



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 360 057**

51 Int. Cl.:

**A61Q 15/00** (2006.01)

**A61K 8/26** (2006.01)

**A61K 8/49** (2006.01)

**A61K 8/27** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **04292721 .0**

96 Fecha de presentación : **17.11.2004**

97 Número de publicación de la solicitud: **1541122**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **15.06.2005**

54

Título: **Composición cosmética desodorante que contiene la asociación de pidolato de zinc y de una sal de aluminio antitranspirante.**

30

Prioridad: **12.12.2003 FR 03 51035**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**31.05.2011**

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**31.05.2011**

73

Titular/es: **L'Oréal**  
**14, rue Royale**  
**75008 Paris, FR**

72

Inventor/es: **Lemoine, Cyril;**  
**Beau, Nathalie y**  
**Prud'Homme, Estelle**

74

Agente: **Ungría López, Javier**

ES 2 360 057 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

Composición cosmética desodorante que contiene la asociación de pidolato de zinc y de una sal de aluminio antitranspirante

5

### Descripción

#### Campo de la invención

10 La invención tiene por objeto una composición cosmética desodorante que contiene al menos:  
a) pidolato de zinc y  
b) al menos una sal de aluminio antitranspirante particular, yendo la razón ponderal pidolato de zinc/sal de aluminio de 1/20 a 5/1.

15 La invención se relaciona igualmente con un procedimiento de tratamiento cosmético de la transpiración humana y de los olores axilares humanos con ayuda de esta composición.

#### Antecedentes de la invención

20 En el ámbito cosmético, es bien conocida la utilización en aplicación tópica de productos desodorantes que contienen sustancias activas de tipo antitranspirante, de tipo bactericida o de tipo absorbente de olores para disminuir, incluso suprimir, los olores axilares generalmente desagradables.

25 Las sustancias bactericidas inhiben el desarrollo de la flora cutánea responsable de los olores axilares. Tienen el inconveniente de no ser activas sobre el olor del sudor ya desarrollado. Entre los productos bactericidas, el más habitualmente empleado es el Triclosán (éter 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxidifenílico), que presenta el inconveniente de modificar de forma importante la ecología de inhibido por determinados compuestos, como por ejemplo los tensioactivos no iónicos, habitualmente utilizados en la formulación de composiciones cosméticas. Por otra parte, el carácter insoluble del Triclosán en agua no permite su incorporación en fórmulas esencialmente acuosas.

30 Las sustancias antitranspirantes tienen como efecto limitar el flujo de sudor. Están generalmente constituidas por sales de aluminio. Su eficacia desodorante es limitada cuando se utilizan solas. Además, en concentraciones elevadas estas sustancias presentan un potencial irritante para la piel.

35 Se conoce por la patente DE 101 37901 la utilización de inhibidores de la arilsulfatasa para reducir la descomposición de los ésteres de esteroides que causan olores corporales.

40 Se conocen igualmente por la patente EP 768.080 composiciones desodorantes acuosas, en particular emulsiones de agua/silicona, que contienen como principio activo absorbente de olores sales de zinc hidrosolubles, como el pirrolidonocarboxilato de zinc, también llamado pidolato de zinc, el sulfato de zinc, el cloruro de zinc, el pidolato de zinc y el fenolsulfonato de zinc. Su eficacia desodorante no es aún plenamente satisfactoria cuando se utilizan solos.

45 Se conocen también por la patente EE.UU. 6.426.061 composiciones para combatir el desarrollo de los olores de la transpiración humana que comprenden la asociación de los principios activos siguientes: (1) un inhibidor del receptor de andrógenos (resveratrol, epigallocatequina-3-galato o ácido flufenámico); (2) un principio activo anti-DHT (sales de zinc, en particular el sulfato de zinc); (3) un inhibidor de proteínas portadoras de olores; (4) una sal de aluminio antitranspirante, y (5) un agente antimicrobiano del tipo dipidolato de clorhexidina o diacetato de clorhexidina. Estas composiciones presentan el inconveniente de utilizar agentes antimicrobianos particularmente activos sobre la flora cutánea.

50 Se conocen por la solicitud de patente WO01/52804 composiciones desodorantes a base de sales antitranspirantes a las que se propone añadir quelantes de metales de transición. Estas formulaciones son potencialmente ecotóxicas y plantean problemas de medio ambiente.

55 Se conocen también por la solicitud de patente WO01/99376 composiciones desodorantes que contienen inhibidores de arilsulfatasa, entre los cuales se mencionan las sales de aluminio y el pidolato de zinc. Este documento describe, en particular, un ejemplo de barra antitranspirante que contiene un 20% en peso de clorhidrato y un 0,05% de pidolato de zinc. Este tipo de composición produce una tasa elevada de residuo blanco sobre la piel tras su aplicación.

60

#### Objeto de la invención

El fin de la presente invención es, pues, disponer de nuevas composiciones cosméticas que contienen un sistema desodorante que tiene una eficacia superior a la de las sales antitranspirantes y a la de las sales de zinc utilizadas

solas y que no presentan los inconvenientes de los productos desodorantes de la técnica anterior tales como los evocados anteriormente.

