

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 442 252**

51 Int. Cl.:

A61Q 15/00 (2006.01)

A61K 8/28 (2006.01)

A61K 8/44 (2006.01)

A61K 8/365 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **16.11.2006 E 06846328 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **16.10.2013 EP 1948317**

54 Título: **Composiciones antitranspirantes**

30 Prioridad:

16.11.2005 US 737207 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

10.02.2014

73 Titular/es:

**COLGATE-PALMOLIVE COMPANY (100.0%)
300 PARK AVENUE
NEW YORK, NY 10022-7499, US**

72 Inventor/es:

**MATTAI, JAIRAJH;
KILPATRICK-LIVERMAN, LATONYA;
HOLERCA, MARIAN y
TANG, XIOZHONG**

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 442 252 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

Composiciones antitranspirantes

5 La presente invención se refiere a composiciones antitranspirantes.

Antecedentes de la invención

10 Las composiciones antitranspirantes que contienen sales de aluminio o aluminio-circonio tienden a exhibir polimerización de estas sales con el tiempo, formando especies con pesos moleculares que van desde aproximadamente 500 hasta aproximadamente 500.000 g/mol. En general, las especies de menor peso molecular tienen mayor efecto antitranspirante que las especies de mayor peso molecular. Sin pretender imponer una teoría, se cree que las moléculas más pequeñas ocluyen los poros de sudor más fácilmente y más eficazmente, produciendo de este modo el efecto antitranspirante deseado. Por lo tanto, la reducción del tamaño de los polímeros aumenta el efecto antitranspirante y, además, disminuye la cantidad de sal antitranspirante que es necesaria para controlar la transpiración. La capacidad para reducir la cantidad de sal antitranspirante en una formulación sin comprometer la eficacia tendría varias ventajas. Las sales antitranspirantes son un componente relativamente caro de una formulación típica antitranspirante. Por tanto, es muy deseable disponer de composiciones donde las sales antitranspirantes se estabilicen para reducir la polimerización.

20 El grado de polimerización antitranspirante se puede medir por cromatografía de exclusión de tamaño (SEC), también conocida como cromatografía de filtración en gel (GFC). El paso de moléculas pequeñas a través de una columna de SEC se retarda mientras que las moléculas grandes pasan más rápidamente. El tiempo de elución de una sustancia polimérica que migra a través de la columna de SEC está correlacionada con el tamaño de las moléculas de polímero y esta relación permite determinar el peso molecular aparente de un polímero. En la mayoría de los casos, pueden identificarse por SEC de 4 a 6 grupos bien definidos de especies polimerizadas en composiciones de sal de aluminio o aluminio-circonio y se conocen comúnmente como picos 1, 2, 3, 4, 5 y 6 (6 no siempre está presente). El pico 1 se asocia con las especies de circonio y así está presente sólo para las sales de aluminio-circonio. El pico 2 no siempre está presente en el caso de las sales de aluminio-circonio. El pico 6 no siempre está presente. Los picos anteriores (1, 2 y 3) corresponden a las especies más grandes y los picos posteriores (4, 5 y 6) corresponden a las especies más pequeñas y más deseables. Los picos se correlacionan con los valores de peso promedio de peso molecular para polímeros, no como valores discretos.

35 Sigue habiendo una necesidad en la técnica para mejorar las composiciones antitranspirantes y/o desodorantes. En particular, sería deseable proporcionar tales composiciones que tienen una estabilidad mejorada. Además, sería deseable proporcionar tales composiciones que tienen una mayor eficacia antitranspirante. Todavía sería aún más deseable proporcionar tales composiciones donde la formación de especies poliméricas de circonio y/o de aluminio de más alto peso molecular se redujese o se suprimiese, en particular cuando dicha reducción o supresión condujese a una eficacia mejorada, por ejemplo, en relación con la oclusión más eficaz de los poros de sudor.

40 El documento WO-A-2004/089325 da a conocer sales antitranspirantes sin glicina combinadas con betaína. El documento WO-A-2005/092795 divulga complejos de halogenuro de aluminio básicos. El documento US-A-2005/0036969 divulga una composición antitranspirante alcohólica acuosa que contiene sal de calcio antitranspirante mejorada.

Resumen de la invención

50 La presente invención proporciona una composición antitranspirante de acuerdo con la reivindicación 1. Las características preferidas se definen en las reivindicaciones dependientes.

