



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 356 376**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/26** (2006.01)

**A61K 8/28** (2006.01)

**A61K 8/37** (2006.01)

**A61Q 15/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05796429 .8**

96 Fecha de presentación : **21.10.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1814505**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **08.08.2007**

54 Título: **Procedimiento cosmético para las axilas.**

30 Prioridad: **26.11.2004 GB 0425945**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**07.04.2011**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**07.04.2011**

73 Titular/es: **UNILEVER plc.**  
**Unilever House 100 Victoria Embankment**  
**London EC4Y 0DY, GB**  
**UNILEVER N.V.**

72 Inventor/es: **James, Alexander, Gordon;**  
**Marti, Vernon Peter J.;**  
**Paterson, Sarah E.;**  
**Pople, Jennifer, Elizabeth y**  
**Turner, Graham Andrew**

74 Agente: **Carpintero López, Mario**

**ES 2 356 376 T3**

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

## DESCRIPCIÓN

La presente invención se refiere a un procedimiento cosmético y, más particularmente, a un procedimiento para inhibir o controlar simultáneamente el sudor y/o mal olor de las axilas, y mejorar o controlar el oscurecimiento de la piel, y composiciones para ello.

### 5 Antecedentes

Para ayudar a regular su temperatura corporal, los seres humanos transpiran, dando como resultado sudor que permanece sobre la piel hasta que se evapora. La extensión en la que ocurre esto depende de la densidad de las glándulas sudoríparas, siendo el sobaco (axila) un área del cuerpo donde ocurre una concentración especialmente alta. El sudor recién transpirado sobre la piel es comparativamente inodoro, aunque la población bacteriana de la piel puede convertirlo en compuestos malolientes, dando como resultado el problema de olor corporal que a muchas sociedades no les gusta o incluso aborrecen. Adicionalmente, a algunas sociedades no les gusta la presencia de manchas húmedas debidas al sudor. Por consiguiente, se ha desarrollado una industria global para controlar o inhibir la transpiración en regiones limitadas del cuerpo, tal como en la axila, u otras regiones localizadas tales como las plantas de los pies que, habitualmente, aunque no siempre, están cubiertas con ropa o calzado, y donde las poblaciones bacterianas pueden desarrollarse en un sudor rico en nutrientes.

Probablemente, la clase de agentes empleados más ampliamente para controlar la transpiración comprende sales astringentes y, especialmente, sales astringentes de aluminio y/o zirconio. Estos agentes actúan como un desodorante bactericida, controlando de esta manera el número de bacterias, y cuando se han bloqueado suficientes glándulas sudoríparas, actúan como un antitranspirante localizado eficaz.

Las composiciones que contienen las sales astringentes, mencionadas anteriormente, han encontrado un considerable favor del público para controlar el olor y/o la transpiración, aunque se ha identificado un problema adicional. Algunas personas presentan una propensión a que su piel se enrojezca u oscurezca después de la aplicación de dichas composiciones. El enrojecimiento u oscurecimiento, por sí mismo, puede considerarse indeseable, porque éste es un efecto localizado y, por consiguiente, tiene un aspecto diferente de la piel que lo rodea. Por consiguiente, los usuarios que sufren de coloración de la piel localizada se enfrentan a un dilema. ¿Deben emplear su antitranspirante y controlar la transpiración localmente, pero sufrir un oscurecimiento localizado y visible, o deben evitar el uso de un antitranspirante y sufrir manchas de humedad y el riesgo de ofender a sus compatriotas debido a los males olores de su cuerpo? Sin embargo, dichas personas pueden enfrentarse al futuro y a sus compatriotas con nueva confianza, porque su problema se está abordando.

Cada uno de los documentos WO-A-02/102337, EP-A-1428521 y US-A-6086887, desvela una o más composiciones que contienen una sal antitranspirante astringente y un aceite natural, que comprende un triglicérido de ácido carboxílico insaturado C18. Sin embargo, ninguno contempla composiciones tales que inhiban el oscurecimiento de la piel, que surge de la aplicación en la piel de la axila de una composición antitranspirante.

Aunque el documento EP-A-691125 desvela composiciones que contienen tanto ácido alcano  $\alpha$ - $\omega$  dicarboxílico y, entre otros, un éster de ácido monocarboxílico de triglicérido, no contempla la inhibición del oscurecimiento de la piel que surge de la aplicación a la piel de la axila de una composición antitranspirante.

Un objeto de la presente invención es proporcionar un procedimiento cosmético que emplee simultáneamente una cantidad antitranspirante o desodorante eficaz de una sal astringente de aluminio y/o zirconio, y que mejore o supere el oscurecimiento de la piel o que potencie el aclaramiento de la piel.

### 40 Breve resumen de la presente invención

De acuerdo con un aspecto de la presente invención, se proporciona un procedimiento cosmético para inhibir el oscurecimiento de la piel, de acuerdo con la reivindicación 1.

En el presente documento, el término procedimiento cosmético se emplea de la manera convencional, es decir, indica que el procedimiento no es terapéutico.

Los porcentajes de la composición del presente documento están en peso, basados en el residuo de la composición después de que el peso de cualquier propulsor sea ha excluido, a menos que se indique de otra manera.

Aplicando por vía tópica una combinación de constituyentes de acuerdo con la reivindicación 1 a la piel, a regiones del cuerpo tales como la axila, donde hay un alta densidad de glándulas sudoríparas y/o una región ocluida donde las bacterias podrían desarrollarse, de lo contrario, si no se somete a un control aplicado externamente, es posible conseguir el objetivo de inhibir la producción de sudor localmente, al mismo tiempo que se inhibe o se evita que

la piel se oscurezca, lo que puede surgir cuando una composición antitranspirante correspondiente se aplica por vía tópica.

5 Sin quedar ligado a teoría particular alguna como el mecanismo mediante el cual se consigue dicho resultado beneficioso, se cree que la selección del sistema de inhibición del oscurecimiento descrito en el presente documento, en concreto el aceite de triglicérido, opcionalmente junto con un ácido carboxílico activo cooperante, en una concentración relativa adecuada respecto a la sal astringente antitranspirante para inhibir el oscurecimiento de la piel, o para ayudar a o promover el aclaramiento del color de la piel respecto al que surge del contacto tópico con una composición antitranspirante, posiblemente contrarrestando el oscurecimiento de la piel que se induce por uno o más constituyentes distintos de la composición antitranspirante y, en particular, la sal antitranspirante.

10 El aceite de triglicérido es capaz de hidrolizarse in situ y, de esta manera, de actuar como un depósito de actividad durante un periodo prolongado, como es deseable para un material que se deja puesto (el antitranspirante), que permanece sobre la piel hasta que la persona lava de nuevo la región en la que se ha aplicado el antitranspirante. Esto es a menudo al menos 4 horas y puede ser, concebiblemente, de 8 a 24 horas. Por consiguiente, un material que se hidroliza lentamente in situ ofrece un beneficio potencial. Un enfoque alternativo que en teoría podría contemplarse  
15 comprende emplear una cantidad similar de los ácidos que son hidrolizables a partir de los glicéridos. Aunque podría esperarse que dichos ácidos controlaran la irritación, la aplicación de choque de dicha concentración puede inducir oscurecimiento. De esta manera, las propuestas para controlar la irritación no muestran, inevitablemente, el control del oscurecimiento de la piel.

20 Debe entenderse que diversas formulaciones de antitranspirantes desveladas en las memorias descriptivas de patente (solicitudes) publicadas anteriormente han contemplado la incorporación de uno o más aceites de triglicérido, por ejemplo un aceite de emoliente natural. El documento WO-A-02/102337 desvelaba composiciones antitranspirantes que podían contener aceites de triglicérido, como precursores para la generación in situ, por hidrólisis, de activadores de PPAR, actuando de esta manera como anti-irritantes sobre la piel, aunque los ejemplos explícitos especificaban los propios activadores de PPAR, no los precursores. El documento EP-A-1428521 desvelaba composiciones  
25 antitranspirantes que contenían un aceite de triglicérido y glicerol dentro de proporciones en peso especificadas, reconociendo el beneficio de dicha combinación para compartir el daño a la piel provocado por el afeitado. El documento US 60806887 desvela composiciones antitranspirantes que contienen aceite de borraja. Los documentos US 5871717 y US 6231842 contemplan el uso de ceras de triglicérido para composiciones antitranspirantes en gel. Sin embargo, ninguna de las divulgaciones de las memorias descriptivas mencionadas anteriormente han enseñado que si se emplea en una proporción apropiada respecto al principio activo antitranspirante, el oscurecimiento de la piel, y en particular el oscurecimiento de la piel de la axila puede inhibirse por incorporación del aceite de triglicérido en una base de composición antitranspirante. El documento WO 99/47110 y los documentos US 602296, US 6042841 y US 6365175 correspondientes contemplan la incorporación de aceite petroselinico, o aceites que lo contienen, en  
30 composiciones de tratamiento de la piel, aunque dichas composiciones no contienen un principio activo antitranspirante astringente y, por consiguiente, no proporcionan una enseñanza en relación con composiciones antitranspirantes o mejora de los efectos secundarios que pueden surgir del uso de composiciones antitranspirantes.

