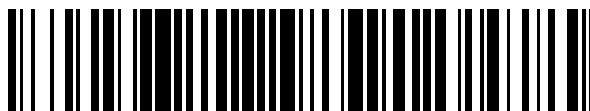


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 389 031**

51 Int. Cl.:

A61K 8/06 (2006.01) **A61K 8/894** (2006.01)

A61K 8/39 (2006.01)

A61K 8/49 (2006.01)

A61K 8/58 (2006.01)

A61K 8/86 (2006.01)

A61K 8/26 (2006.01)

A61K 8/28 (2006.01)

A61Q 15/00 (2006.01)

A61K 8/34 (2006.01)

A61K 8/37 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **08867902 .2**

96 Fecha de presentación: **22.12.2008**

97 Número de publicación de la solicitud: **2288330**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **02.03.2011**

54 Título: **Geles transparentes antitranspirantes**

30 Prioridad:
28.12.2007 DE 102007063351

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
22.10.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
22.10.2012

73 Titular/es:
HENKEL AG & CO. KGAA (100.0%)
Henkelstrasse 67
40589 Düsseldorf, DE

72 Inventor/es:
BANOWSKI, BERNHARD;
CLAAS, MARCUS y
BUSE, NADINE

74 Agente/Representante:
ISERN JARA, Jorge

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).

ES 2 389 031 T3

DESCRIPCIÓN

Geles transparentes antiperspirante

El objetivo de la presente solicitud son las composiciones transparentes antitranspirantes en forma de una emulsión agua en aceite, que contienen una mezcla equilibrada de componentes oleicos y emulgentes seleccionados, para mejorar la acción antitranspirante.

5 Estado de la técnica

Las composiciones antitranspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite son ya conocidas en el estado de la técnica. La WO 92/05767 A1 publica o revela la existencia de geles transparentes antitranspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite a base de ciclometiconas y polidimetilsiloxanos emulsionantes sustituidos por grupos de óxido de etileno-óxido de propileno. La WO 96/06594 A1 informa sobre composiciones transparentes antitranspirantes de agua en aceite, que contienen aceites de silicona volátiles y/o aceites de hidrocarburos volátiles y emulgentes de agua en aceite libres de silicona Laureth-1 o Laureth-4. La WO 98/17238 A1 informa sobre barras antitranspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite a base de emulgentes de agua en aceite libres de silicona, disustituidos con radicales alquilo terminales, que no tratan el problema de la transparencia. La WO 00/067888 A1 revela la existencia de emulsiones Ag/Ac muy fluidas con una viscosidad de como máximo 5000 mPas, una fase acuosa de al menos un 75% en peso, lípidos de como máximo un 20% en peso, emulgentes y otros componentes lipófilos, donde la fase oleica presenta una polaridad total entre 20 y 30 mN/m y está libre de siliconas, y se encuentra estabilizada por emulgentes de agua en aceite libres de silicona disustituidos con radicales alquilo en posición terminal. En este documento tampoco se habla del tema de la transparencia.

La patente americana 6.007.799 revela la existencia de composiciones transparentes antitranspirantes en forma de emulsiones de agua en aceite, que tienen un contenido elevado en principios activos antitranspirantes y no requieren el uso de ciclometiconas. Las composiciones publicadas en la patente americana 6.007.799 contienen un emulgente de siloxano sustituido por grupos alquilo, alquiloilados, al menos un "coupling agent" seleccionado entre compuestos como, por ejemplo, el éter PPG-14 butílico, y una fase oleica que contiene un componente con un índice de refracción de 1,4 hasta 1,5.

30 Cometido

Los geles transparentes en forma de una emulsión de agua en aceite gozan de gran popularidad entre los consumidores. Los geles conocidos de Ag/Ac libres de gas impulsor, a base de ciclometiconas, tras su aplicación a la piel dejan una sensación de frescor y al mismo tiempo facilitan el cuidado de la piel. Tras su aplicación no dejan ningún residuo. Esta aplicación libre de residuos que es muy apreciada por el consumidor se puede ver gracias a la transparencia de la composición.

Para la transparencia óptima el índice de refracción de la fase oleica y de la fase acuosa debe ser del orden de 0,001 o bien preferiblemente de 0,0004. En la determinación de un constituyente, por ejemplo de los compuestos de aluminio-zirconio eficaces antitranspirantes, que poseen un índice de refracción relativamente elevado de la fase acuosa, existen limitaciones en la elección de los constituyentes restantes.

Un problema en los geles actualmente conocidos es su elevado contenido en ciclometicona. En el caso de las ciclometiconas convencionales se establecen diferencias entre el ciclotetrasiloxano, ciclopentasiloxano y ciclohexasiloxano. El ciclotetrasiloxano, cuyo punto de fusión es inusualmente elevado con -11°C, puede dar lugar a problemas en la estabilidad del almacenamiento en las cantidades de empleo elevadas típicas para un gel de emulsión agua en aceite. Además hoy en día por cuestiones ecológicas se evita el empleo de ciclotetrasiloxano. Los productos convencionales de ciclometicona están prácticamente libres de ciclotetrasiloxano. Sin embargo, la clase de sustancia de la ciclometicona debido al contenido en trazas de ciclotetrasiloxano es una materia prima problemática. Por otro lado, las ciclometiconas presentan unas propiedades de uso sorprendentes, de manera que su sustitución es realmente difícil. Las ciclometiconas son componentes oleicos relativamente volátiles. Por este motivo se emplean siempre en cosmética, en particular en los antitranspirantes, ya que ayudan a resolver el problema de la suciedad de la ropa. Por otro lado, los antitranspirantes con un porcentaje elevado en ciclometicona volátil tras su aplicación dejan unos residuos blancos sobre la piel que se adhieren ligeramente a la misma y pueden desprenderse y todo ello es desagradable para el consumidor.