También se proporciona un procedimiento para controlar la transpiración según la reivindicación 12, un procedimiento para controlar el olor según la reivindicación 13 y un procedimiento para la preparación de la composición antitranspirante según la reivindicación 14.

55 Descripción detallada de la invención

Los componentes de la composición antitranspirante pueden estar presente en forma libre o de sal y dependiendo de la formulación, pueden estar precipitados o disueltos o en forma de solvatos.

60 Las sales de aluminio o aluminio-circonio pueden estar presentes por ejemplo en forma de cloruro o clorhidrato, por ejemplo, cloruro de aluminio, clorhidrato de aluminio, sesquiclorhidrato de aluminio, diclorhidrato de aluminio, triclorhidrato de aluminio y circonio, tetraclorhidrato de aluminio y circonio, pentaclorhidrato de aluminio y circonio, octaclorhidrato de aluminio y circonio, o mezclas de los mismos. Opcionalmente, estas sales se pueden formar o proporcionarse en forma de complejos con otros compuestos, por ejemplo, complejos con los hidroxiácidos y/o ácidos de amonio cuaternario como se describe y/o aminoácidos, tales como glicina y/o alcoholes polivalentes, por ejemplo, etilenglicol, polietilenglicol, propilenglicol o polipropilenglicol. Cuando el antitranspirante comprende una sal

de aluminio-circonio, la sal puede, por ejemplo, tener una relación molar de aluminio a circonio de aproximadamente 2 a aproximadamente 10, por ejemplo, aproximadamente 2 a aproximadamente 5, o aproximadamente 5 a aproximadamente 10. En algunas realizaciones que comprenden una sal de aluminio-circonio, la sal de aluminio-circonio puede ser por ejemplo una sal clorhidrato de aluminio-circonio o un complejo de la misma, donde la relación molar entre (aluminio y circonio) y los átomos de cloro es de aproximadamente 0,9 a aproximadamente 2,1, por ejemplo, aproximadamente 1,2 a aproximadamente 1,8.

La betaína existe en forma de ion híbrido, formando una sal interna entre la parte de amonio cuaternario catiónico y la porción de ácido carboxílico aniónico. Sin embargo, puede estar presente en forma de sal, por ejemplo, en forma de sal de adición de ácido. Por ejemplo, la betaína se puede proporcionar en la forma de clorhidrato de betaína.

Un catión de metal divalente se puede proporcionar en forma de sal o de óxido, por ejemplo, de calcio en la forma de, por ejemplo, cloruro de calcio u óxido de calcio.

En una realización de la composición antitranspirante, la sal antitranspirante es una sal clorhidrato de aluminio-circonio, en donde la relación entre el metal (aluminio y circonio) y el cloruro es de aproximadamente 0,9 a aproximadamente 2,1, la relación entre la betaína y el circonio es de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 2 y la relación entre la betaína y el hidroxácido es de aproximadamente 0,2 a aproximadamente 30.

En una realización, la composición manifiesta una estabilidad mejorada en comparación con las formulaciones análogas que carecen de un hidroxácido o que carecen de un hidroxácido y un catión divalente, por ejemplo, según se mide mediante al menos uno de (a) una reducción en la formación especies de aluminio y/o circonio polimerizadas de un mayor peso molecular tal como se indica, al menos, por la reducción en el área de los picos de la SEC 2 y/o 3 y/o un incremento en el área de los picos de la SEC 4 y/o 5; (b) una reducción en la formación de especies de circonio polimerizadas de mayor peso molecular como se indica, al menos, por la reducción del área del pico de SEC 1, o (c) un aumento en el pico 5 en comparación con el pico 4. Por ejemplo, las composiciones cuando se analizaron por SEC como una solución acuosa al 5% usando condiciones capaces de resolver las especies de aluminio y/o circonio en al menos 4 picos sucesivos, en una realización, exhiben una relación entre el área de la SEC del primer pico principal (pico 1, polímero más grande) y la zona de la SEC del último pico principal (por lo general pico 5) de menos de aproximadamente 1 y en otra realización de menos de aproximadamente 0,25.

En una realización, se proporciona una formulación antitranspirante y/o desodorante para uso tópico, que comprende al menos una composición antitranspirante estabilizada en combinación con un vehículo cosméticamente aceptable. Tales formulaciones pueden ser conocidas en la técnica, por ejemplo, en la forma de una barra, gel, crema, bola líquida, o de pulverización de aerosol. Ejemplos de formulaciones que comprenden las composiciones antitranspirantes estabilizadas de la invención se proporcionan a continuación.