#### Descripción Detallada de la Invención, Incluyendo las Realizaciones Preferidas.

40 El procedimiento de la invención empleado en el presente documento aplica, por vía tópica, una composición que contiene al menos dos constituyentes esenciales más un tercer constituyente opcional, que actúa con respecto al control de la generación de sudor/olor, y el color de la piel a la que se aplica la composición.

45 La sal astringente, desodorante o antitranspirante, se incorpora preferentemente en una cantidad del 0,5-60% de la composición, excluyendo el peso de cualquier propulsor, seleccionándose la concentración real presente normalmente en relación al aplicador particular a emplear y, si la capacidad desodorante en solitario es aceptable, o si se necesita también capacidad antitranspirante. Para aplicación desde aplicadores de contacto, la concentración de la sal astringente a menudo es de al menos el 1%, y especialmente adecuadamente es de al menos el 5% de la composición (que en la práctica, para aplicadores de contacto, no contiene propulsor), y es deseablemente menor del 30%. En algunas composiciones, una concentración preferida de la sal astringente es del 10 al 26%. Para aplicadores sin contacto, alguna composición no contiene un propulsor y, en dichas composiciones, la concentración de dicha sal astringente a menudo se selecciona en el intervalo de 5 al 20%. Para composiciones que contienen un propulsor, este  
50 último constituye del 35 al 90% de toda la composición, es decir, el propulsor más el residuo (composición de base), y en dichas composiciones de aerosol la proporción de sal astringente en la composición de base a menudo es del 10 al 50%, y en muchos casos del 30 al 50%.

55 Los principios activos antitranspirantes para su uso en el presente documento se seleccionan entre sales de aluminio, zirconio y mixtas de aluminio/zirconio, incluyendo tanto sales inorgánicas como sales con aniones orgánicos y complejos. Las sales astringentes particularmente preferidas son sales hidrolizadas y, especialmente, sales clorhidrato

opcionalmente activadas. Para composiciones de aerosol, el principio activo antitranspirante preferentemente está libre de zirconio.

5 Los halohidratos de aluminio, normalmente, se definen mediante la fórmula general  $Al_2(OH)_xQ_y \cdot wH_2O$ , en la que Q representa cloro, bromo o yodo, x es variable de 2 a 5 y  $x + y = 6$ , mientras que  $wH_2O$  representa una cantidad variable de hidratación. Las sales de halohidrato de aluminio especialmente eficaces, conocidas como clorhidratos de aluminio activados, se describen en el documento EP-A-6739 (Unilever NV et al), incorporándose los contenidos de dicha memoria descriptiva al presente documento por referencia.

10 Las sales astringentes de zirconio para emplear en el presente documento normalmente pueden representarse por la fórmula general empírica:  $ZrO(OH)_{2n-nz}B_z \cdot wH_2O$ , en la que z es una variable en el intervalo de 0,9 a 2,0, de manera que el valor  $2n-nz$  es cero o positivo, n es la valencia de B, y B se selecciona entre el grupo que consiste en cloruro, otro haluro, sulfamato, sulfato y mezclas de los mismos. La posible hidratación en un grado variable se representa por  $wH_2O$ . Preferentemente, B representa cloruro. Preferentemente, la variable z está en el intervalo de 1,5 a 1,87. En la práctica, dichas sales de zirconio habitualmente no se emplean por sí mismas, sino como un componente de un antitranspirante basado en aluminio y zirconio combinados.

15 Las sales de aluminio y zirconio anteriores pueden tener agua coordinada y/o unida en diversas cantidades, y/o pueden estar presentes como especies poliméricas, mezclas o complejos. En particular, las sales hidroxí de zirconio a menudo representan un intervalo de sales que tienen diversas cantidades del grupo hidroxí. El clorhidrato de zirconio y aluminio puede preferirse particularmente.

20 Pueden emplearse complejos antitranspirantes basados en las sales de aluminio y/o zirconio astringentes mencionadas anteriormente. El complejo a menudo emplea un compuesto con un grupo carboxilato y, ventajosamente, este es un aminoácido. Los ejemplos de aminoácidos adecuados incluyen dl-triptófano, dl-β-fenilalanina, dl-valina, dl-metionina y β-alanina, y preferentemente glicina, que tiene la fórmula  $CH_2(NH_2)COOH$ . Algunos de estos complejos Al/Zr se denominan habitualmente ZAG en la bibliografía. Los principios activos ZAG generalmente contienen aluminio, zirconio y cloruro, con una proporción Al/Zr en el intervalo de 2 a 10, especialmente de 2 a 6, una proporción Al/Cl de 2,1 a 0,9 y una cantidad variable de glicina. Los principios activos de este tipo preferido están disponibles en Westwood, de Summit y de Reheis. Como alternativa, el complejo puede preformarse con un alcohol alifático polihídrico, tal como propilenglicol o glicerol. Un complejo con un clorhidrato se denomina, habitualmente, clorhidrex.

30 Pueden emplearse mezclas de dos o más sales astringentes, aunque sin embargo, se prefiere particularmente emplear sales astringentes que están libres de zirconio, tales como clorhidratos de aluminio, y los denominados clorhidratos de aluminio activados.

La proporción de sal antitranspirante sólida en una composición en suspensión, normalmente, incluye el peso de cualquier agua de hidratación y cualquier agente complejante que pueda estar presente también en el principio activo sólido. Sin embargo, cuando la sal activa se incorpora en una solución, en un disolvente hidrófilo tal como glicol, su peso normalmente excluye cualquier agua presente.

35 Si la composición está en forma de una emulsión, el principio activo antitranspirante se disolverá en la fase hidrófila, que normalmente comprende agua por sí misma, opcionalmente junto con uno o más líquidos miscibles en agua. La fase hidrófila a menudo comprende una fase dispersa, aunque en algunos casos puede constituir, como alternativa, la fase continua. En las emulsiones, el principio activo antitranspirante a menudo proporcionará del 3 al 60% en peso de la fase hidrófila, particularmente del 10% al 20% hasta el 55% o 60% de esa fase.

40 Como alternativa, la composición puede tomar la forma de una suspensión, en la que el principio activo antitranspirante en forma de partículas está suspendido en un vehículo líquido inmiscible en agua. Dicha composición probablemente no tendrá ninguna fase acuosa diferente presente y, convenientemente, puede denominarse "sustancialmente anhidra", aunque debería entenderse que algo de agua puede estar presente unida al principio activo antitranspirante, o como una pequeña cantidad de soluto dentro de la fase líquida inmiscible en agua. En dichas composiciones, el tamaño de partícula de las sales antitranspirantes a menudo está dentro del intervalo de 0,1 a 200 μm, con un tamaño de partícula medio a menudo de 1 a 20 μm.

45 El principio activo antitranspirante puede estar presente en forma de esferas huecas o partículas densas (por lo que se entienden partículas que no son huecas) o una mezcla de ambas, a discreción del fabricante.