Un cometido de la presente solicitud consistía en preparar compuestos transparentes antitranspirantes en forma de una emulsión agua en aceite, que estuvieran totalmente libres de ciclometiconas. Otro cometido de la presente solicitud consistía en preparar composiciones transparentes antitranspirantes o antiperspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite, que presentaran un contenido elevado en fase acuosa

dispersada, preferiblemente de al menos un 75% en peso. Puesto que los principios activos convencionales antitranspirantes son solubles en agua, se encuentran en la fase acuosa. Una liberación rápida de principio activo puede verse respaldada por un elevado contenido en fase acuosa.

5 Otro cometido de la presente solicitud consistía en preparar composiciones transparentes antitranspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite, que presentaran una consistencia tipo gel con una viscosidad media hasta elevada y se pudieran aplicar por medio de una bola de aplicación (Roll-on) o bien una vaina tipo barra.

10 Otro cometido de la presente solicitud consistía en preparar composiciones transparentes antitranspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite, que estuvieran libres en gran parte o en su totalidad de ciclometiconas y que presentaran una buena liberación del principio activo antitranspirante.

15 Otro cometido de la presente solicitud consistía en preparar composiciones transparentes antitranspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite, que estuvieran libres en gran parte o en su totalidad de ciclometiconas y fueran suficientemente estables al almacenamiento.

20 Otro cometido de la presente solicitud consistía en preparar composiciones transparentes antitranspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite, que estuvieran libres en gran parte o en su totalidad de ciclometiconas y fueran suficientemente estables al almacenamiento y presentaran una buena liberación del principio activo antitranspirante.

25 Sorprendentemente se ha constatado que las composiciones conforme a la reivindicación 1 resuelven los cometidos mencionados.

Los objetivos de la presente solicitud son compuestos transparentes antiperspirantes en forma de una emulsión de agua en aceite, que contienen un 10-20% de fase oleica externa, que contiene i) al menos un éster simétrico, asimétrico o cíclico de ácido carbónico con alcoholes C₆-C₂₂ lineales o ramificados, ii) al menos un producto de adición de 1-14 unidades de óxido de propileno a alcoholes C₆-C₂₂ mono o plurivalentes así como iii) 0 hasta un máximo del 3% en peso de ciclometicona, un 75-90% en peso de fase acuosa dispersada con al menos un principio activo antitranspirante, que se elige entre los compuestos de aluminio-zirconio, y al menos un compuesto, que se elige entre los alcoholes C₂-C₉ plurivalentes solubles en agua con 2-6 grupos hidroxilo y los polietilenglicoles solubles en agua con 3-20 unidades de óxido de etileno, al menos un emulgente de agua en aceite a base de silicona con al menos un sustituyente alquílico R con 4-20 átomos de carbono, al menos un éter de polietilenglicol de un alcohol C₁₂-C₂₂ lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno y ningún emulgente de agua en aceite libre de silicona. Todos los porcentajes en peso hacen referencia al peso total de la emulsión.

40 Otro objetivo de la presente solicitud es un método cosmético, no terapéutico para reducir la aparición de sudor, en el cual se aplica una composición preferida conforme a la invención, conforme a una de las reivindicaciones 1-9 sobre la piel, preferiblemente sobre la piel de la zona de las axilas.

45 Las composiciones conforme a la invención contienen de un 10 a un 20% en peso de fase oleica externa; preferiblemente el contenido en fase oleica es del 12 al 18% en peso, en particular del 14 al 16% en peso, respecto al peso total de la emulsión. El emulgente de agua en aceite basado en silicona, así como los componentes emulsionados, no intervienen en la fase oleica en el sentido de esta solicitud. Los componentes lipófilos, que en condiciones normales no son líquidos ("aceite") sino que son sólidos, por ejemplo, las ceras, se encuentran en la fase oleica en el sentido de esta solicitud. El etanol contenido así como los alcoholes C₂-C₉ polivalentes con 2 hasta 6 grupos hidroxilo y los polietilenglicoles solubles en agua con 3-20 unidades de óxido de etileno no pertenecen a la fase oleica en el sentido de esta solicitud, sino que a la fase acuosa, aunque al menos presentan propiedades parcialmente solubles en aceite.

50 Las "condiciones normales" son en el sentido de la presente solicitud una temperatura de 20°C y una presión de 1013,25 mbar. Los datos sobre el punto de fusión hacen referencia asimismo a una presión de 1013,25 mbar.

La fase oleica contiene forzosamente una combinación de al menos un éster cíclico, simétrico o asimétrico de ácido carbónico con alcoholes C₆-C₂₂ lineales o ramificados, y al menos un producto de almacenamiento de 1-14 unidades de óxido de propileno unidas a los alcoholes C₃-C₁₆ mono o polivalentes.

60 Sorprendentemente se ha constatado que esta combinación de componentes oleicos equivale a un sustituto o reemplazo del porcentaje de ciclometicona en las emulsiones Ag/Ac antiperspirantes conocidas. Estas combinaciones de aceites respaldan de forma sorprendente la liberación de principio activo del principio activo antiperspirante. Además estos aceites aportan una sensación agradable en la piel similar a la de la

ciclometicona. Debido a su índice de refracción estos aceites crean emulsiones Ag/Ac muy transparentes.

Los componentes oleicos preferidos, que equivalen a los ésteres simétricos, no simétricos o bien cíclicos del ácido carbónico con alcanos C_6 - C_{22} lineales o ramificados, son el Di-n-hexilcarbonato, di-n-heptilcarbonato, di-n-octilcarbonato, que se obtienen bajo la denominación INCI de carbonatos de dicaprililo, por ejemplo como el producto comercial Cetiol® CC de Cognis, además del Di-2-etilhexilcarbonato, que se conoce por la denominación INCI de carbonato dietilhexílico, como el producto comercial Tegosoft® DEC de Degussa-Evonik, además del Di-n-nonilcarbonato, Di-n-decilcarbonato, Di-n-laurilcarbonato, Di-n-miristilcarbonato, Di-n-cetilcarbonato, Di-isocetilcarbonato, Di-n-estearilcarbonato, Di-isoestearilcarbonato, Di-araquilcarbonato y Di-behenilcarbonato como carbonatos sustituidos simétricamente así como no simétricamente, como el n-hexil-octilcarbonato, n-hexil-2-etilhexilcarbonato y el n-octil-n-decilcarbonato. Los ésteres cíclicos del ácido carbónico se pueden obtener por esterificación del carbonato de dimetilo o del carbonato de dietilo con alcanos bi- o plurivalentes. Se prefieren de un modo extraordinario los di-n-octilcarbonatos, que tienen un índice de refracción n_D de 1,435-1,436 a 21°C, así como el Di-2-etilhexilcarbonato. Se prefieren en una cantidad total de un 8-18% en peso, en particular del 10-16% en peso, especialmente del 12-14% en peso respecto a la emulsión completa.

