



(51) МПК

A61K 8/06 (2006.01)*A61K 8/26* (2006.01)*A61K 8/28* (2006.01)*A61K 8/72* (2006.01)*A61Q 15/00* (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2005100961/15, 22.05.2003

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
22.05.2003(30) Конвенционный приоритет:
18.06.2002 GB 0213999.6

(43) Дата публикации заявки: 10.08.2005

(45) Опубликовано: 27.04.2008 Бюл. № 12

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: WO 0249590 A3, 27.06.2002. RU 2185144
C2, 20.07.2002. RU 2184529 C2, 10.07.2002. GB
714551 A, 01.09.1954.(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
18.01.2005(86) Заявка РСТ:
EP 03/05471 (22.05.2003)(87) Публикация РСТ:
WO 03/105795 (24.12.2003)

Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной, рег. № 517

(72) Автор(ы):

БРАУН Натан Чарльз (GB),

РАЙЕЛИ Хью (GB),

СМИТ Иэн Карл (GB),

СТОКТОН Джоан Элизабет (GB)

(73) Патентообладатель(и):

УНИЛЕВЕР НВ (NL)

(54) КОМПОЗИЦИЯ ЭМУЛЬСИЙ ДЛЯ АНТИПЕРСПИРАНТОВ

(57) Реферат:

Изобретение относится к косметическим
средствам и касается антиперспирантов и
дезодорантов. Композиция эмульсии вода/масло
антиперспиранта содержит растворенную
стягивающую соль выбранных из солей алюминия,

циркония и смешанных солей алюминия-циркония,
эмульгатор и, в отдельной фазе, полимер,
содержащий группы кислот Бренстеда.
Предложенная композиция позволяет уменьшить
потоотделение. 2 н. и 7 з.п. ф-лы, 6 табл.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.

A61K 8/06 (2006.01)*A61K 8/26* (2006.01)*A61K 8/28* (2006.01)*A61K 8/72* (2006.01)*A61Q 15/00* (2006.01)(12) **ABSTRACT OF INVENTION**(21), (22) Application: **2005100961/15, 22.05.2003**(24) Effective date for property rights: **22.05.2003**(30) Priority:
18.06.2002 GB 0213999.6(43) Application published: **10.08.2005**(45) Date of publication: **27.04.2008 Bull. 12**(85) Commencement of national phase: **18.01.2005**(86) PCT application:
EP 03/05471 (22.05.2003)(87) PCT publication:
WO 03/105795 (24.12.2003)Mail address:
**129010, Moskva, ul. B.Spasskaja, 25, str.3,
OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i
Partnery", pat.pov. E.E.Nazinoj, reg. № 517**(72) Inventor(s):
**BRAUN Natan Charl'z (GB),
RAJELI Kh'ju (GB),
SMIT lehn Karl (GB),
STOKTON Dzhoan Ehlizabet (GB)**(73) Proprietor(s):
UNILEVER NV (NL)(54) **EMULSION COMPOSITION FOR ANTIPERSPIRANTS**

(57) Abstract:

FIELD: cosmetology.

SUBSTANCE: the present innovation refers to cosmetic preparations and deals with antiperspirants and deodorants. Emulsion composition of water/salt of antiperspirant contains dissolved astringent salt chosen out of

the salts of aluminum, zirconium and mixed salts of aluminum-zirconium, an emulsifying agent and, in separate phase, a polymer containing the groups of Brönsted acids. The suggested composition enables to decrease perspiration.

EFFECT: higher efficiency.

9 cl, 8 ex, 6 tbl

Настоящее изобретение относится к области науки о препаратах антиперспирантов и дезодорантов. Более конкретно, оно относится к композициям для антиперспирантов с высокими рабочими характеристиками, имеющим структуру эмульсии типа вода-в-масле (в/м).

5 В заявке РСТ/ЕРО1/13253, авторы описывают композиции для антиперспирантов с высокими рабочими характеристиками, содержащими соль антиперспиранта и полимер, содержащий группы кислот Бренстеда, который действует как вспомогательный гелеобразующий агент для соли антиперспиранта, когда смешивается с ней в присутствии воды, перед применением, соль антиперспиранта и полимер физически отделены друг от друга.

10 Другие системы, содержащие соль антиперспиранта и полимер, содержащий группы кислот Бренстеда, цитируются в указанной выше заявке. Однако ни одна из этих других систем не предлагает сочетания физической стабильности и высоких рабочих характеристик, обеспечиваемых композициями эмульсии в/м по настоящему изобретению.

15 Композиции эмульсий в/м ранее использовались в качестве продуктов антиперспирантов. Например, Европейский патент EP 812 182 (Unilever PLC) описывает основу для аэрозольной композиции антиперспиранта в форме эмульсии в/м, и содержащей растворимую соль алюминия, летучий силикон, и поверхностно-активное вещество на основе силикона.

20 Обнаружено, что рабочие характеристики композиции эмульсии в/м, содержащей растворенную соль антиперспиранта, могут быть улучшены с помощью присутствия, в фазе, отдельной от растворенной соли антиперспиранта, полимера, содержащего группы кислот Бренстеда. В дополнение к этому, такие системы имеют приемлемую физическую стабильность; этот факт является очень неожиданным, принимая во внимание

25 изначальную термодинамическую нестабильность, присущую эмульсионным системам. Таким образом, в соответствии с первым аспектом настоящего изобретения, предусматривается композиция эмульсии в/м для антиперспиранта, содержащая растворенную соль антиперспиранта, эмульсификатор и, в дисперсной фазе, отдельной от растворенной соли антиперспиранта, полимер, содержащий группы кислот Бренстеда.