Las áreas de los picos de la SEC se utilizan como indicadores del tamaño del polímero de aluminio y de circonio en las soluciones de sales antitranspirantes. Se cree, sin pretender imponer ninguna teoría, que la eficacia antitranspirante y/o desodorante mejorada se asocia con el aumento en el área del pico 4 y/o 5 respecto al área del pico 2 y/o pico 3 y con la disminución en el área del pico 1, lo que indica un menor grado de polimerización de las especies de aluminio y de circonio, respectivamente. Las áreas relativas de los picos 1 a 5 constituyen el "perfil SEC", como se usa ese término en la presente memoria, de una composición antitranspirante y/o desodorante. Las composiciones estabilizadas de la invención mantienen, durante un período de tiempo, perfiles de SEC mejorados, lo que indica un menor grado de polimerización de las especies de aluminio y/o circonio después del envejecimiento, en comparación con las composiciones no estabilizadas, por ejemplo, composiciones que carecen de una sal de calcio y/o un hidroxácido.

Las áreas de los picos se pueden ajustar en función de un patrón interno, con un área del pico de aluminio total (suma de los picos 2 a 5) como denominador común. Esto es posible ya que el área total del pico de aluminio se mantiene constante. El ajuste de las áreas de los picos a un patrón interno de esta manera refleja mejor la distribución de polímero en la muestra.

En la composición de acuerdo con la invención, las cantidades relativas de los componentes (a), (b) y (c) como se describe anteriormente son tales que una solución acuosa de estos componentes en las mismas cantidades relativas, en una concentración de 25% de (a) + (b), tras el envejecimiento de la solución a 45 °C durante 60 días, tiene:

- (i) un área del pico 1 de la SEC ajustada de no más de 40%, por ejemplo, no más de 20%, o no más de 10%;
- (ii) un área del pico 5 de la SEC ajustada de al menos 30%, por ejemplo, al menos 40%; y
- (iii) un área del pico 4 de la SEC ajustada de al menos 15%.

El área del pico 4 de la SEC ajustada es opcionalmente no más de 25%.

En ciertas realizaciones, la sal de aluminio o aluminio-circonio de las composiciones antitranspirantes de la invención puede estar presente en la formulación tópica final en cualquier cantidad total adecuada, típicamente de

aproximadamente 4% a aproximadamente 35%, por ejemplo, de aproximadamente 10% a aproximadamente 25% o aproximadamente 15% a aproximadamente 20%, en peso de la formulación. Se entenderá que, si bien las cantidades en los diferentes intervalos de sales de aluminio, sales de aluminio-circonio o complejos de las mismas se indican en la presente memoria, se pueden utilizar cantidades menores para contribuir a la actividad desodorante de los productos desodorantes que no están clasificados como antitranspirantes.

Las composiciones antitranspirantes de la invención comprenden un compuesto ácido de amonio cuaternario, es decir, un ácido alfa-carboxílico de amonio cuaternario, que es betaína. La betaína es la sal interna del hidróxido de 1-carboxi-N,N,N-trimetilmetanaminio (nomenclatura de la IUPAC) y es de ion híbrido. Se produce naturalmente en muchos productos alimenticios y también se puede sintetizar. Aunque a veces incorrectamente referida como un aminoácido, se entenderá que la betaína no es verdaderamente un aminoácido. Un "componente betaína" en la presente memoria puede ser betaína o una sal de la misma. En ciertas realizaciones, el componente betaína comprende betaína, clorhidrato de betaína o una mezcla de los mismos. El componente de betaína puede, por ejemplo, estar presente en la formulación final para uso tópico en una cantidad total de 0,5 a 20%, por ejemplo, 5% a 15%, en peso. En una realización, cuando la composición comprende una sal de aluminio-circonio, la relación molar entre la betaína y el circonio puede ser de 0,1 a 2, por ejemplo, 0,1 a 1.

