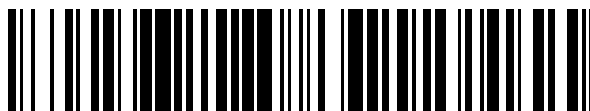


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 387 636**

51 Int. Cl.:

A61K 8/19 (2006.01)

A61K 8/26 (2006.01)

A61K 8/365 (2006.01)

A61Q 15/00 (2006.01)

A61Q 17/00 (2006.01)

A61K 8/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **09776998 .8**

96 Fecha de presentación: **07.07.2009**

97 Número de publicación de la solicitud: **2313059**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **27.04.2011**

54 Título: **Preparados cosméticos con plata pasivada**

30 Prioridad:
08.07.2008 DE 102008031927

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
27.09.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
27.09.2012

73 Titular/es:
**Beiersdorf AG
Unnastrasse 48
20253 Hamburg, DE**

72 Inventor/es:
**MAURER, Peter;
VOGT, Melanie;
URBAN, Michael;
TRAUPE, Bernd;
BIEL, Stefan;
WEINERT, Katrin y
WINDISCH, Björna**

74 Agente/Representante:
Isern Jara, Jorge

ES 2 387 636 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

Preparados cosméticos con plata pasivada

5 La presente invención se refiere a preparados cosméticos o dermatológicos exentos de agua que llevan complejos hidrosolubles de citrato de plata-ácido cítrico en combinación con agentes pasivantes escogidos del grupo de los filosilicatos. El preparado se puede pulverizar como aerosol e incluye especialmente uno o más principios activos antitranspirantes.

10 Es suficientemente conocido el uso de plata como agente desinfectante en el tratamiento de heridas, en aparatos médicos y en preparados farmacéuticos y cosméticos.

15 Al contrario que las disoluciones acuosas de sales de plata solubles (p.ej. nitrato de plata o acetato de plata), en el caso de las disoluciones coloidales acuosas de plata se trata de dispersiones líquidas de plata elemental o de dispersiones líquidas de compuestos complejos de plata poco solubles. Los materiales de partida dispersables en agua solo contienen trazas de iones plata.

20 La plata, como otros metales nobles, forma disoluciones coloidales relativamente estables con agua como agente dispersante. Para preparar disoluciones coloidales de plata hay diferentes métodos. En ellas la plata se encuentra en estado elemental. En el coloide de dispersión se observan tamaños de partícula entre 1 y 100 nm, casi siempre entre 10 y 50 nm.

La cuestión estriba en preparar plata no coloidal.

25 La patente EP 1128824 describe unos compuestos de plata no coloidales, con iones plata libres en combinación con agua y un agente complejante exento de tioles, que puede elegirse entre aminoácidos y/o hidroxiácidos como lisina o ácido mandélico.

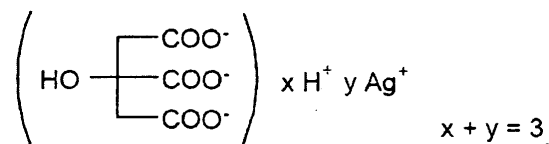
30 La patente US 20050266081 describe unos hidrogeles antimicrobianos que contienen sales de plata, arcillas como reguladores de viscosidad y electrolitos. Como sales de plata, aparte de los preferidos lactatos de plata, también se mencionan los citratos de plata. Como arcillas se citan, entre otras, los minerales monoclinicos de arcilla similares a la montmorillonita. Los hidrogeles contienen al menos 70% de agua.

35 Como es de esperar, en los preparados acuosos las arcillas mencionadas sirven para regular la viscosidad. No se describen preparados exentos de agua o con un contenido máximo de agua del 5% en peso.

La patente WO 2006029213 A1 describe compuestos de citrato de plata de acción antimicrobiana. Esos compuestos de plata estabilizados en ácido cítrico acuoso pueden adquirirse en el comercio como TINOSAN® SDC.

40 En la patente EP 1041879 A1 se describe la preparación de estos compuestos mediante un proceso electroquímico. Los TINOSAN® SDC comprenden iones plata (Ag⁺) generados electroquímicamente, pero en la mezcla no hay plata coloidal.

45 Los TINOSAN® SDC comprenden esencialmente un complejo hidrosoluble de citrato de plata-ácido cítrico de forma:



50 con un contenido aproximado de 80% de agua, 20% de ácido cítrico y 2280 - 2640 ppm (aproximadamente 0,25%) de plata.

El citrato de plata descrito en las patentes WO 2006029213 A1 y EP 1041879 A1 (TINOSAN® SDC) se puede usar con distintos aditivos en composiciones cosméticas acuosas y/o basadas en emulsiones. Concretamente, en la patente WO 2006029213 A1 se describen desodorantes en combinación con Tinosan® SDC.

