



**TD DE
E DE
ION**

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 00026094 02000000 Folios: 56
Fecha (AMD): 2000-04-10 16:18:35
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social UNILEVER N.V. sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de Holanda

No. de Identificación _____

Representante Legal (Persona Jurídica) JOSE ANTONIO LLOREDA

País de Domicilio Holanda

Departamento o Estado _____

Dirección Weena 455, 3013 AL Rotterdam, Holanda

Ciudad Rotterdam Teléfono 44 123 4781781

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre JOSE ANTONIO LLOREDA

Dirección y Domicilio Calle 72 No. 5-83 Piso 6, Santafé de Bogotá, Colombia

Ciudad Santafé de Bogotá, D.C. Teléfono 57 1 3264270

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor(es) Kevin Ronald Franklin, Lynda Grainger y Adam Jan Kowalski

Identificación _____

Dirección Todos residen en: Unilever Research Port Sunlight, Quarry Road East, Bebington, Wirral, Merseyside CH63 3JW, Reino Unido

Ciudad Merseyside Teléfono 44 123 4781781

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención "COMPOSICIONES ANTITRANSPIRANTES"

PRIORIDAD REIVINDICADA SI ☒ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD ANDINA ☐ UNIONISTA ☒

(33) País GB (32) Fecha 12-04-99 (31)No. Solicitud 9908208.3

Para Publicar a los ☐ 6 meses ☐ 12 meses ☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente Solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

A61K7/32.

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

Las composiciones antitranspirantes aquí presentes comprenden un activo antitranspirante, un portador y un estructurante para el portador que contiene una concentración efectiva de una combinación de por lo menos un esterol y por lo menos un ester esterol, para formar un sólido o un sólido blando. Las composiciones pueden ser anhidro y estar en forma de suspensión de un activo antitranspirante, o pueden contener emulsiones acuosas.

Un esterol particularmente adecuado comprende β sitoesterol y un ester esterol particularmente preferido comprende orizanol. Preferiblemente la proporción molar de esterol a ester esterol está en el rango entre 3:1 y 1:2.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

- | | |
|--|-------------------------------------|
| Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica | ☐ |
| Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la S.I.C. 12.817 | ☒ |
| Recibo de la tasa respectiva \$608.000,00 | ☒ |
| Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación | ☐ |
| Si se reivindica prioridad Andina: | |
| Copia dela primera solicitud | ☐ |
| Traducción oficial | ☐ |
| Si se reivindica prioridad Unionista: | |
| Copia certificada de la primera solicitud: | ☐ |
| Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior | |
| Traducción Simple | ☐ |
| Capítulo descriptivo | ☒ |
| Dibujos, planos necesarios | ☐ |
| Capítulo reivindicatorio | ☒ |
| Tarjeta archivo propietarios según formato | ☒ |
| Tarjeta archivo temático según formato | ☒ |
| Extracto para publicación según formato | ☒ |
| Arte final 12 x 12 cms. Y 6x6 cms | ☐ |
| Otros Documentos | ☐ |
| Nota: Anexo información sobre la fuente normativa de reciprocidad y petición Reconocimiento Personería | ☒ |

SOLICITO LA CONCESIÓN DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA

NOMBRE JOSÉ ANTONIO LLOREDA

C.C. 17.159.681 de Bogotá TP No. 10.784



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176089-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00326094 0030000

Folios: 56

Fecha (AMD): 2000-04-10 16:18:35

Tramite : 032 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 22,114
FECHA : ABRIL 5 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	1000350	15,677,000.00

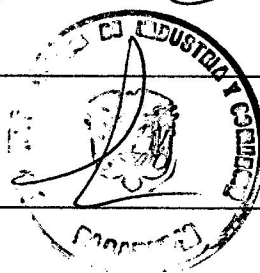
***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INV	608,000.00
		TOTAL	\$ 608,000.00

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.



ANEXO

Atentamente manifiesto a usted que la fuente normativa de la reciprocidad de la cual se deriva el derecho del solicitante para reivindicar prioridad en el presente caso, se encuentra:

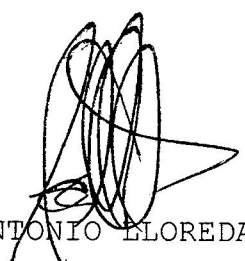
- a) En el Artículo 2 del Anexo 1C, Aspectos de los Derechos de Propiedad Intelectual relacionados con el Comercio, del Acuerdo por el cual se establece la "Organización Mundial de Comercio (OMC)" suscrito en Marruecos el 15 de abril de 1994. Este acuerdo fue aprobado por el Congreso de Colombia mediante Ley 170 de 1994 y por la Corte Constitucional Colombiana mediante Sentencia C-137-95 de 28 de marzo de 1995, y entró en vigencia en nuestro país el 30 de abril de 1995, 30 días después de su ratificación.

Dicho Artículo establece que en lo que respecta a las partes II, III y IV del Acuerdo (referidas a la existencia, alcance y ejercicio de los derechos de propiedad intelectual, entre otros) los Miembros cumplirán los artículos 1 a 12 y el Artículo 19 del Convenio de París —el Artículo que establece la prioridad de las patentes de invención es el Artículo 4--

- b) En el Artículo 4 del mencionado Anexo 1C, Aspectos de los Derechos de Propiedad Intelectual relacionados con el Comercio, del Acuerdo por el cual se establece la Organización Mundial de Comercio (OMC), el cual consagra el "Trato de la nación más favorecida" para los países Miembros del mismo.
- c) En el Artículo 4 del Convenio de París, del cual ya era parte Colombia en el momento en que se presentó la solicitud cuya prioridad ahora reivindico, con lo cual se cumple la reciprocidad exigida en el Artículo 12 de la Decisión 344 del Acuerdo de Cartagena para con solicitudes provenientes de los Países Miembros del Acuerdo de Cartagena.

ANEXO

El documento que acredita la calidad REPRESENTANTES LEGALES en Bogotá de los doctores JOSE LLOREDA CAMACHO y/o ALFONSO LLOREDA CAMACHO y/o JOSE ANTONIO LLOREDA para TODOS LOS ASUNTOS RELACIONADOS CON LA PROPIEDAD INDUSTRIAL de la sociedad peticionaria, que faculta a cada uno de dichos abogados para actuar individualmente, se encuentra protocolizado ante esa División bajo el No. 12.817. En consecuencia, ruego a usted reconocer la personería de cada uno de dichos Representantes Legales para actuar dentro del presente expediente, a fin de que cualquiera de ellos pueda intervenir en cualquier tiempo respecto de la solicitud en él contenida.



JOSE ANTONIO LLOREDA

T.P. No. 10.784

CODIGO 231

COMPOSICIONES ANTITRANSPIRANTES

Resumen: Objeto y Finalidad de la Invención

Las composiciones antitranspirantes aquí presentes comprenden un activo antitranspirante, un portador y un estructurante para el portador que contiene una concentración efectiva de una combinación de por lo menos un esteroide y por lo menos un éster esteroide, para formar un sólido o un sólido blando. Las composiciones pueden ser anhidras y estar en forma de suspensión de un activo antitranspirante, o pueden contener emulsiones acuosas.

Un esteroide particularmente adecuado contiene β sitosterol y un éster esteroide particularmente preferido que contiene orizanol. Preferiblemente la proporción molar de esteroide a éster esteroide está en el rango entre 3:1 y 1:2.

COMPOSICIONES ANTIPERSPIRANTES

Campo Técnico

La presente invención se relaciona con composiciones antitranspirantes y en particular a composiciones espesas o estructuradas.

Antecedentes y Técnica Anterior

Las composiciones antitranspirantes comúnmente aplicadas son de amplio uso a lo largo de gran parte del mundo, para permitir a sus usuarios evitar o minimizar los parches húmedos visibles en su piel, especialmente en las regiones axilares.

Las formulaciones antitranspirantes han sido aplicadas usando un rango de diferentes aplicadores, incluyendo aerosoles, roll on, bombas de aplicación, barras y aplicadores tipo hongo, de acuerdo con las preferencias individuales de los usuarios. En algunas partes del mundo, las barras son especialmente populares. El término barra tradicionalmente indica una barra de un material sólido que usualmente se aloja dentro de un contenedor dispensador y que retiene su integridad mientras está siendo aplicada, una barra firme. Cuando una porción de una barra firme se desliza a lo largo de la superficie de la piel, una película de la composición de la barra se transfiere a la superficie de la piel. Aunque la barra tiene la apariencia de un artículo sólido, el material que forma la barra usualmente comprende una fase

líquida estructurada de manera tal que la película del material sea rápidamente transferida a otra superficie al contacto bajo presión.

Más recientemente, el término ha sido aplicado a sólidos blandos, que tienen una aparente forma sólida durante el almacenamiento, pero que fluyen bajo una presión suave o corte, de modo que al usarlos puedan ser extruidos a través de una apertura o aperturas a una superficie dispensadora. Los sólidos blandos mantienen su forma por al menos 30 segundos si son removidos bajo condiciones de no corte/estrés del contenedor, pero si se someten a corte o estrés, su estructura es destruida y no más de una fracción menor de la estructura puede ser reformada dentro de un período de aproximadamente 24 horas cuando el corte/estrés sea removido.