La composición de la invención también puede comprender opcionalmente al menos un catión divalente, por ejemplo, en forma de una sal. En una forma de realización, este catión es una sal de calcio u óxido de, por ejemplo, cloruro de calcio, bromuro de calcio, nitrato de calcio, acetato de calcio, formiato de calcio, gluconato de calcio, ascorbato de calcio, lactato de calcio, glicinato de calcio, citrato de calcio, carbonato de calcio, óxido de calcio, hidróxido de calcio, fosfato de calcio, fosfonato de calcio, picrolonato de calcio, sulfato de calcio, sulfonato de calcio, sulfocianato de calcio, perrenato de calcio o mezclas de los mismos. En ciertas realizaciones, la sal de calcio comprende un anión que tiene una cadena de alquilo o alquenilo C₁₋₆₀ lineal o ramificada y al menos un resto funcional capaz de unirse a un ion de calcio. El al menos un resto funcional puede ser un resto nitrato, sulfato, sulfonato, carbonato, carbonilo, fosfato, fosfonato o hidroxilo. El anión puede comprender uno o más heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno, oxígeno y azufre, formando parte tales heteroátomos de la cadena y/o parte del resto funcional. En una realización, cuando el catión divalente se proporciona en forma de una sal, esta puede estar presente en la formulación final en una cantidad total de 0,2% a 10%, por ejemplo, de 2% a 8%, en peso. En una realización, la relación molar entre el ion de metal divalente y de aluminio o (aluminio y circonio) puede ser de 0,02 a 1,2, por ejemplo, de 0,1 a 0,8.

La composición también comprende al menos un alfa-hidroxiácido y opcionalmente comprende además al menos un beta-hidroxiácido. En ciertas realizaciones, el hidroxiácido se elige entre ácido láctico, ácido glicólico, ácido lactobiónico, carnitina, ácido salicílico y mezclas de los mismos. En ciertas realizaciones, el alfa-hidroxiácido tiene un pK_a de 4,5 o menos, 2,5 a 4,5, o 3,5 a 4,0.

En ciertas realizaciones, el al menos un alfa-hidroxiácido está presente en una cantidad total de 0,2% a 10%, por ejemplo, 0,5% a 9%, o 2% a 8%, en peso. En ciertas realizaciones, la relación molar entre el compuesto ácido de amonio cuaternario y el hidroxiácido es típicamente de 0,2 a 30, por ejemplo, 5 a 25, o 10 a 20.

En ciertas realizaciones, la composición tiene:

- (i) una relación molar entre (aluminio y circonio) y los átomos de halógeno en la al menos una sal de aluminio-circonio o complejo de la misma de 0,9 a 2,1;
- (ii) una relación molar entre el aluminio y el circonio de 2 a 10;
- (iii) una relación molar entre el calcio y el (aluminio y circonio) de 0,02 a 1,2;
- (iv) una relación molar entre la betaína y el circonio de 0,1 a 2; y
- (v) una relación molar entre la betaína y el hidroxiácido de 0,2 a 30.

Los componentes opcionales que se pueden incluir en una formulación antitranspirante y/o desodorante de las composiciones antitranspirantes de la invención incluyen disolventes, alcoholes solubles en agua tales como alcoholes C₂₋₈ incluyendo etanol; glicoles, incluyendo propilenglicol, dipropilenglicol, tripropilenglicol y mezclas de los mismos; glicéridos, incluyendo monoglicéridos, diglicéridos y triglicéridos; ácidos orgánicos de cadena media a larga, alcoholes y ésteres; tensioactivos incluyendo agentes emulsionantes y dispersantes; aminoácidos incluyendo glicina; estructurantes incluyendo espesantes y agentes gelificantes, por ejemplo, polímeros, silicatos y dióxido de silicio; emolientes; fragancias y colorantes; incluyendo tintes y pigmentos. Si se desea, se puede añadir un agente antitranspirante y/o desodorante adicional a la sal de aluminio-circonio o complejo de la misma, por ejemplo, un agente reductor del olor, tal como un agente precipitante de azufre, por ejemplo, gluconato de cobre, gluconato de cinc, citrato de cinc, etc.

Las composiciones antitranspirantes se pueden formular en formulaciones antitranspirantes y/o desodorantes tópicas adecuadas para la aplicación a la piel, de manera ilustrativa una barra, un gel, una crema, una bola, un sólido blando, un polvo, un líquido, una emulsión, una suspensión, una dispersión o un aerosol. La composición puede comprender una única fase o puede ser un sistema de múltiples fases, por ejemplo, un sistema que comprende una fase polar y una fase oleosa, opcionalmente en forma de una emulsión estable. La composición

puede ser líquida, semi-sólida o sólida. Las siguientes formulaciones tópicas se proporcionan con fines ilustrativos:

En un ejemplo profético, la formulación está en la forma de un aerosol que comprende:

- 5 (a) aproximadamente 4% a aproximadamente 25% en peso en total de al menos una sal clorhidrato de aluminio-circonio o complejo de la misma;
 (b) aproximadamente 0,5 a aproximadamente 20% en peso en total de al menos un componente betaína;
 (c) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en peso en total de al menos una sal de calcio;
 10 (d) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en peso en total de al menos un hidroxiácido, incluyendo un alfa-hidroxiácido;
 (e) aproximadamente 35% a aproximadamente 87% en peso de agua;
 (f) aproximadamente 3% a aproximadamente 7% en peso en total de al menos un emoliente soluble en agua; y
 (g) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 3% en peso en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado entre los agentes tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos, tensioactivos anfóteros, copolióles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos.