30 В соответствии со вторым аспектом настоящего изобретения, предусматривается способ уменьшения потоотделения, включающий нанесение на тело человека композиции эмульсии в/м, содержащей растворенную соль антиперспиранта и эмульсификатор, и совместное нанесение из дисперсной фазы, отдельной от растворенной соли антиперспиранта, полимера, содержащего группы кислот Бренстеда.

35 В соответствии с третьим аспектом настоящего изобретения, предусматривается способ изготовления композиции антиперспиранта, указанный способ включает получение эмульсии водного раствора соли антиперспиранта в масляной непрерывной фазе, с последующим смешиванием эмульсии, полученной таким образом, с отдельной фазой, содержащей полимер, содержащий группы кислот Бренстеда.

40 Композиции эмульсий в/м для антиперспирантов по настоящему изобретению содержат соль антиперспиранта, растворенную в водной дисперсной фазе. Полимер, содержащий группы кислот Бренстеда, служит для улучшения рабочих характеристик соли антиперспиранта, когда оба компонента вступают в тесный контакт при нанесении. Однако является важным, чтобы тесный контакт между двумя компонентами предотвращался до их

45 нанесения, и это является причиной того, что полимер, содержащий группы кислот Бренстеда, наносится как отдельная фаза. Преждевременное взаимодействие между двумя компонентами приводит к созданию водонерастворимого комплекса, который не является эффективным антиперспирантом. Преждевременное взаимодействие между двумя компонентами может быть

50 предотвращено путем нанесения их из различных композиций, и это представляет собой способ уменьшения потоотделения в соответствии с настоящим изобретением. Альтернативно, может наноситься композиция в соответствии с первым аспектом настоящего изобретения.

В композициях в соответствии с первым аспектом настоящего изобретения, существенным является, чтобы полимер, содержащий группы кислот Бренстеда, присутствовал в фазе, отдельной от растворенной соли антиперспиранта. Это может достигаться путем суспендирования полимера, содержащего группы кислот Бренстеда, в виде твердого продукта, в непрерывной масляной фазе. Таким образом, в одном из вариантов, предусматривается композиция эмульсии в/м для антиперспиранта, содержащая растворенную соль антиперспиранта, и суспендированный в виде твердого продукта, в масляной непрерывной фазе, полимер, содержащий группы кислот Бренстеда.

В альтернативном варианте первого аспекта настоящего изобретения, предусматривается композиция эмульсии в/м для антиперспиранта, содержащая растворенную соль антиперспиранта, эмульсификатор и эмульсифицированный в виде отдельной дисперсной фазы водный раствор полимера, содержащего группы кислот Бренстеда. Композиции этого типа в настоящем описании описываются как "двойные" эмульсии. Для получения таких композиций, существенно, чтобы полимер был растворимым в воде, предпочтительно, имел растворимость, равную 5 г/л или более, более предпочтительно, 10 г/л или более, и наиболее предпочтительно, 50 г/л или более. Существенным также является, чтобы раствор полимера эмульсифицировался в масляной фазе; это может достигаться с использованием такого же эмульсификатора, который используется при эмульсификации раствора антиперспиранта, или иного.

Композиции по настоящему изобретению содержат масляную непрерывную фазу. Композиции могут содержать силиконовое масло, углеводородное масло и/или сложноэфирные масла. Когда присутствует более чем одно масло, может быть предпочтительным, чтобы эти масла смешивались, хотя иногда может быть желательной несмешиваемость. Для устранения необходимости встряхивания жидких композиций перед использованием, предпочтительно, чтобы только одна масляная непрерывная фаза присутствовала в таких композициях. Предпочтительно, чтобы композиции по настоящему изобретению содержали силиконовое масло, и, кроме того, является предпочтительным, чтобы силиконовое масло содержалось в масляной непрерывной фазе. Силиконовые масла могут быть циклическими или линейными, примеры включают силиконовые жидкости серий 344, 345, 244, 245, 246, 556 и 200 от Dow Corning; силиконы 7207 и 7158 от Union Carbide Corporation; и силикон SF1202 от General Electric. Альтернативно или в дополнение к этому, могут использоваться несиликоновые масла; такие материалы включают минеральные масла, гидрированный полиизобутен, полидецен, парафины, изопарафины, по меньшей мере, с 10 атомами углерода, и алифатические или ароматические сложноэфирные масла (например, изопропилмиристат, лаурилмиристат, изопропилпальмитат, диизопропилсебекат, диизопропиладипат, или C₈-C₁₈ алкилбензоаты).

Композиции по настоящему изобретению также содержат, по меньшей мере, одну водную дисперсную фазу. Содержание водной дисперсной фазы (фаз) в общей композиции (исключая любой летучий пропеллент, который может присутствовать) равно, как правило, от 50% до 90%, в частности от 50% до 70%, когда используется в композициях для палочек, в частности от 70% до 90%, в частности от 75% до 85%, когда используется в жидких или кремообразных/мягких твердых композициях, все проценты - массовые. Средний размер капель водной дисперсной фазы, содержащей соль антиперспиранта, предпочтительно равен от 1 до 25 мкм, в частности от 1 до 10 мкм, в особенности от 1 до 7 мкм. Когда композиция, кроме того, содержит водную дисперсную фазу, содержащую полимер, средний размер капель этой дисперсной фазы предпочтительно равен от 1 до 25 мкм, в частности от 1 до 10 мкм, в особенности от 5 до 7 мкм. Упомянутые средние размеры капель представляют собой средние значения по Заутеру D(4,3), как определяется с помощью методик рассеяния света.