55 Los ejemplos de preparados descritos en la patente WO 2006029213 A1 son principalmente acuosos.

Aunque en la patente WO 2006029213 se cita de manera general la posibilidad de aplicar por pulverización, a este respecto solo se mencionan espráis de desinfección acuosos, lo cual no parece sorprendente, teniendo en cuenta los problemas descritos en relación con los aerosoles acuosos de antitranspirantes.

60 El empleo de compuestos de plata disueltos en agua resulta problemático debido a la corrosión de los medios de almacenamiento metálicos, como por ejemplo los botes de aerosol. Este efecto se ve reforzado por la presencia de

compuestos que favorecen la corrosión, como por ejemplo las sales ácidas de aluminio y/o de aluminio/circonio. Además al contacto con el agua se atascan a menudo las válvulas de los aerosoles y en otras formas de aplicación cosméticas se producen aglutinaciones, inestabilidades e inhomogeneidades.

5 Otro problema de las mezclas acuosas puede surgir al usar perfume hidrosoluble encapsulado. En presencia de agua estos perfumes encapsulados se pueden hinchar, aglutinar y reaccionar descomponiéndose.

10 Por lo tanto es deseable proporcionar preparados cosméticos o dermatológicos que permitan la administración en forma de aerosol de compuestos de plata de acción antimicrobiana disueltos en agua, partiendo de un entorno propiamente hidrófobo.

Los problemas se resuelven mediante un preparado cosmético o dermatológico en forma de aerosol, conforme a la presente invención, según la reivindicación 1.

15 Además el preparado lleva preferiblemente uno o más principios activos antitranspirantes.

20 Preparado exento de agua significa, según la presente invención, que además del agua contenida en el complejo de plata – hasta 90% en peso respecto a la masa total del complejo – puede incluir agua adicional hasta una proporción aproximada del 5% en peso respecto a la masa total del preparado. Exento de agua significa preferiblemente una proporción máxima del 2% en peso, sobre todo del 0% en peso, respecto a la masa total del preparado.

Además del agua introducida mediante el complejo de citrato de plata-ácido cítrico el preparado lleva como máximo un 5% en peso de agua adicional respecto a la masa total del preparado.

25 Con un contenido preferido de aproximadamente 5% en peso, como máximo, del complejo de citrato de plata y un contenido máximo del 90% en peso de agua incluida en dicho complejo, el preparado de la presente invención lleva por tanto, preferiblemente, un máximo de 4 – 5% en peso de agua, que puede provenir del complejo. Además el preparado admite como máximo un 5% en peso más de agua, sin que se produzcan problemas como los conocidos del estado técnico.

30 Así pues, el preparado puede contener un máximo de 10% en peso de agua, entre la aportada por el complejo y la que llevan otros componentes del preparado o la añadida como complemento, sin que haya merma de las ventajas del preparado de la presente invención descritas a continuación. A pesar de este posible contenido de agua, el preparado de la presente invención se considera exento de ella. Las ventajas se exponen a continuación.

35 El complejo de citrato de plata-ácido cítrico hidrosoluble de la presente invención se puede escoger respectivamente entre los complejos descritos en las patentes WO 2006029213 A1 y EP 1041879 A1. El contenido revelado en estos documentos también lo es íntegramente de la presente invención.

40 El complejo de plata ahí descrito, que también puede adquirirse comercialmente como TINOSAN® SDC, permite según la presente invención preparar plata no coloidal.

45 La presente invención permite usar este citrato de plata acuoso de acción antimicrobiana en un entorno donde, tal como se ha explicado antes, la presencia de agua suele causar problemas de inestabilidad y almacenamiento. Por ejemplo, el uso del complejo acuoso de citrato de plata en preparados de aerosol contenidos en envases metálicos sería crítico, porque el agua puede corroer el bote de metal o piezas de las válvulas, p.ej. los muelles. Este efecto se acentúa con la presencia de compuestos que favorecen la corrosión, como por ejemplo las sales ácidas de aluminio y/o de aluminio/circonio, que son habituales en los preparados antitranspirantes (preparados AT).

50 Tampoco se encuentra en el estado técnico ningún caso en que el citrato de plata acuoso esté envasado en recipientes metálicos o en contacto con piezas de metal.

55 Asimismo es sabido que al extraer el agua del complejo de citrato de plata, ésta precipita enseguida y no puede desplegar su acción antimicrobiana. Por tanto la simple extracción del agua no es ninguna solución. Ahora, con la presente invención también se resuelve este problema.

