和改性的聚硅氧烷蜡。适用于本发明的任选悬浮剂的非限制性实施例记载于美国专利5,976,514（Guskey等人）、美国专利5,891,424（Bretzler等人）中，这些文献均引入本文以供参考。

其它适合的悬浮剂包括按组合物重量计浓度为约 0.1% 至约 10% 的聚硅氧烷弹性体。这类适用为本发明的悬浮剂的聚硅氧烷物质的非限制性实施例记载于美国专利5,654,362（Schulz, Jr. 等人）；美国专利6,060,546（Powell等人）和美国专利5,919,437（Lee等人）中，这些文献均引入本文以供参考。

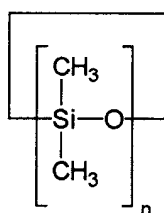
在本发明的除臭剂实施方案中，适合的悬浮剂的非限制性实施例包括脂肪酸盐（比如硬脂酸钠）和其它类似物质，它们记载于美国专利6,013,248（Luebbe等人）中，这些文献均引入本文以供参考。

无水液体载体

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物包括无水液体载体，其浓度按组合物的重量计为约 10% 至约 99%，优选地为约 20% 至约 70%。这些浓度根据产品形式、所需产品硬度、组合物的其它组分的选择等参数而有所不同。用于组合物的无水液体载体可以是任何已

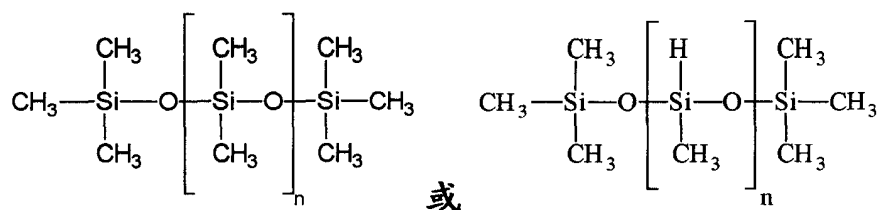
知的用于个人护理应用或其它适于皮肤局部应用的无水液体。

无水液体载体优选地包括挥发性聚硅氧烷液体，所述聚硅氧烷包括环状、直链和/或支链聚硅氧烷。在本发明的止汗剂组合物中，挥发性聚硅氧烷的浓度按组合物的重量计为约 5% 至约 80%、优选地为约 20% 至约 60%、更优选地为约 30% 至约 60%。挥发性聚硅氧烷优选地为具有约 3 至约 7 个、更优选为约 5 至约 6 个硅原子的环状聚硅氧烷。最优选的是符合下式的物质：



其中，n为约3至约7，优选地为约5至约6，最优选地为5。这些挥发性聚硅氧烷的粘度通常小于约10厘沲。用于本发明的适合的挥发性聚硅氧烷包括但不限于环二甲基硅氧烷 D5（可由G.E. Silicones商购获得）；道-康宁344和道-康宁345（可由道-康宁公司商购获得）；和GE7207、GE7158和硅氧烷液体 SF-1202和 SF-1173（可由通用电气公司商购获得）。适合的挥发性聚硅氧烷的非限制性实施例记载于Todd等人发表的论文“Volatile Silicone Fluids for Cosmetics”中，Cosmetics and Toiletries, 91: 27-32 (1976)，该文献引入本文以供参考。

无水液体载体可以包括非挥发性聚硅氧烷液体，其优选的浓度按组合物的重量计为约 1% 至约 35%、更优选地为约 5% 至约 30%。非挥发性聚硅氧烷载体优选在人的皮肤温度或低于人的皮肤温度时为液体，或者在无水止汗剂组合物的局部应用期间或之后为液体。优选的非挥发性液体聚硅氧烷为符合下列两个化学式中任意一个的物质：



其中，n为足够大以提供在环境条件下测得的高达约100,000厘沱的粘度，优选为小于约500厘沱，更优选地为10厘沱至约200厘沱，甚至更优选为10厘沱至约50厘沱。适合的非挥发性直链聚硅氧烷的具体非限制性实施例包括道-康宁200、六甲基二硅醚、道-康宁225、道-康宁1732、道-康宁5732、道-康宁5750（可由道-康宁公司获得）；和 SF-96、SF-1066以及SF18(350)硅氧烷液体（可由 G.E. Silicones 获得）。