Hay normalmente tres clases de barras antitranspirantes, principalmente barras de suspensión, barras de emulsión y barras de solución. Las barras de suspensión contienen un material activo antitranspirante particulado suspendido en un portador estructurado. Las barras de emulsión normalmente comprenden una emulsión de una fase de aceite y una fase hidrofílica que contiene el activo antitranspirante en solución, siendo estructurada la fase continua. En algunas barras de emulsión, la fase continua es una fase de aceite. En barras de solución, el antitranspirante es normalmente disuelto en la fase de portador líquido que es estructurada. La fase líquida puede comprender agua y/o un solvente orgánico miscible en agua. Las tres categorías pueden ser aplicadas tanto a barras de composiciones sólidas firmes como blandas.

Convencionalmente, muchas barras han sido estructuradas usando ceras de ocurrencia natural o sintéticas, de las cuales ejemplos típicos incluyen alcohol estearilo, ceras de hidrocarburos o ceras de silicona. Las ceras están ampliamente disponibles y mediante selección adecuada de las ceras mismas y sus concentraciones en la

formulación pueden efectivamente obtener ya sea un sólido blando como un sólido firme. Así, por ejemplo, barras estructuradas con cera se describen en un artículo en *Cosmetics and Toiletries*, 1990, vol 105, p75-78. Sin embargo, barras de alcohol graso o estructuradas con cera tienden a dejar depósitos blancos visibles en la aplicación sobre la piel humana, y los depósitos pueden también ser transferidos a la ropa por contacto físico con la piel. Una proporción significativa y posiblemente creciente, de consumidores de antitranspirantes han indicado desagrado hacia los depósitos blancos. De igual manera, la industria antitranspirante, incluyendo los presentes inventores, han dedicado tiempo y recursos considerables para encontrar medios para mejorar o sobrepasar la percepción del consumidor de los depósitos blancos.

Un numero de estructurantes alternativos de ceras han sido propuestos. El término "gelante" es a menudo empleado en lugar de "estructurante". Donde el producto resultante es un líquido de viscosidad incrementada en lugar de un sólido o gel, el término "espesante" también puede ser usado. Por ejemplo, el uso de sorbitol dibencilideno (DBS) o los derivados resultantes han sido propuestos como gelantes en un número de publicaciones, tales como EP 0512770, WO 92/19222, USP 4822 602 y USP 4725430. Las formulaciones que contienen dichos gelantes pueden sufrir de un número de desventajas, incluyendo inestabilidad en la presencia de antitranspirantes ácidos, y las temperaturas de procesamiento comparativamente altas necesarias en la producción de barras. Algunas de tales formulaciones que contienen dichos gelantes son pegajosas o grumosas.

Una combinación de una amida n-acilaminoácido y ácido 12-hidroxiesteárico para gelatinizar una formulación no acuosa se describe en WO 93/23008 y en USP 3989087. Sin embargo, se necesitan altas temperaturas de procesamiento para disolver los gelantes y prevenir la gelatinización prematura. Cuando se aplica sobre la piel, la formulación

puede ser difícil de lavar, una reformulación para sobrepasar este problema puede ser imposible por la necesidad de alta temperatura de procesamiento.

En WO 97/11678 a Helene Curtis, Inc. se describe el uso de un esteroil y particularmente lanoesteroil como gelante, algunas veces junto con un derivado hidrolizado de almidón para composiciones antitranspirantes.

En WO 98/34588 a Lancaster Group GmbH, se describe el uso de lanoesteroil como gelante para composiciones cosméticas basadas en aceite, que contienen un material cosmético activo, de los cuales un material listado es un desodorante, aunque no se ejemplifica.

Objetos de la Invención

Es un objeto de la presente invención mejorar o sobrepasar una o más de las anteriores desventajas de las barras estructuradas. En un objeto particular de la invención, en al menos un aspecto, comprende suministrar una barra que presente depósitos de baja visibilidad gelatinizados por un sistema no cérico.

Resumen de la Invención

De acuerdo con la presente invención se suministra una composición antitranspirante que contiene un activo antitranspirante, un portador líquido y un estructurante incluyendo un esteroil para espesar o solidificar la composición caracterizada por que el estructurante

comprende una concentración efectiva de una combinación de al menos un esteroide y al menos un éster esteroide.

La combinación del esteroide con el éster esteroide en una razón de mol adecuada permite que el portador líquido hidrofóbico en la formulación antitranspirante se estructure efectivamente y en una manera controlable rápidamente. La combinación de la invención de gelantes, un sistema de gelantes gemelos, ha demostrado una gelatinización superior en comparación con cada constituyente. Sin estar limitado a ninguna teoría específica o explicación de por que la combinación es tan efectiva, se cree que los constituyentes esteroide y el éster esteroide se apilan el uno con el otro para formar una red de hilos, siendo el apilamiento regular. La presencia de ambos constituyentes en el apilamiento parece motivar el crecimiento de los hilos y resultan en una red que es superior a aquella de cada constituyente por si mismo.

El empleo de un sistema de gelantes gemelos puede evitar o al menos mejorar un problema potencial de gelatinización prematura que algunas veces puede surgir si se emplea un sistema de gelante único, por ejemplo, mediante el control de la manera y el tiempo en el cual los dos componentes del sistema de gelantes gemelos son mezclados en la fase a ser gelatinizada.

Descripción detallada de la Invención

La formulación de la invención comprende como constituyentes esenciales

- a) un sistema gelante de esteroide/éster esteroide en adición a;
- b) un activo antitranspirante y
- c) un portador líquido

El sistema gelante esterol/éster esterol comprende el esterol y el éster esterol en una proporción molar que es normalmente seleccionada del rango entre 10:1 a 1:10, especialmente entre 6:1 a 1:4, y preferiblemente de 3:1 a 1:2. El empleo de los dos constituyentes del sistema dentro de dicho rango de razón de mol, y especialmente dentro del rango preferido facilita el co-apilamiento de los constituyentes y consecuentemente facilita la formación de una red que es rápidamente capaz de estructurar la formulación.

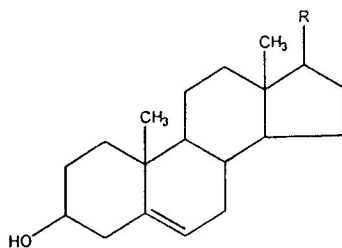
El sistema de gelantes gemelos de la invención está deseablemente presente en una concentración mayor que 0.5%, y preferiblemente mayor que 1%. Está normalmente presente a una concentración de hasta un 20%, y en muchas realizaciones preferidas de no más de 15%. Las concentraciones aquí incluidas son expresadas en peso basada en las formulaciones, a menos que se indique explícitamente lo contrario, siendo ellas para el sistema gelante o algún otro constituyente. Excepto en ejemplos operativos o comparativos, todos los números aquí incluidos que indican cantidades o proporciones de materiales tales como límites de rangos deben ser entendidos como modificados por, a menos que se indique expresamente lo contrario.

La dureza de la barra o la viscosidad de la formulación varían dependiendo, entre otros parámetros, tanto en la concentración del sistema de gelantes gemelos como de la escogencia de la razón de mol de los dos constituyentes del sistema. Para preparar un sólido blando, se prefiere emplear el sistema en una concentración en el rango entre 1.2 a 2.75% y una concentración más alta para preparar un sólido, particularmente de 3.5 a 9%. La formulación tiende a demostrar mayor dureza al incrementar la razón de esterol a éster esterol. Esta propiedad es un beneficio notable, ya que permite que la dureza de la formulación sea afinada con precisión mientras permite que las

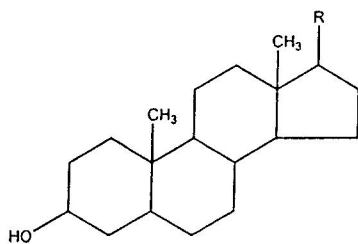
concentraciones generales del sistema gelante y los constituyentes remanentes se mantengan sin cambios.

En este documento, el esteroide comprende un alcohol poliacrílico que contiene al menos 24 átomos de carbono y contiene al menos 4 anillos condensados, y cada anillo tiene al menos 3 átomos de carbono y preferiblemente de 3 a 6 átomos de carbono, y especialmente 5 ó 6 átomos de carbono. El sistema de anillos puede ser saturado o puede contener al menos un grado de no saturación. En un número de esteroides deseables, los anillos son aproximadamente planos y en aún otros esteroides deseables, el sustituyente hidroxil es equatorial. Preferiblemente, el esteroide no comprende lanosterol.

En realizaciones particularmente preferidas, el esteroide satisface una de las siguientes fórmulas:



(1)



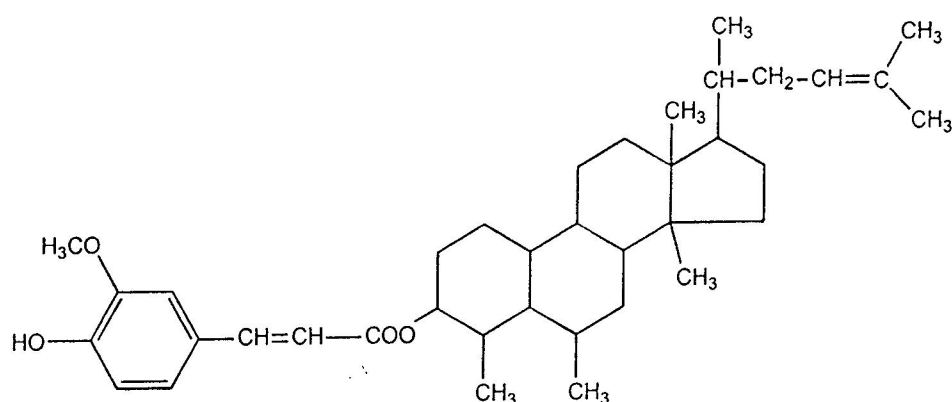
(2)

en las cuales R representa un grupo alifático, cicloalifático o aromático, y preferiblemente un grupo de hidrocarburo saturado o no saturado alifático lineal o ramificado. R deseablemente contiene de 1 a 20 carbonos y preferiblemente de 4 a 14 carbonos.