#### Descripción detallada de la invención

5 La solicitante descubrió que se obtiene tal composición utilizando la asociación del pidolato de zinc (o pirrolidonocarboxilato de zinc) y de una sal de aluminio antitranspirante particular en una razón ponderal de pidolato de zinc/sal de aluminio que varía de 1/20 a 5/1.

10 La solicitante descubrió inesperadamente que esta asociación particular aumentaba de manera substancial el efecto de disminución de la intensidad del olor con respecto a los principios activos utilizados individualmente y podía incluso producir un efecto de sinergia

15 Descubrió igualmente que esta asociación particular podía ser formulada en composiciones desodorantes cosméticamente aceptables cuyos contenidos en residuo visible sobre la piel a la aplicación o tras el secado de la composición después de su aplicación son bajos y comparables a los productos desodorantes actualmente en el mercado.

20 De una forma más precisa, la invención tiene por objeto una composición cosmética desodorante que contiene al menos:

a) pidolato de zinc y

b) al menos clorhidrato de aluminio en forma activa o no activa, yendo la razón ponderal de pidolato de zinc/sal de aluminio de 1/20 a 5/1.

25 La invención se relaciona también con un procedimiento de tratamiento cosmético de la transpiración humana y de los olores axilares humanos con ayuda de esta composición.

30 En el seno de la presente invención, se entiende por "composición desodorante" cualquier composición capaz de reducir el flujo de sudor o de enmascarar, absorber, mejorar y/o reducir el olor desagradable resultante de la descomposición del sudor humano por las bacterias.

35 Las sales de aluminio antitranspirantes pueden estar presentes en la composición según la invención a razón de aproximadamente un 0,5 a un 25% en peso con respecto al peso total de la composición.

El pidolato de zinc puede estar presente en la composición según la invención a razón de aproximadamente un 0,05% a un 10% en peso y más preferiblemente de un 0,1 a un 5% en peso con respecto al peso total de la composición.

40 Las composiciones desodorantes según la invención destinadas al uso cosmético pueden presentarse en forma de lociones, de cremas o de geles fluidos distribuidos en spray aerosol, en frasco bombeador o en roll-on, en forma de cremas espesas distribuidas en tubos o en rejilla o en forma de bastoncillos (barras), y contener a este respecto los ingredientes generalmente utilizados en este tipo de productos y bien conocidos por el experto en la técnica, a condición de que no interfieran con la sal de aluminio y el pidolato de zinc descritos en la presente invención.

45 Las composiciones desodorantes según la invención destinadas al uso cosmético pueden llevar al menos una fase acuosa. Están especialmente formuladas en lociones acuosas o en emulsión de agua-en-aceite o de aceite-en-agua o en emulsión múltiple (emulsión triple de aceite-en-agua-en-aceite o de agua-en-aceite-en-agua) (tales emulsiones son conocidas y están descritas, por ejemplo, por C. FOX en «Cosméticos and Toiletries» - noviembre de 1986 – Vol. 101 - páginas 101-112).

50 La fase acuosa de dichas composiciones contiene agua y en general otros solventes solubles o miscibles en agua. Los solventes solubles o miscibles en agua comprenden los monoalcoholes de cadena corta, por ejemplo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, como el etanol o el isopropanol, y los dioles o los polioles, como el etilenglicol, el 1,2-propilenglicol, el 1,3-butilenglicol, el hexilenglicol, el dietilenglicol, el dipropilenglicol, el 2-etoxietanol, el éter monometílico de dietilenglicol, el éter monometílico de trietilenglicol y el sorbitol. Se utilizarán más particularmente el propilenglicol y la glicerina.

Según una forma particular de la invención, las composiciones antitranspirantes pueden ser anhidras.

60 Por "anhidra", se entiende en el sentido de la invención una composición cuyo contenido en agua libre o añadida es inferior al 3% y preferentemente cuyo contenido en agua añadida es inferior al 1% en peso con respecto al peso total de la composición.

Las composiciones según la invención tienen preferentemente al menos una fase líquida orgánica no miscible en

agua. Ésta contiene, en general, uno o más compuestos hidrofóbicos que hacen que dicha fase no sea miscible en agua. Dicha fase es líquida (en ausencia de agente estructurante) a temperatura ambiente (20-25°C). Preferiblemente, la fase líquida orgánica no miscible en agua conforme a la invención está generalmente constituida por un aceite o por una mezcla de aceites y contiene al menos un 80% de compuestos que tienen una presión de vapor que no sobrepasa el valor de 4 kPa (30 mm Hg) a 25°C.

La fase líquida orgánica no miscible en agua contiene preferentemente uno o más aceites emolientes siliconados o hidrocarbonados, volátiles o no volátiles. Estos aceites emolientes están especialmente descritos en las patentes EE.UU. 4.822.596 y EE.UU. 4.904.463.

Las siliconas volátiles se definen de forma conocida como compuestos volátiles a temperatura ambiente. Se pueden citar entre estos compuestos las siliconas volátiles cíclicas y lineales del tipo dimetilsiloxano cuyas cadenas tienen de 3 a 9 residuos siliconados. Preferentemente, se escogen las ciclometiconas D<sub>4</sub>, D<sub>5</sub> o D<sub>6</sub>.