#### Sistema de inhibición del oscurecimiento de la piel

50 En el presente documento, el sistema de inhibición del oscurecimiento de la piel para su uso en el procedimiento cosmético, comprende un aceite de triglicérido, opcionalmente junto con un ácido carboxílico activo. El aceite de triglicérido es normalmente un aceite extraído de plantas, a menudo un derivado de ácidos carboxílicos  $C_{18}$ ,

5 normalmente lineales, aunque puede producirse sintéticamente. Dichos aceites son ésteres de glicerilo, especialmente adecuados de uno o más ácidos grasos C<sub>18</sub> insaturados. Los restos ácido graso de los aceites pueden comprender, habitualmente, de uno a tres enlaces insaturados olefínicos y, a menudo, uno o dos. Aunque en muchos casos los enlaces olefínicos adoptan la configuración trans, en un número de productos deseables el enlace o enlaces adoptan la configuración cis. Si están presentes dos o tres enlaces insaturados olefínicos, éstos pueden estar conjugados. El resto de ácido graso puede estar sustituido con un grupo hidroxilo. Los aceites naturales empleables en el presente documento comprenden, deseablemente, uno o más triglicéridos de ácido oleico, ácido linoleico, ácido linolénico o ácido ricinoleico. Diversos isómeros de dichos ácidos a menudo tienen nombres comunes, incluyendo ácido linolenaláidico, ácido trans-7-octadecenoico, ácido parinárico, ácido pinolénico, ácido punícico, ácido petroselénico y ácido estearidónico. Es especialmente deseable emplear glicéridos derivados de ácido oleico, ácido linoleico, ácido ricinoleico, ácido petroselénico o una mezcla que contiene uno o más de ellos.

15 Los aceites vegetales naturales, que contienen uno o más de dichos triglicéridos, incluyen aceite de semilla de cilantro para derivados de ácido petroselénico, aceite de semilla de alegría, grasa de almendra del árbol del makita o aceite de semilla de blanquillo para derivados de ácido cis-parinárico, aceite de semilla de ricino deshidratada, para derivados de ácidos linoleicos conjugados, aceite de semilla de borraja y aceite de onagra para derivados de ácidos linoleico y linolénico, aceite de aguileña, para ácido columbínico y aceite de girasol o aceite de cártamo, para derivados de ácido oleico, a menudo junto con ácidos linoleicos. Otros aceites adecuados son aceites que pueden obtenerse del cáñamo, que puedan procesarse para obtener derivados de ácido estearadónico y aceite de maíz. Un aceite natural especialmente conveniente, gracias a sus características y disponibilidad, comprende aceite de girasol, que varía de aquellos ricos en glicéridos de ácido oleico a aquellos ricos en glicéridos de ácido linoleico, indicando rico que su contenido es mayor que el del otro ácido nombrado. Otros aceites convenientes incluyen aceite de ricino, que comprende de ésteres de ácido ricinoleico.

20 La proporción de aceite de triglicérido en la composición a menudo se selecciona en el intervalo del 1 al 10% en peso y, especialmente, en el intervalo de al menos el 2% de peso. En las realizaciones en las que el aceite de triglicérido se emplea junto con un ácido activo, por ejemplo del 0,5 al 2%, su concentración normalmente no es mayor del 6% en peso. En un número deseable, el aceite de glicérido, o mezcla de aceites, se emplean en una proporción del 2%, 4% o 6% del peso total de la composición. En otras diversas realizaciones deseables y, especialmente cuando el ácido activo se emplea en una concentración por debajo del 0,5%, el aceite de triglicérido se emplea en una concentración de al menos el 4%, tal como del 6% al 10%.

25 El tercer constituyente de la composición, empleado particularmente deseablemente en el procedimiento cosmético, comprende un ácido activo seleccionado entre

- ai) ácidos dicarboxílicos alifáticos,
- a ii) ácidos carboxílicos C<sub>18</sub> insaturados y a iii) ácidos hidroxibenzoicos.

35 Los ácidos dicarboxílicos alifáticos ai) adecuados son lineales. Deseablemente, los ácidos dicarboxílicos contienen de 6 a 12 átomos de carbono y, particularmente, de 8 a 12. Un ejemplo especialmente adecuado comprende ácido azelaico.

40 Los ácidos carboxílicos C<sub>18</sub> alifáticos insaturados, a ii), es decir, oleofínicamente insaturados (ácidos C<sub>18</sub>, para acortar) a menudo son lineales. Los ácidos C<sub>18</sub> normalmente comprenden de 1 a 4 grupos olefínicos, de los cuales dos o más pueden ser conjugados. Un ejemplo de ácidos C<sub>18</sub> monoinsaturados es, deseablemente ácido petroselénico. Preferentemente, los ácidos C<sub>18</sub> comprenden al menos 2 grupos olefínicos, tales como ácidos linoleicos, ácidos linolénicos y ácidos estearidónicos. El ácido linoleico es, muy deseablemente, un ácido linoleico conjugado, que en ocasiones incluye enlaces tanto cis como trans, tal como el ácido linoleico cis-9-trans-11 conjugado y el ácido linoleico trans-10-cis-12 conjugado, o dos enlaces trans como en el ácido linoleico trans-9-trans-11 conjugado.

45 El ácido hidroxibenzoico, a iii), preferentemente comprende un grupo hidroxilo en relación orto respecto al grupo ácido carboxílico, incluyendo en particular ácido salicílico.

50 El ácido carboxílico activo puede comprender un miembro individual de las clases mencionadas anteriormente o, si se desea, se puede emplear una mezcla de dos o más de ellos tal como, por ejemplo, una mezcla de ácido salicílico con un ácido linoleico, especialmente un ácido linoleico conjugado y/o con un ácido dicarboxílico lineal, o una mezcla de un ácido linoleico con un ácido dicarboxílico lineal. En dichas mezclas, el peso relativo de cada uno de los constituyentes ácidos es de la mitad a dos veces la del otro o cada uno de los otros constituyentes.

En algunas realizaciones, es especialmente beneficioso emplear una mezcla de ácidos activos, por ejemplo usando una combinación de ácido dicarboxílico C<sub>6</sub>-12 (ai) con un ácido insaturado C<sub>18</sub> (a ii) o un ácido hidroxibenzoico

(aiii), o una mezcla de los tres ácidos (ai, aii y aiii). Las proporciones en peso deseables de los ácidos activos son:

ai:aii	2:1 a 1:2
ai:aiii	4:1 a 1:1
ai:aii:aiii	2:1:0,5 a 1:2:1

El % en peso total del ácido activo en la composición, cuando se emplea una mezcla de ácidos activos.

5

La proporción de constituyente ácido activo, o total de los constituyentes ai a aiii, a menudo se seleccionan en el intervalo del 0,25 al 2% de la composición (excluyendo cualquier propulsor) y, preferentemente, se seleccionan del intervalo del 0,5 al 1,5%, tal como del 0,75% al 1,25%. Cuando se expresa en relación con la sal astringente, la proporción en peso a menudo se selecciona en el intervalo de 1:4 a 1:40 de ácido activo:sal astringente, y en un número de realizaciones altamente deseables es de 1:7,5 a 1:25.

10

El aceite de triglicérido convenientemente está presente en una proporción en peso respecto a la sal astringente que tiene en cuenta cualquier ácido carboxílico activo que esté presente adicionalmente. En presencia del 0 al 0,5% de dicho ácido activo y especialmente en formulaciones de contacto, el peso del triglicérido a menudo se elige en el intervalo del 4 al 10% (excluyendo los % en peso de la composición cualquier propulsor). En numerosas otras realizaciones, y especialmente en formulaciones de contacto, el peso del triglicérido a menudo se elige en el intervalo del 2 al 6%, junto con una proporción del 0,5 al 2%, particularmente hasta el 1,5%, por ejemplo del 0,75 al 1,25% del ácido carboxílico activo.

15

La proporción en peso del sistema de inhibición del oscurecimiento de la piel a sal antitranspirante astringente, es decir, la proporción x:y es 1:<4 y, normalmente, es 1:>1, en la que x representa la concentración en peso de dicho aceite de triglicérido más 4 veces la concentración en peso de ácido carboxílico activo, e y representa la concentración en peso de dichas sales astringentes. Preferentemente, la proporción x:y del sistema de inhibición del oscurecimiento a la sal astringente en la composición es 1:≤3 (es decir, y es igual a o menor de 3) y, en muchas realizaciones deseables, es 2:≤5. La proporción x:y normalmente es 4:≥5 y, en muchas realizaciones deseables, es 2:≥3, tal como en la región de 2:5 a 3:5. Por ejemplo, si la sal antitranspirante está presente a una concentración del 24%, y la proporción en peso de ácido activo:aceite de triglicérido es 1:4, la concentración de aceite de triglicérido mínima es del 3%.

20

25

El empleo del sistema de aceite de triglicérido, preferentemente con ácido carboxílico activo, posibilita mitigar el oscurecimiento de la piel para aquellas personas que demuestran una propensión a verse afectadas por ello. Esto se describe convenientemente como una inhibición del oscurecimiento de la piel, pero, por comparación con la piel en ausencia del aceite o sistema de aceite/ácido activo, el usuario puede percibir que su piel es más clara, de manera que esto podría considerarse como un aclaramiento de la piel.