已知用于个人护理品的许多其它液相载体可以以单独的或与本发明所述的液相载体相结合的形式用于止汗剂组合物中。许多此类液相载体记载于美国专利6,013,248（Luebbe等人）和5,968,489（Swaile等人）中，这些文献均引入本文以供参考。

任选组分

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物可另外包括任何已知的用于止汗剂和除臭剂产品或其它个人护理品的任选组分，或者所述任选组分适于局部应用于人的皮肤。

任选组分的非限制性实施例包括染料或着色剂、乳化剂、香料、推进剂、除臭剂香料、防腐剂、维生素、非维生素营养物质、润肤剂、偶合剂或其它溶剂、表面活性剂、加工助剂，比如粘度改性剂、洗涤助剂等。此类任选物质的实施例记载于美国专利4,049,792（Elsnau）；美国专利5,019,375（Tanner等人）；和美国专利5,429,816（Hofrichter等人）中，这些文献均引入本文以供参考。

制备方法

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物可以通过任何已知的和其它有效的技术来制备，该技术适于配制所需形式的止汗剂和除臭剂

产品。

例如，本发明的止汗剂的固体和半固体的实施方案可以通过将挥发性和非挥发性聚硅氧烷液相载体（或任何其它所需要的无水液体载体）在环境条件下混合来配制，或者在足以使混合物成为流体或液体的条件下配制，然后向混合物中加入任意的悬浮剂，再将所得混合物充分加热以使得所加入的悬浮剂熔化（例如在大约85℃下使许多固体蜡液化）并形成单相液体。然后在所得混合物冷却到约78℃之前，将止汗剂活性组分和其它水溶性固体（例如固体泛酸盐）加入并分散到整个加热的单相液体中，在这个温度下将香料和其它类似材料（如果有的话）加入到混合物中，然后将该混合物冷却到恰好高于悬浮剂的凝固温度（例如典型地为约60℃），再将其倒入分配包装内，并在环境条件下凝固。

例如，通过将无水液体载体与适合的悬浮剂和这种悬浮剂的活化剂混合，在搅拌加入止汗剂活性组分和其它水溶性固体之前，使混合物增稠到所需粘度，从而可制得本发明的止汗剂液体实施方案。将所得混合物在适当的匀化器中进行剪切以达到所需的浓缩液粘度。对于气溶胶液体实施方案，将所得液体和在浓缩液中的适当的推进剂一起装入气溶胶容器中，所加入的推进剂比率应适于所选择的推进剂系统。

其它适合的配制止汗剂组合物的方法是公知的，并已记载于止汗剂领域，这些组合物均可用于配制本发明的止汗剂组合物。制备固体止汗剂实施方案的方法包括那些记载于美国专利4,822,603（Farris等人）和4,985,238（Tanner等人）中的方法。制备气溶胶止汗剂实施方案的方法包括记载于美国专利6,136,303（Ruebusch等人）；美国专利4,904,463（Johnson等人）和美国专利4,840,78（Johnson等人）中的方法。软膏或霜膏实施方案的方法记载于美国专利5,902,571（Putman等人）和美国专利5,902,570（Bretzler等人）中。上述所有参考文献均引入本文以供参考。

配制本发明的除臭剂实施方案的适合方法记载于美国专利

6,013,248 (Luebbe等人)和美国专利5,902,572 (Luebbe等人)中,这些参考文献均引入本文以供参考。

优选的制备方法

优选地使组合物通过研磨步骤以减少或消除相对较大的固体附聚物,从而制得本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物,所述固体附聚物在固体泛酸盐与止汗剂或固体颗粒形式的止汗剂活性组分混合时形成。

现已发现固体泛酸盐易于与任意固体止汗剂或除臭剂活性组分(特别是止汗剂活性组分)聚结,以在组合物内形成不希望得到的很大的结块固体。也已发现,在将制剂倒入包装内冷却之前,通过粉碎中间体制剂可以减少和消除附聚物,从而进一步改进止汗剂和除臭剂组合物的应用化妆品。

更具体地讲,本发明的优选制备方法包括以下步骤:

(a) 通过混合以下组分来制备中间组合物:

(i) 按重量计约 0.1% 至约 30% 的止汗剂或除臭剂活性组分;

(ii) 按重量计约 0.01% 至约 10% 的固体水溶性泛酸盐;

(iii) 按重量计约 0.1% 至约 40% 的悬浮剂;和

(iv) 按重量计约 10% 至约 99% 的无水液体载体;和

(b) 加热中间组合物至悬浮剂熔点以上温度,以形成包含固体止汗剂活性组分和固体水溶性泛酸盐及其固体附聚物的中间液体组合物;

(c) 将中间液体组合物研磨足够长时间以将固体附聚物的平均粒径减小至小于 50 μm ;然后

(d) 将研磨过的液体中间物倒入分配包装内,并使被包装的组合物冷却至室温,以形成无水止汗剂和除臭剂组合物。

在本发明的研磨步骤中,应用的剪切力应足以有效地粉碎或减少所有颗粒附聚物,并把颗粒分散到整个组合物中。此类研磨或高

剪切混合方法的非限制性实施例包括胶体研磨和高压均化。经过研磨步骤后的固体附聚物的平均粒径可以通过偏振光显微镜法测量或确定，该方法在各种化学领域中是众所周知的。

使用方法

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物可以以有效剂量局部应用于腋窝或皮肤的其它区域，以处理或减少出汗湿度和/或恶臭。组合物应用于所需的皮肤区域，其优选的用量范围为约0.1克至约20克，更优选地为约0.1克至约10克，甚至更优选地为约0.1克至约1克。为达到有效的止汗和恶臭控制效果，组合物优选地每天应用一至两次，更优选地为每天一次。

本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物可以配制成各种产品形式，然后用本文所述的方法应用于腋窝或其它皮肤区域，这些各不相同的产品形式包括固体（例如棒）、半固体（例如洗剂、霜膏和软膏）、或液体（例如气溶胶、非气溶胶喷剂、滚涂液和多孔圆顶液体）。

实施例

在表1至5中所述的下列非限制性实施例说明了本发明的无水止汗剂和除臭剂组合物的具体实施例，包括其制备和使用方法。根据本发明所述的使用方法，每一示例的组合物被局部地应用于皮肤的腋窝区域，包括应用于剃刮过的腋下区域。所用的组合物对皮肤作用温和，并有助于治疗或抚慰受刺激的腋下皮肤，包括被剃刮过的腋下皮肤。

除非另有说明，所有示例的量均为基于止汗剂棒组合物总重量的重量百分数。

实施例 1 至 3: 止汗剂软膏/霜膏、蜡状棒和低残余物棒

在表 1 至 3 中的实施例分别通过如下方法配制。首先，将胶凝剂（充分氢化的 HEAR 和 C18-C36 酸甘油三酯）溶于聚硅氧烷液体、环戊硅氧烷和聚二甲基硅氧烷中，将胶凝剂和硅氧烷材料一起加热至 85℃，同时在 IKA 搅拌平板上进行搅拌。然后在搅拌的情况下将

固体止汗剂活性组分缓慢加入到加热的混合物中，加料完成后，立即将所得混合物重新加热至 85℃。在此温度下，将水溶性固体（例如烟酰胺和泛酸钙）随同生育酚乙酸酯一起加入。在带有 S 25 N – 25F 附件的 IKA 牌 T 25 Ultra-Turrax 分散混合器中，在 4 速的设置条件下将混合物进行研磨。将产品研磨足够长的时间，以减少和粉碎所有的水溶性固体或固体止汗剂活性组分的附聚物。在研磨充分后，从热的混合物中取出少量研磨产品样品，置于金属刮刀上，在偏振显微镜下进行检验。将产品一直研磨，直至没有明显可见的大于 10 微米的水溶性固体和/或止汗剂活性组分附聚物。在研磨完成后，立即将产品冷却，并在大约 60℃ 温度下倒入止汗剂容器中，冷却至室温，得到所需的产品形式。