Según la presente invención el agua aportada con el complejo de citrato de plata, y también el agua ocasionalmente añadida (máx. 5% en peso), es complejada y ligada por el agente pasivante.

60 El agua aportada por el complejo se une al agente pasivante y por tanto ya no está disponible para causar un efecto perjudicial.

65 Los agentes pasivantes del tipo de los filosilicatos son disilicatos sódicos poliméricos cristalinos que se emplean como coadyuvantes multifuncionales alternativos al trifosfato pentasódico o como complemento de los sistemas potenciadores de zeolita, principalmente en formulaciones de detergentes.

- Es sabido que los filosilicatos pueden actuar como intercambiadores iónicos, fijando los que producen la dureza del agua (iones Ca y Mg), y como soportes alcalinos, tampones y agentes anticorrosivos. Según la presente invención los filosilicatos se eligen entre los minerales arcillosos del grupo formado por montmorillonita, nontronita, hectorita, saponita, sauconita, beidellita, alleverdita, illita, halloisita, attapulgita y/o sepiolita. Se prefiere la disteardimonio-hectorita. Las hectoritas - $M_{0,3}^+(Mg_{2,7}Li_{0,3})[Si_4O_{10}(OH)_2]$, donde M^+ casi siempre = Na^+ - son minerales arcillosos monoclinicos pertenecientes al grupo de las esmectitas y análogos a la montmorillonita.
- 5 Aquí cabría esperar otro problema.
- 10 Debido a la extracción de agua por el filosilicato, el citrato de plata se queda sin agua y por tanto precipita.
- Contrariamente a los resultados esperados, en la presente invención se ha demostrado que este agente pasivante retiene el agua del complejo de citrato de plata, sin que se produzcan fenómenos concomitantes negativos tales como corrosión, etc., ni tampoco la precipitación de la sal de plata disuelta. Es decir, a pesar de la extracción del agua mediante la unión al agente pasivante, la plata no precipita y queda disponible como agente antimicrobiano.
- 15 Sorprendentemente la plata pasivada de este modo en la formulación se disuelve de nuevo en presencia de agua adicional, como la procedente de la humedad de la piel o del sudor, y entonces puede volver a desplegar su acción antimicrobiana. Es decir, cuando se dispensa el preparado con un bote metálico, en el cual el agua es perjudicial, un aporte de agua tras la aplicación, p.ej. mediante el sudor, da como resultado que la plata pueda actuar libremente.
- 20 Para la plata pasivada con filosilicatos este efecto se consigue especialmente en presencia de sudor, pues los iones sodio que contiene ayudan a desalojar la plata de los sitios de unión al filosilicato.
- 25 La pasivación del citrato de plata mediante los filosilicatos pasivantes produce por consiguiente un preparado en el cual el agua del complejo de citrato de plata no puede tener ningún efecto negativo y a la vez está disponible para estabilizar el citrato de plata.
- Se ha demostrado que la plata también se integra en los filosilicatos. A pesar de ello el efecto antimicrobiano no se pierde y se reactiva al liberarse la plata en contacto con agua.
- 30 Este mecanismo de acción según la presente invención es ventajoso para desodorantes o antitranspirantes, por ejemplo, porque la acción antimicrobiana del citrato de plata solo tiene lugar por efecto del sudor, en el lugar donde es secretado.
- 35 La combinación de la presente invención es por tanto especialmente ventajosa para preparados de aerosol, porque el agua del citrato de plata se usa para activar los filosilicatos y es fijada por ellos. Mediante este proceso especial el citrato de plata mantiene una envoltura de hidratación suficiente para seguir en forma no coloidal, es decir, con actividad antimicrobiana, excluyendo a la vez los desagradables efectos secundarios. De esta manera se conserva la efectividad antimicrobiana del citrato de plata, como p.ej. el rendimiento del desodorante, aunque el principio activo del desodorante y el agua que lo disuelve se unen estrechamente con los filosilicatos.
- 40 En el estado técnico los filosilicatos suelen activarse antes de usarlos, es decir, se convierten en una forma capaz de esponjarse, tratándolos con un líquido polar y elevadas fuerzas de cizalladura. Para los aerosoles antitranspirantes (AT) exentos de agua se usa p.ej. carbonato de propileno, etanol, dipropilenglicol, como líquidos polares. Según la presente invención puede prescindirse de esta activación. Ahora, según la presente invención, la activación se produce mediante la intervención de la solución acuosa del complejo de citrato de plata. La activación del filosilicato se puede optimizar ventajosamente añadiendo perfume y el disolvente que contiene. Así se activan los filosilicatos y se produce un aumento de viscosidad de todo el preparado; como consecuencia los filosilicatos y otros ingredientes dispersos, como los agentes AT, sedimentan con menos facilidad, es decir más lentamente. Toda el agua contenida está unida al filosilicato y no puede provocar efectos negativos (corrosión, aglutinación de cápsulas de perfume, etc.). Además, sorprendentemente, la propia plata se integra en los filosilicatos y solo se libera efectivamente sobre la piel cuando entra en contacto con el sudor.
- 45 Un proceso de elaboración convencional consistente en incorporar mediante intenso cizallamiento el principio activo desodorante - un complejo de plata acuoso - después de activar los filosilicatos tiene los inconvenientes conocidos, pues en este caso los sitios de unión de los filosilicatos están ocupados por otros componentes de la formulación y ya no quedan disponibles en cantidad suficiente para las moléculas de agua de la solución del citrato de plata.
- 50 La importancia de los distintos procesos de activación y pasivación se puede demostrar con pruebas de filtración. En el ejemplo siguiente se preparó una solución de principio activo con contenido de AT, exenta de agua, de manera convencional (fig. 1) y según el tipo de la presente invención (fig. 2), y tras un periodo de almacenamiento se filtró al vacío a través de un filtro de 200 μm .
- 60 La fig. 1 muestra muy claramente que en la preparación convencional se forman unos aglomerados grandes no homogéneos, lo cual tiene como desventaja la posible obturación de las válvulas de los aerosoles y/o una descarga
- 65