30

Además de los constituyentes anteriores, las composiciones empleadas en la presente invención pueden contener, si se desea, glicerol, por ejemplo una proporción en peso respecto a la sal astringente seleccionada en el intervalo de hasta 1:2, tal como de 1:16 a 2:5. El glicerol puede incorporarse como un constituyente individual de la composición o, como alternativa, al menos en parte, puede estar presente como un aducto de o complejo con la sal astringente, o absorberse en un constituyente en forma de partículas. En numerosas realizaciones deseables, el glicerol está presente a una concentración del 1 al 5% de la composición, y en las mismas u otras realizaciones a una proporción en peso de 2:3 a 1:3 del aceite de triglicérido.

35

La composición puede contener, si se desea, un agente quelante que sea capaz de complejarse con un ión metálico de transición, tal como hierro en forma de partículas. Dichos agentes quelantes son convenientemente ácidos aminopolicarboxílicos, tales como ácido etilendiaminatetracético (EDTA) o ácido pentético (DTPA). El agente quelante está presente convenientemente a una concentración de hasta el 1% de la composición y, en muchos casos, del 0% o 0,025% hasta el 0,25%, tal como del 0,05% a 0,15%.

40

Las composiciones que se aplican por vía tópica de acuerdo con la presente invención pueden estar en forma de sólidos firmes, sólidos blandos, geles, cremas y líquidos, y se dispensan usando aplicadores apropiados para las características físicas de la composición. Las composiciones pueden incluir constituyentes adicionales apropiados para dispensar mediante dichos aplicadores.

45

Las composiciones para su uso en un procedimiento de acuerdo con la presente invención a menudo comprenden un vehículo líquido para la sal antitranspirante o desodorante. Dicho vehículo líquido puede ser hidrófobo, para suspender la sal, o hidrófilo para disolver la sal, o comprender una mezcla de líquidos tanto hidrófilos como hidrófobos, disolviéndose la sal típicamente en el líquido hidrófilo y dispersándose uno de los dos líquidos en el otro para formar una emulsión o una microemulsión. El vehículo líquido o mezcla de vehículos a menudo constituye del 30

al 95% en peso de la composición y, en muchos casos, del 40 al 80%.

5 Los vehículos líquidos hidrófobos habitualmente pueden comprender uno o más materiales que se han seleccionado entre las clases químicas de siloxanos, hidrocarburos, alcoholes alifáticos ramificados, ésteres y éteres que tienen un punto de fusión no mayor de 25°C y un punto de ebullición de al menos 100°C. Se reconocerá que los aceites de triglicérido satisfacen dichos requisitos y, por consiguiente, contribuyen al contenido de vehículo líquido global de la composición.

10 Los siloxanos pueden ser volátiles o no volátiles, indicando volátil una presión de vapor medible a 20 o 25°C. Típicamente, la presión de vapor de una silicona volátil está en el intervalo de 1 Pa a 2 kPa a 25°C. Los siloxanos volátiles, tales como ciclodimeticonas D4-D6 volátiles, o dimeticonas lineales, son especialmente deseables y particularmente las ciclodimeticonas que comprenden D5 (tales como DC345), o mezclas que contienen al menos un 80% de D5 y/o D6.

15 Los aceites de silicona no volátiles útiles en el presente documento normalmente comprenden alquilarilpolisiloxanos lineales que contienen hasta 4 o 5 átomos de silicio en el siloxano, tales como metilfenilsiloxanos, en los que a menudo hay de 0,5 a 1,2 sustituyentes fenilo por sustituyente metilo, como por ejemplo en DC704™, disponible en Dow Corning, Inc. Otras siliconas no volátiles comprenden dimeticonas lineales de peso molecular intermedio y superior, que son líquidas a 20°C, tales como miembros de la serie DC200™ de aceites de silicona que tienen una viscosidad de al menos 1 mPa.s, disponibles en Dow Corning, Inc.

20 Los aceites de hidrocarburo volátiles comprenden aceites de parafina. Los aceites de hidrocarburo no volátiles, que a menudo contienen como media entre 20 y 40 átomos de carbono, incluyen aceite mineral y polideceno hidrogenado.

Los alcoholes grasos líquidos normalmente son alcoholes de cadena ramificada que contienen de 12 a 25 carbonos, y varios de dichos alcoholes deseables contienen de 16 a 20 carbonos, incluyendo alcohol isosteárico y octil-decilaalcohol.

25 Los ésteres de alcohol graso líquidos incluyen ésteres de alcohol graso de ácido naftoico o, especialmente, benzoico. En dichos ésteres, el alcohol graso a menudo es lineal y en muchos casos contiene de 12 a 20 átomos de carbono, tal como C<sub>12</sub>-C<sub>15</sub> o una mezcla de longitudes de cadena. El término comprende también aceites de glicérido.

Los polialquilenglicol éteres líquidos habitualmente comprenden un resto polipropilenglicol poliglicol/polipropilenglicol de 5 a 20 unidades que termina en un éter de alquilo de 2 a 6 carbonos, tal como butilo o t-butilo. Un ejemplo adecuado puede obtenerse en el CTFA INCI, con el nombre aprobado de PPG-14-butil éter.

30 Los líquidos portadores hidrófilos que pueden emplearse en las composiciones del presente documento habitualmente comprenden agua y/o un alcohol mono o polihídrico o un homólogo miscible en agua. Los alcoholes monohídricos a menudo son de cadena corta, por lo que se entiende que contienen hasta 6 carbonos y, en la práctica, son más a menudo etanol o, en ocasiones, isopropanol. Los alcoholes polihídricos habitualmente comprenden etilen o propilenglicol, o puede emplearse un homólogo, tal como dietilenglicol.

35 Hablando en general, hay dos clases de materiales de soporte que se emplean en el presente documento, líquidos hidrófobos, en concreto inmiscibles en agua, que forman una clase y los hidrófilos, tales como agua y alcohol dihidrico, forman una segunda.

40 Tanto los portadores hidrófobos como hidrófilos pueden emplearse en la misma composición, habitualmente en una proporción en peso de 100:1 a 1:100. Para reducir la probabilidad de que los líquidos se separen en capas diferentes, es habitual emplear un emulsionante o mezcla de emulsionantes, alentando de esta manera que una fase se retenga como una dispersión dentro de la otra fase continua. La proporción de emulsionante en las emulsiones antitranspirantes, normalmente se selecciona en el intervalo de 0,1 al 8% en peso, y en muchas realizaciones es del 0,5 al 5%. Los emulsionantes adecuados habitualmente tienen un valor de HLB en la región de 2 a 10 y a menudo en la región de 3 a 8. En una mezcla de emulsionantes, todos pueden tener un valor de HLB en las regiones mencionadas anteriormente, o uno o más pueden tener un valor de HLB mayor, tal como de 10 a 16, con la condición de que el valor de HLB promedio en peso sea hasta 10 o particularmente hasta 8. Las clases de emulsionantes comprenden habitualmente tensioactivos no iónicos, que tienen dicho valor de HLB, incluyendo ésteres o éteres de óxido de polialquileno, tales como óxido de polietileno (POE) y/o ésteres o éteres de óxido de polipropileno (POP) que opcionalmente contienen una unidad glicerilo y/o derivados de éster o éter graso de un grupo polihidroxi alifático o cicloalifático, que contienen de 3 a 6 carbonos, tal como glicerol o sorbitol. El número de unidades POE y/o POP en un emulsionante tensioactivo no iónico normalmente es entre 2 y 100 y, particularmente, en un promedio en peso entre 3 y 25 unidades y, en muchos casos, en un promedio entre 4 y 10.

En muchos tensioactivos no iónicos, deseables como emulsionantes en el presente documento, el componente hidrófobo de los mismos normalmente se proporciona mediante el resto alquilo de un alcohol o ácido graso, que en muchos casos contiene de 12 a 30 carbonos y, en particular, uno o más grupos palmitilo, cetilo estearilo y/o eicosanilo o behenilo. De estos, estearilo y una mezcla de estearilo y cetilo son especialmente favoritos.