Las siliconas no volátiles se definen de forma conocida como compuestos de baja presión de vapor a temperatura ambiente. Entre estos compuestos, se incluyen: los polialquilsiloxanos, en particular los polialquilsiloxanos lineales, como por ejemplo los polidimetilsiloxanos, o dimeticonas, lineales, comercializados por la sociedad Dow Corning bajo la denominación de «Dow Corning 245 Fluid»; los polialquilarilsiloxanos como por ejemplo los polimetilfenilsiloxanos, comercializados por la sociedad Dow Corning bajo la denominación de «Dow Corning 556 Fluid»; y los copolímeros de poliéter y siloxano, como por ejemplo los dimeticona copolíoles.

Entre los aceites emolientes no volátiles utilizables en la presente invención, se pueden citar, por ejemplo: los derivados hidrocarbonados, los aceites minerales, los alcoholes grasos, los ésteres de alcoholes C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub> con ácidos C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>, los ésteres del ácido benzoico con alcoholes C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub> y sus mezclas, poliíoles C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> seleccionados preferentemente entre el glicerol, el propilenglicol o el sorbitol, y los polímeros de polialquilenlicol.

Los aceites emolientes están presentes preferentemente en cantidades que van del 1 al 50% en peso y más preferentemente del 5 al 40% en peso con respecto al peso total de la composición.

La composición cosmética desodorante según la invención puede contener uno o más principios activos desodorantes adicionales, como por ejemplo agentes bacteriostáticos o agentes bactericidas, tales como el éter 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxidifenílico (Triclosán), el éter 2,4-dicloro-2'-hidroxidifenílico, la 3',4',5'-triclorosalicilanilida, la 1-(3',4'-diclorofenil)-3-(4'-clorofenil)urea (Triclocarbán) o el 3,7,11-trimetildodeca-2,5,10-trienol (Farnesol); las sales de amonio cuaternarias, como las sales de cetiltrimetilamonio y las sales de cetilpiridinio; la chlorhexidina y sus sales; el monocaprato de diglicerol, el monolaurato de diglicerol y el monolaurato de glicerol; y las sales de polihexametilenbiguanida.

Con el fin de mejorar la homogeneidad del producto, se pueden utilizar además uno o más agentes de suspensión, que son seleccionados preferentemente entre las arcillas montmorillonitas modificadas hidrofóbicas, como las bentonitas o hectoritas modificadas hidrofóbicas. Se pueden citar, por ejemplo, el producto Stearalkonium Bentonite (nombre CTFA) (producto de reacción de la bentonita y del amonio cuaternario cloruro de estearalconio), tal como el producto comercial vendido bajo la denominación TIXOGEL MP 250 por la sociedad Sud Chemie Rheologicals, United Catalysts Inc., o el producto Distardimonium Hectorite (nombre CTFA) (producto de reacción de la hectorita y del cloruro de diestearildimonio), vendido bajo la denominación de Bentone 38 o Bentone Gel por la sociedad Elementis Specialities.

Los agentes de suspensión están presentes preferentemente en cantidades del 0,1 al 5% en peso y más preferentemente del 0,2 al 2% en peso con respecto al peso total de la composición.

Las composiciones según la invención pueden contener igualmente además al menos un polvo orgánico.

Entre las cargas utilizables según la invención, se pueden citar los polvos orgánicos. Se entiende en la presente solicitud por «polvo orgánico» todo sólido insoluble en el medio a temperatura ambiente (25°C).

Como polvos orgánicos que pueden ser utilizados en la composición de la invención, se pueden citar, por ejemplo, las partículas de poliamida, y especialmente las vendidas bajo las denominaciones ORGASOL por la sociedad Atochem; los polvos de polietileno; las microesferas a base de copolímeros acrílicos, tales como las de copolímero de dimetacrilato de etilenglicol/metacrilato de laurilo vendidas por la sociedad Dow Corning bajo la denominación de POLYTRAP; las microesferas de polimetacrilato de metilo, comercializadas bajo la denominación MICROSPHERE M-100 por la sociedad Matsumoto o bajo la denominación COVABEAD LH85 por la sociedad Wackherr; los polvos de copolímero de etileno-acrilato, como los comercializados bajo la denominación FLOBEADS por la sociedad Sumitomo Seika Chemicals; los polvos expandidos, tales como las microesferas huecas y especialmente las microesferas formadas por un terpolímero de cloruro de vinilideno, de acrilonitrilo y de metacrilato y comercializadas bajo la denominación EXPANCEL por la sociedad Kemanord Plast bajo las referencias 551 DE 12 (granulometría de