表 1: 止汗剂软膏/霜膏

组分	实施例 1.1	实施例 1.2	实施例 1.3	实施例 1.4
碱式三氯化铝锆的甘氨酸盐（固体）	25.25	25.25	25.25	25.25
聚二甲基硅氧烷（10厘施）	5.00	5.00	5.00	5.00
完全氢化的高芥酸油菜籽油（HEAR油）	5.00	5.00	5.00	5.00
烟酰胺（固体）	3.50	3.50	0	7.00
C18-C36酸甘油三酯 Syncrowax HGLC	1.25	1.25	1.25	1.25
香料	0.75	0.75	0.75	0.75
泛酸钙（固体）	0.50	0.50	3.50	1.00
生育酚乙酸酯	0.50	0	0	0
环戊硅氧烷	适量	适量	适量	适量
总计	100.00	100.00	100.00	100.00

表 2：止汗剂蜡状棒（固体）

组分	实施例 2.1	实施例 2.2	实施例 2.3	实施例 2.4
碱式三氯化铝锆的甘氨酸盐（固体）	20.00	20.00	20.00	20.00
硬脂醇	11.00	11.00	11.00	11.00
滑石，美国药典 (USP) 级别	6.50	7.00	7.50	3.00
烟酰胺（固体）	3.50	3.50	0	7.00
聚二甲基硅氧烷（50厘泡）	3.00	5.00	5.00	5.00
蓖麻蜡	2.90	5.00	5.00	5.00
泛酸钙（固体）	0.50	0.50	3.50	1.00
生育酚乙酸酯	0.50	0	0	0
热解法二氧化硅	0.18	0.18	0.18	0.18
一缩二丙二醇	0.18	0.18	0.18	0.18
Microthene	0.18	0.18	0.18	0.18
二十二醇	0.08	0.08	0.08	0.08
香料	0.75	0.75	0.75	0.75
环戊硅氧烷	适量	适量	适量	适量
总计	100.00	100.00	100.00	100.00

表 3：止汗剂低残余物棒（固体）

组分	实施例 3.1	实施例 3.2	实施例 3.3	实施例 3.4
碱式三氯化铝锆的甘氨酸盐（固体）	25.25	20.00	20.00	20.00
聚二甲基硅氧烷（50厘泡）	5.00	5.00	5.00	5.00
完全氢化的高芥酸油菜籽油（HEAR油）	15.00	15.00	15.00	15.00
异构烷烃类 (Isopar) M	10.00	10.00	10.00	10.00
烟酰胺（固体）	3.50	3.50	0	7.00
C18-C36酸甘油三酯 Syncrowax HGLC	3.75	3.75	3.75	3.75
香料	0.75	0.75	0.75	0.75
泛酸钙（固体）	0.50	0.50	3.50	1.00
生育酚乙酸酯	0.50	0	0	0
环戊硅氧烷	适量	适量	适量	适量
总计	100	100	100	100

实施例 4：止汗剂气溶胶

在表4中气溶胶实施方案的实施例可以通过公知的制备气溶胶止汗剂产品的方法来配制，比如记载于美国专利6,136,3039（Ruebusch等人）；美国专利4,904,463（Johnson等人）和美国专利4,840,786（Johnson等人）中的方法。通过将水溶性固体（例如烟酰胺、泛酸钙等）和固体止汗剂活性组分在气溶胶容器中混合，可制备在表4中的实施例。将所有其它材料混合在一起以形成均匀的预混物液体，再将此新形成的预混物加到气溶胶容器中。然后在加压的情况下将推进剂加入，并将容器密封。

表 4：止汗剂气溶胶

组分	实施例 4.1	实施例 4.2	实施例 4.3	实施例 4.4
5/6 水合氯化铝固体（大球状物- 95）Reheis化学公司	10.50	10.50	11.00	10.50
SE76聚硅氧烷树胶 ¹	5.00	5.00	5.00	5.00
SWS 801 ²	15.00	15.00	15.00	15.00
环二甲基硅氧烷 ³	3.40	3.40	3.40	3.40
烟酰胺（固体）	1.00	1.00	0	0.50
泛酸钙（固体）	0.50	0.50	1.00	0.50
维生素C（固体）	0	0	0	0.50
生育酚乙酸酯	0.50	0	0	0.50
推进剂 A-46 ⁴	适量	适量	适量	适量
总计	100.00	100.00	100.00	100.00