Los componentes oleicos preferidos, que equivalen a productos de adición de 1-14 unidades de óxido de propileno a alcanos C_3 - C_{16} mono- o plurivalentes, se eligen de los productos de adición de 1 hasta 14 unidades de óxido de propileno a alcanos C_3 - C_{16} mono- o plurivalentes, en particular a n-butanol-1, n-pentanol-1, n-hexanol-1, n-heptanol-1, n-octanol-1, n-decanol-1, n-decano-1, 10-diol, alcohol laurílico, alcohol miristílico y alcohol cetílico. Se prefieren en particular los éteres PPG-2-miristílico, PPG-3-miristílico (Witconol® APM), PPG-4-miristílico, PPG-5-miristílico, PPG-2-laurílico, PPG-3-laurílico, PPG-4-laurílico, PPG-5-laurílico, PPG-6-laurílico, PPG-2-decílico, PPG-3-decílico, PPG-4-decílico, PPG-5-decílico, PPG-6-decílico, PPG-7-decílico, PPG-2-octílico, PPG-3-octílico, PPG-4-octílico, PPG-5-octílico, PPG-6-octílico, PPG-7-octílico, PPG-8-octílico, PPG-2-hexílico, PPG-3-hexílico, PPG-4-hexílico, PPG-5-hexílico, PPG-6-hexílico, PPG-7-hexílico, PPG-8-hexílico, PPG-9-hexílico, PPG-4-butilico, PPG-5-butilico, PPG-6-butilico, PPG-7-butilico, PPG-8-butilico, PPG-9-butilico, PPG-10-butilico, PPG-11-butilico, PPG-12-butilico, PPG-13-butilico y PPG-14-butilico (Ucon® Fluid AP).

Se ha constatado que con un producto de adición PPG como el éter estearílico PPG-15 (Arlamol® E) no se han podido conseguir los mismos buenos efectos en lo que se refiere a la liberación de principio activo antitranspirante como con los productos de adición de las 1-14 unidades de óxido de propileno a los alcanos C_{3-16} mono o polivalentes. De acuerdo con la invención se prefieren en particular los éteres de miristilo PPG-3 y de butilo PPG-14; de forma extraordinaria se prefiere el éter de miristilo PPG-3.

De acuerdo con la invención lo que realmente es preferible son las combinaciones de Di-n-octilcarbonato y éter de miristilo PPG-3, Di-n-2-etilhexilcarbonato y éter de miristilo PPG-3, Di-n-octilcarbonato y éter de butilo PPG-14, así como Di-2-etilhexilcarbonato y éter de butilo PPG-14.

Al menos se prefiere un producto de adición de 1-14 unidades de óxido de propileno a los alcanos C_{3-16} mono o polivalentes en una cantidad total del 1-5% en peso, en particular del 2-4% en peso, en especial del 2,5-3% en peso, respecto a la emulsión completa.

De acuerdo con la invención las composiciones especialmente preferidas se caracterizan por que los componentes oleicos, que equivalen a ésteres simétricos, asimétricos o cíclicos del ácido carbónico con alcanos C_6 - C_{22} lineales o ramificados, se presentan en un porcentaje en peso de 4 a 19 respecto a los componentes oleicos, que equivalen a los productos de adición de 1-14 unidades de óxido de propileno a los alcanos C_{3-16} mono o polivalentes. Es preferible que este porcentaje en peso sea de 5-15, en particular de 6-14 y en especial de 7-13. Se ha constatado que con un porcentaje en peso inferior a 2 no se pueden conseguir los mismos buenos efectos en la liberación del principio activo antiperspirante.

Las composiciones conforme a la invención se caracterizan por que el porcentaje en peso contenido de ciclometicona es de 0 hasta un máximo del 3% en peso, preferiblemente de 0 hasta un máximo del 2,5%, en particular de 0 hasta un máximo del 2%, y extraordinariamente del 0 hasta un máximo del 1% en peso, respecto al peso total de la emulsión.

Las composiciones conforme a la invención contienen además un 75-90% en peso de la fase acuosa dispersada, al menos un principio activo antitranspirante y al menos un compuesto, elegido de los alcanos C_2 - C_9 polivalentes solubles en agua con 2-6 grupos hidroxilo y de los polietilenglicoles solubles en agua con 3-20 unidades de óxido de etileno.

El contenido en fase acuosa es preferiblemente del 78-88% en peso, en particular del 80-86% en peso y especialmente del 81-84% en peso, respecto al peso total de la emulsión.

El contenido en agua libre asciende al 0-50% en peso, preferiblemente al 5-40% en peso, en especial al 10-30% en peso y de forma extraordinaria al 15-20% en peso, respecto al peso total de la emulsión. El agua cristalina ligada, por ejemplo la de los principios activos antitranspirantes, no se considera aquí agua libre.

5

Los constituyentes emulsionantes no pertenecen a la fase acuosa en el sentido de esta solicitud.