aproximadamente 12  $\mu\text{m}$  y masa volúmica de 40  $\text{kg}/\text{m}^3$ ), 551 DE 20 (granulometría de aproximadamente 30  $\mu\text{m}$  y masa volúmica de 65  $\text{kg}/\text{m}^3$ ) y 551 DE 50 (granulometría de aproximadamente 40  $\mu\text{m}$ ), o las microesferas comercializadas bajo la denominación MICROPEARL F 80 ED por la sociedad Matsumoto; los polvos de materiales orgánicos naturales, tales como los polvos de almidón, especialmente de almidones de maíz, de trigo o de arroz, entrecruzados o no, tales como los polvos de almidón entrecruzado por el anhídrido octenilsuccínico, comercializados bajo la denominación DRY-FLO por la sociedad National Starch; las microperlas de resina de silicona, tales como las comercializadas bajo la denominación TOSPEARL por la sociedad Toshiba Silicone, especialmente TOSPEARL 240; los polvos de aminoácidos, tales como el polvo de lauroilisina comercializado bajo la denominación AMIHOPE LL-11 por la Sociedad Ajinomoto; las partículas de microdispersión de cera, que tienen preferentemente dimensiones medias inferiores a 1  $\mu\text{m}$  y especialmente de 0,02  $\mu\text{m}$  a 1  $\mu\text{m}$  y que están constituidas esencialmente por una cera o por una mezcla de ceras, tales como los productos comercializados bajo la denominación Aquacer por la sociedad Byk Cera, y especialmente: Aquacer 520 (mezcla de ceras sintéticas y naturales), Aquacer 514 ó 513 (cera de polietileno) y Aquacer 511 (cera polimérica), o tales como los productos comercializados bajo la denominación Jonwax 120 por la sociedad Johnson Polymer (mezcla de ceras de polietileno y de parafina) y bajo la denominación Ceraflour 961 por la sociedad Byk Cera (cera de polietileno modificada micronizada); y sus mezclas. El o los polvos orgánicos pueden estar presentes, por ejemplo en una cantidad

La composición cosmética según la invención puede incluir además adyuvantes cosméticos seleccionados entre las ceras, los suavizantes, los antioxidantes, los opacificantes, los estabilizantes, los agentes hidratantes, las vitaminas, los perfumes, bactericidas, los conservantes, los polímeros, los perfumes, los agentes espesantes, agentes propulsores o cualquier otro ingrediente habitualmente utilizado en cosmética para este tipo de aplicación.

Por supuesto, el experto en la técnica velará por seleccionar este o estos eventuales compuestos complementarios de tal forma que las propiedades ventajosas intrínsecamente ligadas a la composición cosmética según la invención no resulten alteradas, o no lo sean substancialmente, por la o las adiciones contempladas.

Las ceras pueden ser seleccionadas entre las ceras animales, fósiles, vegetales, minerales o de síntesis. Se pueden citar especialmente las ceras de abeja, las ceras de Carnauba, de Candelilla, de caña de azúcar o del Japón, las ozoceritas, la cera de Montana, las ceras microcristalinas, las parafinas y las ceras y resinas de silicona.

Los espesantes, preferentemente no iónicos, pueden ser seleccionados entre las gomas de guar y celulosas modificadas o no modificadas, tales como la goma de guar hidroxipropilada y la cetilhidroxietilcelulosa, y las sílices, como por ejemplo la Bentone Gel MIO, vendida por la sociedad NL INDUSTRIES, o la Veegum Ultra, vendida por la sociedad POLYPLASTIC.

Las cantidades de estos diferentes constituyentes que pueden estar presentes en la composición cosmética según la invención son las clásicamente utilizadas en composiciones desodorantes.

Las composiciones según la invención pueden también contener uno o más de otros agentes estructurantes o gelificantes de la fase líquida orgánica no miscible en agua de la composición, tales como los alcoholes grasos sólidos lineales y/o las ceras; los ácidos grasos o sus sales (ácido esteárico, estearato de sodio, ácido 12-hidroxiesteárico); los dibencilideneditoleos (DBS); el lanosterol; los derivados de N-acilaminoácidos; los derivados de di- o triácidos carboxílicos, como las alquil-N,N'-dialquilsuccinamidas (es decir: dodecil-N,N'-dibutilsuccinamida); y los organopolisiloxanos elastoméricos, tales como los descritos en la solicitud WO97/44010.

La composición según la invención puede también estar presurizada y estar acondicionada en un dispositivo aerosol.

La presente invención tiene por objeto un dispositivo aerosol constituido por:

- (A) un recipiente que contiene una composición desodorante tal como se ha definido anteriormente y
- (B) al menos un agente propulsor y un medio de distribución de dicha composición aerosol.

Los propulsores generalmente utilizados en este tipo de productos y bien conocidos por el experto en la técnica son por ejemplo el éter dimetílico (DME); los hidrocarburos volátiles, tales como el n-butano, el propano, el isobutano y sus mezclas, eventualmente con al menos un hidrocarburo clorado y/o fluorado; entre estos últimos, se pueden citar los compuestos vendidos por la sociedad Dupont de Nemours bajo las denominaciones Fréon® y Dymel®, y en particular el monofluorotriclorometano, el difluorodichlorometano, el tetrafluorodichloroetano y el 1,1-difluoroetano, vendido especialmente bajo la denominación comercial DYMELE 152 A por la sociedad DUPONT. También se pueden utilizar como agente propulsor el gas carbónico, el protóxido de nitrógeno, el nitrógeno o el aire comprimido.