irregular del producto envasado. Además la descarga de tales aglomerados puede producir una sensación cutánea negativa y dejar restos sobre la piel y la ropa.

5 La fig. 2 muestra que en la preparación según la presente invención, es decir la mezcla directa del complejo acuoso de citrato de plata con el agente pasivante sin su activación previa, se evita la formación de dichos aglomerados y por tanto los citados inconvenientes.

10 La combinación de complejo de citrato de plata y pasivante según la presente invención permite elaborar preparados cosméticos o dermatológicos que solo pueden desplegar localmente el efecto antimicrobiano deseado por adición de agua externa (p.ej. mediante el sudor).

15 La presente invención también tiene la ventaja de que el preparado puede contener el agua del complejo de citrato de plata y un máximo de 5% en peso de agua adicional, y actuar prácticamente como si estuviera exento de agua, porque ésta, como se ha dicho antes, está ligada y no puede ejercer ningún efecto negativo sobre el entorno u otros componentes.

20 Los antitranspirantes o desodorantes cosméticos sirven para eliminar el olor corporal debido a la descomposición por microorganismos del sudor recién secretado – de por sí inodoro. Los desodorantes cosméticos usuales se basan en diversos principios activos.

En el lenguaje usual no hay generalmente una distinción clara entre los términos “desodorante” y “antitranspirante”. De hecho – también sobre todo en el ámbito de habla alemana – se denominan en general desodorantes o “deos” los productos que se aplican en la axila, independientemente de que también tengan efecto antitranspirante.

25 Los antitranspirantes (AT) son productos inhibidores del sudor, que al contrario que los desodorantes – que evitan en general una descomposición microbiana del sudor ya formado – impiden absolutamente su secreción.

30 La deseada minimización de la secreción del sudor puede tener lugar mediante diversos mecanismos. Entre ellos cabe citar el uso tradicional de astringentes, que provocan precipitaciones de albúmina y coagulaciones y por tanto un estrechamiento o cierre de la glándula sudorípara.

Los nuevos tipos de sustancias activas AT se basan, por ejemplo, en el principio de los anticolinérgicos, los cuales interrumpen los estímulos nerviosos que producen el aumento de secreción de las glándulas sudoríparas.

35 Otro principio en el que se basan los nuevos tipos de sustancias activas AT es la interferencia en los procesos de transporte de membrana en la célula. Así los inhibidores específicos de las aquaporinas inhiben las proteínas que forman los canales en la membrana celular para facilitar el paso del agua y de otras moléculas. Los inhibidores de canales iónicos también interfieren en los procesos de transporte de membrana y ósmosis. Otro nuevo mecanismo de acción de los AT se puede realizar empleando díodos vecinales de cadena corta y se debe probablemente a su actividad osmótica.

Así pues, si se usa un agente que no tiene ninguna influencia en la secreción de sudor, es decir que no tiene lugar ningún efecto antitranspirante, según la presente invención no se trata de un producto antitranspirante.

45 Por tanto según la presente invención son principios activos antitranspirantes aquellas sustancias que tienen una influencia en la secreción del sudor.