10

15

20

La fase acuosa de los compuestos conforme a la invención comprende al menos un principio activo que inhibe o evita el sudor, que se conoce también como principio activo antitranspirante, que se elige entre los compuestos de aluminio-zirconio orgánicos e inorgánicos adstringentes, solubles en agua. Los compuestos de aluminio-zirconio se caracterizan por una eficacia especialmente elevada al mismo tiempo que por una buena tolerancia cutánea. Aportan a la fase acuosa un índice de infracción n_D superior al de los compuestos de aluminio libres de zirconio. Los principios activos antitranspirantes especialmente preferidos se eligen entre los complejos de glicol-aluminio y zirconio, por ejemplo, complejos de propilenglicol de aluminio y zirconio, se eligen entre los clorhidratos de aluminio y zirconio, como el triclorhidrato de aluminio y zirconio, el tetraclorhidrato de aluminio y zirconio, el pentaclorhidrato de aluminio y zirconio, el octaclorhidrato de aluminio y zirconio, los complejos de glicina-clorhidrato de aluminio y zirconio como el triclorhidrexglicina de aluminio y zirconio, tetraclorhidrexglicina de aluminio y zirconio, pentaclorhidrexglicina de aluminio y zirconio y octaclorhidrexglicina de aluminio y zirconio. Según la invención se entiende por solubilidad en agua una solubilidad de al menos un 5% en peso a 20°C, es decir, que cantidades de al menos 5 g de sustancia activa antitranspirante son solubles en 95 g de agua a 20°C. Los principios activos antitranspirantes se pueden emplear como solución acuosa o glicólica o como solubilidad acuosa o glicólica.

25

30

Los compuestos conforme a la invención especialmente preferidos se caracterizan por que existe al menos un principio activo antitranspirante en una cantidad del 3-27% en peso, preferiblemente del 5-22% en peso y en particular del 10-20% en peso, respecto al peso total de sustancia activa (USP, Farmacopea US) en la composición total. La cantidad indicada en porcentaje en peso en la presente solicitud de patente en sal o sales antiperspirantes se calcula según el método de la Farmacopea US (USP), excluyéndose el agua cristalina ligada y otros ligandos, por ejemplo, la glicina.

35

40

La fase acuosa de las composiciones conforme a la invención comprende además al menos un compuesto, seleccionado entre los alcanos C_2 - C_9 plurivalentes solubles en agua con 2-6 grupos hidroxilo y los polietilenglicoles solubles en agua con 3-20 unidades de óxido de etileno. La adición de estos compuestos es especialmente necesaria para conseguir la transparencia de toda la emulsión. El índice de refracción de la fase acuosa sin estos polioles sería demasiado bajo para poderse adaptar al índice de refracción de la fase oleica. Además estos componentes de poliol solubles en agua contribuyen a la estabilidad de la emulsión.

45

50

Es preferible elegir estos componentes de poliol solubles en agua entre el 1,2-propilenglicol, 1,3-propilenglicol, 2-metil-1,3-propanodiol, glicerina, butilenglicoles como el 1,2-butilenglicol, en especial el 1,3-butilenglicol y el 1,4-butilenglicol, pentilenglicoles como el 1,2-pentanodiol, hexanodioles, como en particular el 1,2-hexanodiol y el 1,6-hexanodiol, hexanotrioles como el 1,2,6-hexanotriol, el 1,2-octanodiol, 1,8-octanodiol, dipropilenglicol, tripropilenglicol, diglicerina, triglicerina así como mezclas de las sustancias antes mencionadas. Los polietilenglicoles solubles en agua preferidos se eligen entre el PEG-3, PEG-4, PEG-6, PEG-7, PEG-8, PEG-9, PEG-10, PEG-12, PEG-14, PEG-16, PEG-18 y PEG-20 así como mezclas de los mismos, donde se prefieren de PEG-3 a PEG-8. También se pueden emplear azúcares, alcoholes de azúcar y determinados derivados de azúcar como el eritritol, sorbitol, xilitol, fructosa, glucosa, maltosa, maltitol, manitol, inositol, sacarosa, trehalosa y xilosa pero debido a su adherencia son menos apropiados o bien solamente son apropiados en pequeñas cantidades.

55

60

Se prefieren el 1,2-propilenglicol, 1,3-butilenglicol, dipropilenglicol y 1,2-hexanodiol así como mezclas de los mismos. Las mezclas de polioles preferidas contienen 1,2-propilenglicol y dipropilenglicol. Las mezclas de poliol especialmente preferidas contienen 1,2-propilenglicol y dipropilenglicol en una relación en peso de 4:1 hasta 2:1. Estas mezclas tienen unas propiedades especiales en lo referente a su transparencia, liberación de principio activo, sensación en la piel y tolerancia cutánea. Las composiciones conforme a la invención preferidas se caracterizan por que contienen al menos un compuesto, elegido entre los alcanos C_2 - C_9 polivalentes con 2 hasta 6 grupos hidroxilo y los polietilenglicoles solubles en agua con 3-20 unidades de óxido de etileno, en una cantidad total del 20-60% en peso, preferiblemente del 25 al 55% en peso, en particular del 30 al 50% en peso, especialmente del 35 al 45% en peso, respecto al peso total de la emulsión.

Las composiciones conforme a la invención comprenden además al menos un emulgente de agua en aceite a base de silicona con al menos un sustituyente alquílico R con 4-20 átomos de carbono.

Un grupo especialmente preferido conforme a la invención de emulgentes de agua en aceite son las siliconas modificadas por poli-(C₂-C₃) alquilenglicoles que han sido modificadas de forma hidrófoba con grupos alquilo C₄-C₂₀. El sustituyente alquílico hidrófobo R con 4-20 átomos de carbono se elige preferiblemente de los grupos n-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, 2-etilhexilo, n-decilo, n-undecilo, n-dodecilo, n-tetradecilo, n-hexadecilo = cetilo, n-octadecilo = estearilo y n-eicosanilo = araquilo. Se prefieren los sustituyentes de cetilo.

Los emulgentes de agua en aceite basados en silicona especialmente preferidos se eligen de los grupos de cetil PEG/PPG-10/1 Dimeticona (antes: Cetil dimeticona copoliol, que se comercializa como Abil EM 90), preferiblemente el cetil PEG/PPG-7/3 Dimeticona, PEG/PPG-10/3 éter de oleilo Dimeticona, el polímero reticulado laurilo dimeticona PEG-15, cetil PEG/PPG-15/15 éter butílico Dimeticona, copolioses alquílicos de meticona y etoxi glucósido de alquil dimeticona. Se prefiere en especial el cetil PEG/PPG-10/1 Dimeticona.