5 Otra clase adecuada de emulsionantes, particularmente interesante cuando la formulación comprende una fracción significativa de aceite de silicona, comprende copolímeros de alquil dimeticona, en concreto dimetilpolisiloxanos modificados con polioxialquileno. El grupo polioxialquileno a menudo es un POE o POP o un copolímero de POE o POP. Los copolímeros a menudo terminan en grupos alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>22</sub>, particularmente C<sub>12</sub> a C<sub>18</sub>. Los ejemplos adecuados comprenden copolímeros de cetil dimeticona disponibles como Abil EM90™ o EM97™ de Th.Goldschmidt.

10 Las composiciones que permanecen en forma líquida pueden aplicarse empleando aplicadores convencionales, tales como mediante rodillo o bombeándolas o estrujándolas a través de un orificio de generación de pulverización. Dichas composiciones pueden espesarse, por ejemplo usando uno o más espesantes descritos posteriormente en el presente documento, aunque normalmente su viscosidad, medida a 25°C mediante un viscosímetro Brookfield equipado con una barra rotatoria T a 20 rpm, no es mayor de 1000 mPa.s.

15 La segunda clase puede espesarse mediante materiales solubles o dispersables en agua de mayor viscosidad, incluyendo varios de los emulsionantes, y/o espesarse o gelificarse con polímeros solubles en agua o dispersables en agua, incluyendo poliácridatos, y polímeros naturales solubles o dispersables en agua, tales como polisacáridos solubles en agua o derivados de almidón, tales como alginatos, carragenano, agarosa y polímeros dispersables en agua, incluyendo derivados de celulosa. Una fase acuosa puede espesarse también de acuerdo con la tecnología, usando una dispersión de material en forma de partículas insoluble en agua, tal como arcilla finamente dividida, posiblemente junto con un electrolito o polielectrolito incluyendo un emulsionante soluble en agua.

20 Los alcoholes dihidricos, que opcionalmente contienen uniones éter, tales como aquellos descritos anteriormente, también pueden gelificarse usando dibenciliden alditoles, tales como por ejemplo dibenciliden sorbitol. Los fluidos portadores inmiscibles en agua, tales como aquellos descritos anteriormente en el presente documento, pueden espesarse o estructurarse usando un amplio intervalo de espesantes, y gelificantes solubles en aceite y estructurantes que son conocidos por el productor experimentado. Los espesantes para dichos vehículos líquidos incluyen sustancias inorgánicas en forma de partículas, que en ocasiones se denominan como alternativa agentes de suspensión, particularmente si el uso final de la formulación es en un aerosol, tal como arcillas o sílice finamente dividida. Dichos espesantes son bastante adecuados para aumentar la viscosidad de los líquidos, aunque pueden producir también semisólidos (sólidos blandos), con la condición que se emplee el suficiente espesante.

25 Otros materiales que pueden actuar como espesantes para líquidos inmiscibles en agua, aunque muchos de los cuales pueden actuar también como gelificantes o estructurantes aumentando su concentración en el líquido, pueden comprender polímeros orgánicos que son solubles en el líquido o líquidos portadores, aunque normalmente a una temperatura elevada, por encima de 60°C. Dichos polímeros son particularmente muy adecuados para producir composiciones en forma de sólidos blandos o firmes.

30 Dichos polímeros pueden seleccionarse entre polisacáridos esterificados con un ácido graso, de los cuales un ejemplo excelente comprende palmitato de dextrina: poliamidas como se analiza en el documento US 5500209, tal como el producto disponible con el nombre comercial Versamid 950™, que es derivado de hexametileno diamina y ácido adípico; copolímeros de bloque de alquileno/arileno, por ejemplo estireno y etileno, copolímeros de bloque de propileno y/o butileno, por ejemplo copolímeros de bloque SEBS, muchos de los cuales están disponibles con el nombre comercial Kraton™; galactomanano sustituido con alquilo, tal como N-HANCE™: copolímeros de vinil pirrolidona con polietileno que contienen al menos 25 unidades metileno. La concentración de dichos polímeros en el líquido inmiscible en agua a menudo se selecciona en el intervalo del 1 al 20%, dependiendo de la extensión del espesante o estructuración requerido, y la eficacia del polímero elegido en el líquido/mezcla.

35 Una clase de estructurante que es deseable gracias a su capacidad probada a largo plazo para producir sólidos firmes y, más recientemente, en la preparación de sólidos blandos comprende ceras. En el presente documento, el término cera se emplea para abarcar no solo materiales de origen natural, que son sólidos con una sensación cerosa, e insolubles en agua a 30-40°C, sino que se funden a una temperatura algo más alta, típicamente entre 50 y 95°C, tal como cera de abejas, cera candelilla o cera de carnauba, aunque también materiales que tienen propiedades similares. Dichas otras ceras incluyen ceras de hidrocarburo, por ejemplo ceras de parafina, cera mineral y cera microcristalina; ceras sintéticas, tales como polietileno de 2000 a 10000 dalton, derivados cerosos o componentes cerosos de ceras naturales, tales como componentes éster, extraídos o sintetizados, derivados de éster sólido de glicerilo o glicerol, típicamente con ácidos grasos saturados lineales, que normalmente contienen una fracción significativa de restos ácidos C<sub>16-22</sub>, que pueden sintetizarse u obtenerse hidrogenando el aceite natural

correspondiente; ceras de petróleo, polímeros de silicona cerosos que contienen sustituyentes alquilo de al menos una longitud de cadena C<sub>10</sub> y, lo que es importante, alcoholes grasos cerosos, que normalmente son lineales y a menudo contienen de 14 a 24 carbonos, tales como alcohol estearílico, alcohol cetílico y/o alcohol behenílico.

5 Otras clases de estructurantes para líquidos inmiscibles en agua, que pueden emplearse en el presente documento, de acuerdo con su divulgación en la bibliografía de patentes, en relación con la preparación de formulaciones antitranspirantes en forma de sólido blando o barra firme, incluyen poliamidas solubles en aceite o copolímeros de amida/silicona, ácido hidroxiesteárico, tal como ácido 12-hidroxiesteárico o derivados de éster o amida de los mismos, amidas y ésteres de N-acil aminoácido, descritos en el documento US-A-3969087, tales como, en particular, di-n-butilamida del ácido N-lauroil-L-glutámico; derivados de amida como se expone en el documento WO 10 98/27954, en concreto alquil N,N'-dialquil succinamidas; treitol o gelificantes amido análogos, como se expone en el documento US-A-6410001; lanosterol, como se expone en el documento US-A-6251377; derivados de amido de ciclohexano, como se expone en el documento US-A-6410003; una combinación de un esteroide y un éster de esteroide, como se expone en el documento WO 00/61096, por ejemplo  $\gamma$ -orizanol o  $\beta$ -sitosterol; y ésteres de ácido graso de celobiosa, tales como en particular un producto que contiene predominantemente octanoato de celobiosa y una fracción minoritaria de heptanoato de celobiosa.

Pueden emplearse mezclas de materiales dentro de cada clase de gelificante/estructurante.

20 Las composiciones que son sólidos firmes, obtenidos habitualmente mediante el uso de un gelificante o estructurante, pueden aplicarse empleando un aplicador en barra, y los sólidos blandos, geles y cremas pueden aplicarse empleando un aplicador que tiene un cabezal de dispensación provisto de al menos una abertura a través de la cual el sólido blando, gel o crema puede extruirse bajo una presión moderada.

25 Cuando la composición antitranspirante empleada en el presente documento comprende una composición de aerosol, contiene un propulsor además de una composición de base como se ha descrito en el presente documento anteriormente, habitualmente en una proporción en peso de 95:5 a 40:60 y, en muchas formulaciones, la proporción en peso es de 90:10 a 50:50. Para evitar dudas, las concentraciones de ingredientes en las composiciones de aerosol del presente documento, excepto para el propulsor, están basadas en la composición de base. De esta manera, por ejemplo, la concentración de carboxílico activo del 1% en las composiciones de base corresponde a una concentración del 0,25% en toda la composición de aerosol, cuando las proporciones son del 25% composición de base y 75% de propulsor.

30 El propulsor es convenientemente es un material de bajo punto de ebullición, que típicamente ebulle por debajo de -5°C, por ejemplo un alcano tal como propano, butano o isobutano, y que posiblemente contiene una fracción de pentano o isopentano o un hidrofluorocarbono o fluorocarbono de contenido de carbono o similar. Durante la carga de la bombona del aerosol, el gas propulsor se licua gracias a la elevada presión que se genera en su interior. Como reconoce la persona experta, la composición de base para una composición de aerosol típicamente está en forma de un líquido, que puede haberse espesado, aunque no gelificado o solidificado.