En otro ejemplo profético, la formulación está en la forma de una bola que comprende:

- 20 (a) aproximadamente 4% a aproximadamente 25% en peso en total de al menos una sal clorhidrato de aluminio-circonio o un complejo de la misma;
 (b) aproximadamente 0,5 a aproximadamente 20% en peso en total de al menos un componente betaína;
 (c) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en peso en total de al menos una sal de calcio;
 25 (d) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en peso en total de al menos un hidroxiácido, incluyendo un alfa-hidroxiácido;
 (e) aproximadamente 27% a aproximadamente 88% en peso de agua;
 (f) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 3% en peso en total de al menos un silicato de magnesio y aluminio;
 30 (g) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 10% en peso en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado entre los agentes tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos, tensioactivos anfóteros, copolióles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos; y
 (h) 0% a aproximadamente 5% en peso en total de al menos un disolvente miscible en agua.

- 35 En ciertas realizaciones, la composición antitranspirante está presente en la formulación en una fase polar y la formulación comprende además una fase oleosa.

En otro ejemplo profético, la formulación está en la forma de barra, donde la fase polar comprende, en peso de la formulación:

- 40 (a) aproximadamente 4% a aproximadamente 30% en total de al menos una sal clorhidrato de aluminio-circonio o un complejo de la misma;
 (b) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 20% en total de al menos un componente betaína;
 45 (c) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos una sal de calcio;
 (d) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos un hidroxiácido, incluyendo un alfa-hidroxiácido;
 (e) aproximadamente 5% a aproximadamente 40% en total de agua, uno o más disolventes miscibles en agua, o una mezcla de los mismos; y
 50 (f) 0% a aproximadamente 5% en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado entre los agentes tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos, tensioactivos anfóteros, copolióles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos;

y la fase oleosa comprende, en peso de la formulación:

- 55 (g) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 8,0% de un agente gelificante poliamida siloxano;
 (h) aproximadamente 20% a aproximadamente 60% de un fluido a base de un componente orgánico volátil o silicona;
 (i) 0% a aproximadamente 20% en total de al menos un componente cosmético seleccionado entre alcoholes grasos C₈₋₂₂, ésteres grasos C₁₂₋₃₆, benzoatos de alquilo C₈₋₁₈, polisiloxanos lineales y mezclas de los mismos;
 60 (j) 0% a aproximadamente 10% en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado entre los agentes tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos, tensioactivos anfóteros, copolióles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos; y
 (k) 0% a aproximadamente 3% de una fragancia.

- 65 En otro ejemplo profético, la formulación está en la forma de una barra, donde la fase polar comprende, en peso de la formulación:

- (a) aproximadamente 4% a aproximadamente 30% en total de al menos una sal clorhidrato de aluminio-circonio o un complejo de la misma;
- (b) aproximadamente 0,5 a aproximadamente 20% en total de al menos un componente betaína;
- (c) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos una sal de calcio;
- 5 (d) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos un hidroxiaácido, incluyendo un alfa-hidroxiaácido;
- (e) aproximadamente 5% a aproximadamente 40% en total de agua, uno o más disolventes miscibles en agua, o una mezcla de los mismos; y
- 10 (f) 0% a aproximadamente 5% en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado entre los agentes tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos, tensioactivos anfóteros, copolióles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos;

y la fase oleosa comprende, en peso de la formulación:

- 15 (g) aproximadamente 20% a aproximadamente 60% en total de uno o más disolventes cosméticamente aceptables seleccionados de alcoholes polihídricos C₂₋₈, alcoholes grasos insaturados C₈₋₂₂, alcoholes grasos saturados C₈₋₂₂ de cadena lineal y ramificada y mezclas de los mismos;
- (h) 0% a aproximadamente 10% en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado entre los agentes tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos,
- 20 tensioactivos anfóteros, copolióles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos;
- (i) 0% a aproximadamente 3% de una fragancia; y
- (j) aproximadamente 5% a aproximadamente 25% en peso de una poliamida a base de dímero de ácido linoleico.