Adicionalmente a los emulgentes de agua en aceite a base de silicona modificados por grupos alquilo hidrófobos indicados antes, una configuración preferida de la invención puede contener dichos emulgentes de agua en aceite a base de silicona, cuya denominación INCI anterior equivalía a la dimeticona copoliol, con las denominaciones INCI actuales de PEG-x Dimeticona (con x=2-20, preferiblemente 3-17, en especial 11-12), PEG/PPG a/b Dimeticona (donde a y b independientemente uno de otro corresponden a las cifras de 2-30, preferiblemente 3-30 y en particular 12-20, especialmente 14-18), Bis-PEG/PPG-c/d Dimeticona (donde c y d independientemente uno de otro corresponden a las cifras de 10-25 preferiblemente 14-20 y en particular 14-16) y las Bis-PEG/PPG-e/f PEG/PPG g/h Dimeticona (donde e, f, g y h equivalen independientemente uno de otro a las cifras de 10 a 20, en particular de 14 a 18 y especialmente el 16). Se prefieren especialmente las PEG/PPG-18/18 Dimeticonas, que se obtienen en el comercio en una mezcla 1:9 con ciclometicona como DC 3225 C o bien DC 5225 C, la PEG/PPG-4/12 Dimeticona, que se obtiene bajo la denominación Abil B 8852, así como la Bis-PEG/PPG-14/14 Dimeticona, que en una mezcla con Ciclotmeticona se obtiene en el comercio bajo el nombre de Abil EM 97 (Goldschmidt), la Bis-PEG/PPG-20/20 Dimeticona, que se obtiene bajo la denominación de Abil B 8832, la PEG/PPG-5/3 trisiloxano (Silsoft 305), así como la PEG/PPG-20/23 Dimeticona (Silsoft 430 y Silsoft 440).

Las composiciones conforme a la invención preferidas se caracterizan por que contienen al menos un emulgente de agua en aceite a base de silicona con al menos un sustituyente alquilo R con 4 a 20 átomos de carbono en una cantidad total del 1-4% en peso, preferiblemente del 1,5-3,5% en peso, en especial del 2-3% en peso, excepcionalmente del 2,2-2,5% en peso, respecto al peso total de la emulsión.

Las composiciones conforme a la invención son estables incluso sin emulgentes de agua en aceite libres de silicona y por ello no los contienen. Se ha constatado que algunos emulgentes de agua en aceite libres de silicona pueden influir negativamente en la liberación de principio activo de las composiciones conforme a la invención.

Ejemplos de dichos emulgentes de Ag/Ac libres de silicona excluidos conforme a la invención se eligen entre las sustancias de fórmula general A-O-(CHR¹-X-CHR²-O)_a-A', donde A y A' equivalen a radicales orgánicos hidrófobos iguales o distintos, a representa una cifra de 1 hasta 100, preferiblemente de 2 hasta 60, en particular de 5 hasta 40, X equivale a un enlace simple o bien al grupo >CHOR³, R¹ y R² equivalen a un átomo de hidrógeno o a un grupo metilo y se eligen de manera que ambos radicales no equivalen al mismo tiempo al metilo, y R³ equivale a un átomo de hidrógeno o a un grupo acilo o alquilo ramificado o no ramificado, saturado o no saturado con 1 hasta 20 átomos de carbono.

Otros emulgentes Ag/Ac libres de silicona excluidos se eligen de manera que los radicales A y A' se eligen del grupo de radicales acilo y alquilo y radicales hidroxiacilo ramificados o no ramificados, saturados o no saturados con 10 hasta 30 átomos de carbono así como además del grupo de grupos de hidroxiacilos unidos unos a otros con funciones éster, según el esquema: OOC-R''-CR'H-(OOC-R''-CR'H)_b-OOC-R''-CHR', donde R' se elige del grupo de grupos alquilo ramificados y no ramificados con 1 hasta 20 átomos de carbono y R'' se elige del grupo de grupos de alquilenos ramificados y no ramificados con 1 hasta 20 átomos de carbono y b puede alcanzar cifras de 0 hasta 200.

Otros emulgentes Ag/Ac libres de silicona excluidos se eligen entre

- (1) Alcoholes saturados con 8-24 átomos de C, en particular con 16-22 átomos de C, por ejemplo, alcohol cetílico, alcohol estearílico, alcohol araquidílico o alcohol de behenilo o mezclas de estos alcoholes, como los que se obtienen en la hidratación técnica de ácidos grasos vegetales y animales;
- (2) Alcoholes etoxilados y ácidos carbónicos con 8-24 átomos de C, en particular con 16-22 átomos de C, que presentan un valor HLB de 1-8, por ejemplo, Laureth-1 o Laureth-4;
- (3) Esteres parciales de un poliol con 3-6 átomos de C y ácidos grasos saturados y/o insaturados, ramificados y/o no ramificados con 8-24, en particular 12-18 átomos de C. Dichos esterres parciales

son, por ejemplo, los monoglicéridos del ácido palmítico, esteárico y oleico, los mono y/o diésteres de sorbitol, en particular los del ácido mirístico, palmítico, esteárico o bien de mezclas de estos ácidos grasos. Aquí se mencionan también los monoésteres de trimetilolpropano, eritrita o pentaeritrita y los ácidos grasos saturados con 14-22 átomos de C. También se emplean los monoésteres técnicos, que se obtienen por esterificación de 1 mol de poliol con 1 mol de ácido graso y equivalen a una mezcla de monoésteres, diésteres, triésteres y si se diera el caso polioles no esterificados.

- (4) Ésteres de poliglicerina de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o no saturados, ramificados y/o no ramificados de una longitud de cadena de 8-24, en particular de 12-18 átomos de C, con hasta 10 unidades de glicerina, preferiblemente hasta 3 unidades de glicerina y un grado de esterificación de 1-10, preferiblemente de 1-5;
- (5) Éteres de mono- y/o poliglicerina de alcoholes saturados y/o no saturados, ramificados y/o no ramificados de una longitud de cadena de 8-30, en particular de 12-18 átomos de C, con hasta 10 unidades de glicerina, preferiblemente hasta 3 unidades de glicerina y un grado de esterificación de 1-10, preferiblemente de 1-5;
- (6) Ésteres de propilenglicol de ácidos carboxílicos saturados y/o no saturados, ramificados y/o no ramificados de una longitud de cadena de 8-24, en particular de 12-18 átomos de C;
- (7) Ésteres de metilglucosa de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o no saturados, ramificados y/o no ramificados de una longitud de cadena de 8-24, en particular de 12-18 átomos de C;
- (8) Ésteres de poliglicerina-metilglucosa de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o no saturados, ramificados y/o no ramificados de una longitud de cadena de 8-24, en particular de 12-18 átomos de C.