Соль антиперспиранта

Используемые соли антиперспиранта (АП) часто выбираются из стягивающих солей, включая, в частности, соли алюминия, циркония и смешанные соли алюминия-циркония,

включая как неорганические соли, соли с органическими анионами, так и комплексы. Предпочтительные соли антиперспирантов представляют собой хлориды алюминия, циркония и алюминия-циркония, их оксихлориды и их хлоргидратные соли. Особенно предпочтительные соли антиперспирантов являются многоатомными по природе, это

5 означает, что катионы соли ассоциируются в группы, содержащие более чем один ион металла.

Галогенгидраты алюминия обычно определяются общей формулой $Al_2(OH)_xQ_y \cdot wH_2O$, в которой Q представляет хлор, бром или йод, x представляет собой переменное от 2 до 5,

10 и $x+y=6$, в то время как wH_2O представляет собой переменную величину гидратирования. Хлоргидрат алюминия (ACH) представляет собой особенно предпочтительное активное вещество.

Соли циркония обычно определяются общей формулой $ZrO(OH)_{2-x}Q_x \cdot wH_2O$, в которой Q представляет хлор, бром или йод; x равно примерно от 1 до 2; w равно примерно от 1 до 7; и как x, так и w могут иметь значения, не равные целым числам.

15 Предпочтительными являются цирконилоксигалогениды, гидроксигалогениды циркония и их сочетания. Неограничивающие примеры солей циркония и способов для их приготовления описаны в патенте Бельгии 825 146, Schmitz, выданном 4 августа 1975 года и в патенте США 4223010 (Rubino).

Соли АП, как используется в настоящем изобретении, могут присутствовать в виде

20 смесей или комплексов. Пригодные для использования комплексы алюминия-циркония часто содержат соединение с карбоксилатной группой, например аминокислоту. Примеры пригодных для использования аминокислот включают триптофан, β -фенилаланин, валин, метионин, β -аланин и, наиболее предпочтительно, глицин.

В некоторых вариантах, желательным является использование комплексов сочетания

25 галогенгидратов алюминия и хлоргидратов циркония с аминокислотами, такими как глицин, которые описываются в патенте США 3792068 (Procter and Gamble Co.). Некоторые из этих комплексов Al/Zr часто называются в литературе ZAG. Активные вещества ZAG, как правило, содержат алюминий, цирконий и хлорид с отношением Al/Zr, находящимся в пределах от 2 до 10, в частности от 2 до 6, с отношением Al/Cl, равным от 2,1 до 0,9,

30 и переменное количество глицина. Активные вещества этого предпочтительного типа являются доступными от Westwood, от Summit и от Reheis.

Другие активные вещества, которые могут использоваться, включают стягивающие соли титана, например, такие, как описано в патенте Великобритании GB 2299506.

Соли АП предпочтительно включаются в композиции по настоящему изобретению в

35 количестве от 0,5 до 60 мас.%, в особенности от 5 до 30 мас.% или 40 мас.%, в частности от 5 или 10 мас.% до 30 или 35 мас.%.

Соль АП, как правило, растворяют в воде перед эмульсификацией. Водный раствор соли АП, как правило, имеет концентрацию от 10 до 70 мас.%, в частности от 25 до 60 мас.%,

40 в особенности от 40 до 60 мас.%. Эмульсия в/м, формируемая из раствора соли АП, до добавления отдельной фазы полимера и какого-либо летучего пропеллента обычно имеет пропорцию дисперсной фазы, равную от 50 до 90%, в частности от 50 до 70%, когда используется в композициях для палочек, и от 70 до 90%, в частности от 75 до 85%, когда используется в жидких или кремообразных/мягких твердых композициях, все проценты - массовые.

45 Полимер

Полимеры по настоящему изобретению содержат группы кислот Бренстеда и действуют как вспомогательные гелеобразующие агенты для соли АП, когда смешиваются с ней в

присутствии воды, например воды в поте человека, при температуре 37°C или менее.

50 Совместное гелеобразование приводит к более густому состоянию материи - то есть, так сказать, к получению трехкомпонентной системы (полимер, соль АП, вода), имеющей более высокую вязкость, чем вязкость водного раствора либо полимера, либо соли АП, самих по себе. Без желания связываться с теорией, предполагается, что совместное гелеобразование включает химическое взаимодействие между группами кислот Бренстеда

на полимере и гидратированных катионов металлов солей АП.

Простое исследование может использоваться для определения того, может ли полимер действовать в качестве вспомогательного гелеобразующего объекта или нет: если смешивание водного раствора полимера с водным раствором соли АП приводит к
5 увеличению вязкости, тогда полимер представляет собой вспомогательный гелеобразующий агент для соли АП.

Во многих вариантах настоящего изобретения, является предпочтительным, чтобы растворимость используемых полимеров в воде, когда она измеряется при 37°C, предпочтительно составляла 5 г/л или более, более предпочтительно, 10 г/л или более,
10 наиболее предпочтительно, 50 г/л или более. Предпочтительно, чтобы полимеры образовывали истинные растворы в воде, а не дисперсии; такие истинные растворы, как правило, имеют коэффициент поглощения, меньший чем 0,2, предпочтительно, меньший, чем 0,1 (для длины оптического пути 1 см при 600 нм), измеренный с использованием Pharmacia Biotech Ultrospec 200 Spectrophotometer или подобного ему инструмента.

15 Является также желательным, чтобы полимер был водорастворимым при pH 7; установление указанного значения pH, как правило, требует определенной величины нейтрализации присутствующих групп кислот Бренстеда.

