

(19)



**Евразийское  
патентное  
ведомство**

(11) **044389**

(13) **B1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

- (45) Дата публикации и выдачи патента  
**2023.08.23**
- (21) Номер заявки  
**202190945**
- (22) Дата подачи заявки  
**2019.10.23**
- (51) Int. Cl. *A61K 8/34* (2006.01)  
*A61K 8/37* (2006.01)  
*A61K 8/42* (2006.01)  
*A61K 8/58* (2006.01)  
*A61Q 15/00* (2006.01)

---

(54) **АНТИПЕРСПИРАНТНЫЕ КОМПОЗИЦИИ, НЕ СОДЕРЖАЩИЕ АЛЮМИНИЯ**

---

- (31) **18209520.8**
- (32) **2018.11.30**
- (33) **EP**
- (43) **2021.09.27**
- (86) **PCT/EP2019/078941**
- (87) **WO 2020/108885 2020.06.04**
- (71)(73) Заявитель и патентовладелец:  
**ЮНИЛЕВЕР ГЛОБАЛ АйПи  
ЛИМИТЕД (GB)**
- (72) Изобретатель:  
**Уотерфилд Филип Кристофер,  
Здравкова Анелия Николова (GB)**
- (74) Представитель:  
**Нилова М.И. (RU)**
- (56) WO-A1-9424993  
US-A1-2008267895  
GB-A-2273872  
US-A-4921694  
US-A1-2010104517

- 
- (57) Согласно изобретению предложена антиперспирантная композиция, содержащая этанол, амфифильный материал, летучий силикон и увлажняющее средство, где амфифильный материал представляет собой смесь, состоящую из монолаурата глицерина и изостеарилового спирта в соотношении от 25:75 до 45:55 по массе, при этом композиция имеет хорошую стабильность и хорошие показатели ухода за кожей.
- 

**B1**

**044389**

**044389**

**B1**

### Область техники

Настоящее изобретение относится к области косметических композиций и их применению в качестве антиперспирантов, в частности антиперспирантных композиций, не содержащих алюминия.

### Уровень техники

В EP 550960 A1 (Unilever, 1992) предложено применение в качестве активного антиперспирантного вещества амфифильного материала, который при контакте с потом образует нерастворимую в воде жидкокристаллическую фазу с более чем одномерной периодичностью. В указанной публикации не раскрыты ни этанольные композиции, ни вопросы их стабильности.

В WO 94/024993 (Unilever, 1994) предложена антиперспирантная композиция, содержащая амфифильный материал, который при контакте с потом образует нерастворимую в воде жидкокристаллическую фазу с более чем одномерной периодичностью, в косметическом носителе, содержащем летучий силикон и содержащем менее 10% по массе от общей массы композиции одноатомного короткоцепочечного спирта.

### Краткое описание изобретения

Задачей настоящего изобретения является создание антиперспирантной композиции, которая не требует присутствия соли алюминия или циркония для обеспечения антиперспирантного действия. Еще одна задача настоящего изобретения состоит в обеспечении этого с помощью композиции, которая имеет высокую степень стабильности при хранении и которая обеспечивает положительные эффекты ухода за кожей.

Задачей настоящего изобретения является обеспечение основы для антиперспирантной аэрозольной композиции, причем основа не содержит солей алюминия и имеет хорошую стабильность.

В первом аспекте изобретения предложена антиперспирантная композиция, содержащая этанол, амфифильный материал, летучий силикон и увлажняющее средство, где амфифильный материал представляет собой смесь, состоящую из монолаурата глицерина и изостеарилового спирта в соотношении от 25:75 до 45:55, при этом:

- (i) отношение амфифильного материала к (этанол + летучий силикон) составляет от 1:9 до 2:3;
- (ii) отношение летучего силикона к (этанол + амфифильный материал) составляет от 1:10 до 11:9;
- (iii) отношение этанола к (амфифильный материал + летучий силикон) составляет от 3:7 до 3:2 и
- (iv) общее количество увлажняющего средства в композиции составляет от 0,1 до 10%, за исключением любого пропеллента, который может присутствовать.

Во втором аспекте изобретения предложен способ получения антиперспирантной аэрозольной композиции, включающий добавление пропеллента к композиции в соответствии с первым аспектом изобретения.

В третьем аспекте изобретения предложен косметический способ обеспечения антиперспирантного действия, включающий местное нанесение композиции в соответствии с первым аспектом изобретения.