50 Al contrario que los antitranspirantes, los desodorantes puros no interfieren en la secreción del sudor, sino que simplemente controlan el olor corporal o axilar o influyen en él (productos que mejoran el olor). En este caso los mecanismos de acción corrientes son efectos antibacterianos como los que también muestra la plata no coloidal, la neutralización del olor (enmascaramiento), la intervención en los metabolismos bacterianos, la pura aromatización con perfumes, así como el uso de precursores de ciertos componentes perfumantes que por reacción enzimática se convierten en sustancias fragantes.

55 En la patente WO 2006029213 A2 se mencionan diversas formas de preparados cosméticos, como champús o incluso desodorantes, que se distinguen por tanto de los antitranspirantes comprendidos en la presente solicitud.

60 Además de los propios principios activos inhibidores del sudor (las sustancias activas AT) los preparados pueden contener sustancias que inhiben la degradación microbiana del sudor como p.ej. el triclosano. El triclosano actúa contra gérmenes Gram positivos y Gram negativos y también contra hongos y levaduras; por consiguiente tiene un efecto desodorante, pero ningún efecto antitranspirante, pues el impacto en la flota cutánea no puede afectar a la secreción del sudor.

65 En el caso concreto de los antitranspirantes basados en sales de aluminio se puede renunciar, si ha lugar, a la adición de otras sustancias puramente desodorantes, pues dichos compuestos aluminicos tienen de por sí potencial antimicrobiano. Además la reducida disponibilidad de agua debida a la menor secreción de sudor también inhibe el

crecimiento bacteriano.

Las sustancias antitranspirantes según la presente invención se pueden escoger concretamente entre

- 5 1. Principios activos AT clásicos, sobre todo sales metálicas, especialmente de aluminio, con preferencia:
- clorhidrato de aluminio (ACH) y clorhidrato de aluminio activado (ACH' o AACH)
 - sesquiclorhidrato de aluminio (ASCH), diclorhidrato de aluminio (ADCH)
 - complejos de aluminio-circonio con contenido opcional de glicina (AZG), tri-, tetra-, penta-, octaclorhidrato de aluminio-circonio, tri-, tetra-, penta-, octaclorohidrex de aluminio-circonio GLY
- 10 asimismo:
- cloruro, sulfato de aluminio
 - alumbres (p.ej. alumbre amónico, alumbre potásico)
 - clorohidroxilactato sódico-alumínico y/o
- 15 2. Principios activos AT nuevos, exentos de aluminio, como, especialmente,
- anticolinérgicos, preferiblemente: compuestos de glicopiperolato como los que están descritos en la patente WO 2007141289 A1 y/o glicopirrolato
 - inhibidores de aquaporina
 - inhibidores del canal iónico, preferiblemente inhibidores de NKCC1 y/o
 - dioles vecinales de cadena corta como los que están descritos en la patente WO 2009007089 A2.

20 Como principio activo pueden incorporarse ventajosamente sales ácidas de aluminio y/o aluminio-circonio activadas. En el caso de los compuestos de aluminio se emplean ventajosamente complejos exentos de agua y en el de los compuestos de aluminio-circonio complejos exentos de agua y de tampones. Como tampón suele usarse glicina.

25 La siguiente relación de principios activos antitranspirantes no debe considerarse de ningún modo restrictiva:

Sales de aluminio (de fórmula molecular empírica $[Al_2(OH)_mCl_n]$, donde $m+n=6$):

- clorhidrato de aluminio $[Al_2(OH)_5Cl] \times H_2O$, complejos de Al estándar: Locron L, Locron LIC, Locron LIF (Clariant), Chlorhydrol (Reheis), ACH-303 (Summit), Aloxicoll L (Giulini). Complejos de Al activados: Reach 501 (Reheis), Aloxicoll 51 L
- sesquiclorhidrato de aluminio $[Al_2(OH)_{4,5}Cl_{1,5}] \times H_2O$, complejos de Al estándar: Aloxicoll 31L (Giulini), Westchlor 186 (Westwood Chemicals). Complejos de Al activados: Reach 301 (Reheis)
- diclorhidrato de aluminio $[Al_2(OH)_4Cl_2] \times H_2O$