Когда полимер присутствует в виде суспендированного твердого продукта, является предпочтительным (в особенности, в жидких композициях), чтобы полимер медленно
20 растворялся в воде, когда требуется более 8 недель, предпочтительно более 16 недель, при температуре окружающей среды, для растворения в водной фазе, содержащей растворенную соль антиперспиранта, до такой степени, которая вызывает сгущение или осаждение твердого продукта.

Группы кислот Бренстеда в полимере могут присутствовать в их протонированной
25 форме или могут присутствовать в их нейтрализованной форме, в виде групп солей. Как частично нейтрализованные, так и полностью нейтрализованные кислые полимеры, могут использоваться в настоящем изобретении. Пригодные для использования группы кислот Бренстеда включают группы карбоновых кислот, группы сульфоновых кислот и группы фосфоновых кислот. Группы карбоновых кислот являются особенно предпочтительными.
30 Группы кислот Бренстеда предпочтительно присутствуют в концентрации, большей чем 0,1 ммоль на грамм полимера, более предпочтительно, в концентрации, большей чем 1,0 ммоль/г полимера, наиболее предпочтительно в концентрации, большей чем 3,0 ммоль/г полимера. Приведенные концентрации групп кислот Бренстеда относятся к группам одноосновных кислот Бренстеда и должны быть уменьшены *pro rata* для групп
35 многоосновных кислот Бренстеда. Латентные группы кислот Бренстеда, такие как ангидриды или другие группы, которые генерируют группы кислот Бренстеда при добавлении воды, также могут присутствовать.

Когда полимер присутствует в виде суспендированного твердого продукта, предпочтительно (в особенности, в жидких композициях), чтобы уровень групп кислот
40 Бренстеда в полимере ограничивался уровнем, меньшим чем 6 ммоль/г, более предпочтительно меньшим чем 5 ммоль/г, наиболее предпочтительно меньшим чем 4 ммоль/г. Таким образом, получают более стабильные композиции.

Предпочтительные полимеры представляют собой органические полимеры, в частности органические полимеры, обладающие только ограниченным положительным зарядом, то
45 есть, так сказать, имеющие менее чем 50% молярных, предпочтительно менее чем 25% молярных, положительно заряженных мономерных единиц. Особенно предпочтительные органические полимеры представляют собой неионные и анионные полимеры. Типичные полимеры обладают углеродными основными цепями, необязательно прерываемыми сложноэфирными или амидными связями.

50 Кислотное число полимера представляет собой широко используемое средство характеристики. Кислотные числа, как правило, выражают кислотность полимера в количестве миллиграммов основания гидроксида калия, требуемого для полной нейтрализации одного грамма полимера. Таким образом, единица измерения может

сокращенно записываться как мг КОН/г.

Типичные полимеры, используемые в настоящем изобретении, имеют кислотные числа, большие чем 160. Полимеры предпочтительно имеют кислотные числа, большие чем 320, более предпочтительно, большие чем 450. Особенно предпочтительные полимеры имеют кислотные числа, большие чем 580. Эти кислотные числа основываются на полимере в его полностью протонированном состоянии; то есть, так сказать, реальная степень нейтрализации полимера при использовании игнорируется в связи с "кислотным числом". Кислотные числа могут измеряться экспериментально или оцениваться теоретически.

Когда используется последний способ, группы ангидридов кислот, присутствующие в полимере, должны учитываться как две кислотные группы, такие латентные кислые группы, как правило, гидролизуются до ди-кислот с помощью гидроксида калия.

Предпочтительные группы карбоновых кислот могут вводиться в полимер путем включения в полимер таких мономеров, как акриловая кислота, метакриловая кислота, малеиновая кислота, итаконовая кислота, кротоновая кислота, малеиновый ангидрид или итакониловый ангидрид. Когда единственным источником групп кислот Бренстеда являются мономеры ангидридов, необходимо, чтобы группы ангидридов были, по меньшей мере, частично, гидролизованы перед использованием полимера. Полимеры, содержащие смесь любых указанных выше мономеров кислот и/или ангидридов, также могут преимущественно использоваться. Особенно предпочтительные полимеры представляют собой такие полимеры, которые получают, по меньшей мере, частично, из мономеров малеиновой кислоты и/или малеиновых ангидридов.

Иногда является желательным включение других мономеров в полимер. Пригодные для использования мономеры включают простой метилвиниловый эфир, C₁-C₈ алкилакрилаты и метакрилаты, винилацетат, этилен и пропилен. Включение таких мономеров может облегчить синтез полимера, упростить обращение и/или приготовление полимера, и может улучшить рабочие характеристики полимера в качестве вспомогательного гелеобразующего агента.

Молекулярная масса полимера предпочтительно находится в пределах от 500 до 5000000, в частности от 10000 до 3000000, в особенности от 100000 до 2500000. Выбор соответствующей молекулярной массы для полимера может приводить к преимуществам с точки зрения простоты приготовления, эстетичности продукта (в частности, ощущения от продукта) и рабочих характеристик продукта.

Особенно предпочтительные полимеры представляют собой сополимеры простого метилвинилового эфира и малеиновой кислоты/ангидрида.

Полимер предпочтительно включают в композицию в количестве от 0,1 до 10 мас.%, более предпочтительно от 0,5 до 5 мас.%, а наиболее предпочтительно от 1 до 4 мас.%, от указанной композиции.

Когда полимер присутствует в виде суспендированного твердого продукта, размер частиц полимера, как правило, находится в пределах между 0,1 и 200 мкм, предпочтительно, со средним размером частиц от 3 до 50 мкм, средний размер частиц представляет собой средние значения по Заутеру D(4,3), как определяется с помощью методик рассеяния света.