1. 硅氧烷树胶预混物（15% 的聚硅氧烷-15x10⁶ 厘泊和 85% 的环二甲基硅氧烷）；通用电气公司
2. 二氨基官能化硅氧烷，分子量为76,000；SWS Silicone公司
3. 总的环二甲基硅氧烷，包括在注释2中所述的在硅氧烷预混物中所含的环二甲基硅氧烷。

4. 由 87% 的异丁烷和 13% 的丙烷组成的混合物（按推进剂的总重量计）

实施例 5：止汗剂液体

表 5 中的实施例是通过在环境条件下将各种组分混合在一起分别配制的。然后将所得混合物分别在带有 S 25 N- 25F 附件的 IKA 牌 T 25 Ultra-Turrax 分散器(设置为 4 速)中进行研磨。将混合物研磨足够长时间，以减少或粉碎任意水溶性固体和/或止汗剂活性组分的附聚物。将混合物进行充分研磨，直至用少量样品在偏振显微镜下检测没有大于 10 微米的可见附聚物。在研磨结束后，立即将液体止汗剂产物倒入滚涂液止汗剂容器或其它适合的液体止汗剂分配器中。

表 5：止汗剂液体

组分	实施例 5.1	实施例 5.2	实施例 5.3	实施例 5.4
碱式三氯化铝锆的甘氨酸盐（固体）	21.25	21.25	21.75	20.00
聚二甲基硅氧烷（10厘施）	10.00	10.00	10.00	10.00
Microthene	7.00	7.00	7.00	7.00
有机皂土 38	1.00	1.00	1.00	1.00
胶体二氧化硅(Cab-O-Sil)	0.70	0.70	0.70	0.70
碳酸异丙烯酯	0.30	0.30	0.30	0.30
香料	0.50	0.50	0.50	0.50
烟酰胺（固体）	3.50	3.50	0	2.0
泛酸钙（固体）	0.50	0.50	3.50	1.0
维生素C	0	0	0	2.0
生育酚乙酸酯	0.50	0	0	0
环戊硅氧烷	适量	适量	适量	适量
总计	100.00	100.00	100.00	100.00

实施例 6: 除臭剂

表 6 中的实施例是通过将除臭剂和皮肤活性组分固体（例如泛酸钙、烟酰胺等）在气溶胶容器中混合在一起而分别制备的。将聚硅氧烷树胶、氨基官能化的聚硅氧烷、环二甲基硅氧烷和香料进行预混并加入上述容器中。然后在加压的情况下加入推进剂，并将容器密封。这些制剂可以通过在止汗剂领域中公知的方法制备，其中的一个非限制性实施例记载于美国专利 4,806,338（Luebbe 等人），该文被引入以供参考。

表 6: 除臭剂

组分	实施例 6.1	实施例 6.2	实施例 6.3	实施例 6.4
三氯生	0.3	0.3%	0.3%	0
Sensiva SC-50 ¹	0	0	0.6%	0.6%
SE76 聚硅氧烷树胶 ²	5.00	5.00	5.00	5.00
SWS 801 ³	15.00	15.00	15.00	15.00
环二甲基硅氧烷 ⁴	3.40	3.40	3.40	3.40
烟酰胺（固体）	1.00	1.00	0	0.50
泛酸钙（固体）	0.50	0.50	1.00	0.50
维生素C（固体）	0	0	0	0.50
生育酚乙酸酯	0.50	0	0	0.50
香料	3.0	2.0	2.0	2.0
推进剂 A-46 ⁵	适量	适量	适量	适量
总计	100.00	100.00	100.00	100.00

1. 高纯度的 1-烷基甘油醚的代表性合成物；制造商 S.A Schulke & Mayr, Belgium N.V.

2. 聚硅氧烷树胶预混物（15% 的聚硅氧烷- 15×10^6 厘泊和 85 的环二甲基硅氧烷）；通用电气公司

3. 二氨基官能化聚硅氧烷，分子量76,000; SWS Silicone, Inc.

4. 总的环二甲基硅氧烷，包括在注释2所述的聚硅氧烷预混合物中的环二甲基硅氧烷。

5. 由 87% 的异丁烷和 13% 的丙烷组成的混合物（按推进剂的总重量计）