La composición que contiene el o los principios activos desodorantes y el o los agentes propulsores puede encontrarse en el mismo compartimento o en compartimentos diferentes en el recipiente aerosol. Según la invención, la concentración de agente propulsor varía generalmente del 5 al 95% en peso presurizado y más

preferiblemente del 50 al 85% en peso con respecto al peso total de la composición presurizada.

5 El medio de distribución, que forma una parte del dispositivo aerosol, está generalmente constituido por una válvula de distribución accionada por un cabezal de distribución, que a su vez tiene un conducto por el cual se vaporiza la composición aerosol. El recipiente que contiene la composición presurizada puede ser opaco o transparente. Puede ser de vidrio, de material polimérico o de metal, recubierto eventualmente por una capa de barniz protector.

10 La presente invención tiene igualmente por objeto un procedimiento cosmético para tratar los olores axilares humanos, consistente en aplicar sobre la superficie axilar una cantidad eficaz de una composición tal como se ha definido anteriormente.

Los ejemplos siguientes sirven para ilustrar la presente invención.

15 **I/ Comparación de la actividad desodorante de la asociación pidolato de zinc/sal de aluminio con respecto a las asociaciones triclosán/sal de aluminio y ricinoleato de zinc/sal de aluminio.**

Protocolo de la prueba de eficacia desodorante

20 Se efectúan recogidas de sudor axilar en sauna de 6 voluntarios y las muestras de sudor individual, conservadas en hielo durante varias horas, son entonces prácticamente inodoras. Se mezclan después y se reparten en alícuotas de 1 ml. Se añaden los principios activos a estas alícuotas y se incuban luego en la estufa a 37°C. A las 24 horas de incubación, un jurado de expertos evalúa la intensidad del olor en comparación con una muestra de control: 1 ml de sudor incubado sin adición de principio activo.

25 Se expresan los resultados en % de variación de la intensidad del olor en comparación con esta muestra de sudor control (media de los % de variación a T 24 h).

Principios activos estudiados	Cantidad estudiada (mg MA/ml de sudor)	% de disminución de la intensidad del olor
ACH	0,1 mg MA	-37%
(A)	0,1 mg MA	-47%
(B)	0,4 mg MA	-49%
(C)	0,3 mg MA	-4%
ACH + (A)	0,2 mg MA	-72%
ACH + (B)	0,5 mg MA	-46%
ACH + (C)	0,4 mg MA	-38%

ACH: Clorhidrato de aluminio (Micro Dry - Reheis)

(A): Pidolato de zinc (Govobio G Zn - Seppic)

(B): Triclosán (CIBA)

(C): Ricinoleato de zinc (Grillo Werke)

30 Se constata que la adición del pidolato de zinc a la sal de aluminio da lugar a un aumento substancial del efecto de disminución de la intensidad del olor, contrariamente a la adición del Triclosán y a la del ricinoleato de zinc a la misma sal de aluminio.

Principios activos estudiados	Cantidad estudiada (mg MA/ml de sudor)	% de disminución de la intensidad del olor
ACH	0,2 mg MA	-47%
(A)	0,2 mg MA	-47%
0,1 mg ACH+ 0,1 mg (A)	0,2 mg MA	-72%

Se constata que la asociación pidolato de zinc/sal de aluminio en una cantidad de principio activo total de 0,2 mg da lugar a un aumento substancial del efecto de disminución de la intensidad del olor con respecto a cada principio activo utilizado solo en la misma cantidad. Se observa, pues, una sinergia de la eficacia desodorante.

5 **II/ Prueba de microbiología: actividad poco bactericida del pidolato de zinc con respecto al Triclosán**

Protocolo:

10 La prueba aquí descrita permite la determinación cuantitativa de la actividad bactericida de una composición sobre gérmenes en condiciones óptimas de crecimiento, a saber, gérmenes del tipo *Corynebacterium xerosis* (Colección del Instituto Pasteur n° 5216); *Staphylococcus hominis* (Colección del Instituto Pasteur n° 81 57) y *Brevibacterium epidermidis* (Colección del Instituto Pasteur n° 102110 ) cultivados sobre agar Triptocaseína soja inclinado. La víspera de la prueba, se depositan en un pildorero 32 g de caldo Triptocaseína soja y se pone a incubar a 35°C. El día de la prueba, se añaden 4 g de la composición de ensayo y se homogeneiza en el Vórtex.

15 Se prepara un control de crecimiento sin producto en las mismas condiciones con el fin de verificar que los gérmenes están en condiciones de crecimiento favorables durante toda la duración de la prueba.

20 Para la preparación del inóculo, cinco días antes del comienzo de la prueba se practica un pase de las dos cepas bacterianas a medio apropiado. Se incuba durante 5 días a 35°C. El día de la prueba, se lava el cultivo inclinado con aproximadamente 9 ml de diluyente. La suspensión obtenida tiene un título de 108 gérmenes/ml (se efectúa un recuento). Se introducen 4 ml de inóculo en el pildorero, lo que corresponde a una tasa de 107 bacterias por gramo de preparación. Se pone el pildorero en una incubadora-agitadora (35°C - 200 RPM).