35 Las composiciones contempladas en el presente documento para inhibir el oscurecimiento de la piel pueden comprender, adicionalmente, uno o más constituyentes opcionales que hasta ahora se habían incorporado o propuesto para la incorporación en composiciones antitranspirantes. Dichos constituyentes opcionales pueden ser líquidos o sólidos y, normalmente, comprenden en total no más del 10% en peso de la composición. Dichos constituyentes opcionales pueden comprender modificadores sensoriales, tales como talco o polietileno finamente dividido, tal como en 40 una cantidad de hasta el 5% en peso; fragancia, incluyendo, si se desea desodoperfumes, a menudo en una cantidad de hasta el 4%, por ejemplo del 0,3 al 2% en peso, colorantes; agentes refrescantes de la piel, tales como mentol, agentes de lavado tales como tensioactivos no iónicos.

45 Las composiciones contempladas en el presente documento para inhibir el oscurecimiento de la piel puede prepararlas la persona experta usando procedimientos conocidos en la industria de los antitranspirantes, o descritos en la bibliografía publicada para la preparación de composiciones antitranspirantes de bola, crema estrujable o de pulverización bombeable, o sólido blando o barra firme.

50 En algunas composiciones preferidas, el aceite de triglicérido C<sub>18</sub> se complementa con un ácido activo, como se describe en el presente documento y, particularmente, en las proporciones de aceite de triglicérido a ácido activo descritas anteriormente en el presente documento. Una combinación particularmente deseable comprende el ácido dicarboxílico alifático C<sub>6-12</sub>, tal como ácido azelaico (que es especialmente deseable) o el ácido hidroxibenzoico, tal como ácido salicílico con el aceite de triglicérido. Una combinación adicional, que es ventajosa, y es particularmente deseable si por alguna razón no se emplea el ácido azelaico, comprende el aceite de triglicérido y un ácido linoleico, tal como un ácido linoleico conjugado. En ciertas realizaciones especialmente deseables, el aceite de triglicérido se obtiene, al menos parcialmente, del mismo ácido C<sub>18</sub> insaturado que el ácido activo que se emplea junto con el aceite.

Las composiciones empleadas en la presente invención pueden prepararse de una manera convencional, y con un equipo convencional conocido por la persona experta, que es apropiado para el tipo físico de composición que desea preparar.

5 A modo de ejemplo, una composición líquida se prepara convencionalmente mezclando los ingredientes  
 10 juntos en una cuba, normalmente a una temperatura que conduce a la disolución o por encima del punto de fusión de  
 los ingredientes, y posiblemente con premezcla del principio activo antitranspirante con un disolvente, para asegurar la  
 disolución óptima. Las emulsiones a menudo contienen una etapa de calentamiento intermedia, por encima del punto  
 de fusión de los emulsionantes, tal como de 50 a 70°C. Si la composición líquida comprende dos fases líquidas, la  
 15 composición a menudo se somete a mezcla con cizalla, para alentar la formación de emulsión. Las composiciones que  
 comprenden un antitranspirante en forma de partículas suspendido en un vehículo líquido espesado pueden formarse a  
 una temperatura a la que el espesante se dispersa o se disuelve en el vehículo líquido, que puede variar de  
 temperatura ambiente a una temperatura elevada, posiblemente hasta 60 o 70°C, dependiendo de la elección de  
 espesante/vehículo. Si la composición está en forma de un sólido blando o barra firme, éste se obtiene normalmente  
 20 incorporando un gelificante o estructurante en un vehículo líquido, y el gelificante a menudo se premezcla con el  
 vehículo líquido (o una fracción del mismo) a una temperatura elevada, por ejemplo por encima de 70-80°C, hasta que  
 ocurre la disolución. Los ingredientes restantes se añaden después progresivamente mientras que la composición  
 permanece por encima de su temperatura de fraguado, la composición se introduce en un molde o se dispensa en un  
 recipiente y finalmente se enfría o se permite que se enfríe a temperatura ambiente. Las cremas que emplean  
 un espesante a menudo se preparan de una manera similar a los líquidos, aunque si incluyen un gelificante orgánico,  
 25 puede emplearse un procedimiento similar al de las barras. Las formulaciones en aerosol normalmente comprenden en  
 primer lugar la formación de una formulación líquida, que se introduce en un recipiente de aerosol, la válvula se ajusta y  
 el propulsor se fuerza a presión hacia el recipiente. La inhibición simultánea del oscurecimiento de la piel e inhibición  
 del sudor de acuerdo con otro aspecto de la invención se realiza aplicando por vía tópica a la piel humana una  
 composición que contiene una composición antitranspirante o desodorante como se ha descrito anteriormente en el  
 presente documento, de acuerdo con la reivindicación 1, en una cantidad suficiente para permitir que la sal astringente,  
 por ejemplo, sal de Al o Al/Zr contenida en la composición actúe como antitranspirante. Normalmente, puede  
 observarse un efecto antitranspirante cuando la sal astringente se aplica a una densidad de al menos 2 g/m<sup>2</sup> y muchos  
 usuarios aplican de 4 a 6 g/m<sup>2</sup> como media. Para los fines de la presente invención, dicha densidad puede medirse  
 realmente o calcularse midiendo el área de la piel a la que se aplica la composición y la pérdida de peso de la  
 30 composición desde el aplicador, conociendo la concentración de sal astringente en la composición. Se reconocerá  
 que la cantidad real de composición que debe depositarse variará con el tipo de aplicador, de hecho cada usuario  
 tiende a regular la cantidad usada, aunque normalmente para la mayoría de usuarios el peso de la composición  
 (excluyendo el propulsor) depositado está dentro del intervalo de 5 g/m<sup>2</sup> a 35 g/m<sup>2</sup>.

35 Habiendo proporcionado una descripción detallada de la invención, se ilustrará ésta ahora mediante los  
 siguientes Ejemplos.

Los ingredientes empleados en los Ejemplos son los siguientes:

- 1 agua desmineralizada - producción en el laboratorio
- 2 clorhidrato de aluminio, solución al 50% p/p de Chlorhydrol™ (Reheis)
- 3 Cropure™ aceite de semilla de girasol (Croda)
- 40 4 (Seatons)
- 5 Volpo S2™ (Croda)
- 6 Brij 78™ (Uniqema)
- 7 misma fragancia de principio a fin
- 8 Emerox 1110™ (Cognis)
- 45 9 Ácido Linoleico Conjugado (80% activo) - Clarinol A80™
- 10 (Clariant)
- 11 sal Di Na Nervanaid Ba2™
- 12 Pricerine 9091™ (Uniqema)

	13	Ionol™ (Shell)
	14	solución acuosa al 40% de Rezal 67™ (Reheis)
	15	Ciclometicona (principalmente D5) - DC245™ (Dow Corning)
	16	Emulgade SE (Cognis)
5	17	Solonace (National Starch)
	18	Emulgin B2 (Cognis)
	19	Polawax GP200™ (Croda)
	20	Eumulgin B-2™ (Cognis)
	21	Eutanol G™ (Cognis)
10	22	Complejo de Clorhidrato de Aluminio y Zirconio con Glicina, Reach 908™, con un 2% de glicerol en aducto, preparación casera de acuerdo con el procedimiento del documento WO03/70210
	23	Clorhidrato de Aluminio Activado A296™ (BK Giulini)
	24	Dimeticona, 10 mPa.s, DC200™ (Dow Corning Inc)
	25	Fluid AP™ (Amerchol)
15	26	Finsolv TN™ (Finetex)
	27	Lanette 18™ (Cognis)
	28	Acumist B18™ (Allied Signal)
	29	Castorwax MP80™ (CasChem)
	30	Ultra Talc 3000™ (Ultra Chemical)
20	31	Prifac 8961™ (Uniqema)
	32	Brij 700™ (Uniqema)
	33	A296™ (BK Giulini) que forma un aducto con un 2% de glicerol, preparación casera de acuerdo con el procedimiento del documento WO03/70210
	34	Bentone 38™ * (Rheox)
25	35	DC1501™ (Dow Corning)
	36	Lannette 16™ (Cognis)
	37	Silice pirógena Aerosil 200™ (Degussa)
	38	(Fluka)
	39	Complejo de Clorhidrato de Aluminio y Zirconio con glicina, Reach 908™ (Reheis)
30	40	(Fluka)
	41	Disorbene™ (Roquette)
	42	Propanolamina (BASF)

35 Los % en peso mostrados en las Tablas posteriores se refieren al propio ingrediente, y no al constituyente activo que hay en su interior, que puede ser menor del 100% del ingrediente.