Когда полимер присутствует в виде водного раствора, эмульсифицированного как отдельная дисперсная фаза, он предпочтительно используется в качестве раствора с концентрацией от 5 до 50 мас.%, более предпочтительно от 10 до 30 мас.%, а наиболее предпочтительно от 15 до 20 мас.%. Когда эмульсия в/м формируется из полимера в растворе соли, перед смешиванием с эмульсией АП в/м, она, как правило, имеет пропорцию дисперсной фазы от 50 до 90%, в частности от 50 до 70%, когда используется в композициях для палочек, и от 70 до 90%, в особенности от 75 до 85%, когда используется в жидких или кремообразных/мягких твердых композициях, все проценты - массовые.

Массовое отношение соли АП к полимеру предпочтительно равно 25:1 или менее, 1:10 или более, в частности находится в пределах между 25:1 и 1:10, в особенности между 10:

1 и 1:5.

Эмульсификатор

Эмульсификатор представляет собой главный компонент эмульсии в/м, содержащей растворенную соль антиперспиранта, и может также ассоциироваться с независимой полимерной фазой. Эмульсификатор может представлять собой анионное, катионное, цвиттерионное или неионное поверхностно-активное вещество; неионные поверхностно-активные вещества являются предпочтительными. Пропорция эмульсификатора в композиции в целом может составлять от 0,1 до 5%, предпочтительно от 0,2 до 3,5%, более предпочтительно от 0,25 до 2,5%, а наиболее предпочтительно от 0,4 до 0,6%, в особенности для жидких композиций.

Желательно использование эмульсификатора или смеси эмульсификаторов с общим значением гидроксильно-липофильного баланса HLB, в пределах от 2 до 10, предпочтительно от 3 до 8. Смесь эмульсификаторов может содержать поверхностно-активное вещество с высоким значением HLB и поверхностно-активное вещество с низким значением HLB, смешанные с получением соответствующего общего значения HLB.

Эмульсификаторы с высоким значением HLB включают неионные сложные или простые эфиры, содержащие полиоксиалкиленовый остаток, в частности полиоксиэтиленовый (POE) остаток, содержащий от 2 до 80, а в особенности от 5 до 60, этиленоксидных (EO) единиц. Полиоксипропиленовые (POP) эмульсификаторы также могут использоваться, как и эмульсификаторы, содержащие один или несколько полигидроксилированных единиц, таких как глицерин, сорбит или какой-либо другой альдитол. Эмульсификатор должен также содержать гидрофобный остаток, например, алкильную, алкенильную или аралкильную группу, как правило, содержащую примерно от 8 до 50 атомов углерода, а в особенности от 10 до 30 атомов углерода. Гидрофобный остаток может быть либо линейным, либо разветвленным и часто является насыщенным, хотя он может быть ненасыщенным, и необязательно является фторированным. Гидрофобный остаток может содержать смесь с различными длинами цепей, например цепей, полученных из таллового масла, свиного топленого сала, пальмового масла, подсолнечного масла или соевого масла. Примеры пригодных для использования эмульсификаторов с высокими значениями HLB включают C₁₆-C₁₈ спирты, этоксилированные 10-25 этиленоксидными остатками, и стеарат или дистеарат PEG-15-25. Другие пригодные для использования примеры включают моно-, ди- или триглицериды C₁₀-C₂₀ жирных кислот. Дополнительные примеры включают простые эфиры C₁₈-C₂₂ жирных спиртов и полиэтиленоксидов с 8-12 единицами EO.

Эмульсификаторы с низкими значениями HLB, как правило, со значениями HLB от 2 до 6, включают сложные моно- или, возможно, ди-эфиры жирных кислот и многоатомных спиртов, таких как глицерин, сорбит, эритрит или триметилпропан. Жирный ациловый остаток часто представляет собой C₁₄-C₂₂ и является насыщенным во многих случаях, включая цетил, стеарил, арахидил и бегенил. Примеры включают моноглицериды пальмитиновой или стеариновой кислоты, сложные сорбитоловые моно- или ди-эфиры миристиновой, пальмитиновой или стеариновой кислоты и сложные триметилпропановые моноэфиры стеариновой кислоты.

Эмульсификаторы, которые являются производными силикона, под которыми подразумеваются эмульсификаторы, которые имеют липофильную силиконовую цепь, являются особенно предпочтительными, в особенности когда непрерывная фаза композиции содержит силиконовое масло. Примеры таких эмульсификаторов включают полиоксиалкиленовые производные диметилполисилоксанов, в частности производные POE, POP или сополимеры POE-POP. Такие производные могут заканчиваться C₁-C₁₂ алкильными группами. Такие эмульсификаторы также могут называться диметиконсополиолсиликоновыми поверхностно-активными веществами, например цетилдиметиконсополиолом.

Пригодные для использования эмульсификаторы и соэмульсификаторы являются широко доступными под множеством торговых наименований, включая AbilTM, ArlancelTM,

Brij™, Cremophor™, Dehydrol™, Dehymuls™, Emerest™, Lameform™, Pluronic™, Prisorine™, Quest PGPН™, Span™, Tween™, SF1228, DC3225C и Q2-5200.

Другие компоненты

Другие компоненты могут необязательно включаться в композиции по настоящему изобретению.