25 En otro ejemplo profético, la formulación está en la forma de un gel, donde la fase polar comprende, en peso de la formulación:

- (a) aproximadamente 4% a aproximadamente 35% en total de al menos una sal clorhidrato de aluminio-circonio o un complejo de la misma;
- 30 (b) aproximadamente 0,5 a aproximadamente 20% en total de al menos un componente betaína;
- (c) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos una sal de calcio;
- (d) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos un hidroxiaácido, incluyendo un alfa-hidroxiaácido;
- (e) aproximadamente 25% a aproximadamente 60% de agua;
- 35 (f) aproximadamente 5% a aproximadamente 40% en total de al menos un disolvente miscible en agua; y
- (g) 0% a aproximadamente 5% en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado entre los agentes tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos, tensioactivos anfóteros, copolióles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos;

40 y la fase oleosa comprende, en peso de la formulación:

- (g) aproximadamente 5% a aproximadamente 20% en peso de un líquido orgánico volátil;
- (h) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 2% en peso de un copoliol de dimeticona; y
- (i) aproximadamente 5% a aproximadamente 20% en peso de una silicona lineal.

45 En otro ejemplo profético, la formulación está en la forma de una crema, donde la fase polar comprende, en peso de la formulación:

- (a) aproximadamente 4% a aproximadamente 30% en total de al menos una sal clorhidrato de aluminio-circonio o un complejo de la misma;
- 50 (b) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 20% en total de al menos un componente betaína;
- (c) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos una sal de calcio;
- (d) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos un hidroxiaácido, incluyendo un alfa-hidroxiaácido; y
- 55 (e) aproximadamente 40% a aproximadamente 82% de agua;

y la fase oleosa comprende, en peso de la formulación:

- (f) aproximadamente 2% a aproximadamente 10% de un líquido orgánico volátil;
- 60 (g) aproximadamente 0,1% a aproximadamente 3% de un monoglicérido, diglicérido, triglicérido, o mezcla de los mismos;
- (h) aproximadamente 4% a aproximadamente 15% en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado de tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos, tensioactivos anfóteros, copolióles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos; y
- (i) aproximadamente 3% a aproximadamente 8% en total de al menos un alcohol graso C₈₋₂₂.
- 65

En otro ejemplo profético, la formulación está en la forma de una bola, donde la fase polar comprende, en peso de la formulación:

- 5 (a) aproximadamente 4% a aproximadamente 25% en total de al menos una sal clorhidrato de aluminio-circonio o un complejo de la misma;
- (b) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 20% en total de al menos un componente betaína;
- (c) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos una sal de calcio;
- (d) aproximadamente 0,2% a aproximadamente 10% en total de al menos un hidroxilácido, incluyendo un alfa-hidroxilácido;
- 10 (e) aproximadamente 30% a aproximadamente 50% de agua;
- (f) aproximadamente 5% a aproximadamente 40% en total de al menos un disolvente miscible en agua; y
- (g) 0% a aproximadamente 2% en total de al menos un agente tensioactivo cosméticamente aceptable seleccionado entre los agentes tensioactivos catiónicos, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos, tensioactivos anfóteros, copolíoles de dimeticona, etoxilatos de poliéter y mezclas de los mismos;

15 y la fase oleosa comprende, en peso de la formulación:

- (h) aproximadamente 20% a aproximadamente 50% de un líquido a base de un componente orgánico volátil o silicona; y
- 20 (i) aproximadamente 0,5% a aproximadamente 2% en peso de un copoliol de dimeticona.

La formulación antitranspirante y/o desodorante se puede proporcionar en cualquier recipiente adecuado como una lata de aerosol, tubo o recipiente con una tapa porosa, recipiente en bola, botella, recipiente con un extremo abierto, etc.

25 Un procedimiento de la invención para controlar la transpiración comprende aplicar a la piel una cantidad eficaz antitranspirante de una formulación de cualquier realización abarcada o descrita específicamente en la presente memoria.

30 Un procedimiento de la invención para controlar el olor de la transpiración comprende aplicar a la piel una cantidad efectiva desodorante de una formulación de cualquier realización abarcada o descrita específicamente en la presente memoria.