35 Sales de aluminio-circonio:

- triclорohidrex de aluminio/circonio glicina $[Al_4Zr(OH)_{13}Cl_3] \times H_2O \times Gly$, complejos de Al/Zr estándar: Rezal 33GC (Reheis), AZG-7164 (Summit)
- tetraclorohidrex de aluminio/circonio glicina $[Al_4Zr(OH)_{12}Cl_4] \times H_2O \times Gly$, complejos de Al/Zr estándar: Rezal 36, Rezal 36G, Rezal 36 GC (Reheis), AZG-368 (Summit), Zirkonal L435G (Giulini), Westchlor ZR 35 BX5, Westchlor ZR 41 (Westwood Chemicals)
- pentaclorohidrex de aluminio/circonio glicina $[Al_8Zr(OH)_{23}Cl_5] \times H_2O \times Gly$, complejos de Al/Zr estándar: Rezal 67 (Reheis), Zirkonal L540, Zirkonal L530 PG (Giulini), Westchlor ZR 80B (Westwood Chemicals)
- octaclorohidrex de aluminio/circonio glicina $[Al_8Zr(OH)_{20}Cl_8] \times H_2O \times Gly$: Westchlor ZR 82B
- Reach AZP - 908 SUF tetraclorohidrex de aluminio/circonio Gly activado
- Reach AZZ - 902 SUF triclорohidrex de aluminio/circonio Gly activado

También pueden usarse ventajosamente sales de aluminio/circonio exentas de glicina.

50 Los antitranspirantes (AT) de la presente invención pueden reducir la formación de sudor y lo inhiben.

Con el uso del complejo antimicrobiano de citrato de plata en los preparados cosméticos se puede reducir la flora bacteriana sobre la piel. De esta manera se reducen eficazmente los microorganismos causantes del olor. No se altera propiamente el flujo del sudor, en caso ideal solo se detiene temporalmente la descomposición microbiana del sudor. Cuando se emplea el complejo de plata en los antitranspirantes, sí que se altera el flujo del sudor, pero no mediante el complejo de Ag, sino por efecto del agente AT.

Los principios activos antitranspirantes de los grupos anteriormente descritos se usan en las formulaciones de la presente invención en una cantidad del 1 hasta el 40% en peso, preferiblemente del 3 al 15% en peso, respecto a la masa total del preparado, es decir, incluyendo, dado el caso, los gases propelentes.

60 Empleando aproximadamente 35% en peso de AACH (clorhidrato de aluminio activado) en la solución de principio activo (sin gas propelente) y una relación de llenado de 15:85 aproximadamente (solución de principio activo a gas propelente) habrá un contenido aproximado de 5,25% en peso de AACH en el producto final.

65 Los agentes AT del grupo de los anticolinérgicos, como por ejemplo las sales de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)-oxi]-1,1-dimetil-piperidinio, sobre todo el bromuro de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)-oxi]-1,1-dimetil-piperidinio,

pueden añadirse en una proporción del 0,05 hasta el 1,0% en peso, preferiblemente del 0,1%-0,7%, sobre todo del 0,3%-0,5% en peso, respecto a la masa total del preparado.

5 Como agentes AT también se pueden incorporar a los preparados según la presente invención dioles vecinales y principios activos similares del grupo de las sustancias osmóticamente activas. En este caso, preferentemente, en una proporción del 10 al 50% en peso, preferiblemente del 15%-30%, sobre todo del 15-25%, respecto a la masa total del preparado.

10 Naturalmente también es posible agregar otros principios activos antitranspirantes y/o desodorantes.

Los pasivantes, especialmente la disteardimonio-hectorita, se añaden en una proporción del 1 al 10% en peso, sobre todo en un intervalo del 2 al 5% en peso, respecto a la masa total del preparado.

15 El complejo de citrato de plata, incluyendo el agua del complejo, se añade en una proporción máxima del 5% en peso, preferiblemente del 2% en peso, sobre todo del 0,1 al 2% en peso, respecto a la masa total de la mezcla de principios activos.

20 La mezcla de principios activos es igual al preparado; entonces, como aerosol, las proporciones se refieren, dado el caso, a la mezcla de principios activos sin gas propelente.

25 Los preparados de la presente invención se ofrecen preferentemente en envases de aerosol estándar. Sobre todo son adecuados para la pulverización a través de válvulas y atomizadores de AT estándar, pues ayudan a superar las desventajas de las obstrucciones. La ventaja de los preparados de la presente invención es por tanto que se puede prescindir de costosos envases especiales, como por ejemplo válvulas para polvo. Por su especial construcción o forma geométrica este tipo de válvulas es menos sensible a la obturación por partículas gruesas, pero su uso tiene en general la desventaja de que su forma especial requiere el uso extra de cabezales atomizadores adaptados, lo cual acarrea costes adicionales, así como una diversificación del surtido de envases y por tanto mayor complejidad logística.

30 Estos inconvenientes se evitan con la presente invención.

35 Otro problema resuelto por la presente invención es que cuando se usan al mismo tiempo perfumes hidrosolubles encapsulados – que en presencia de agua se hinchan, adhieren y descomponen – tampoco se observan dichos inconvenientes, porque el agua contenida en la solución de principios activos está unida al pasivante y por tanto es imposible cualquier interacción con la matriz de la cápsula.