### Подробное описание изобретения

В настоящем описании признаки, выраженные как "предпочтительные" в отношении конкретного аспекта изобретения, следует понимать как предпочтительные в отношении каждого аспекта изобретения (аналогично, признаки, выраженные как "более предпочтительные" или "наиболее предпочтительные").

В настоящем описании предпочтительные признаки изобретения особенно предпочтительны при использовании в сочетании с другими предпочтительными признаками.

В настоящем описании "условия окружающей среды" относится к 20°C и давлению 101325 Па, если не указано иное.

В настоящем описании все проценты, соотношения и количества являются массовыми, если не указано иное.

В настоящем описании слово "содержащий" предназначено для обозначения "включающий", но не обязательно "состоящий из", т.е. не является исчерпывающим.

В настоящем описании под "косметическими" способами и композициями следует понимать нетерапевтические способы и композиции соответственно.

В настоящем описании "амфифильный материал" представляет собой материал, определяемый наличием как гидрофильных, так и гидрофобных частей в его структуре.

В настоящем описании "нерастворимый в воде" означает растворимость в воде менее 0,1% по массе (при 37°C).

Антиперспирантные композиции в соответствии с настоящим изобретением предпочтительно не содержат антиперспирантных солей алюминия или циркония. В действительности, они более предпочтительно не содержат любых солей алюминия или циркония.

В настоящем описании "не содержит" означает содержание менее 0,1% и предпочтительно менее 0,01% указанного компонента или компонентов.

В настоящем описании "летучий силикон" представляет собой силикон, имеющий давление пара более 1 Па при 25°C.

Композиции согласно настоящему изобретению особенно эффективны при нанесении на подмышечные области тела человека и/или ступни. Композиции особенно эффективны при нанесении на подмышечные области тела человека.

Аэрозольные антиперспирантные композиции состоят из пропеллента и основы. Компоненты основы обычно сначала смешивают вместе, а пропеллент добавляют в последнюю очередь в ходе процесса, который иногда называют "газированием". Важно, чтобы основа имела хорошую стабильность при хранении, поскольку период времени между приготовлением основы и добавлением пропеллента может быть значительным.

В настоящем описании "основа" аэрозольной антиперспирантной композиции представляет собой все компоненты конечной композиции, за исключением пропеллента.

Важно, чтобы готовая антиперспирантная композиция имела хорошую стабильность при хранении, чтобы она могла выдерживать длительную транспортировку в магазины и длительные периоды хранения на полках перед покупкой и использованием.

Амфифильный материал.

Амфифильный материал представляет собой смесь, состоящую из монолаурата глицерина и изостеарилового спирта в соотношении от 25:75 до 45:55

Важно, чтобы количество амфифильного материала, присутствующего в композиции, было достаточным для достижения приемлемой степени антиперспирантного действия при нанесении композиции на кожу тела человека. Амфифильный материал составляет по меньшей мере 10% трехкомпонентной смеси, состоящей из этанола, амфифильного материала и летучего силоксана.

Отношение амфифильного материала к (этанол + летучий силикон) составляет от 1:9 до 2:3, это соотношение альтернативно выражают как от 10:90 до 40:60. Следовательно, количество амфифильного материала в трехкомпонентной смеси, состоящей из этанола, амфифильного материала и летучего силоксана, составляет от 10 до 40%.

Амфифильный материал служит в качестве антиперспирантного активного вещества в композиции, подобно описанному в предшествующих публикациях EP 550960 A1 и WO 94/024993 от Unilever.

В соответствии с предпочтительным вариантом реализации изобретения амфифильный материал физически набухает и образует жидкокристаллическую структуру при контакте с потом, тем самым усиливая эффект закупорки пор.

Содержание амфифильного материала в конечной композиции, без учета любого пропеллента, составляет предпочтительно по меньшей мере 10%, более предпочтительно по меньшей мере 12% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 15%.

Летучий силикон.

Летучий силикон на уровне его включения служит для уменьшения потенциального раздражения и/или улучшения органолептических свойств композиции.

Отношение летучего силоксана к (этанол + амфифильный материал) составляет от 1:9 до 11:9, альтернативно выражаемое как от 10:90 до 55:45. Это приравнивается к содержанию летучего силоксана в количестве от 10 до 55% трехкомпонентной смеси, состоящей из этанола, амфифильного материала и летучего силоксана. Предпочтительно летучий силикон присутствует в количестве от 10 до 50% и более предпочтительно от 15 до 40% трехкомпонентной смеси, состоящей из этанола, амфифильного материала и летучего силоксана.