Es particularmente adecuado emplear β -sitoesterol o capesterol o colesterol, o un derivado hidrogenado resultante, tal como dihidrocolesterol, o una mezcla de dos o más de estos. Un esterol especialmente preferido es β -sitoesterol.

El éster esterol empleado aquí es ventajosamente un éster que emplea los esteroides descritos arriba con un ácido fenólico. El término ácido fenólico como se emplea aquí, se relaciona con la familia del ácido cinámico, tal como ácido caféico y ácido ferúlico. Resultados benéficos han sido obtenidos cuando la estructura del anillo del éster esterol coincide con la estructura del anillo del esterol, por ejemplo en términos de un número, tamaño y posición relativa de los anillos fusionados. El éster esterol preferiblemente es substituido por un grupo alifático, cicloalifático o aromático en un anillo de carbono remoto del éster substituyente, y más preferiblemente el espaciado relativo del grupo éster de aquel del grupo alifático, cicloalifático o aromático en el éster esterol es el mismo que el espaciado del grupo hidroxil de ese grupo alifático, cicloalifático o aromático en el esterol. Es altamente deseable emplear un hidrocarburo substituyente que puede ser lineal o ramificado y saturado o no saturado, que contenga de 2 a 20 y particularmente de 4 a 14 carbonos. Una sub clase conveniente de substituyentes comprende hidrocarburos ramificados que contengan de 5 a 10 átomos de carbono y un grado de no saturación.

Es particularmente adecuado emplear como el éster esterol, orizanol, algunas veces referido como γ orizanol que consiste en una mezcla de ésteres de ácido ferúlico de alcoholes tirterpeno no saturados y contiene materiales que satisfacen la siguiente fórmula (3):-



(3)

Un sistema de gelantes gemelos especialmente preferido comprende β -sitoesterol y γ orizanol, ventajosamente dentro de los rangos de proporciones molares descritos anteriormente.

La combinación de la invención de esteroles mas éster esteroles forma una red de hilos o fibras interconectados que se extienden por todo el líquido portador hidrofóbico o fase hidrofóbica si el líquido portador además comprende una fase polar dispersa. Las fibras interconectadas son generalmente delgadas, con un diámetro normalmente menor a 0.5 μm y a menudo menor que 0.2 μm y tienen numerosas ramas o interconexiones.

Para uso en un campo son relacionado, se describe en WO 97/42830 a Unilever NV la adición de dos diferentes esteroles específicos, preferiblemente fitoesteroles para incrementar la firmeza de las grasas líquidas, tales como grasos comestibles, sin que ninguna sugestión de dichos esteroles sea contemplada para gelatinizar un portador líquido en composiciones antitranspirantes.

El segundo constituyente esencial de las composiciones de la invención es un activo antitranspirante. Los activos antitranspirantes, son preferiblemente incorporados en una cantidad entre 0.5-60%, particularmente de 5 a 30 ó 40% y especialmente de 10 a 30 ó 35%.

Los activos antitranspirantes para uso aquí son a menudo seleccionado de sales astringentes activas, incluyendo en particular sales de aluminio, sales de circonio y sales mezcladas de aluminio-circonio, incluyendo para cada uno tanto sales inorgánicas y sales orgánicas y complejos. Las sales astringentes preferidas incluyen aluminio, circonio, y haluros de aluminio-circonio y sales halohidratos tales como clorhidratos.

Las sales de aluminio preferidas incluyen halohidratos de aluminio que tengan una fórmula general $Al_2(OH)_xQ_y \cdot wH_2O$ en la cual Q representa cloruro, bromuro o yoduro, x es de 2 a 5 y $x+y=6$, x y y son ya sea enteros o no enteros y w representa una cantidad variable de hidratación, que puede ser cero. Algunos sales halohidratos especialmente preferidas comprenden clorhidratos de aluminio activados tales como aquellos descritos en EP-A-6739 (Unilever NV et al), el contenido de dicha especificación es incorporada aquí para referencia.

Las sales activadas retienen su actividad aumentada y son ventajosamente empleadas en formulaciones substancialmente anhidridas, p.e. en formulaciones que no contienen una fase acuosa distintiva. Algunas sales activadas también pueden retener su actividad aumentada en formulaciones hidras.

Un rango de sales de circonio que pueden ser empleadas deseablemente en las composiciones antitranspirantes aquí incluidas es representado por la siguiente fórmula general empírica: $ZrO(OH)_{2n-nz}B_z \cdot wH_2O$ en la cual z es un entero o no entero en el rango entre 0.9 y

2.0, n es la valencia de B, $2-nZ$ es al menos 0, B es seleccionado entre el grupo consistente en haluros, incluyendo cloruro, sulfamato, sulfato y las mezclas resultantes y w representa una cantidad variable de hidratación, que puede ser cero. En las sales preferidas de circonio, B representa cloruro y z está en el rango entre 1.5 y 1.87. En la práctica, tales sales de circonio no son usualmente empleadas por si mismas, per como un componente de un antitranspirante basado en la combinación de aluminio y circonio, el componente de aluminio normalmente es seleccionado de acuerdo con la fórmula arriba mencionada para halohidratos. Las sales especialmente deseable comprenden clorhidratos mezclados de aluminio-circonio, opcionalmente activados.

Se reconocerá que las fórmulas identificadas arriba para aluminio, circonio y sales de aluminio-circonio son empíricas y abarcan compuestos que tienen agua coordinada y/o limitante en varias cantidades así como especies poliméricas y mezclas y complejos. En particular, las sales hidroxí de circonio a menudo representan un rango de sales que tienen varias cantidades del grupo hidroxí.

Los complejos antitranspirantes basados en las arriba mencionadas sales astringentes de aluminio, circonio y aluminio-circonio pueden deseablemente ser empleadas en la presente invención. Preferiblemente, los materiales de halohidrato de aluminio y/o clorhidrato de circonio son convertidos en complejos. El complejo a menudo emplea un ácido carboxílico o un grupo carboxilato, y ventajosamente un aminoácido. Ejemplo de amino ácidos adecuados incluyen dl-triptofano, dl-β-fenilalanina, dl-valina, dl-metionina y β-anilina y preferiblemente glicina que satisface la fórmula $\text{CH}_3\text{CH}(\text{NH}_2)\text{CO}_2\text{H}$.

Es altamente deseable emplear complejos de una combinación de halohidratos de aluminio y clorhidratos de circonio junto con amino ácidos tales como glicina, como aquellos revelados en US-A3792038

(Luedders et al). Algunos de esos complejos de Al/Zr son comúnmente llamados ZAG en la literatura. Los activos ZAG generalmente contienen aluminio, circonio y cloruro con una razón de Al/Zr en el rango entre 2 a 10, especialmente de 2 a 6 una razón de (Al-Zr)/Cl en el rango de 2.1 a 0.9 y una cantidad variable de un amino ácido, particularmente glicina. Los activos de este tipo preferido están disponibles de Westwood, Summit y Reheis.

En algunas formulaciones, es particularmente preferible emplear complejos ZAG activados que pueden ser producidos por el proceso revelado en la USP 5486347 (Callaghan et al).

Otros activos que pueden ser utilizados comprenden lactatos de aluminio, sales borato de enlace cruzado de aluminio y sales astringentes de titanio, por ejemplo aquellas descritas en GB 2299506 A. Otros activos incluyen clorlinérgicos, antihistamínicos y antiandrenéricos.

La proporción de sal antitranspirante sólida en la composición normalmente incluye el peso de cualquier agua de hidratación y cualquier agente de complejo que también pueda estar presente. Sin embargo, cuando la sal antitranspirante se disuelve en la solución acuosa, su peso excluye cualquier agua presente.

En algunas realizaciones de la presente invención, las sales antitranspirantes usadas aquí en forma particulada, y particularmente en composiciones que no comprenden una fase acuosa o hidrofílica. Tales composiciones son convenientemente referidas como anhidras o substancialmente anhidras. El tamaño de partícula de las sales antitranspirantes en dichas composiciones a menudo cae dentro del rango entre 1 a 200 μm con un tamaño de partícula medio de 3 a 20 μm , de manera tal que los barriles convencionales se llenan con procesos de vertimiento convencionales. Tanto los tamaños medios de

partículas grandes como pequeños pueden también ser contemplados desde 20 a 50 μm O 0.1 a 3 μm .

En otras realizaciones, el activo antitranspirante puede ser empleado en forma de solución, por ejemplo cuando la composición comprende una fase polar, normalmente que comprende agua y/o un solvente miscible en agua. En dichas realizaciones, la concentración del activo antitranspirante en solución (en la fase polar dispersa) está con frecuencia en el rango entre 3 y 60%, basado solamente en la fase polar, particularmente entre 10 o 20% hasta 55% o 60% de esta fase.