40 A pesar de la presencia de agua (máximo 10% en peso (véase arriba)), cualquier material encapsulado soluble en agua para aceites perfumantes se puede combinar según la presente invención con soluciones acuosas de plata. Por tanto como material encapsulador se puede utilizar preferentemente almidón modificado (INCI: Sodium Starch Octenylsuccinate o Modified Starch).

Aquí también se manifiesta nuevamente la sorprendente ventaja del preparado de la presente invención, que a pesar de contener agua actúa globalmente como si estuviera exento de ella.

45 La cantidad empleada de cápsulas de perfume está comprendida ventajosamente en el intervalo del 0,3 – 0,8% en peso respecto a la masa total del preparado. Aquí se añade luego preferiblemente un 0,8 -1,2% en peso de aceite perfumante convencional (libre). Las cápsulas de perfume se componen preferentemente de un 40% de almidón-octenilsuccinato sódico, 10% de manitol y aproximadamente 50% de aceite perfumante. En la elección del aceite perfumante para la encapsulación se puede recurrir a fragancias básicas libres y también a la encapsulación de fragancias especiales, como por ejemplo acordes frescos.

50 La efectividad y la aceptación sensorial de los preparados cosméticos dérmicos dependen en gran medida de cada vehículo empleado. La elección adecuada de un sistema de soporte galénico es por tanto decisiva para el posterior uso y aplicación.

55 En formas de aplicación como los aerosoles los sistemas exentos de agua tienen un amplio uso. Es ventajosa su buena compatibilidad con los envases metálicos, así como su estabilidad microbiológica y física, especialmente en presencia de altas concentraciones de electrolitos, como es el caso de los agentes AT.

60 La ausencia de agua, que en los preparados cosméticos sirve a menudo de disolvente, obliga a usar sistemas de soporte alternativos. Estos sistemas se pueden preparar en forma de polvos, lo cual evidentemente puede ser una desventaja para la aplicación, para la adherencia a la piel (y por tanto para la duración del efecto) y también para la aceptación cosmética.

65 Por consiguiente, según la presente invención, el preparado comprende ventajosamente una matriz soporte lipófila, es decir, una fase continua que consta al menos de un soporte líquido aceitoso inmiscible con agua.

De manera sorprendente y preferida según la presente invención ha dado buenos resultados el uso de una matriz soporte lipófila que comprende ventajosamente uno o más componentes en estado líquido a temperatura ambiente, los cuales, en presencia de un agente AT, permiten formularlo en forma de dispersión fina. Mediante la adición de espesantes lipófilos, ceras y componentes sólidos a temperatura ambiente se puede ajustar ventajosamente la viscosidad o la consistencia del preparado a la correspondiente forma de aplicación.

Aparte de su mera función soporte, los componentes lipófilos también pueden disminuir los residuos blancos de los agentes AT, visualmente apreciables, y mejorar su adherencia a la piel. La mejor adherencia sobre la piel también es deseable para las sustancias aromáticas añadidas.

Los aceites soporte especialmente preferidos para la matriz lipófila deben escogerse entre las ciclometiconas, la parafina líquida, el PPG-14 butil-éter, los benzoatos de alquilo C12-15 y/o los triglicéridos caprílico/cápricos.

Es preferible elaborar un preparado cosmético o dermatológico en forma de aerosol que contenga, si es preciso, un principio activo antitranspirante y aceites soporte elegidos entre las ciclometiconas, la parafina líquida, el PPG-14 butil-éter, los benzoatos de alquilo C12-15 y/o los triglicéridos caprílico/cápricos.

Los preparados cosméticos y dermatológicos de la presente invención pueden contener sustancias auxiliares de tipo cosmético como las que se emplean corrientemente en tales preparados, p.ej. conservantes, bactericidas, filtros de UV, antioxidantes, vitaminas, sustancias minerales, partículas sólidas suspendidas, perfumes, antiespumantes, colorantes, pigmentos, espesantes, sustancias humectantes o hidratantes u otros componentes usuales en una formulación cosmética o dermatológica, como alcoholes, polioles, polímeros, estabilizadores de espuma o derivados de silicona.

Los siguientes ejemplos ilustran preparados de la presente invención. Las proporciones indicadas se refieren a la masa total del preparado o de la solución de principios activos.