Содержание летучего силоксана в конечной композиции, без учета пропеллента, составляет предпочтительно от 10 до 67%, более предпочтительно от 10 до 50%, наиболее предпочтительно от 15 до 40%.

Предпочтительно летучий силикон содержит более 90% по массе или состоит из силоксанов, содержащих от 2 до 6 атомов кремния, расположенных либо циклически, либо линейно.

Линейные силоксаны имеют общую формулу



где Me = метильная группа (-CH<sub>3</sub>).

Когда n=0, силоксан представляет собой гексаметилдисилоксан.

Когда n=1, силоксан представляет собой октаметилтрисилоксан.

Когда n=2, силоксан представляет собой декаметилтетрасилоксан.

Когда n=3, силоксан представляет собой додекаметилпентасилоксан.

Особенно предпочтительно, чтобы летучий силикон содержал более 90 мас.% силоксанов, выбранных из группы, состоящей из гексаметилдисилоксана, октаметилтрисилоксана, декаметилтетрасилоксана, додекаметилпентасилоксана и декаметилциклопентасилоксана, или состоял из них.

Особенно предпочтительно, летучий силикон содержит более 90% по массе или состоит из силоксанов, выбранных из группы, состоящей из гексаметилдисилоксана, октаметилтрисилоксана, декаметилтетрасилоксана и декаметилциклопентасилоксана.

Этанол.

Этанол является необходимым компонентом композиций согласно настоящему изобретению, который способствует солубилизации амфифильного материала.

Отношение этанола к (амфифильный материал + летучий силикон) составляет от 3:7 до 3:2, альтернативно выражаемое как от 30:70 до 60:40. Это приравнивается к содержанию этанола в количестве от 30 до 60% трехкомпонентной смеси, состоящей из этанола, амфифильного материала и летучего силикона. Для дополнительного содействия солюбилизации амфифильного материала предпочтительно, чтобы отношение этанола к амфифильному материалу составляло по меньшей мере 10:7. Более предпочтительно это соотношение составляет по меньшей мере 2:1 или 67:33.

Содержание этанола в конечной композиции, без учета любого пропеллента, составляет предпочтительно по меньшей мере 30%, более предпочтительно по меньшей мере 33% и наиболее предпочтительно по меньшей мере 35%.

Увлажняющее средство.

Увлажняющее средство является необходимым компонентом композиций согласно настоящему изобретению. Увлажняющие средства, применяемые в настоящем изобретении, представляют собой гигроскопичные материалы, обладающие способностью к образованию водородных связей.

Назначение увлажняющего средства состоит в содействии уходу за кожей за счет удерживания влаги в коже. Это может улучшить барьерные свойства кожи.

Предпочтительные увлажняющие средства для применения в настоящем изобретении содержат множество гидрофильных групп, в частности гидроксильных групп и/или аминогрупп. Такие материалы могут быть особенно эффективными донорами водородных связей, что делает их особенно хорошими увлажняющими средствами.

В настоящем описании аминогруппы включают группы, связанные с карбонильной группой с образованием амида, являющиеся или не являющиеся частью большей функциональной группы.

Особенно предпочтительные увлажняющие средства выбраны из глицерина, 2-гидроксиэтилмочевины (ГЭМ) и пропиленгликоля (ПГ).

Другие предпочтительные увлажняющие средства представляют собой полигидроксилированные материалы, такие как ПГ, дипропиленгликоль (ДПГ) и глицерин.

Особенно предпочтительным увлажняющим средством является глицерин.

Общее количество применяемого увлажняющего средства составляет от 0,1 до 10%, за исключением любого пропеллента, который может присутствовать. Это содержание составляет предпочтительно от 0,5 до 6% и более предпочтительно от 1 до 5% композиции, за исключением любого пропеллента, который может присутствовать.

Включение увлажняющих средств в традиционные антиперспирантные композиции, содержащие антиперспирантные соли алюминия и циркония, было затруднительным. Авторы настоящего изобретения обнаружили, что эти средства могут быть включены в альтернативные антиперспирантные композиции согласно настоящему изобретению путем тщательного выбора количеств и соотношений компонентов. Отсутствие такого выбора приводит к получению многофазных или нестабильных композиций.

Другие компоненты.