El tercer constituyente esencial de la composición es un portador líquido, a menudo en una proporción de 20 a 95% de la composición, y particularmente de 40 a 90%.

El portador que es incorporado en las composiciones aquí incluidas comprende uno o más materiales que son líquidos en los cuales la composición se usa o puede ser gelatinizada o por el contrario estructurada por el estructurante para proveer un sólido firme o extruible en la temperatura de uso, que convencionalmente es la temperatura residencial, la cual está usualmente debajo de los 40° C y en muchas instancias debajo de 30° C y a menudo en al menos 15° C. El portador puede ser hidrofóbico o una mezcla de hidrofóbico e hidrofílico, estando este último normalmente en la forma de una emulsión. Es particularmente deseable que el portador aquí incluido contenga suficiente material hidrofóbico para producir una fase continua en la cual una fase hidrofílica discontinua o una fase particulada puedan ser dispersas. El sistema de gelantes gemelos de la presente invención es adecuado especialmente para gelatinizar un medio hidrofóbico y que también estructure una fase de aceite dispersa, que deba estar presente.

El líquido portador hidrofóbico puede tener alguna volatibilidad o contener constituyentes volátiles pero generalmente su presión de vapor será menor que 4 kPa a 25° C, de manera tal que pueda ser descrito como un aceite o una mezcla de aceites. Más específicamente, se desea que al menos 80% en peso del líquido portador hidrofóbico consista de materiales que tengan una presión de vapor no superior a 4 kPa a 25° C.

Una clase de portadores que es particularmente deseable aquí es hidrofóbica y comprende siliconas líquidas, para promover buenas propiedades sensoriales en el momento del uso de la formulación. Preferiblemente al menos una fracción mayor del portador de silicona está constituido por al menos un poliorganosiloxano volátil, p.e. materiales líquidos que tengan una presión de vapor medible bajo condiciones ambiente (cerca de 20 a 25° C). Típicamente, la presión de vapor de las siliconas volátiles está en el rango entre 1 ó 10Pa a 2Kpa a 25° C. Los poliorganosiloxanos volátiles pueden ser lineales o cíclicos o las mezclas resultantes. Los siloxanos cíclicos preferidos incluyen polidimetilsiloxanos y particularmente aquellos que contengan de 3 a 9 átomos de silicio y preferiblemente no más de 7 átomos de silicio y más preferiblemente de 4 a 6 átomos de silicio, a menudo referidos como ciclometiconas. Los siloxanos lineales preferidos incluyen polidimetilsiloxanos que contengan de 3 a 9 átomos de silicio. Los siloxanos volátiles, por si mismos normalmente presentan viscosidades menores que $1 \times 10^{-5} \text{ m}^2/\text{seg}$ (10 centistokes), y particularmente arriba de $1 \times 10^{-7} \text{ m}^2/\text{seg}$ (0.1 centistokes), los siloxanos lineales normalmente presentan una viscosidad por debajo de $5 \times 10^{-6} \text{ m}^2/\text{seg}$ (5 centistokes) Las siliconas volátiles también pueden comprender siloxanos lineales, ramificados o cíclicos tales como los anteriormente mencionados siloxanos lineales o cíclicos substituidos por uno o más grupos $-\text{O}-\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ pendientes. Ejemplos de los aceites de silicona comercialmente disponibles incluyen aceites que tienen designaciones de grado 344, 345, 244, 245 y 246 (de Dow Corning).

La Silicona 7207 y la Silicona 7158 (de union Carbide Corporation) y la SF1202 (de General Electric [US]). Las siliconas volátiles a menudo están presentes en la composición en una proporción de hasta 80%, particularmente de 10 a 70% y en un número de instancias de 20 a 60%.

El portador hidrofóbico empleado en las composiciones aquí incluídas puede alternativamente o adicionalmente comprender aceites de silicona no volátiles, los cuales incluyen siloxanos polialquilo, siloxanos polialquilarilo y copolímeros polietersiloxano. Estos pueden ser adecuadamente seleccionados de dimeticona y copolios de dimeticona. Aceites de silicona no volátiles comercialmente disponibles incluyen las series Dow Corning 556 y Dow Corning 200. Las siliconas no volátiles están a menudo presentes en no más de cerca del 30% en peso de la composición, y preferiblemente de 1 a 15% en peso. En muchas instancias, cuando un aceite de silicona no volátil está presente, su razón de peso al aceite de silicona volátil se escoge en el rango entre 1:3 a 1:40.

Los portadores orgánicos hidrofóbicos libres de silicio pueden ser incorporados en las composiciones de la invención en adición a o en lugar de las siliconas líquidas, p.e. de 0 a 100% de los líquidos portadores hidrofóbicos. Dichos materiales portadores orgánicos hidrofóbicos libres de silicio pueden incluir hidrocarburos alifáticos líquidos tales como aceites minerales o polisobuteno hidrogenado, a menudo seleccionados por presentar una baja viscosidad. Ejemplos adicionales de los hidrocarburos líquidos comprenden polideceno e isoparafinas que contengan al menos 10 átomos de carbono.

Otros portadores hidrofóbicos adecuados comprenden ésteres líquidos alifáticos o aromáticos, como una fracción del portador miscible en

agua, se desea que no más del 20% y en muchas instancias menor que 10% del peso del portador miscible en agua.

Los ésteres alifáticos adecuados contienen al menos un grupo alquilo de cadena larga, tal como ésteres derivados de alcoholes C_1 - C_{20} esterificados con un ácido alcanóico C_8 a C_{22} o un ácido alcanedióico C_6 a C_{10} . Las porciones de alcohol y de ácido o las mezclas resultantes son preferiblemente seleccionadas de tal manera que tengan un punto de fusión menor que $20^\circ C$. Los ésteres adecuados incluyen miristato isopropilo, miristato laurilo, palmitato isopropilo, sebacato diisopropilo y adipato diisopropilo.

Los ésteres aromáticos líquidos adecuados, preferiblemente que tenga un punto de fusión por debajo de $20^\circ C$, incluyen benzoatos alquilo grasos. Ejemplos de dichos ésteres incluyen benzoatos alquilo C_8 a C_{18} adecuados o las mezclas resultantes.

Instancias adicionales de portadores hidrofóbicos adecuados comprenden éteres alifáticos líquidos derivados de al menos un alcohol graso, tal como derivados de éter miristilo p.e. éter miristilo PPG-3 o éteres alquil menores de poliglicoles tales como éter butilo PPG-14. La proporción de éter e una formulación de acuerdo con la presente invención es a menudo seleccionada del rango entre 0 a 40% p/p y en algunas formulaciones particularmente de 1 a 30% p/p.

Otros portadores hidrofóbicos adecuados comprenden alcoholes alifáticos líquidos que contengan al menos 10 átomos de carbono que sean líquidos a $20^\circ C$. Ejemplos de dichos alcoholes incluyen alcoholes de cadena ramificada tales como alcohol etilhexilo, alcohol octildodecanol e isoesterilo. La proporción del alcohol en una formulación de acuerdo con la presente invención es a menudo seleccionada del rango entre 0 a 40% p/p y particularmente de 1 a 30% p/p. Los alcoholes alifáticos que son sólidos a $20^\circ C$ están

preferiblemente ausentes o presentes a una baja concentración de tal manera que sean menos del 5% p/p de la composición completa, debido a que dichos alcoholes pueden llevar a depósitos blancos visibles en el uso típico de la composición.

La proporción total de portador (es) hidrofóbico (s) libre sin silicona es a menudo escogida en el rango entre 0 a 80% y particularmente de 5 a 70% en peso. Las mezclas de los portadores orgánicos hidrofóbicos sin silicona pueden ser empleadas. Si se emplean líquidos orgánicos hidrofóbicos libre de silicio conteniendo oxígeno, se desea que no constituyan más del 70% en peso del portador hidrofóbico. Menores proporciones de la fase hidrofóbica, en el rango hasta por ejemplo 20, 30, ó 35% en total del peso son más posibles.

Las mezclas de portadores con silicona y sin silicona pueden ser adecuadamente empleadas aquí, en cualquier razón de peso, en un número de realizaciones probadas la razón está en el rango entre 20:1 a 1:20.

El portador o la mezcla de portadores empleada en la presente invención puede ser y en muchas composiciones efectivas ser anhidras, p.e. no contiene agua libre, mediante el empleo de solamente un o más portadores hidrofóbicos. Alternativamente, si se desea, la composición puede comprometer un portador hidrofílico, tal como en particular agua y/o un solvente orgánico miscible en agua tal como un solvente alcohólico miscible en agua, en adición al portador hidrofóbico, tal como aquellos indicados anteriormente aquí. Las composiciones que contienen un portador tanto hidrofóbico como hidrofílico normalmente tienen uno de ellos como una fase dispersa. Las formulaciones que contienen una fase dispersa en la práctica comprometerán adicionalmente un surfactante emulsificante, tal como un surfactante aniónico, catiónico, zwitteriónico y/o noniónico.

En las emulsiones aquí incluidas, la fase polar dispersa, incluyendo cualquier material disuelto allí, normalmente constituye de 5 a 80% del peso de la composición y en muchas realizaciones hasta 50 ó 60% en peso y similares u otras realizaciones contienen al menos 25% en peso. La fase continua que contiene el estructurante suministra el balance de peso de la composición, entre el 20 al 95% en peso. Las emulsiones aquí incluidas normalmente contienen un agua en una emulsión de aceite, p.e. la fase dispersa es la fase hidrofílica. Cuando se emplea una emulsión, puede ser conveniente preparar una emulsión en un paso separado antes de mezclarlo con los constituyentes remanentes de la composición para producir la formulación completa.