Ejemplos:

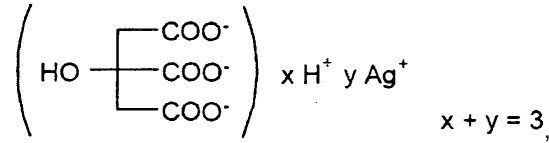
Antitranspirantes en aerosol

	1 % en peso	2 % en peso	3 % en peso
Octildodecanol	0,80	1,00	0,90
Acetato de tocoferilo	0,06	0,08	0,07
Dimeticona	2,34	3,20	3,10
Aceite de aguacate	0,10	0,15	0,10
Disteardimonio-hectorita	4,00	3,80	3,90
Ciclometicona	49,00	53,47	48,50
Clorohidrato de aluminio	35,00	33,00	37,00
Ácido cítrico / citrato de plata	0,70	0,30	0,10
Perfume	5,33	5,00	5,10
Almidón-octenilsuccinato sódico + manitol	2,67	0,00	1,23

Con gas propelente, preferiblemente butano/isobutano/propano y proporción de llenado 5:95 hasta 30:70, sobre todo 10:90 hasta 20:80, preferiblemente 15:85.

REIVINDICACIONES

5 **1.** Preparado cosmético o dermatológico en forma de aerosol, con un contenido máximo de agua del 10% en peso respecto a la masa total del preparado, que comprende uno o más complejos de citrato de plata-ácido cítrico de fórmula



10 con un contenido de hasta el 90% en peso de agua respecto a la masa total del complejo, en combinación con uno o más agentes pasivantes, caracterizado porque como agentes pasivantes se escogen minerales arcillosos del grupo constituido por montmorillonita, nontronita, hectorita, saponita, sauconita, beidellita, allevardita, illita, halloisita, attapulgita y/o sepiolita, y porque los agentes pasivantes están contenidos en una proporción del 1 hasta el 10% en peso respecto a la masa total del preparado.

15 **2.** Preparado según la reivindicación 1 que comprende además uno o más principios activos antitranspirantes.

3. Preparado según la reivindicación 2, caracterizado porque como principios activos antitranspirantes se eligen sales ácidas de aluminio y/o de aluminio/circonio.

20 **4.** Preparado según una de las reivindicaciones anteriores, que lleva perfume encapsulado con un material soluble en agua.

5. Preparado según la reivindicación 4, caracterizado porque como material de encapsulación se escoge el almidón-octenilsuccinato sódico.

25 **6.** Preparado según la reivindicación 1 que comprende disteardimonio-hectorita como agente pasivante.

7. Preparado según una de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los filosilicatos se usan sin activar.

30 **8.** Preparado según una de las reivindicaciones anteriores, que comprende una matriz soporte lipófila.

9. Preparado según la reivindicación 8, caracterizado porque como matriz soporte lipófila se eligen aceites del grupo formado por las ciclometiconas, la parafina líquida, el PPG-14 butil-éter, los benzoatos de alquilo C12-15 y/o los triglicéridos caprílico/cápricos.

35



Figura 1

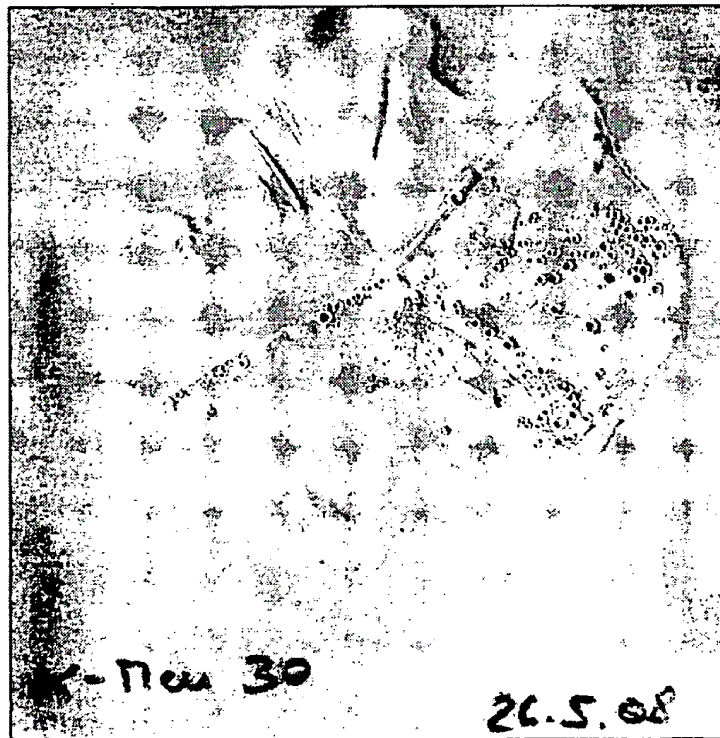


Figura 2