Otros ejemplos de emulgentes Ag/Ac sin silicona excluidos conforme a la invención son el lanolato de glicerilo, monoestearato de glicerilo, diestearato de glicerilo, monoisoestearato de glicerilo, monomiristato de glicerilo, monooleato de glicerilo, monoestearato de diglicerilo, monolaurato de glicerilo, monocaprinato de glicerilo, monocaprilato de glicerilo, monoisoestearato de diglicerilo, diisoestearato de diglicerilo, monoestearato de propilenglicol, monolaurato de propilenglicol, monoisoestearato de sorbitol, monolaurato de sorbitol, monocaprilato de sorbitol, sesquiestearato de sorbitol, monoisooleato de sorbitol, diestearato de sacarosa, alcohol cetílico, alcohol estearílico, alcohol araquidílico, alcohol de behenilo, alcohol de isobehenilo, éter de 2-etilhexilglicerina, alcohol de selaquilo, alcohol de quimilo, éter estearílico de polietilenglicol (2) (Steareth-2), estearato de glicerilo y sorbitol, isoestearato de poligliceril-4, sesquiestearato de poligliceril-2, aceite de ricino PEG-7-hidrogenado, succinato de isoestearildiglicerilo, éter de PEG-5-colesterilo, PEG-30 dipolihiidroxiestearato, heptaoleato de decaglicerilo, diisoestearato de poligliceril-3, diestearato de PEG-8, diglicerina, dipolihiidroxiestearato, isoestearato de glicerina, isoestearato de sorbitol, diestearato de poligliceril-3-metilglucosa, estearato de PEG-2, copolímero de PEG-45/dodecilglicol, copolímero de PEG-22/dodecilglicol y copolímero de metoxi PEG-22/dodecilglicol.

Las composiciones conforme a la invención se caracterizan además por que al menos contienen un éter de polietilenglicol de un alcohol C12-C22 lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno. Estos compuestos se conocen como emulgentes de aceite en agua. Sorprendentemente se ha constatado que la adición de este tipo de éter de polietilenglicol de un alcohol C12-C22 lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno conduce a una mayor y mejor liberación de principio activo del principio activo antiperspirante. Era realmente sorprendente que no todos los emulgentes de aceite en agua ejercieran este efecto favorecedor en las composiciones conforme a la invención, ni incluso aquellos que se encontraban en el mismo intervalo de valores de HLB que el éter de polietilenglicol preferido conforme a la invención de un alcohol C12-C22 lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno. Las composiciones preferidas conforme a la invención se caracterizan por que al menos un éter de polietilenglicol de un alcohol C12-C22 lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno se elige del grupo de Laureth-20, Laureth-25, Laureth-30, Laureth-35, Laureth-40, Laureth-45, Laureth-50, Laureth-55, Laureth-60, Laureth-65, Laureth-70, Laureth-75, Laureth-80, Laureth-85, Laureth-90, Laureth-95, Laureth-100, Myristeth-20, Myristeth-25, Myristeth-30, Myristeth-35, Myristeth-40, Myristeth-45, Myristeth-50, Myristeth-55, Myristeth-60, Myristeth-65, Myristeth-70, Myristeth-75, Myristeth-80, Myristeth-85, Myristeth-90, Myristeth-95, Myristeth-100, Ceteth-20, Ceteth 25, Ceteth 30, Ceteth-35, Ceteth 40, Ceteth 45, Ceteth-50, Ceteth 55, Ceteth 60, Ceteth-65, Ceteth 70, Ceteth 75, Ceteth-80, Ceteth 85, Ceteth 90, Ceteth-95, Ceteth 100, Ceteth 110, Ceteth 120, Ceteth 130, Ceteth 140, Ceteth 150, Isoceteth 20, Isoceteth 25, Isoceteth 30, Isoceteth 35, Isoceteth 40, Isoceteth 45, Isoceteth 50, Isoceteth 55, Isoceteth 60, Isoceteth 65, Isoceteth 70, Isoceteth 75, Isoceteth 80, Isoceteth 85, Isoceteth 90, Isoceteth 95, Isoceteth 100, Isoceteth 110, Isoceteth 120, Isoceteth 130, Isoceteth 140, Isoceteth 150, Steareth 20, Steareth 25, Steareth 30, Steareth 35, Steareth 40, Steareth 45, Steareth 50, Steareth 55, Steareth 60, Steareth 65, Steareth 70, Steareth 75, Steareth 80, Steareth 85, Steareth 90, Steareth 95, Steareth 100, Steareth 110, Steareth 120, Steareth 130, Steareth 140, Steareth 150, Isosteareth 20, Isosteareth 25, Isosteareth 30, Isosteareth 35, Isosteareth 40, Isosteareth 45, Isosteareth 50, Isosteareth 55, Isosteareth 60, Isosteareth 65, Isosteareth 70, Isosteareth 75, Isosteareth 80, Isosteareth 85, Isosteareth 90, Isosteareth 95, Isosteareth 100, Isosteareth 110, Isosteareth 120, Isosteareth 130, Isosteareth 140,

Isosteareth 150, Arachideth-20, Arachideth-25, Arachideth-30, Arachideth-35, Arachideth-40, Arachideth-45, Arachideth-50, Arachideth-55, Arachideth-60, Arachideth-65, Arachideth-70, Arachideth-75, Arachideth-80, Arachideth-85, Arachideth-90, Arachideth-95, Arachideth-100, Arachideth-110, Arachideth-120, Arachideth-130, Arachideth-140, Arachideth-150, Beheneth-20, Beheneth-25, Beheneth-30, Beheneth-35, Beheneth-40, Beheneth-45, Beheneth-50, Beheneth-55, Beheneth-60, Beheneth-65, Beheneth-70, Beheneth-75, Beheneth-80, Beheneth-85, Beheneth-90, Beheneth-95, Beheneth-100, Beheneth-110, Beheneth-120, Beheneth-130, Beheneth-140, Beheneth-150, así como mezclas de los mismos. Se prefiere el Steareth-100.