La emulsión, en muchas instancias, incorpora uno o más emulsificantes, los cuales a menudo son no iónicos. La proporción de emulsificante o sistema emulsificante, p.e. combinación de emulsificantes, en la emulsión es a menudo seleccionada del rango entre 0.1 a 10% p/p, y en muchas instancias de 0.25 a 5% p/p. Mas preferida es una cantidad de 0.1 ó 0.25% hasta 3% p/p. se desea emplear un emulsificante o sistema emulsificante que suministre un valor general HLB en el rango entre 2 a 10 y preferiblemente de 3 a 8.

Puede ser conveniente emplear un sistema emulsificante que emplee en combinación un emulsificante que tenga un valor HLB arriba del valor general deseado y uno que tenga el valor HLB debajo del valor deseado. Al emplear los dos emulsificantes en conjunto, en las proporciones apropiadas, es rápidamente posible obtener un promedio pesado de valor HLB que promueva la formación de una emulsión.

Muchos emulsificantes adecuados son emulsificantes de éster o éter noniónico que comprenden una porción polioxialquileo, especialmente una porción polioxietileno, que a menudo contiene de cerca de 2 a 80, y especialmente de 5 a 60 unidades de oxietileno, y/o contiene un compuesto polihidroxi tal como glicerol o sorbitol y otros

alditales como porción hidrofílica. La porción hidrofílica puede contener polioxipropileno. Los emulsificantes adicionalmente contienen una porción hidrofóbica alquilo, alquenilo o aralquilo, que normalmente contiene de aproximadamente 8 a 50 carbonos y particularmente de 10 a 30 carbonos.

La porción hidrofóbica puede ser lineal o ramificada y es a menudo saturada, aunque puede ser no saturada y es opcionalmente fluorinada. La porción hidrofóbica puede contener una mezcla de longitudes de cadena, por ejemplo aquellas derivadas de cebo, manteca de cerdo, aceite de palma, aceite de semilla de girasol o aceite de soya. Dichos surfactantes no iónicos también pueden ser derivados de un compuesto polihidroxi tal como glicerol o sorbitol u otros aditales. Ejemplos de emulsificantes incluyen cetareth-10 a 25, ceteth-10-25, estareth-10-25 y PEG-15-25 estearato ó diestearato. Otros ejemplos adecuados incluyen mono, di y triglicéridos de ácidos grasos C_{10} - C_{20} . Ejemplos adicionales incluyen éteres de alcohol graso C_{18} - C_{22} de óxidos de polietileno (8 a 12 EO)

Los co-emulsificantes, que normalmente tienen un valor HLB bajo, y a menudo desde 2 a a menudo comprenden mono o posiblemente diésteres de ácido graso de alcoholes polihídricos tales como glicerol, sorbitol, eritritol o trimetilolpropano. La porción grasa es a menudo de C_{14} a C_{22} y es saturada en muchas instancias, incluyendo cetilo, estearilo aracidilo y behenilo. Los ejemplos incluyen monoglicéridos de ácido palmítico o esteárico mono y diésteres sorbitol de ácido misrístico palmítico o esteárico y monoésteres trimetilolpropano de ácido esteárico.

Una clase particularmente deseable de emulsificantes comprende copolímeros dimeticona, principalmente dimetilpolisiloxanos modificado polioxialquileno. El grupo polioxialquileno es a menudo un polioxietileno

(POE) o polioxipropileno (POP) o un copolímero de POE y POP. Los copolímeros a menudo terminan en grupos alquilo C_1 a C_{12} .

Los emulsificantes adecuados son ampliamente disponibles bajo cualquier marca incluyendo Abil™, Arlacel™, Brij™, Cremophor™, Dehidrol™, Emerest™, Lameform™, Quest PGPH™, Pluronic™, Prosorine™, Span™, Tween™, SF 1228, DC3225C y Q2-5200.

El portador hidrofílico normalmente comprende agua y puede comprender uno o más líquidos solubles en agua o miscibles en agua en adición a o reemplazo para agua. La proporción de agua en una emulsión de acuerdo a la presente invención es a menudo seleccionada en el rango entre hasta 50% y particularmente de 5 a 40%. Algo del agua puede ser introducida como solvente para el activo antitranspirante.

Una clase de solventes solubles en agua ó miscibles en agua comprende alcoholes mohohídricos de cadena corta, p.e. C_1 a C_4 y especialmente etanol o isopropanol, que pueden impartir una capacidad desodorizante a la formulación. Una clase posterior de líquidos hidrofílicos comprende di o polioles, preferiblemente que tengan un punto de fusión debajo de 40° C, o que sean miscibles en agua. Ejemplos de di o polioles incluyen glicol, 1,2 propilen glicol, 1,3, butilen glicol, hexilen glicol, dietilen glicol, dipropilen glicol 2-etoxietanol, dietilen glicol monoetiléter y trietilenglicol mometileter. Los polioles especialmente preferidos comprenden glicerol o sorbitol y compuestos relacionados que sean también capaces de actuar como un humectante. La proporción de un mono, di o poliol en la formulación es a menudo seleccionada en el rango hasta un 15% y en un número de instancias de 0.5 a 12%, convenientemente hasta cerca de 5% y preferiblemente de cerca de 0.2 a 3%.

Ingredientes opcionales en las composiciones de la invención pueden incluir desinfectantes, por ejemplo a una concentración de hasta 10% p/p. Los activos desodorantes adecuados pueden comprender concentraciones desodorantes efectivas de sales metálicas antitranspirante, deoparfumes y/o microbicidas, incluyendo particularmente bactericidas, tales como aromáticos clorinados, incluyendo derivados de biguanida, de los cuales materiales conocidos son Irgasan DP300™ (triclosán), Triclorban™ y clorhexidina merecen mencionarse.

Otra clase comprende sales de biguanida tales como las disponibles bajo la marca comercial Cosmosil™.

Otros ingredientes opcionales incluyen agentes de lavado, a menudo presentes en una cantidad hasta de 10% p/p para ayudar en la remoción de la formulación de la piel o la ropa. Tales agentes de lavado son normalmente surfactantes no iónicos tales como ésteres o éteres que contengan una porción alquilo C₈ a C₂₂ y una porción hidrofílica que puede comprender un grupo polioxialquilenos (POE o POP) y/o poliol.

Un constituyente opcional adicional de la formulación contiene uno o más estructurantes secundarios que pueden ser empleados en adición al primer sistema estructurante, p.e. el esteroles más éster esteroles. La cantidad de cada estructurante en la formulación es a menudo 0, y usualmente no más de 15% de la formulación. Normalmente no es mayor que la cantidad de estructurante primario.

Los estructurantes secundarios empleables aquí pueden ser no poliméricos o poliméricos. Los estructurantes no poliméricos, algunas veces referidos como gelantes, pueden ser seleccionados entre ácidos grasos o las sales resultantes, tales como ácido esteárico o estearato de sodio o ácido 12- hidroxistearato. Otros gelantes adecuados pueden

comprender alditoles dibencilideno, p.e. sorbitol dibencilideno, derivados de amino ácido n-acilo seleccionados incluyendo derivados de éster amida, tales como dibutilamida glutamado N-lauroil, dichos gelantes pueden ser contemplados junto con ácido hidroesteárico o un derivado resultante de éster o amida. Gelantes adicionales incluyen derivados de amida de ácidos carboxílicos di o tribásicos, tales como N,N'-dialquilsuccinamidas alquilo, p.e. N,N'-dibutylsuccinamida dodecilo. El alcohol estearilo y/o cera natural derivada de plantas o animales o ceras sintéticas similares pueden ser empleados, si se desea, como estructurante secundario pero actualmente no son preferidos.

Los estructurantes poliméricos que pueden ser empleados pueden comprender elastómeros organo polisiloxanos de manera tal que los productos de reacción de un polisiloxano terminado en vinilo y un agente de enlace cruzado o poli (metilo substituido) o poli (fenil substituido) siloxanos terminados en alquilo o polioxilalquilenos alquilo. Un número de poliamidas también han sido reveladas como estructurantes para líquidos hidrofóbicos. Los polímeros que contienen grupos de enlace tanto siloxanos como de hidrógeno han sido revelados en la WO 97/36571 y en WO 99/06473. Si la composición comprende una fase acuosa, esta fase puede ser estructurada o espesada mediante poliacrilamidas, poliacrilatos u óxidos de polialquilenos.

Las composiciones aquí incluidas puede incorporar uno o más adjuntos cosméticos convencionalmente contemplables para antitranspirantes sólidos o sólidos blandos. Tales adjuntos cosméticos pueden incluir mejoradores de sensación de piel, tales como talco o polietileno finamente dividido, por ejemplo, en una cantidad hasta aproximadamente 10% p/p, agentes benéficos para la piel, tales como alantoina o lípidos, por ejemplo en una cantidad hasta del 5% p/p, colores, agentes refrescantes de piel diferentes a los alcoholes ya mencionados, como mentol y derivados de mentol, a menudo en una

concentración hasta de 2% p/p. U adjunto comúnmente empleado comprende perfume, el cual normalmente está presente en una concentración de 0 a 4% y en muchas formulaciones de 0.25 a 2%.