25 Después de cada tiempo de contacto (2, 4, 6 y 24 horas), se homogeneiza el contenido del pildorero en el Vórtex. Se efectúan diluciones decimales. Se deposita en la superficie de placas de Petri de agar (medio Eugon LT 100). Se incuban las placas de Petri durante 6 a 7 días en la estufa a 35°C.

30 Se procede al recuento de las colonias sobre las placas que contienen más de 20 y menos de 200 colonias.

35 resultados idénticos: nula,  
 1 Log de reducción: baja,  
 2 Log de reducción: media,  
 3 Log de reducción: buena,  
 ≥ 4 Log de reducción: excelente.

Se preparó, por una parte, una fórmula 1 con el pidolato de zinc y una fórmula 2 con el Triclosán; se seleccionaron los soportes de manera que fueran compatibles con el principio activo desodorante.

Ingredientes	Fórmula 1 (invención)	Fórmula 2 (técnica anterior)
Triclosán		0,1 g
Pidolato de zinc	1 g	
Polietilenglicol con 8 OE	16,8 g	6 g
Copolímero entrecruzado de ácido acrílico/acrilato de alquilo C <sub>10</sub> -C <sub>30</sub>	-	0,9 g
Hidróxido de sodio puro	-	cs (pH=7)
Agua desionizada microbiológicamente limpia	82,8 g	93,0 g

40 Se mide la actividad bactericida de cada una de las formulaciones 1 y 2 frente a las cepas *Corynebacterium xerosis*, *Staphylococcus hominis* y *Brevibacterium epidermidis* y se comparó con una fórmula sin principio activo (placebo). Los resultados obtenidos están resumidos en la tabla siguiente:

Composiciones	Eficacia a las 24 horas con respecto al gel sin principio activo		
	Cepas	<i>Corynebacterium xerosis</i> (CIP 5216)	<i>Staphylococcus hominis</i>
1 (invención)	Nula	Baja	Nula
2 (técnica anterior)	Excelente	/	/

5 Se observa que, en la fórmula 1, el pidolato de zinc utilizado a una concentración 10 veces mayor que la del Triclosán tiene una actividad antibacteriana baja o nula sobre las diferentes cepas estudiadas. Tiene, pues, un espectro de actividad bactericida sensiblemente menos amplio que el del Triclosán y respeta más la flora cutánea.

### III/ Comparación de la actividad desodorante de un aerosol anhidro a base de pidolato de zinc en asociación con una sal de aluminio con respecto a un aerosol a base de sal de aluminio - prueba *in vivo*

10 Se confirmó el mejoramiento de la eficacia desodorante del clorhidrato de aluminio en asociación con el pidolato de zinc *in vivo* sobre una fórmula aerosol anhidra antitranspirante. Se compara la fórmula 3 según la invención (asociación de un pidolato de zinc con un clorhidrato de aluminio en una razón ponderal de 1/9,5) con una fórmula 4 que no contiene más que una sal de aluminio (véase la tabla siguiente).

Ingredientes	Fórmula 3 (invención)	Fórmula 4 (técnica anterior)
Clorhidrato de aluminio (Micro Dry-Reheis)	5,25 g	5,25 g
Pidolato de zinc	0,50 g	-
Palmitato de isopropilo	0,90 g	0,90 g
Citrato de trietilo (Citroflex-Morflex)	1,05 g	1,05 g
Ciclopentasiloxano (DC245 -DOW CORNING)	5,56 g	5,56 g
Ciclopentasiloxano y dimeticonol (85,3/14,7) (DC1501 Fluid -DOW CORNING)	1,35 g	1,35 g
Estearalconio bentonita (Tixogel MP 250 - Sud Chemie Rheologicals United Catalysts Inc.)	0,39 g	0,39 g
Isobutano	85,00 g	85,00 g

15 Protocolo de la prueba de eficacia desodorante:

Se efectúan las pruebas sobre 30 voluntarios que tienen una intensidad de olor media y simétrica > 5 en una escala del 1 (intensidad imperceptible) al 9 (intensidad extremadamente fuerte).

20 Para cada voluntario, se trata una de las axilas en una sola aplicación mediante la formulación 3 y la otra mediante la fórmula 4.

25 La cantidad aplicada es de  $1,2 \pm 0,05$  g vaporizados a 15 cm de la axila. Se aplica el desodorante después de secar la axila.

Se efectúan las evaluaciones por medio de un "sniff test" directo de la intensidad del olor de transpiración y de lo desagradable que éste es, 24 horas después de 1 aplicación.

30 Se evalúa la eficacia desodorante por los dos criterios siguientes:

(1) la intensidad del olor de transpiración (escala del 1: intensidad imperceptible al 9: intensidad extremadamente



fuerte); cuanto más bajo es el valor, menos fuerte es el olor

(2) el valor hedónico (escala del 1: olor extremadamente desagradable al 9: extremadamente agradable); cuanto más elevado es el valor, menos desagradable es.