## Ejemplos 1-10 y Comparación CA

5 Las composiciones líquidas representativas, como se resume en la Tabla 1 a continuación, que se pueden dispensar mediante un sistema de bola de acuerdo con el documento EP1175165, se preparan mezclando los constituyentes de una manera convencional a una temperatura que alcanza aproximadamente 65 a 70°C para la disolución del emulsionante en una cuba, añadiendo una fragancia a aproximadamente 50-55°C y después vertiéndolos en el aplicador de dispensación.

10 Pueden prepararse formulaciones similares empleando un complejo de clorhidrato de aluminio y zirconio con glicina <sup>(22)</sup> a una concentración del 12,5%, en lugar del clorhidrato de aluminio <sup>(2)</sup>. Dichas composiciones contienen el aceite triglicérido a una proporción en peso proporcionadamente mayor (un factor de 1,2) que las proporciones mostradas anteriormente, y una reducción concomitante en la concentración de agua <sup>(1)</sup>.

Tabla 1

Ejemplos	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	CA
Ingrediente	% en peso										
Agua <sup>1</sup>	resto										
ACH <sup>2</sup>	15	15	15	15	15	15	15	15	15	15	17,5
Aceite de Girasol <sup>3</sup>	4	4	4	4	4	4	2	4	4	8	
Aceite de Ricino <sup>4</sup>							2				
Steareth-2 <sup>5</sup>	1,92	1,92	1,92	1,92	1,92	1,92	1,92	1,92	1,92	3,84	2,6
Steareth-20 <sup>6</sup>	1,28	1,28	1,28	1,28	1,28	1,28	1,28	1,28	1,28	2,56	0,6
Fragancia <sup>7</sup>	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1	1
Ácido Azelaico <sup>8</sup>	1	0,5					0,75	1	0,6		
CLA <sup>9</sup>			1	0,5			0,75		0,6		
Ácido salicílico <sup>10</sup>					1	0,5		0,5	0,3		
EDTA <sup>11</sup>		0,1	0,1		0,1			0,1	0,1	0,1	
Glicerol <sup>12</sup>										4	
BHT <sup>13</sup>	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05	0,05

15 Las formulaciones presentan antitranspiración, como se muestra mediante un ensayo convencional en el que la composición se aplica a una axila (aleatoriamente I/D) de un grupo de personas con edades entre los 18 y 55 años, y el peso de sudor generado en las condiciones de ensayo convencionales durante un periodo de tiempo convencional, como se mide y compara con el peso de sudor generado en la otra axila a la que la composición no se aplicó.

20 El oscurecimiento de la piel de la axila por aplicación de las composiciones de la invención y convencionales se evalúa mediante un ensayo en el que la composición se aplica usando un aplicador de bola, de acuerdo con el documento EP1175165, típicamente aplicando de 0,2 a 0,3 g de composición por sobaco en cada aplicación. El producto se aplica durante un periodo de cuatro semanas (con cuatro aplicaciones de producto por cada producto por día), para dar una oportunidad a que se desarrolle el oscurecimiento de la piel. El producto de ensayo se aplica a un sobaco de un panel de aprox. 30 ensayadores, y una composición antitranspirante se aplica a su otro sobaco (aleatoriamente I/D). El panel se selecciona entre personas que no presentan un oscurecimiento de la axila significativo en el comienzo del ensayo. Durante el ensayo de 4 semanas, el color de la piel de la axila se evalúa regularmente por un asesor experto y experimentado, comparando la parte oscurecida de cada axila con el color de piel base del ensayador, que se toma como el color de la piel del brazo interno superior adyacente. Estos datos se promedian para un panel de ensayadores, y se obtiene una puntuación de hiperpigmentación media para cada composición de muestra (sea de la invención o convencional). Las puntuaciones para las muestras de composición de la invención se comparan

entonces con las composiciones convencionales, y se ve que cada una presenta una menor puntuación que para la composición convencional, confirmando que las composiciones de la invención inhiben el oscurecimiento de la piel.

Ejemplos 11 y 12 y Comparación CB

5

Las composiciones de pulverización por bombeo representativas resumidas en la Tabla 2 a continuación se preparan por un procedimiento convencional, y se llenan con dispensadores de pulverización por bombeo convencionales antes de la aplicación, y al ensayarlas de la manera de los Ejemplos 1-10, muestran inhibición del oscurecimiento de la piel.

Tabla 2

Ejemplo	11	12	CB
Constituyente	Porcentaje en peso		
Pentacloro Al-Zr-hidrato <sup>14</sup>	50,0	50,0	50,0
Agua <sup>1</sup>	Resto		
Ciclometicona <sup>15</sup>	2,0	4,0	10,0
Glicerol <sup>12</sup>	4,0	2,0	2,0
Aceite de Girasol <sup>3</sup>	8,0	5,0	
Ácido Azelaico <sup>8</sup>		1,0	
Estearato de Glicerilo, Ceteareth-20, Ceteareth-12, Alcohol Cetearílico, Palmitato de Cetilo <sup>16</sup>	2,0	2,0	2,0
Almidón de Patata Anfótero <sup>17</sup>	1,0	1,0	1,0
Perfume	1,0	1,0	1,0
Estearato de Glicerilo <sup>18</sup>	1,0	1,0	1,0
Alcohol Cetearílico, Estearato de PEG 20 <sup>19</sup>	0,65	0,65	0,65
Ceteareth 20 <sup>20</sup>	0,4	0,4	0,4
Octildodecano <sup>21</sup>	0,5	0,5	0,5

10

Ejemplos 13 a 17 y comparación CC

Las composiciones en barra representativas, resumidas en la Tabla 3 a continuación, se prepararon por un procedimiento convencional, y se llenan en dispensadores de barra firme como se describe en el documento US-A-6598767 antes de la aplicación y, al ensayarlas de la manera de los Ejemplos 1-10, muestran inhibición del oscurecimiento de la piel.

15

Tabla 3

Ejemplos	13	14	15	16	17	CC
Constituyentes	Porcentaje en peso					
Ciclometicona <sup>15</sup>	Resto					
AZAG <sup>*22</sup>	24,0		24,0		24,0	
AACH <sup>23</sup>		24,0		24,0		24,0
Silicona no volátil <sup>24</sup>	7,5		7,5	7,5	7,5	7,5
PPG-14 butil éter <sup>25</sup>	6,0		6,0			6,0
Benzoato de alquilo C <sub>12-15</sub> <sup>26</sup>		6,0		6,0	6,0	
Alcohol estearílico <sup>27</sup>	14,5	14,5	14,5	14,5	14,5	14,5
Polietileno en polo <sup>28</sup>	3,0	3,0	3,0	3,0	3,0	14,5
Cera de ricino <sup>29</sup>	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0
Talco <sup>30</sup>	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0
Glicerol*	2,0		2,0		2,0	
Aceite de Girasol <sup>3</sup>	8,0	5,0	5,0	5,0	5,0	
Ácido Azelaico <sup>8</sup>		1,0				
CLA <sup>9</sup>			1,0			
Ácido salicílico				1,0		
Ácidos de aceite de girasol <sup>31</sup>					1,0	
Fragancia	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0
Steareth 100 <sup>32</sup>	0,7	0,7	0,7	0,7	0,7	0,7
Los ingredientes marcados con * en estos Ejemplos se combinaron en una etapa preparativa previa, antes de que el resto de constituyentes se pusieran juntos.						

## Ejemplos 18 a 20 y Comparación CD

5

Las formulaciones de aerosol representativas, resumidas en la Tabla 4 a continuación, se preparan por un procedimiento convencional, y se llenan en dispensadores de aerosol como se describe en el documento EP1044055B antes de la aplicación, se presurizan con un propulsor y al ensayarlas de la manera de los Ejemplos 1-10, muestran inhibición del oscurecimiento de la piel.