35 En un procedimiento de la invención para preparar una composición o formulación antitranspirante y/o desodorante, al menos una sal de aluminio-circonio o complejo de la misma se mezcla con al menos un componente de betaína en un medio acuoso y al menos una sal de calcio y al menos un hidroxilácido se añaden a la mezcla resultante para formar la composición. La selección de componentes particulares de aluminio-circonio, betaína, sal de calcio y componentes hidroxilácido y cantidades de estos componentes utilizados se puede hacer de acuerdo con la divulgación anterior.

40 A menos que se indique lo contrario, todos los porcentajes de los componentes de la composición dados en esta especificación son en peso basado en un peso total de la composición o formulación de 100%.

45 A menos que se indique específicamente de otro modo, en una realización, los componentes para uso en las composiciones y formulaciones de la presente invención son componentes cosméticamente aceptables. Por "cosméticamente aceptable" se entiende adecuado para su uso en una formulación para aplicación tópica a la piel humana. Un excipiente cosméticamente aceptable, por ejemplo, es un excipiente que es adecuado para aplicación externa en las cantidades y concentraciones previstas en las formulaciones de esta invención, e incluye, por ejemplo, los excipientes que son "generalmente reconocido como seguros" (GRAS) por la Administración de Alimentos y Fármacos de los Estados Unidos.

50 Para fines de esta solicitud, pKa significa el pKa en solución acuosa diluida a temperatura ambiente y presión, por ejemplo, a aproximadamente 25°C, utilizando técnicas de medición reconocidas en la técnica convencional. Para los ácidos que tienen más de un hidrógeno capaz de disociación y, por lo tanto, que tienen múltiples valores de pKa, el pKa para los propósitos de esta solicitud se refiere al equilibrio de ionización con respecto a la primera etapa de disociación del hidrógeno. Así, el pKa del ácido láctico para los propósitos como se define en la presente memoria sería de alrededor de 3,86 y del ácido glicólico sería de alrededor de 3,83.

60 Las composiciones y formulaciones como se proporcionan en la presente memoria se describen y reivindican con referencia a sus componentes como es habitual en la técnica. Como sería evidente para un experto en la materia, los componentes pueden en algunos casos reaccionar entre sí, de manera que la verdadera composición de la formulación final puede no corresponder exactamente a los componentes enumerados. Por lo tanto, se debe entender que la invención se extiende al producto de la combinación de los componentes enumerados.

65

Ejemplo

5 Se añaden combinaciones variables de CaCl_2 y/o hidroxiácidos (ácido láctico o ácido glicólico) a una solución al 25% de hidroxlorhidrato de circonio-aluminio con betaína (R309; en el presente documento "ZAB"). La solución de la muestra resultante se envejeció durante dos meses a 45 °C antes del análisis por SEC usando un detector del índice de refracción. La Tabla 1 muestra los datos para los picos de la SEC 1, 3, 4 y 5 para cada solución de muestra. El área ajustada se calcula utilizando el área total del pico de aluminio (suma de los picos 2-5) como denominador común.

10

Tabla 1: Áreas de los picos de SEC ajustadas después del envejecimiento

Solución de la muestra	Pico 1	Pico 3	Pico 4	Pico 5
ZAB (R309)	25,74	52,37	22,44	25,19
ZAB + Ácido láctico (2%)	8,57	46,24	11,58	42,18
ZAB + Ácido glicólico (2%)	42,32	44,66	10,01	45,32
ZAB + CaCl_2 (2%)	31,92	42,02	32,91	25,07
ZAB + CaCl_2 (2%) + ácido láctico (2%)	8,80	36,62	20,22	43,16
ZAB + CaCl_2 (2%) + ácido glicólico (2%)	37,86	37,99	18,92	43,09

15 La adición de ácido láctico al 2% disminuye área del pico 1 del 25,74% (ZAB solo) a 8,57% y en presencia de CaCl_2 de 31,92% (ZAB + CaCl_2) a 8,80%. Esto indica que el ácido láctico puede reducir la polimerización de especies de circonio. El ácido glicólico no reduce el área del pico 1 en este estudio.

15

20 La adición de ácido láctico 2% aumenta el área del pico 5 de 25,19% (ZAB solo) a 42,18% y en presencia de CaCl_2 de 25,07% (ZAB + CaCl_2) a 43,16%. Del mismo modo, la adición de ácido glicólico 2% aumenta el área del pico 5 de 25,19% (ZAB solo) a 45,32% y en presencia de CaCl_2 de 25,07% (ZAB + CaCl_2) a 43,09%. Estos resultados indican que los hidroxiácidos, tales como ácido láctico y ácido glicólico pueden reducir la polimerización de las especies de aluminio.