Las composiciones preferidas conforme a la invención se caracterizan por que al menos contienen un éter de polietilenglicol de un alcohol C12-C22 lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno en una cantidad total del 1-4% en peso, preferiblemente del 1,5-3,5% en peso, en particular del 2-3% en peso, extraordinariamente del 2,2-2,6% en peso, respecto al peso total de la emulsión.

Otras composiciones preferidas conforme a la invención se caracterizan por que el Steareth-100 se encuentra en una cantidad total del 1-4% en peso, preferiblemente del 1,5-3,5% en peso, en particular del 2-3% en peso, extraordinariamente del 2,2-2,6% en peso, respecto al peso total de la emulsión.

Otras composiciones preferidas conforme a la invención se caracterizan por que contienen un 1-10% en peso, preferiblemente un 2-8% en peso, en particular un 3-7% en peso, extraordinariamente un 4-6% en peso de etanol, respecto al peso total de la emulsión. Dicho contenido en etanol es una gran ventaja pues favorece la estabilidad de la emulsión y su transparencia.

Los datos sobre viscosidad se refieren a las mediciones con un viscosímetro de rotación de la empresa Brookfield donde se elige el husillo y la velocidad de giro tal como se recomienda en el manual "More solutions to Sticky Problems" de la empresa Brookfield:

Utilizando husillos T y Helipath:

Tabla VIS-1: Viscosímetro Brookfield Modelos LV y HA, límite superior del margen de viscosidad óptimo para la medición con los parámetros de medición indicados (en mPas, miliPascal x segundos)

Husillo Aparato	Velocidad de cizallamiento (revoluciones por minuto, rpm)	T-A	T-B	T-C	T-D
LVT	0,3	66.600	133.000	333.000	666.000
LVT	0,6	33.300	66.600	166,00	333,000
LVT	1,5	13.300	26.600	133.000	333.000
LVT	3	6.660	13.300	33.300	66.600
LVT LVF	6	3.330	6.660	16.600	33.300
LVT LVF	12	1.660	3.330	8.300	16.600
HAT	0,5	800.000	1.600.000	4.000.000	8.000.000
HAT HAF	1	400.000	800.000	2.000.000	4.000.000
HAF	2	200.000	400.000	1.000.000	2.000.000
HAT	2,5	160.000	320.000	800.000	1.000.000
HAT HAF	5	80.000	160.000	400.000	800.000

Tabla VIS-2: Viscosímetro Brookfield Modelo RV, límite superior del margen de viscosidad óptimo para la medición con los parámetros de medición indicados (en mPas, miliPascal x segundos)

Husillo Aparato	Velocidad de cizallamiento (revoluciones por minuto, rpm)	T-A	T-B	T-C	T-D
RVT	0,5	400.000	800.000	2.000.000	4.000.000
RVT	1,0	200.000	400.000	1.000.000	2.000.000
RVT	2,0	100.000	200.000	500.000	1.000.000
RVF	2,5	80.000	150.000	400.000	800.000
RVF	4	50.000	100.000	250.000	500.000

RVT	5	40.000	80.000	200.000	400.000
-----	---	--------	--------	---------	---------

5 La viscosidad indicada equivale al valor límite superior para el margen de medición óptimo para la correspondiente combinación husillo-número de revoluciones. En el caso de un margen de viscosidad en el que sean posibles dos combinaciones de parámetros de medición distintas, se elige la combinación husillo-número de revoluciones, que proporciona el valor más alto en la escala. Además los datos sobre la viscosidad hacen referencia a la composición 24 horas después de la fabricación y se miden a una temperatura de 21°C con un Helipath.

10 Las composiciones preferidas conforme a la invención con una viscosidad preferida son especialmente buenas para su aplicación con un aplicador de bola o bien adecuadas para un dispensador de gel. Para que el consumidor vea todavía más transparente la composición, el envase de la misma será transparente.

15 Otras composiciones preferidas conforme a la invención pueden contener aditivos como principios activos desodorantes, preferiblemente el éter de 2-etilhexilglicerina (Sensiva SC 50), filtros UV, antioxidantes, sustancias activas desensibilizantes como aminoácidos, proteínas e hidrolizados de proteínas, vitaminas y pre-vitaminas, en particular el Pantenol, medios conservantes y principios activos antibacterianos.

Los ejemplos siguientes deberían aclarar la invención sin limitarla.

20 Gel de emulsión Ag/Ac antitranspirante transparente

Carbonato dietilhexílico	12% en peso
Cetil PEG/PPG-10/1 Dimeticona	2% en peso
PPG-3 éter de miristilo	2% en peso
Etanol (96%)	5% en peso
Esencia de perfume	0,6% en peso
Aluminium Zirconium Tetrachlorhydrex Gly	21% en peso
1,2-propilenglicol	24,4% en peso
Dipropilenglicol	13,4% en peso
Steareth-100	2% en peso
Agua	17,6% en peso

25 De un dispensador de gel transparente se aplicaba este gel de emulsión Ag/Ac transparente antiperspirante sobre la piel en la zona de las axilas. Se observaba un efecto antiperspirante duradero.