Структурирующие вещества и эмульсификаторы являются в высшей степени желательными в определенных формах продукта. Структурирующие вещества, когда они используются, предпочтительно присутствуют в количестве от 1 до 30% от массы композиции, в то время как эмульсификаторы предпочтительно присутствуют в количестве от 0,1 до 10% от массы композиции. В композициях для нанесения с помощью шарика, такие материалы помогают контролировать скорость, с которой продукт распределяется с помощью вращающегося шарика. В композициях для палочек, такие материалы могут формировать гели или твердые продукты из растворов или суспензий. Пригодные для использования структурирующие вещества в таких композициях включают целлюлозные загустители, такие как гидроксипропилцеллюлоза и гидроксипропилцеллюлоза, волокнообразующие структурирующие вещества, такие как 12-гидроксистеариновая кислота, сложные эфиры 12-гидроксистеариновой кислоты, амиды 12-гидроксистеариновой кислоты, стеариновую кислоту, бегеновую кислоту и их ди- и триглицериды, дибутиламид N-лаурилглутаминовой кислоты, 2-додецил-N,N'-дибутилсукцинамид и дибензилиденсорбит. Частично или полностью этерифицированные дисахариды, например октаноаты целлобиозы, также могут использоваться, как и структурирующие вещества, подобные декстринпальмитату или сложному алифатическому эфиру, имеющему C₁₂-C₃₀ группу жирного ацила и C₁₂-C₂₄ остаток жирного спирта, подобно бегенату цетеарила. Стероиды (например, β-ситостерол) и сложные стероловые эфиры (например, оризанол) также являются пригодными для использования, когда используются в сочетании. Спреи, получаемые распылением эмульсии, препараты для нанесения с помощью шарика, кремы и гелевые композиции могут формироваться с использованием ряда масел, восков и эмульсификаторов. Пригодные для использования эмульсификаторы включают стеарет-2, стеарет-20, стеарет-21, цетеарет-20, глицерилстеарат, цетиловый спирт, цетеариловый спирт, стеарат PEG-20 и диметиконсополиол. Аэрозоли, получаемые из суспензий, материалы, наносимые с помощью шариков, палочки и кремы требуют структурирующих веществ для замедления седиментации (в жидких композициях) и для получения желаемой консистенции продукта, в нежидких композициях. Пригодные для использования структурирующие вещества включают стеарат натрия, стеариловый спирт, цетиловый спирт, гидрированное касторовое масло, пчелиный воск, синтетические воски, микрокристаллический воск, парафиновые воски, воск канделиллы, дибутиллаурилглутамид, алкилсиликоновые воски, кватерний-18 бентонит, кватерний-18 гекторит, окись кремния и пропиленкарбонат. Некоторые из указанных выше материалов функционируют также в качестве суспендирующих агентов в определенных композициях.

Летучий пропеллент представляет собой дополнительный компонент, используемый в большинстве аэрозольных композиций. Летучие пропелленты могут использоваться при содержании от 95 до 30 мас.%, предпочтительно от 90 до 40 мас.%. Настоящее изобретение также пригодно для использования в аэрозольных композициях с низкими концентрациями VOC (летучих органических соединений), содержащих пропеллент от 30 до 50 мас.% или 55 мас.%. Пригодные для использования пропелленты включают сжиженные углеводороды или газообразные галогенированные углеводороды (в частности, фторированные углеводороды, такие как 1,1-дифторэтан и/или 1-трифтор-2-фторэтан), которые имеют температуру кипения ниже 10°C, в особенности такие, которые имеют температуру кипения ниже 0°C. Особенно предпочтительным является использование сжиженных газообразных углеводородов, в особенности C₃-C₆ углеводородов, включая пропан, изобутан, бутан, изобутан, пентан и изопентан, и смесей двух или более из них.

Другие пропелленты, которые могут использоваться, включают простые алкиловые эфиры, такие как простой диметиловый эфир или сжатые нереакционноспособные газы,

такие как воздух, азот или двуокись углерода.

Определенные сенсорные модификаторы представляют собой дополнительные желательные компоненты в композициях по настоящему изобретению. Такие материалы предпочтительно используются при содержании до 20% от массы композиции.

5 Мягчительные средства, увлажнители, летучие масла, нелетучие масла и материалы из твердых частиц, которые могут придавать смазываемость, все представляют собой пригодные для использования классы сенсорных модификаторов. Примеры таких материалов включают циклометикон, диметикон, диметиконол, изопропилмирилат, изопропилпальмитат, тальк, мелкодисперсную окись кремния (например, Aerosil 200),
10 полиэтилен в виде частиц (например, Acumist B18), полисахариды, кукурузный крахмал, бензоат C₁₂-C₁₅ спирта, простой миристиловый эфир PPG-3, октилдодеканол, C₇-C₁₄ изопарафины, диизопропиладипат, изосорбид лаурат, простой бутиловый эфир PPG-14, глицерин, гидрированный полиизобутен, полидецен, диоксид титана, фенилтриметикон, диоктиладипат и гексаметилдисилоксан.

15 Ароматизаторы также являются желательными дополнительными компонентами в композициях по настоящему изобретению. Пригодные для использования материалы включают обычные парфюмерные средства, такие как парфюмерные масла, а также включают так называемые дезодорирующие парфюмерные средства, как описано в Европейском патенте EP 545556 и в других публикациях. Уровни включения
20 предпочтительно составляют до 4 мас.%, в частности от 0,1 до 2 мас.%, а в особенности от 0,7 до 1,7 мас.%.

Необходимо отметить, что определенные компоненты композиций осуществляют более чем одну функцию. Такие компоненты являются особенно предпочтительными дополнительными ингредиентами, их использование часто экономит как деньги, так место
25 в препарате.

Другие дополнительные компоненты, которые также могут включаться, представляют собой красители, обычные антимикробные средства и консерванты, например C₁-C₃ алкилпарабены.