Las composiciones descritas aquí pueden ser producidas mediante procesos convencionales para hacer sólidos de suspensión o emulsión o sólidos blandos.

Así, de acuerdo con un segundo aspecto de la presente invención se suministra un proceso para la producción de una barra antitranspirante que comprende los pasos de:

1. incorporar en un portador líquido un estructurante que comprende una concentración efectiva de una combinación de al menos un esteroide y al menos un éster esteroide en una cantidad suficiente para espesar o estructurar el portador para producir un sólido o un sólido blando.
2. poner la mezcla que contiene el estructurante o uno o más de sus constituyentes móviles a una temperatura elevada
3. mezclar el portador líquido con un activo antitranspirante para formar la mezcla que contiene el antitranspirante, conduciendo los pasos 2 y 3 ya sea antes, después o simultáneamente con el paso 1
4. introducir la mezcla móvil en un molde que preferiblemente es un contenedor dispensador y
5. enfriar o dejar que se enfríe la mezcla móvil hasta una temperatura en la cual sea espesada o estructurada.

Una secuencia de proceso conveniente para formulaciones de suspensión comprende, primero formar una solución del esteroide y el éster esteroide en el portador o la mezcla de portadores. Esto se lleva a cabo normalmente agitando la mezcla a una temperatura elevada, tal como seleccionada en el rango entre 50 a 120° C. Tanto el éster esteroide

como el esteroil pueden ser introducidos simultáneamente o secuencialmente al portador, a una temperatura y agitación apropiadas, por ejemplo, el éster esteroil seguido por el esteroil, o el éster esteroil y el esteroil pueden ser disueltos en alícuotas del portador que son subsecuentemente mezcladas. Después, el activo antitranspirante particulado puede ser mezclado al introducirse, a una temperatura que es a menudo 5 a 10° C arriba de su temperatura de estabilización, a su contenedor dispensador, tal como un barril usando procesos de llenado adecuados y se enfría o se le permite enfriar hasta temperatura ambiente.

En un proceso adecuado para hacer formulaciones de emulsión, una solución de éster esteroil y esteroil se forma en el portador hidrofóbico de la una manera como para la preparación de una barra de suspensión, y separadamente se prepara una fase acuosa o hidrofílica, mediante la introducción del activo antitranspirante a la fase (si es necesario, debido a que dichos activos pueden convenientemente ser suministrados en una solución acuosa) preferiblemente siendo calentada hasta una temperatura similar a aquella de la fase de aceite y luego mezclada, o alternativamente, introducida a la fase de aceite a una tasa que mantenga la temperatura elevada de la mezcla y posteriormente se llena de una manera similar a la de las barras de suspensión.

Las composiciones aquí incluidas son adecuadas para aplicarse normalmente sobre la piel humana, y particularmente sobre las axilas, por consiguiente reduciendo la transpiración observable.

Así, de acuerdo con un tercer aspecto de la presente invención, se suministra un método para prevenir o reducir la transpiración sobre la piel humana que comprende aplicar normalmente sobre la piel una composición antitranspirante que contiene un activo antitranspirante, un portador líquido y un estructurante que comprende una concentración

efectiva de una combinación de al menos un esteroles excepto lanoesterol y al menos un éster esteroles.

En los Ejemplos o Comparaciones, los varios constituyentes son como sigue:

- 1) vol sol = mezcla DC345 de ciclometicona (Dow Corning Inc.)
- 2) Fluido AP PPG-14 Butiléter (Amercol)
- 3) CAB = Benzoato alquilo C₁₂-C₁₅ Finsolv TN (Fintex).
- 4) ISA = alcohol isoestearilo Prisorine 3515 (Unichema)
- 5 a) β sitoesterol (D.R.T.)
- 5b) ultrasitoesterol (Kaukas)
- 5c) β - sitoesterol (Acros)
- 6) γ Orizanol (Jan Dekker (UK) Ltd)
- 7) Complejo de glicina Al/Zr tetraclorohidrex AZAG 7167 (Summit)
- 8) Colesterol (Acros)
- 9) Dihidro coleaterol (Sigma)
- 10) Polideceno Silkflo 364NF (Albemarle)
- 11) Miristato isopropilo Estol 1514 (Unichema)
- 12) Poliol Dimeticona de detilo Abil EM90 (Th. Glodschmidt)
[emulsificante]
- 13) Solución acuosa al 50% de de pentaclorhidrato Al/Zr Zirkonal 50
(Guilini)
- 14) Glicerol (aldrich)
- 15) AACH de bajo índice de refractivo (Unilever)
- 16) Talco superfino (Cypres Minerals) 57.5% Reza 36 GPSUF solución
acuosa
- 17) Glicina tetraclorhidrex de aluminio circonio (tamaño de partícula
fino) Reza 36 GPSUF solución acuosa
- 18) Complejo de glicina de aluminio-circonio Summit AZ375
- 19) Propilen glicol (Fisons)
- 20) Poliglicerol-3 diisoesterato Lamemform TGI
- 21) Poliglicerol-2 dipolihiidroxiesterato Dehymuls PGPH

- 22) Poliglicerol- poliricinolato Quest PGPR
- 23) Poliglicerol-2 isoesterato Prisorine 3791
- 24) Poliglicerol-2 diisoesterato Prisorine 3792
- 25) Mezcla de Ciclometicona DC 245 (Dow Corning)

Comparaciones C1-C10 y Ejemplos 11 a 19

En estas Comparaciones y Ejemplos, la capacidad de los esteroides y ésteres esteroides individuales y las mezclas de esteroles y éster esteroles para gelatinizar solventes hidrofóbicos representativos es demostrada. El esteroles y/o éster esteroles fue/fueron disueltos en el solvente en una botella de vidrio mediante calentamiento y agitación. La clara solución resultante se dejó enfriar hasta temperatura de laboratorio sin agitar. El producto fue evaluado el día siguiente.

Los resultados se resumen en la Tabla 1 abajo.

Comp. o Ejemplo	Esterol Ester Esterol	Solvente o Mezcla	Producto*
C1	colesterol 10%	Polideceno ⁽¹⁰⁾	Mezcla cristalina
C2	dihidrocolesterol 10%	Polideceno ⁽¹⁰⁾	Mezcla cristalina
C3	β Sitoesterol 10%	Polideceno ⁽¹⁰⁾	pasta suave
C4	Orizanol 10%	Polideceno ⁽¹⁰⁾	Cristales+liquido transp.
Ej 11	Colesterol 5% / Orizanol 5%	Polideceno ⁽¹⁰⁾	gel duro
Ej 12	Dihidrocolesterol 5% / orizanol 5%	Polideceno ⁽¹⁰⁾	gel duro
Ej 13	β sitoesterol 5% / orizanol 5%	Polideceno ⁽¹⁰⁾	gel duro
C5	Colesterol 10%	volsil 70% ⁽¹⁾ ISA 30% ⁽²⁾	Mezcla cristalina
C6	Dihidrocolesterol 10%	volsil 70% ⁽¹⁾ ISA 30% ⁽²⁾	Cristales+ liquido transp.
C7	β Sitoesterol 10%	volsil 70% ⁽¹⁾ ISA 30% ⁽²⁾	Cristales+ liquido transp.
C8	Orizanol 10%	volsil 70% ⁽¹⁾ ISA 30% ⁽²⁾	Cristales+ liquido turbio
Ej 14	Colesterol 5% / Orizanol 5%	volsil 70% ⁽¹⁾ ISA 30% ⁽²⁾	gel duro
Ej 15		volsil 70% ⁽¹⁾ ISA 30% ⁽²⁾	gel duro
Ej 16	Colesterol 5% / Orizanol 5%	volsil 70% ⁽¹⁾ ISA 30% 9 ^o 0	gel duro
C9	Dihidrocolesterol 5% / orizanol 5%	volsil 60% ⁽¹⁾ CAB 40% ⁽⁴⁾	Mezcla cristalina
C10	Orizanol 10%	volsil 60% ⁽¹⁾ CAB 40% ⁽⁴⁾	Cristales+ liquido transp.
Ej 17	β sitoesterol 5% / orizanol 5%	volsil 60% ⁽¹⁾ CAB 40% ⁽⁴⁾	gel duro
Ej 18	β sitoesterol 8% / orizanol 2%	volsil 60% ⁽¹⁾ CAB 40% ⁽⁴⁾	gel duro
Ej 19	β sitoesterol 2% / orizanol 8%	volsil 60% ⁽¹⁾ CAB 40% ⁽⁴⁾	gel duro

De la Tabla 1, puede verse claramente al comparar las comparaciones marcadas con una C y los Ejemplos marcados con Ej, que la combinación del esteroles y el ester esteroles fue capaz de producir una

gelación superior a la que produce el esteroil o el ester esteroil solo a la misma concentración general.