REIVINDICACIONES

1. Composición antiperspirante transparente en forma de una emulsión agua en aceite, que contiene
 - a) 10-20% en peso de fase oleica externa, que contiene
 - a.i) al menos un éster simétrico, no simétrico o cíclico de ácido carbónico con alcoholes C₆-C₂₂ lineales o ramificados,
 - a.ii) al menos un producto de adición de 1-14 unidades de óxido de propileno a alcoholes C₃₋₁₆ mono- o polivalentes así como
 - a.iii) hasta un máximo de un 3% en peso de ciclometicona,
 - b) 75-90% en peso de fase acuosa dispersada con al menos un principio activo antiperspirante, que se elige de los compuestos de aluminio-zirconio, y al menos un compuesto, que se elige de los alcoholes C₂-C₉ solubles en agua polivalentes con 2-6 grupos hidroxilo y polietilenglicoles solubles en agua con 3-20 unidades de óxido de etileno,
 - c) Al menos un emulgente de agua en aceite a base de silicona con al menos un sustituyente alquílico R con 4-20 átomos de carbono,
 - d) Al menos un éter de polietilenglicol de un alcohol C₁₂-C₂₂ lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno.
 - e) Ningún emulgente agua en aceite libre de silicona
 donde todos los porcentajes en peso se refieren al peso total de la emulsión.
2. Composición conforme a la reivindicación 1, que se caracteriza porque los componentes oleicos a.i) y a.ii) se presentan en una relación en peso de 4-19.
3. Composición conforme a la reivindicación 1 ó 2, que se caracteriza porque contiene al menos un éter de polietilenglicol de un alcohol C₁₂-C₂₂ lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno en una cantidad total del 1-4% en peso respecto al peso total de la emulsión.
4. Composición conforme a una de las reivindicaciones 1, 2 ó 3, que se caracteriza porque contiene al menos un éter de polietilenglicol de un alcohol C₁₂-C₂₂ lineal o ramificado con 20-150 unidades de óxido de etileno, elegidas del grupo de Laureth-20, Laureth-25, Laureth-30, Laureth-35, Laureth-40, Laureth-45, Laureth-50, Laureth-55, Laureth-60, Laureth-65, Laureth-70, Laureth-75, Laureth-80, Laureth-85, Laureth-90, Laureth-95, Laureth-100, Myristeth-20, Myristeth-25, Myristeth-30, Myristeth-35, Myristeth-40, Myristeth-45, Myristeth-50, Myristeth-55, Myristeth-60, Myristeth-65, Myristeth-70, Myristeth-75, Myristeth-80, Myristeth-85, Myristeth-90, Myristeth-95, Myristeth-100, Ceteth-20, Ceteth 25, Ceteth 30, Ceteth-35, Ceteth 40, Ceteth 45, Ceteth-50, Ceteth 55, Ceteth 60, Ceteth-65, Ceteth 70, Ceteth 75, Ceteth-80, Ceteth 85, Ceteth 90, Ceteth-95, Ceteth 100, Ceteth 110, Ceteth 120, Ceteth 130, Ceteth 140, Ceteth 150, Isoceteth 20, Isoceteth 25, Isoceteth 30, Isoceteth 35, Isoceteth 40, Isoceteth 45, Isoceteth 50, Isoceteth 55, Isoceteth 60, Isoceteth 65, Isoceteth 70, Isoceteth 75, Isoceteth 80, Isoceteth 85, Isoceteth 90, Isoceteth 95, Isoceteth 100, Isoceteth 110, Isoceteth 120, Isoceteth 130, Isoceteth 140, Isoceteth 150, Steareth 20, Steareth 25, Steareth 30, Steareth 35, Steareth 40, Steareth 45, Steareth 50, Steareth 55, Steareth 60, Steareth 65, Steareth 70, Steareth 75, Steareth 80, Steareth 85, Steareth 90, Steareth 95, Steareth 100, Steareth 110, Steareth 120, Steareth 130, Steareth 140, Steareth 150, Isosteareth 20, Isosteareth 25, Isosteareth 30, Isosteareth 35, Isosteareth 40, Isosteareth 45, Isosteareth 50, Isosteareth 55, Isosteareth 60, Isosteareth 65, Isosteareth 70, Isosteareth 75, Isosteareth 80, Isosteareth 85, Isosteareth 90, Isosteareth 95, Isosteareth 100, Isosteareth 110, Isosteareth 120, Isosteareth 130, Isosteareth 140, Isosteareth 150, Arachideth-20, Arachideth-25, Arachideth-30, Arachideth-35, Arachideth-40, Arachideth-45, Arachideth-50, Arachideth-55, Arachideth-60, Arachideth-65, Arachideth-70, Arachideth-75, Arachideth-80, Arachideth-85, Arachideth-90, Arachideth-95, Arachideth-100, Arachideth-110, Arachideth-120, Arachideth-130, Arachideth-140, Arachideth-150, Beheneth-20, Beheneth-25, Beheneth-30, Beheneth-35, Beheneth-40, Beheneth-45, Beheneth-50, Beheneth-55, Beheneth-60, Beheneth-65, Beheneth-70, Beheneth-75, Beheneth-80, Beheneth-85, Beheneth-90, Beheneth-95, Beheneth-100, Beheneth-110, Beheneth-120, Beheneth-130, Beheneth-140, Beheneth-150, así como mezclas de los mismos.
5. Composición conforme a una de las reivindicaciones 1-4, que se caracteriza porque contiene al menos un compuesto, elegido entre los alcoholes C₂-C₉ polivalentes solubles en agua con 2-6 grupos hidroxilo y polietilenglicoles solubles en agua con 3-20 unidades de óxido de etileno, en una cantidad total del 20-60% en peso respecto al peso total de la emulsión.
6. Composición conforme a una de las reivindicaciones 1-5, que se caracteriza porque contiene al menos un emulgente de agua en aceite a base de silicona con al menos un sustituyente alquílico R con 4-20 átomos de carbono en una cantidad total del 1-4% en peso respecto al peso total de la emulsión.
7. Composición conforme a una de las reivindicaciones 1-6, que se caracteriza porque contiene los principios activos antiperspirantes en una cantidad total del 10-22% en peso respecto al contenido en sustancia activa conforme a la Farmacopea Americana por peso total de la emulsión.

8. Composición conforme a una de las reivindicaciones 1-7, que se caracteriza porque contiene un 1-10% en peso de etanol, respecto al peso total de la emulsión.
- 5 9. Composición conforme a una de las reivindicaciones 1-8, que se caracteriza por una viscosidad de 30.000 hasta 150.000 mPas (21°C).
- 10 10. Método cosmético no terapéutico para reducir la aparición de sudor, que se caracteriza porque se aplica sobre la piel, en particular la piel de la zona de las axilas una composición conforme a una de las reivindicaciones 1-9.