20

REIVINDICACIONES

1. Una composición antitranspirante que comprende un producto de mezcla de:

- 5 (a) al menos una sal seleccionada de entre al menos una sal de aluminio, al menos una sal de aluminio-circonio, al menos un complejo de sal de aluminio y al menos un complejo de sal de aluminio-circonio, donde la sal de aluminio o el complejo de sal de aluminio es al menos una sal seleccionada de entre cloruro de aluminio, clorhidrato de aluminio, sesquiclorhidrato de aluminio, diclorhidrato de aluminio y;
- 10 (b) al menos un alfa-hidroxiácido cosméticamente aceptable; y
- (c) al menos una betaína seleccionada de entre la sal interna del hidróxido de 1-carboxi-N,N,N-trimetilmetanamio y el clorhidrato de hidróxido de 1-carboxi-N,N,N-trimetilmetanamio;

en donde las cantidades relativas de los componentes (a), (b) y (c) son tales que una solución acuosa de estos componentes en las mismas cantidades relativas, en una concentración de 25% de (a) + (b), después del envejecimiento de la solución a 45 °C durante 60 días, tiene un área del pico 1 de la cromatografía de exclusión de tamaño "SEC" ajustada de no más del 40%, un área del pico 5 de la cromatografía de exclusión de tamaño "SEC" ajustada de no más de al menos 30% y un área del pico 4 de la cromatografía de exclusión de tamaño "SEC" ajustada de al menos, 15%, ajustándose cada pico en función del área del pico total de aluminio de la suma de los picos 2 a 5.

- 20 2. La composición de la reivindicación 1, donde la sal es un clorhidrato, opcionalmente seleccionado entre pentaclorhidrato de aluminio-circonio, octaclorhidrato de aluminio-circonio, tetraclorhidrato de aluminio-circonio, triclorhidrato de aluminio-circonio y mezclas de los mismos.
- 25 3. La composición de la reivindicación 1, donde el alfa-hidroxiácido se elige entre ácido láctico, ácido glicólico y combinaciones de los mismos.
4. La composición de la reivindicación 1, donde el alfa-hidroxiácido tiene un pK_a de menos de 4,5.
- 30 5. La composición de la reivindicación 1 que comprende además un catión de metal divalente.
6. La composición de la reivindicación 5, donde el catión metálico divalente es calcio y la relación entre el calcio y el metal (aluminio y circonio) en una base molar es de 0,02 a 1,2.
- 35 7. La composición de la reivindicación 1 que comprende además una sal de calcio seleccionada de entre cloruro de calcio, óxido de calcio y mezclas de los mismos.
8. La composición de la reivindicación 1, donde la sal de aluminio o aluminio-circonio comprende una sal clorhidrato de aluminio-circonio y donde la relación molar entre el metal (aluminio y circonio) y el ion cloruro para la sal es 0,9 a 2,1, opcionalmente la relación molar entre la betaína y el circonio es de 0,1 a 2 y/o opcionalmente la relación molar entre la betaína y el hidroxiácido es de 0,2 a 30.
- 40 9. La composición de la reivindicación 1, donde la composición comprende menos de 1% en peso de un aminoácido.
- 45 10. La composición de la reivindicación 1, que cuando se analiza por cromatografía de exclusión por tamaño como una solución acuosa al 5% usando condiciones capaces de resolver las especies de aluminio y/o circonio en al menos 4 picos sucesivos, la relación entre el área de la SEC del primer pico principal y el área de la SEC del último pico principal es menor que 1, opcionalmente menos de 0,25.
- 50 11. La composición de cualquier reivindicación anterior, donde el área del pico 1 de la SEC es no más de 10% y/o el área de pico 5 de la SEC es al menos 40%.
12. Un procedimiento para controlar la transpiración que comprende aplicar a la piel una formulación que comprende una cantidad eficaz antitranspirante de la composición de la reivindicación 1.
- 55 13. Un procedimiento para controlar el olor de la transpiración que comprende aplicar a la piel una cantidad eficaz de la composición desodorante de la reivindicación 1.
- 60 14. Un procedimiento para la preparación de la composición antitranspirante de la reivindicación 1, que comprende:
- i. la mezcla de la al menos una sal con la al menos una betaína en un medio acuoso; y
- ii. añadir a la mezcla resultante el al menos un alfa-hidroxiácido para formar la composición.