Ejemplos 20 a 38

En estos Ejemplos, las barras en suspensión de acuerdo con las formulaciones resumidas en la Tabla 2 abajo, se hicieron de la siguiente manera:

Los portadores fueron combinados primero. El orizanol (el ester esteroil) se introdujo en los portadores y se disolvió calentando y agitando. Una vez el orizanol se hubo disuelto completamente, el esteroil se introdujo y la mezcla se calentó y se agitó hasta que se obtuvo una solución transparente. La solución se dejó luego enfriar bajo agitación suave hasta que alcanzó una temperatura de aproximadamente 5-10 grados por encima del punto de gelación. Luego se agregó el activo antitranspirante particulado y se dispersó completamente. La mezcla fue luego vaciada en barriles de barras y se dejó enfriar y solidificar. Un número de barras fueron analizadas mediante los métodos descritos aquí y los resultados se presentan en la Tabla 2 abajo. Las evaluaciones se hicieron después de que la barra había sido almacenada por 24 horas por lo menos, a temperatura ambiente de laboratorio.

Tabla 2

Ejemplo No	20	21	22	23	24	25	26	27	28
Constituyente	% en peso en la formulación								
Ciclometiconas ⁽¹⁾	5.6	56.0	56.0	56.0	56.0	52.0	53.0	53.0	55.5
PPG-14 Butil Eter ⁽²⁾	0.7	2.8	-	3.5	-	-	-	-	-
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ ⁽³⁾	8.4	8.4	10.5	10.5	15.0	15.0	15.0	-	12.5
Alcohol Isoestearilo ⁽⁴⁾	4.9	2.8	3.5	-	-	-	-	15.0	-
β Sitoesterol ^(5a)	3.0	3.0	3.0	3.0	3.5	4.5	4.0	4.0	4.0
Orizanol ⁽⁶⁾	3.0	3.0	3.0	3.0	3.5	4.5	4.0	4.0	4.0
AZAG 7167 ⁽⁷⁾	24	24	24	24	24	24	24	24	24
Dureza de penetrómetro (mm)	10.5	10.3	10.5	10.5	9.2	7.7	9.3	8.2	10.7
Marcas de depósito Papel abrasivo	N/d	43	N/d	36	24	25	24	N/d	N/d
Marcas de depósito Lana negra	N/d	60	N/d	52	15	14	17	N/d	N/d

Tabla 2 (cont)

Ejemplo No	29	30	31	32	33	34	35	36	37
Constituyente	% en peso en la formulación								
Ciclometicona ⁽¹⁾	53.0	50.0	50.0	50.0	50.0	56.0	56.0	55.0	55.0
PPG-14 Butil Eter ⁽²⁾	-	-	5.0	4.0	1.0	2.8	2.8	2.8	2.8
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ ⁽³⁾	7.5	15.0	15.0	12.0	12.0	8.4	8.4	8.4	8.4
Alcohol Isoestearilo ⁽⁴⁾	7.0	5.0	-	4.0	7.0	2.8	2.8	2.8	2.8
β Sitoesterol ^(5a)	4.0	3.0	3.0	3.0	3.0	2.1	3.9	-	-
Colesterol ⁽⁸⁾	-	-	-	-	-	-	-	3.5	-
Dihidro-Colesterol ⁽⁹⁾	-	-	-	-	-	-	-	-	3.5
Orizanol ⁽⁶⁾	4.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.9	2.1	3.5	3.5
AZAG 7167 ⁽⁷⁾	24	24	24	24	24.0	24.0	24.0	24.0	24.0
Dureza de penetrómetro (mm)	8.4	11.8	11.7	11.6	11.1	11.0	18.2	10.4	10.6
Marcas de depósito Papel abrasivo	N/d	28	N/d	26	N/d	24	N/d	36	24
Marcas de depósito Lana negra	N/d	11	N/d	29	N/d	26	N/d	63	15

Tabla 2 (cont)

Ejemplo No	38		CWS						
Constituyente	% en peso en la formulación								
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ (³)	62.0								
β Sitoesterol (^{5a})	7.0								
Orizanol (⁶)	7.0								
AACH agua modificada (¹⁵)	24.0								
Dureza de penetrómetro (mm)	15.1		9.4						
Marcas de depósito Papel abrasivo	22		118						
Marcas de depósito Lana negra	12		186						

CWS es una barra en suspensión blanca convencionalmente de alcohol estearilo y estructurada con cera.

Los Ejemplos 20 a 34. 36 y 37 eran barras duras, blancas y opacas. El ejemplo 35 era una barra blanca ligeramente más suave. El Ejemplo 38 era una barra translúcida ligeramente dura. La evaluación cualitativa mostró que todas dejaron depósitos blancos sobre la piel menores que una barra blanca sólida opaca convencional.

De la Tabla 2, puede observarse que las barras en suspensión que tengan una dureza aceptable y que solo dejen poco o muy poco depósito, pueden obtenerse usando una combinación de un esteroles y un ester esteroles de acuerdo con la presente invención.

Ejemplos 39 a 55

En estos Ejemplos, se hicieron barras en emulsión de acuerdo con las formulaciones sumarizadas en la Tabla 3 abajo, como sigue:

En el primer paso, la fase hidrofóbica se preparó combinando los aceites cosméticos y los solventes, el emulsificante se introdujo y se disolvió en un mezclador Silverson. El orizanol (el ester estero) se introdujo y se disolvió mediante calentamiento y agitación a 5000 rpm. Una vez el orizanol se hubo disuelto completamente, el estero se agregó y la mezcla se calentó nuevamente y se agitó hasta que se obtuvo una solución transparente. Luego la solución se dejó bajo agitación suave hasta que alcanzó una temperatura de aproximadamente 5-10 grados por encima de su punto de gelación.

En el segundo paso, la fase acuosa se preparó combinando la solución antitranspirante con los otros componentes de la fase acuosa. Esta se calentó a la misma temperatura que la solución de la fase continua.

En el tercer paso, la fase acuosa se introdujo lentamente en la fase hidrofóbica en el mezclador Silverson, y se mantuvo a una temperatura y condiciones de corte constantes (800 rpm). La mezcla se cortó hasta 10 veces, hasta que la fase acuosa se hubo dispersado de forma pareja. La emulsión resultante se dejó luego reposar y airear. Luego se vació en barriles de barras y se dejó enfriar a una temperatura ambiente de laboratorio y se solidificó. Se evaluaron varias barras resultantes por penetración y dureza mediante los métodos descritos abajo después de que la barra se había mantenido durante por lo menos 24 horas a temperatura ambiente. Los resultados se resumen en la Tabla 3 abajo.

Tabla 3

Ejemplo	39	40	41	42	43	44	45
Constituyente	% en peso de la formulación						
Fase Continua							
Ciclometicona ⁽¹⁾	23.5	32.4	40.0	40.0	40.0	40.0	35.0
PPG-14 ButilEter ⁽²⁾	-	5.0	-	-	-	-	-
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ ⁽³⁾	12.5	12.7	10.0	-	-	-	-
Alcohol Isoestearilo ⁽⁴⁾	-	-	-	10.0	10.0	-	-
Polideceno ⁽¹⁰⁾	11.3	-	-	-	-	-	-
Miristato de Isopropilo ⁽¹¹⁾	-	-	-	-	-	10.0	15.0
β Sitoesterol ^(5a)	-	-	-	-	-	-	-
β Sitoesterol ^(5b)	2.4	2.5	-	2.5	-	2.5	2.5
β Sitoesterol ^(5c)	-	-	2.5	-	-	-	-
Dihidrocolesterol ⁽⁹⁾	-	-	-	-	2.5	-	-
Orizanol ⁽⁶⁾	2.4	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5
Copoliol Dimeticona de Cetilo ⁽¹²⁾	0.9	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
Fase Acuosa							
Zirkonal 50 ⁽¹³⁾	37.6	39.9	40.0	40.0	40.0	40.0	40.0
Glicerol ⁽¹⁴⁾	9.4	4.0	4.0	-	-	4.0	4.0
Agua	-	-	-	4.0	4.0	-	-
Dureza de penetrómetro (mm)	16.9	17.8	17.1	22.4	26.7	N/d	18.8
Marcas de depósito Papel abrasivo	22	28	26	N/d	22	N/d	N/d
Marcas de depósito Lana negra		11	14	N/d	29	N/d	N/d

Tabla 3 (cont)

Ejemplo	46	47	48	49	50	51	52
Constituyente	% en peso de la formulación						
Fase Continua							
Ciclometicona ⁽¹⁾	35.0	35.0	35.0	35.0	25.0	34.0	33.0
PPG-14 ButilEter ⁽²⁾	-	-	-	-	-	-	-
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ ⁽³⁾	7.5	-	15.0	7.5	25.0	7.5	7.5
Alcohol Isoestearilo ⁽⁴⁾	-	-	-	-	-	7.5	7.5
Polideceno ⁽¹⁰⁾	-	-	-	-	-	-	-
Miristato de Isopropilo ⁽¹¹⁾	7.5	15.0	-	7.5	-	-	-
β Sitoesterol ^(5a)	-	-	-	-	-	-	-
β Sitoesterol ^(5b)	-	-	-	-	-	-	-
β Sitoesterol ^(5c)	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5	3.0	3.5
Dihidrocolesterol ⁽⁹⁾	-	-	-	-	-	-	-
Orizanol ⁽⁶⁾	2.5	2.5	2.5	2.5	2.5	3.0	3.5
Copoliol Dimeticona de Cetilo ⁽¹²⁾	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
Fase Acuosa							
Zirkonal 50 ⁽¹³⁾	40.0	40.0	40.0	40.0	40.0	40.0	40.0
Glicerol ⁽¹⁴⁾	4.0	-	-	-	-	-	-
Agua	-	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0
Dureza de penetrómetro (mm)	17.0	20.7	27.4	18.2	18.5	15.6	12.5
Marcas de depósito Papel abrasivo	N/d	29	30	31	N/d	26	25
Marcas de depósito Lana negra	N/d	12	12	8	N/d	12	12

Los Ejemplos 30 a 52 fueron todos barras blancas duras o medio duras opacas o translúcidas/opacas. La evaluación cualitativa mostró que todas dejaron depósitos blancos sobre la piel menores que una barra blanca sólida estructurada en cera convencional.