- 5 Se mide la variación de la intensidad del olor de la fórmula 3 según la invención que contiene la asociación pidolato de zinc/sal de aluminio con respecto a la de la fórmula 4 que no contiene pidolato de zinc:

$$\% \text{ de variación} = (\text{valor de la fórmula 3} - \text{valor de la fórmula 4}) \times 100 / \text{fórmula 4}$$

Variación de la intensidad del olor	Variación del valor hedónico
-14%	+9%

- 10 A las 24 h de la aplicación, los datos permitieron poner en evidencia una disminución significativa de la intensidad del olor axilar y un aumento significativo del valor hedónico, y por lo tanto una disminución del desagrado para la axila tratada mediante la fórmula 3 según la invención que contiene la asociación pidolato de zinc/sal de aluminio con respecto a la fórmula 4 que no contiene pidolato de zinc.

15 **Ejemplos 5 y 6: Barras desodorantes**

Ingredientes	Fórmula 5 (según el ejemplo 1.5 de la solicitud WO 01/99376)	Fórmula 6 (invención)
Ciclopentasiloxano (DC245 –DOW CORNING)	23 g	32 g
Estearato de hexildecilo (Eutanol G16 S - COGNIS)	15 g	/
PPG-14 butil éter (Ucon Fluid AP-Amerchol)	5 g	10 g
Aceite de ricino hidrogenado (Cutina HR-Cognis)	6 g	4 g
Alcohol cetearílico (Lanette O-Cognis)	8 g	/
Alcohol cetearílico/Cetareth-30 80/20 (Sinnowax AO-Cognis)	15 g	/
Talco	8 g	2 g
Clorhidrato de aluminio (Micro Dry - Reheis)	20 g	20 g
Pidolato de zinc	0,05 g	1 g
Alcohol estearílico	/	14 g
Diestearato de PEG-8 (Distearate de PEG 400-Stéarines Dubois)	/	2 g
Benzoato de alquilo C <sub>12-15</sub> (Finsolv TN- Witco)	/	15
	100	100

- 20 Se calienta el ciclopentasiloxano a 65°C. Se añaden los otros ingredientes (uno a uno) permaneciendo a 65-70°C. Se homogeneiza el conjunto (solución transparente) durante 15 minutos. Se añaden los dos principios activos desodorantes y el talco. Se enfría a aproximadamente 55°C (varios grados Celcius por encima del espesamiento de la mezcla) y se vierte en las barras. Se pone a 4°C durante 30 minutos.

Se mide según la prueba descrita a continuación el depósito de residuo blanco de los ejemplos 3 y 4 después de su

aplicación.

Protocolo

5 Se realiza la medición en un aparato de tipo Minolta CR300. Se aplican los productos por frotamiento de ida y vuelta hasta obtener aproximadamente 1 g de producto por 40 cm<sup>2</sup> sobre un papel negro de tipo Canson de hoja de color medio. Se realiza la medición inmediatamente después de la aplicación. Se hace una media de dos medidas.

10 Se mide un delta L:  $\Delta L = L^* \text{ producto} - L^* \text{ referencia}$ .

L\* referencia del papel negro de tipo Canson de hoja de color medio: L\* referencia = 19,45,

Se estima que un producto es blanqueante y no cosméticamente aceptable para un  $\Delta L$  superior a 35.

15 Los resultados obtenidos están resumidos en la tabla siguiente:

Composición	$\Delta L$
5 (técnica anterior)	35
6 (invención)	6

20 Se constata que la composición 5 según la técnica anterior que contiene la asociación pidolato de zinc/clorhidrato de aluminio en una razón 1/400 produce una tasa elevada de residuo blanco sobre el sustrato, mientras que la composición 6 según la invención produce un residuo blanco muy débil comparable a las barras desodorantes actualmente en el mercado, tales como los productos comerciales "Lady Speed Stick - Clean Glide" de Colgate o "Secret Clear Dry" de Procter & Gamble.

25 **Ejemplo 7: Roll-on (emulsión)**

Fase	Ingredientes	Fórmula 7
A	Clorhidrato de aluminio (solución al 50%) (Chlorhydrol 50% USP)	40 g
	Pidolato de zinc	4 g
B	Steareth-21 (Brij 721-ICI)	2 g
	Steareth-2 (Brij 2 - ICI)	2 g
	Estearato de Steareth-5	1 g
	PPG-15 estearil éter (Arlamol E - ICI)	1,5 g
	Ciclopentasiloxano (DC245 -DOW CORNING)	3,5 g
C	Agua	47 g
		100 g

30 Se calientan las fases (B) y (C) por separado a 70°C. Se mezclan (B) y (C) bajo agitación Turax durante 5 min. y se enfría después a 55°C bajo aspa. Se añade A suavemente agitando. Se homogeneiza durante 1 a 3 minutos. Se enfría a 35°C bajo agitación. La fórmula es estable durante 2 meses a 45°C.

Se mide la tasa de residuo blanco según la misma prueba descrita en los ejemplos 3 y 4. Se obtiene un  $\Delta L$  igual a 2.