Форма продукта

30 Композиция антиперспиранта по настоящему изобретению может принимать любую из форм, известных в данной области. Композиция может принимать форму палочки, геля, крема, композиции, наносимой с помощью шарика, нажимного спрэя, спрэя с насосом или аэрозоля. Композиции в виде геля и крема получили коллективное имя "мягких твердых"
35 композиций, в то время как композиции, наносимые с помощью шарика, композиции нажимных спрэев, спрэев с насосом и аэрозольных композиций коллективно именуется "жидкими" композициями. Каждая форма продукта содержит свой собственный выбор дополнительных компонентов, некоторые из них главные, а некоторые - необязательные. Типы компонентов, типичных для каждой из указанных выше форм продуктов, могут включаться в соответствующие композиции по настоящему изобретению.

Способ изготовления

40 Способ изготовления композиций антиперспирантов в соответствии с настоящим изобретением включает эмульсификацию водного раствора соли антиперспиранта в масляной непрерывной фазе, с последующим смешиванием эмульсии, сформированной таким образом, с отдельной фазой, содержащей полимер, содержащий группы кислот
45 Бренстеда. Как правило, отдельная фаза, содержащая полимер, содержащий группы кислот Бренстеда, добавляется в виде дисперсии полимера в масляную непрерывную фазу. Диспергированный полимер может находиться в форме твердых частиц или в виде эмульсифицированных капель водного раствора. Предпочтительно, масляная непрерывная фаза дисперсии полимера содержит одно или несколько масел, общих с непрерывной
50 фазой эмульсии соли антиперспиранта, к которой она добавляется.

Двойные эмульсии по настоящему изобретению изготавливаются путем приготовления независимых эмульсий полимерного раствора и раствора соли антиперспиранта, а затем смешивания их обеих. Эмульсия раствора соли антиперспиранта предпочтительно

подвергается перемешиванию при высоком сдвиговом усилии, как правило, включающем сдвиговое перемешивание при более чем 4000 об/мин, перед смешиванием с фазой полимера. Это может приводить к преимуществам в стабильности. После формирования, композиция двойной эмульсии может использоваться в виде жидкой или мягкой твердой композиции, или, в присутствии соответствующего структурирующего вещества, она может охлаждаться с получением композиции для палочки. Для аэрозольных композиций, предпочтительная процедура производства включает добавление летучего пропеллента после формирования двойной эмульсии.

ПРИМЕРЫ

Настоящее изобретение дополнительно описывается посредством следующих далее неограничивающих примеров.

Аэрозольная композиция эмульсии с твердым полимером				Таблица 1	
Ингредиенты продукта			Содержание (мас.%)		
Торговое наименование	Химическое наименование		Пример 1	Пример 2	
Эмульсификатор Abil EM 90	Цетилдиметикон сополиол		0,12	0,12	
DC245	Циклометикон		2,78	2,78	
Eutanol G	Октилдодеканол		0,50	0,50	
Aloxicoll L	АСН (50% раствор)		10,00	20,00	
DC1501	D5 циклопентасилоксан и диметиконол		1,00	1,00	
Gantrez AN-119 ¹	Поли(простой метилвиниловый эфир-со-малеиновый ангидрид)		1,00	1,50	
Вода	Дистиллированная вода		10,00	-	
Пропеллент CAP 40	Бутан, изобутан, пропан		74,60	74,10	

1. Используемый Gantrez AN-119 является частично гидролизованным, имеет массовое отношение ди-кислоты к ангидриду, равное приблизительно 1:2, и содержание групп кислот Бренстеда, равное 3,7 ммоль/г.

Примеры 1 и 2 приготавливаются следующим образом. Сначала компоненты масляной фазы перемешивают вместе при комнатной температуре. Затем Aloxicoll L (50% водный раствор АСН) и вода медленно добавляются при увеличении величины сдвига. К эмульсии в/м, сформированной таким образом, добавляют полимер Gantrez AN-119 в виде порошка, при минимальном сдвиге. Наконец, полученную композицию основы переносят в алюминиевую емкость, и сжиженный пропеллент добавляется с использованием стандартных технологий.

Композиции двойной эмульсии для аэрозолей					Таблица 2	
		Содержание (мас.%)				
Торговое наименование	Эмульсия полимера	Эмульсия АСН	Пример 3	Пример 4		
Abil EM 90	0,5	0,5	0,1	0,2		
DC245	10,0	10,0	2,08	4,16		
Жидкий AP ¹	5,0	5,0	1,04	2,08		
Парфюмерное средство	2,4	2,4	0,6	1,2		
Eutanol G	2,0	2,0	0,42	0,84		
Aloxicoll L (50% АСН)	-	80,0	10,0	20,0		
Gantrez S-95 ²	12	-	1,0	2,0		
Вода	68,1	0,1	5,67	11,34		
Пропеллент CAP 40	-	-	79,09	58,18		

1. Простой бутиловый эфир PPG-14
 2. Поли(простой метилвиниловый эфир-со-малеиновая кислота)

Композицию двойной эмульсии для аэрозоля примеров 3 и 4 приготавливают следующим образом. Сначала эмульсия AP из таблицы 2 формируется способом, аналогичным тому, который используется при приготовлении эмульсии AP примеров 1 и 2. Независимо, эмульсия полимера из таблицы 2 также формируется обычным способом, без

использования высоких сдвиговых усилий. Затем смешиваются необходимые количества двух эмульсий, с получением двойной эмульсии, требуемое количество этой основы переносят в алюминиевые емкости и добавляют сжиженный пропеллент с использованием стандартных технологий.