В предпочтительных вариантах реализации изобретения композиция представляет собой аэрозольную антиперспирантную композицию, содержащую пропеллент. В таких композициях пропеллент составляет предпочтительно от 35 до 95% всей композиции, более предпочтительно от 40 до 90% и наиболее предпочтительно от 50 до 85% всей композиции.

При использовании пропеллент обычно представляет собой либо сжатый газ, либо материал, который кипит при температуре ниже комнатной, предпочтительно ниже 0°C и особенно ниже -10°C. Примеры сжатых газов включают азот и диоксид углерода. Примеры материалов с низкой температурой кипения включают диметиловый эфир. Другими возможными материалами с низкой температурой кипения, которые могут применяться в качестве пропеллентов, являются гидрофторуглероды, содержащие от 2 до 4 атомов углерода, по меньшей мере 1 атом водорода и от 3 до 7 атомов фтора.

В некоторых предпочтительных вариантах реализации, включающих аэрозольные антиперспирантные композиции, используемый пропеллент содержит диметиловый эфир или углеводород.

Когда композиции согласно изобретению представляют собой аэрозольные композиции, они могут быть получены обычным способом, согласно которому сначала получают композицию основы, затем загружают композицию основы в аэрозольный баллон, вставляют клапанный узел в горловину баллона, тем самым запечатывая баллон, и после этого загружают пропеллент в баллон до желаемого давления и, наконец, устанавливают привод на клапанный узел или над ним.

Предпочтительным дополнительным компонентом композиций согласно настоящему изобретению является дезодорирующее активное вещество. Обычно это противомикробные агенты, активные против бактерий на коже человеческого тела. Они служат для уменьшения неприятного запаха и особенно полезны в композициях, в которых амфифильный материал сам по себе не является противомикробным агентом.

При использовании уровень их включения составляет предпочтительно 0,01-5%, более предпочтительно 0,01-2% и наиболее предпочтительно 0,03-0,5% от массы всей композиции.

Предпочтительными антимикробными дезодорантами являются те, которые более эффективны, чем простые спирты, такие как этанол. Особенно предпочтительные антимикробные дезодоранты раствори-

мы в этаноле, это означает, что их растворимость в этаноле составляет по меньшей мере 10 г/л при 20°C. Примеры подходящих антимикробных дезодорантов включают ниацинамид; соединения четвертичного аммония, такие как соли цетилтриметиламмония; хлоргексидин и его соли; и монокапрат диглицерина, монолаурат диглицерина, монолаурат глицерина и аналогичные вещества, как описано в "Deodorant Ingredients", S.A. Makin и M.R. Lowry, в "Antiperspirants and Deodorants", Ed. K. Laden (1999, Marcel Dekker, New York). Более предпочтительными являются соли полигексаметиленбигуанида (также известные как соли полиаминопропилбигуанида), примером является Cosmocil CQ, доступный от Arch Chemicals, 2',4,4'-трихлор-2-гидроксифениловый эфир (триклозан), 3,7,11-триметилдодека-2,6,10-триенол (фарнезол), эфирные масла, такие как масло чайного дерева и масло тимьяна, климбазол, октапирокс, кетоконазол, пиритион цинка и их смеси.

Предпочтительным необязательным компонентом является консервант, такой как этил- или метилпарабены или ВНТ (бутилгидрокситолуол), обычно в количестве от 0,01 до 0,1% от массы всей композиции.

Далее изобретение будет описано с помощью некоторых примеров, которые не ограничивают объем изобретения.

### Примеры

В следующих примерах примеры в соответствии с настоящим изобретением обозначены цифрами, а сравнительные примеры обозначены прописными буквами.

Летучие силиконы, использованные в указанных примерах, представляли собой:

DC245 = циклопентасилоксан и

DC200 (1.5 cS) = декаметилтетрасилоксан, обозначаемый в настоящем описании как DC200.

Каждый из указанных материалов доступен от Dow Corning.

Амфифильный материал, использованный в указанных примерах, обозначен как "липид", и он представлял собой смесь монолаурата глицерина и изостеарилового спирта в соотношении 60:40.

Этанол, использованный в указанных примерах, представлял собой абсолютный спирт.

Летучий силикон, использованный в указанных примерах, представлял собой либо DC200, либо смесь DC245 и DC200 в соотношении 15:85, обозначенную в таблице как "Смесь".

Увлажняющие средства, использованные в указанных примерах, представляли собой гидроксиэтилмочевину (ГЭМ), пропиленгликоль (ПГ) и глицерин.