**Ejemplo 8: Spray no aerosol (emulsión obtenida por inversión de fase)**

Ingredientes	Fórmula 8
Clorhidrato de aluminio (solución al 50%) (Chlorhydrol 50% USP)	20 g
Pidolato de zinc	3 g

Isononanoato de cetearilo (y) alcohol cetearílico (y) Ceteareth-20 (y) glicerina (y) estearato de glicerilo (y) Ceteareth-12 (y) palmitato de cetilo (Emulgade CM - Cognis)	15 g
Agua	63 g
	100 g

Se solubiliza el pidolato en agua y se añade al Emulgade CM bajo agitación moderada. Se añade la solución de sal de aluminio bajo agitación moderada. La fórmula es estable durante 2 meses a 45°C. Se mide la tasa de residuo blanco según la misma prueba descrita en los ejemplos 5 y 6. Se obtiene un  $\Delta L$  igual a 0.

5

**Ejemplo 9: Aerosol**

Ingredientes	Fórmula 9
Estearalconio Bentonita (Tixogel MP 250 - Sud Chemie Rheologicals United Catalysts Inc.)	0,5 g
Clorhidrato de aluminio (Micro Dry - Reheis)	7 g
Pidolato de zinc	1 g
Benzoato de alquilo C <sub>12-15</sub> (Finsolv TN - Witco)	3 g
Isobutano	80 g
Citrato de trietilo (Citroflex - Morflex)	1 g
Palmitato de isopropilo	1 g
Ciclopentasiloxano (DC245 - DOW CORNING)	6,5 g
	100 g

10 Se introducen los solventes y la arcilla modificada hidrofóbica y se agita después en el Turax hasta la homogeneización. Se añaden entonces la sal de aluminio (antitranspirante) y el pidolato de zinc agitando al mismo tiempo. Se introduce luego el propulsor de forma clásica. Se mide la tasa de residuo blanco según la misma prueba descrita en los ejemplos 5 y 6. Se obtiene un  $\Delta L$  igual a 4 para la fórmula 7.

## REIVINDICACIONES

1. Composición cosmética desodorante, que contiene al menos:
- 5 a) pidolato de zinc y  
b) al menos, a modo de sal de aluminio antitranspirante, clorhidrato de aluminio en forma activada o no activada, yendo la razón ponderal pidolato de zinc/sal de aluminio de 1/20 a 5/1.
- 10 2. Composición según la reivindicación 1, donde la sal de aluminio antitranspirante está presente en cantidades que van del 0,5 al 25% en peso con respecto al peso total de la composición.
- 15 3. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, donde el pidolato de zinc puede estar presente en cantidades que van del 0,05 al 10% en peso y más preferiblemente del 0,1 al 5% en peso con respecto al peso total de la composición.
- 20 4. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, **caracterizada por** presentarse en forma de loción, de crema o de gel fluido distribuido en spray aerosol, en frasco bombeador o en roll-on, en forma de crema o de gel distribuido en tubo o en rejilla, o en forma de bastoncillo (barra).
- 25 5. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada por** tener al menos una fase acuosa.
6. Composición según la reivindicación 5, **caracterizada por** presentarse en forma de loción acuosa, en forma de emulsión de agua-en-aceite o de aceite-en-agua o en forma de emulsión múltiple.
7. Composición según la reivindicación 6, donde la fase acuosa contiene agua y uno o más solventes solubles o miscibles en agua.
- 30 8. Composición según la reivindicación 6, donde los solventes solubles o miscibles en agua son seleccionados entre los monoalcoholes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, los dioles y los polioles.
9. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, **caracterizada por** ser anhidra.
- 35 10. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, **caracterizada por** tener al menos una fase líquida orgánica no miscible en agua.
- 40 11. Composición según la reivindicación 10, en la cual la fase líquida orgánica contiene uno o más aceites emolientes siliconados o hidrocarbonados, volátiles o no volátiles.
- 45 12. Composición según la reivindicación 11, en la cual los aceites emolientes están presentes en cantidades que van del 1 al 50% en peso y más preferiblemente del 5 al 40% en peso con respecto al peso total de la composición.
13. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, **caracterizada por** contener además uno o más principios activos desodorantes adicionales.
- 50 14. Composición según la reivindicación 13, **caracterizada por** contener además uno o más agentes bacteriostáticos o agentes bactericidas.
15. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, **caracterizada por** contener además uno o más agentes de suspensión.
- 55 16. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, **caracterizada por** contener además al menos un polvo orgánico.
- 60 17. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, **caracterizada por** contener además al menos un aditivo cosmético seleccionado entre las ceras, los suavizantes, los antioxidantes, los opacificantes, los estabilizantes, los agentes hidratantes, las vitaminas, los perfumes, los bactericidas, los conservantes, los polímeros, los perfumes, los agentes espesantes y los agentes propulsores.
18. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 10 a 17, **caracterizada por** contener además uno o más agentes estructurantes o gelificantes de la fase líquida orgánica no miscible en agua.
19. Dispositivo aerosol constituido por:

(A) un recipiente que contiene una composición desodorante tal como se ha definido según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18;  
(B) al menos un agente propulsor y un medio de distribución de dicha composición aerosol.

5 20. Procedimiento cosmético para tratar los olores axilares humanos, consistente en aplicar sobre la superficie axilar una cantidad eficaz de una composición tal como se ha definido según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18.

21. Utilización de la asociación del pidolato de zinc y del clorhidrato de aluminio en forma activada o no activada en una razón ponderal que va de 1/20 a 5/1 como principio activo desodorante en una composición cosmética.