- 5 Клиническая оценка рабочих характеристик антиперспирантов примеров 1 и 3 демонстрирует 39 и 41% уменьшение потоотделения соответственно по сравнению с 29% уменьшением потоотделения для сходной композиции эмульсии для аэрозоля, также содержащей 10% Aloxicoll L (то есть 5% АСН), но без добавленной фазы полимера. Примеры 2 и 4 демонстрируют 45 и 51% уменьшение потоотделения соответственно, по сравнению с 43% уменьшением потоотделения, для сходной композиции эмульсии для аэрозоля, также содержащей 20% Aloxicoll L (то есть 10% АСН), но без добавленной фазы полимера.

Ингредиент	Количество		
	Эмульсия полимера	Эмульсия АСН	Пример 5
Abil EM 90	0,5	0,5	0,1
Finsolv TN ¹	-	10,0	1,25
DC245	10,0	-	0,83
Жидкий АП	5,0	5,0	1,04
Eutanol G	2,0	2,0	0,42
Aloxicoll L (50% АСН)	-	80,0	10,0
Gantrez S-95	12,0	-	1,0
Вода	70,5	2,5	6,2
САР 40	-	-	До 100

25 1. C₁₂-C₁₅ алкилбензоат

Пример 5 приготавливают способом, аналогичным примерам 3 и 4; главное отличие заключается в использовании Finsolv TN, в качестве непрерывной фазы эмульсии АСН, и в производстве, в результате, двойной эмульсии, имеющей непрерывную фазу, содержащую как силиконовое масло, так и сложноэфирное масло.

Ингредиент	Содержание (мас.%)		
	Эмульсия полимера	Эмульсия АСН	Пример 6
Silkflo 364NF ¹	10,3	10,3	10,3
Abil EM 90	1,0	1,0	1,0
Aloxicoll L (50% АСН)	-	64,4	41,0
Gantrez S-95	11,6	-	4,1
Глицерин	2,1	2,1	2,1
Вода	До 100	До 100	До 100

40 1. Полидецен

Пример 6 производят посредством независимого приготовления эмульсии полимера и эмульсии АП, способом, аналогичным тому, который используется для примеров 3 и 4, с последующим смешиванием соответствующих количеств и выливания в упаковку для распределения мягкого твердого продукта.

Ингредиент	Содержание (мас.%)		
	Эмульсия полимера	Эмульсия АСН	Пример 7
Kester Вокс K62 ¹	12,7	12,7	12,7
DC245	12,8	12,8	12,8
Finsolv TN	8,5	8,5	8,5
Abil EM 90	0,5	0,5	0,5
Aloxicoll L (50% АСН)	-	62,5	40,0

Gantrez S-95	11,25	-	4,05
Acumist B18 ²	2,0	2,0	2,0
Парфюмерное средство	1,0	1,0	1,0
Вода	51,25	-	18,45
1. Цетеарилбегенат 2. Микронизированный полиэтилен			

5

Пример 7 производят посредством независимого приготовления эмульсии полимера и эмульсии АП, обеих, при 85°С, при добавлении водной фазы, сопровождающемся увеличением усилия сдвига, прикладываемого к формируемой эмульсии. После охлаждения до 75°С, необходимые количества смешиваются и выливаются в форму для палочек. Охлаждение и отверждение дают конечный продукт.

10

Таблица 6			
Композиция двойной эмульсии для нанесения с помощью шарика			
Ингредиент	Содержание (мас.%)		
	Эмульсия полимера	Эмульсия АСН	Пример 8
Abil EM 90	0,7	0,7	0,5
DC245	10,0	12,3	34,4
Жидкий АП	5,0	5,0	3,7
Eutanol G	2,0	2,0	1,5
Aloxicoll L (50% АСН)	-	80,0	44,0
Gantrez S-95	12,0	-	2,2
Парфюмерное средство	-	2,3	1,3
Вода	68,0	-	12,5

15

20

Пример 8 производят посредством независимого приготовления эмульсии полимера и эмульсии АП, способом, аналогичным примерам 3 и 4, с последующим смешиванием этих эмульсий с дополнительным DC245 в требуемых количествах (эмульсия полимера: эмульсия АСН: DC245 = 18,3:55:26,7).

25

Формула изобретения

30

1. Композиция эмульсии в/м для антиперспиранта, содержащая от 0,5 до 60 мас.% растворенных стягивающих солей антиперспиранта, выбранных из солей алюминия, циркония и смешанных солей алюминия-циркония, от 0,1 до 5 мас.% эмульгатора и, в отдельной фазе, от 0,1 до 10 мас.% полимера, содержащего группы кислот Бренстеда.

35

2. Композиция антиперспиранта по п.1, в которой полимер, содержащий группы кислот Бренстеда, суспендируется в виде твердого продукта в масляной непрерывной фазе.

3. Композиция антиперспиранта по п.1, содержащая водный раствор полимера, содержащего группы кислот Бренстеда, эмульгированного в виде отдельной дисперсной фазы.

40

4. Композиция антиперспиранта по любому из предыдущих пунктов, содержащая силиконовое масло.

5. Композиция антиперспиранта по п.1, где эмульгатором является производное силикона.

6. Композиция антиперспиранта по п.1 или 5, где эмульгатор присутствует в количестве от 0,4 до 0,6 мас.%.

45

7. Композиция антиперспиранта по п.2, в которой содержание групп кислот Бренстеда в полимере меньше, чем 4 ммоль/г.

8. Композиция антиперспиранта по п.1, где содержание водной дисперсной фазы (фаз) в общей композиции равно от 50 до 90 мас.%, исключая любой летучий пропеллент, который может присутствовать.

50

9. Способ уменьшения потоотделения, включающий нанесение на тело человека композиции эмульсии в/м, содержащей растворенную соль антиперспиранта и эмульгатор, и совместное нанесение из отдельной фазы полимера, содержащего группы кислот Бренстеда.