Tabla 4

Ejemplos	18	19	20	CD
Composición de base	Porcentaje en peso			
AACH* <sup>33</sup>	39,0	39,0	39,0	39,0
Ciclometicona <sup>15</sup>	18,8	19,8	20,2	23,0
PPG-14 butil éter <sup>25</sup>	21,8	22,8	23,4	26,6
Fragancia	5,4	5,4	5,4	5,4
Arcilla hidrófoba <sup>34</sup>	4,2	4,2	4,2	4,2
Aceite de girasol <sup>3</sup>	7,0	5,0	3,0	
Glicerol*	2,0			
Aceite de Ricino <sup>4</sup>			2,0	
Ácido Azelaico <sup>8</sup>		1,0		
CLA <sup>9</sup>			1,0	
Octildocecano <sup>21</sup>	1,0	1,0	1,0	1,0
Goma de silicona <sup>35</sup>	0,8	0,8	0,8	0,8

5

Para preparar la composición en aerosol presurizada, 1 parte en peso de cada composición de base se introduce en una bombona, seguido de 3 partes en peso de un propulsor que comprende una mezcla de propano, butano e isobutano, CAP40<sup>TM</sup><sup>37</sup>.

#### Ejemplos 21 a 23 y Comparación CE

Las formulaciones de sólido blando representativas, resumidas en la Tabla 5 a continuación, se preparan por un procedimiento convencional, y se llenan en dispensadores de barra blanda convencional antes de la aplicación, y al ensayarlas de la manera de los Ejemplos 1-10, muestran inhibición del oscurecimiento de la piel.

10

Tabla 5

Ejemplos	21	22	23	CE
Constituyente	Porcentaje en peso			
Ciclometicona <sup>15</sup>	36,7	38,8	38,8	43,3
Particulado AACH* <sup>33</sup>	24,5	24,5	24,5	24,5
PPG-14 butil éter <sup>25</sup>	9,5	10,4	10,4	11,9
Cera de ricino <sup>29</sup>	6,0	6,0	6,0	6,0
Alcohol cetílico <sup>36</sup>	6,0	6,0	6,0	6,0
Talco <sup>30</sup>	6,0	6,0	6,0	6,0
Aceite de girasol <sup>3</sup>	7,0	5,0	5,0	

(cont.)

Ejemplos	21	22	23	CE
Glicerol*	2,0			
CLA <sup>9</sup>		1,0		
Ácido salicílico <sup>10</sup>			1,0	
Silíce <sup>37</sup>	1,5	1,5	1,5	1,5
Fragancia	0,8	0,8	0,8	0,8

Ejemplos 24 a 26 y Comparación CF

5

Las composiciones en gel representativas, resumidas en la Tabla 6 a continuación se preparan por un procedimiento convencional, y se llenan en dispensadores de gel convencionales antes de la aplicación, y al ensayarlas de la manera de los Ejemplos 1-10 muestran inhibición del oscurecimiento de la piel.

Tabla 6

Ejemplos	24	25	26	CF
Constituyente	Porcentaje en peso			
Propilenglicol <sup>38</sup>	44,5	47,5	47,5	53,3
AZAG <sup>39</sup>	20,0	20,0	20,0	20,0
Dipropilenglicol <sup>40</sup>	11,0	11,5	11,5	12,1
Alcohol isostearílico <sup>21</sup>	11,0	11,5	11,5	12,1
Dibenzoil sorbitol <sup>41</sup>	3,0	3,0	3,0	3,0
Glicerol <sup>12</sup>	2,0			
Aceite de girasol <sup>3</sup>	8,0	5,0	5,0	
Ácido Azelaico <sup>8</sup>		1,0		
Ácido Linoleico Conjugado <sup>9</sup>			1,0	
3-amino-1-propanol <sup>42</sup>	0,5	0,5	0,5	0,5

10

El principio de inhibición del oscurecimiento de la piel puede demostrarse adicionalmente mediante ensayos comparativos, en los que la piel en un panel de voluntarios con edades entre los 18 y 55 años se broncea mediante una aplicación de radiación UV controlada con una lámpara solar, y posteriormente tiras lado a lado de piel se tratan dos veces al día con una composición antitranspirante, libre de o que contiene un sistema de inhibición del oscurecimiento, o sin tratamiento, y el color de la piel se observa durante un periodo de hasta 4 semanas y se evalúa por un asesor experimentado, frente a un cuadro de color patrón, cuanto mayor sea el número, más intenso será el color. A partir de esas observaciones de cambio de color medio para los panelistas se calcula respecto a los de sin tratamiento. Dichos ensayos han indicado la inhibición del oscurecimiento con <sup>(3)</sup>:<sup>(2)</sup> a una proporción x:y de 8:15, y <sup>(3)</sup>+<sup>(8)</sup> : <sup>(2)</sup> a una proporción x:y de 8:15 y <sup>(3)</sup>+<sup>(10)</sup>: <sup>(2)</sup> a una proporción x:y de 2:5.

15

## REIVINDICACIONES

- 5 1. Un procedimiento cosmético de inhibición o prevención del oscurecimiento de la piel que surge de la aplicación por vía tópica a la piel de la axila de una composición antitranspirante, que comprende una sal antitranspirante activa seleccionada entre sales astringentes de aluminio y/o zirconio, incorporando en la composición un sistema de inhibición del oscurecimiento, que comprende un aceite de triglicérido de ácido carboxílico insaturado C<sub>18</sub>, opcionalmente junto con un ácido carboxílico activo seleccionado entre
- ai) ácidos dioicos alifáticos lineales, que contienen de 6 a 12 átomos de carbono;
  - aii) ácidos carboxílicos C<sub>18</sub> alifáticos insaturados
  - aiii) ácidos hidroxibenzoicos,
- 10 en una proporción de dichas sales astringentes, x:y de 1:<4, en la que x representa la concentración en peso de dicho aceite de triglicérido, más 4 veces la concentración en peso de ácido carboxílico activo, e y representa la concentración en peso de dichas sales astringentes.
2. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 1, en el que la proporción en peso x:y es 1:≤3.
3. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 1, en el que la proporción en peso x:y es 2:≤5.
- 15 4. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que la proporción en peso x:y es 2:≥3.
5. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que la proporción en peso de aceite de triglicérido a ácido carboxílico activo en la composición se selecciona en el intervalo de hasta 8:1 y es preferentemente al menos 2:1.
- 20 6. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que el aceite de triglicérido comprende aceite de girasol, aceite de ricino o una mezcla de los mismos.
7. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que el ácido dicarboxílico alifático lineal es ácido azelaico.
- 25 8. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que el ácido carboxílico C<sub>18</sub> alifático, insaturado, es un ácido linoleico.
9. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 8, en el que el ácido linoleico es un ácido linoleico conjugado.
10. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que ácido hidroxibenzoico es ácido salicílico.
- 30 11. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que las composiciones contienen del 1 al 10% en peso del aceite de triglicérido.
12. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que la composición comprende adicionalmente un agente quelante para un metal de transición.
- 35 13. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 12, en el que el agente quelante es un ácido aminopolicarboxílico.
14. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 13, en el que el ácido aminopolicarboxílico es ácido etilendiaminatetraacético o dietilentriaminapentaacético.
15. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 14, en el que el agente quelante está presente en una proporción en peso respecto al ácido hidroxibenzoico de 1:20 a 1:5.
- 40 16. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que composición comprende adicionalmente glicerol.
17. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 16, en el que el glicerol está presente en la composición en una proporción en peso respecto a aceite de triglicérido de 1:1 a 1:4.

18. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que la composición contiene del 4 al 10% en peso de aceite de triglicérido, y del 0 a menos del 0,5% del ácido carboxílico activo.
19. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que la composición contiene del 2 al 6% en peso del aceite de triglicérido y del 0,5 al 2,0% en peso del ácido carboxílico activo.
- 5 20. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que la sal antitranspirante o desodorante activa comprende una sal de aluminio astringente.
21. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 19, en el que la sal astringente de aluminio es un clorhidrato de aluminio.
- 10 22. Un procedimiento de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que la sal antitranspirante o desodorante activa está presente en una concentración del 10 al 50% en peso de la composición, excluido cualquier propulsor.
23. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 21, en el que la composición está libre de propulsor y contiene del 10 al 26% de la sal astringente antitranspirante o desodorante.
- 15 24. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 21, en el que la composición contiene propulsor, y del 20 al 45% en peso de la sal astringente antitranspirante o desodorante, estando basados los porcentajes en la composición excluyendo el propulsor.
- 20 25. Un procedimiento cosmético de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, para inhibir simultáneamente el sudor e inhibir el oscurecimiento de la piel, que comprende aplicar por vía tópica a una axila la composición antitranspirante, en una cantidad suficiente para depositar la sal antitranspirante astringente a una densidad de al menos 2 g/m<sup>2</sup>.