Композиции, приведенные в таблице, были получены с помощью способов, известных в данной области техники.

Пример	Этанол	Летучий силикон		Липид	Увлажняющее средство	
		Природа	% масс./масс.		% масс./масс.	Природа
1	45	Смесь	39	15	ГЭМ	1
2	45	DC200	39	15	ГЭМ	1
3	46	Смесь	33	20	ГЭМ	1
4	46	DC200	33	20	ГЭМ	1
5	44	Смесь	37	15	ПГ	4
6	44	DC200	37	15	ПГ	4
7	45	Смесь	21	20	ПГ	4
8	45	DC200	21	20	ПГ	4
9	60	DC200	11	25	ПГ	4
10	50	DC200	11	35	ПГ	4
A	30	DC200	21	45	ПГ	4
B	25	DC200	46	25	ПГ	4
11	35	DC200	51	10	ПГ	4
12	44	Смесь	37	15	Глицерин	4
13	44	DC200	37	15	Глицерин	4
14	45	Смесь	21	20	Глицерин	4
15	45	DC200	21	20	Глицерин	4
16	60	DC200	11	25	Глицерин	4
17	50	DC200	11	35	Глицерин	4
C	30	DC200	21	45	Глицерин	4
D	25	DC200	46	25	Глицерин	4
18	35	DC200	51	10	Глицерин	4

Стабильность композиций в соответствии с примерами 5-8 и 12-15 контролировали в течение 8 недель при 20°C. Стабильность композиций в соответствии со всеми другими примерами и сравнительными примерами контролировали в течение 4 недель при температуре окружающей среды.

Композиции в соответствии со всеми примерами согласно настоящему изобретению оказались стабильными в течение периода проведения исследования. Композиции в соответствии со сравнительными примерами А, В, С и D оказались нестабильными. Нестабильность проявлялась в виде разделения фаз, при этом липидный компонент (компоненты), как правило, кристаллизовался из жидкой фазы.

#### ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Антиперспирантная композиция, содержащая этанол, амфифильный материал, летучий силикон, имеющий давление пара более 1 Па при 25°C, и увлажняющее средство, выбранное из глицерина, 2-гидроксиэтилмочевины (ГЭМ) и пропиленгликоля (ПГ), где амфифильный материал представляет собой смесь, состоящую из монолаурата глицерина и изостеарилового спирта в соотношении от 25:75 до 45:55 по массе, при этом:

(i) отношение амфифильного материала к (этанол + летучий силикон) составляет от 1:9 до 2:3 по массе;

(ii) отношение летучего силикона к (этанол + амфифильный материал) составляет от 1:9 до 11:9 по массе;

(iii) отношение этанола к смеси (амфифильный материал + летучий силикон) составляет от 3:7 до 3:2 по массе;

(iv) общее количество увлажняющего средства в композиции составляет от 0,1 до 10% по массе, за исключением любого пропеллента, который может присутствовать;

(v) общее количество этанола составляет от 30 до 60% по массе трехкомпонентной смеси, состоящей из этанола, амфифильного материала и летучего силикона;

(vi) общее количество амфифильного материала составляет от 10 до 40% по массе трехкомпонентной смеси, состоящей из этанола, амфифильного материала и летучего силикона; и

(vii) общее количество летучего силикона составляет от 10 до 55% трехкомпонентной смеси, состоящей из этанола, амфифильного материала и летучего силикона.

2. Композиция по п.1, отличающаяся тем, что указанная композиция представляет собой аэрозольную композицию, содержащую пропеллент.

3. Композиция по п.2, отличающаяся тем, что указанный пропеллент представляет собой диметиловый эфир (ДМЭ) или углеводород.

4. Композиция по п.1 или 2, отличающаяся тем, что указанный пропеллент присутствует в количестве от 30 до 90% по массе от массы композиции.

5. Композиция по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что указанный летучий силикон содержит более 90% по массе силоксанов, выбранных из группы, состоящей из гексаметилдисилоксана, октаметилтрисилоксана, декаметилтетрасилоксана, додекаметилпентасилоксана и декаметилциклопентасилоксана.

6. Композиция по п.5, отличающаяся тем, что указанный летучий силикон содержит более 90% по массе силоксанов, выбранных из группы, состоящей из гексаметилдисилоксана, октаметилтрисилоксана, декаметилтетрасилоксана и декаметилциклопентасилоксана.

7. Композиция по любому из предшествующих пунктов, не содержащая антиперспирантных солей алюминия или циркония.