De la Tabla 3, puede observarse que las barras en suspensión que tengan una dureza aceptable y que solo dejen poco o muy poco depósito, pueden obtenerse usando una combinación de un estero1 y un ester estero1 de acuerdo con la presente invención.

Ejemplos 53 a 56

En estos Ejemplos, barras semi-sólidas o sólidas blandas de acuerdo con la presente invención y que tenían las formulaciones resumidas en la Tabla 4 abajo, se prepararon siguiendo el siguiente proceso:

Primero, El ester estero (orizanol), y el portador fluido, se introdujeron en un recipiente, se calentaron a 110°C, mientras se cortaban en un mezclador Silverson a aproximadamente 3000 rpm hasta que el ester estero se hubo disuelto. Luego, el β sitoesterol se introdujo en el recipiente, y se cortó adicionalmente hasta que se hubo disuelto en una solución transparente. La mezcla se dejó luego enfriar a aproximadamente 80°C y los polvos (talco y AZAG) se introdujeron lentamente con alto corte mezclando en el mezclador, a aproximadamente 6500 rpm hasta que se mezcló todo homogéneamente. La mezcla resultante fue luego vaciada en recipientes de vidrio a las temperaturas de llenado especificadas en la Tabla 4.

Tabla 4

Ejemplo	53	54	55	56
Constituyente	% en peso de la formulación			
AZAG 7167 ⁽¹⁾	24.0	24.0	24.0	24.0
Ciclometicona ⁽¹⁾	54.0	55.5	54.5	53.0
Orizanol ⁽⁶⁾	1.0	0.5	0.75	1.5
β Sitoesterol ^(5a)	1.0	0.5	0.75	1.5
Talco ⁽¹⁶⁾	6.0	6.0	6.0	6.0
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ ⁽³⁾	14.0	14.0	14.0	14.0
Dureza	22.7	N/d	>30	15.1

De la Tabla 4, puede verse que las formulaciones en los Ejemplos 53 y 55 fueron formulaciones sólidas blandas adecuadas para ser

dispensadas en aplicadores de sólidos blandos convencionales en los cuales el material es extruído a través de una abertura. El Ejemplo 57 fue un solvente blando que goteó. El Ejemplo 56 fue un sólido semi-firme, posiblemente más apropiado para aplicación via un aplicador tradicional para un sólido.

Ejemplos 57 a 73

Se prepararon adicionalmente formulaciones sólidas y sólidas blandas mediante los métodos descritos en los Ejemplos previos respectivos para cada tipo de material.

Tabla 5

Ejemplo	57	58	59	60	61	62
Ciclometicona (¹)	15.15	25.25	8.6	38.0	38.0	9.0
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ (³)	10.10	22.73	3.44	7.5	7.5	3.6
PPG-14 Butil Eter (²)	25.25	2.52	30.96	7.5	7.5	32.4
Copoliol Dimeticona de Cetilo (¹²)	1.00	1.00	1.0	1.0	1.0	1.0
Orizanol (⁶)	2.50	2.50	3.0	3.0	3.0	7.0
β Sitoesterol (^{5c})	2.50	2.50	3.0	3.0	3.0	7.0
Rezal 36 57.5% (¹⁷)	43.5	43.5		20.0	20.0	
Zirkonal 50 (¹³)			50.0			40.0
Agua				9.0	5.0	
Propilen Glicol (¹⁹)				3.6	15.0	
Dureza (mm)	>50	>50	>50	32.4	14.4	15.1
Ejemplo No.	63	64	65	66	67	68
Ciclometicona (¹)	24.5	24.5	38.0	24.5	24.5	24.5
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ (³)	22.05	8.82	7.5	22.54	10.78	10.34
Miristato de isopropilo (¹¹)			7.5	1.96	13.72	13.16
PPG-14 Butil Eter (²)	2.45	15.68				
Copoliol Dimeticona de Cetilo (¹²)	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
Orizanol (⁶)	5.0	5.0	3.0	5.0	5.0	4.0
β Sitoesterol (^{5c})	5.0	5.0	3.0	5.0	5.0	4.0
Zirkonal 50 (¹³)	40.0	40.0		40.0	40.0	40.0
Summit AZG-375 (¹⁸)			20.0			
Agua			15.0			4.0
Propilen Glicol (¹⁹)			5.0			
Dureza (mm)	9.3	9.3	11.2	8.28	7.92	12.06

Tabla 5 (cont)

Ejemplo	69	70	71	72	73
Ciclometicona (¹)	34.3	34.3	34.3	31.44	13.65
Benzoato de Alquilo C ₁₂₋₁₅ (³)	8.82	8.82	8.82	6.03	12.28
Miristato de isopropilo (¹¹)	5.88	5.88	5.88	6.03	19.57
PPG-14 Butil Eter (²)					
Copoliol Dimeticona de Cetilo (¹²)	1.0	1.0	1.0	1.00	1.00
Orizanol (⁶)	3.0	3.0	3.0	2.75	5.7
β Sitoesterol (^{5c})	3.0	3.0	3.0	2.75	3.8
Zirkonal 50 (¹³)				40.0	40.0
Summit AZG-375 (¹⁸)	22.0	22.0	22.0		
Agua	16.5	11.0	11.0	10.0	4.0
Propilen Glicol (¹⁹)		11.0			
Glicerol (¹⁴)	5.5		11.0		
Dureza (mm)	13.74	10.71	12.36	14.5	10.9

Ejemplos 74 a 81

En estos Ejemplos, se hicieron formulaciones de acuerdo con la presente invención mediante el método general empleado para los Ejemplos 39-55 con otros emulsificantes o sin un emulsificante explícito.

Tabla 6

Ejemplo	74	75	76	77	78	79	80	81
Ciclometicona ⁽¹⁾	33.78	33.78	33.78	33.78	33.78	33.78	33.78	34.65
Miristato de isopropilo ⁽¹¹⁾	5.79	5.79	5.79	5.79	5.79	5.79	5.79	5.79
Finsolve TN ⁽³⁾	8.69	8.69	8.69	8.69	8.69	8.69	8.69	8.69
Abil EM90 ⁽¹²⁾	1.75							
Lamemform TGI ⁽²⁰⁾				0.875	1.75			
Dehymuls PGPH ⁽²¹⁾			1.75	0.875				
Quest PGPR ⁽²²⁾		1.75						
Prisorine 3791 ⁽²³⁾						1.75	0.875	
Prisorine 3792 ⁽²⁴⁾							0.875	
Orizanol ⁽⁶⁾	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.03
β Sitoesterol ^(5c)	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.03
Zirkonal 50 ⁽¹³⁾	40.0	40.0	40.0	40.0	40.0	40.0	40.0	40.04
Agua	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.0	4.04
Dureza (mm)	12.8	13.1	12.2	11.8	12.8	16.2	12.2	11.6

Ejemplos 82-87

En estos Ejemplos, las formulaciones se obtuvieron mediante el siguiente método general:

La fase continua en aceite se preparó introduciendo primero el orizanol en una mezcla de los aceites y del emulsificante. La mezcla se calentó y luego se mantuvo a aproximadamente 95-100°C, con mezclado suave en un mezclador Silverson hasta que el orizanol se disolvió. Luego se agregó el β sitoesterol y se dejó disolver bajo las mismas condiciones. Se preparó una fase dispersa (también referida como la fase interna) calentando una solución del activo de aluminio circonio en agua o una mezcla de agua y poliol a una temperatura similar a la de la fase continua en aceite. La fase dispersa fue luego introducida lentamente en la fase de aceite mientras se incrementaba progresivamente la velocidad del mezclador Silverson. Cuando la fase dispersa se hubo introducido completamente, la formulación se mezcló a una velocidad mayor durante 5 minutos adicionales, luego se vació en barriles de barras y se dejó enfriar naturalmente a temperatura ambiente de laboratorio.

Tabla 7

Ejemplo	82	83	84	85	86	87
Constituyente	% en peso					
DC245 ⁽²³⁾	25.06	24.11	21.08	20.61	17.10	13.60
Silkflo 364NF ⁽¹⁰⁾	31.67	30.46	26.65	26.04	21.62	17.20
Fluid AP ⁽²⁾	6.27	6.03	5.27	5.15	4.28	3.40
Abil EM90 ⁽¹²⁾	1	1	1	1	1	1
Zirkonal 50 ⁽¹³⁾	24	24	40	40	40	40
Glicerol ⁽¹⁴⁾	6	6	-	-	10	10
Agua	-	-	-	-	-	10
β Sitoesterol ^(5c)	3	4.2	3	3.6	3	2.4
Orizanol ⁽⁶⁾	3	4.2%	3	3.6	3	2.4
Fase interna	30	30	40	40	50	60
Dureza (mm)	12.9	11.2	11.8	10.7	10.4	14.1

Medidas de dureza mediante Penetrómetro

Equipo

Penetrómetro Lab Plant PNR 10.

Aguja para cera seta, masa= 2.5 g, ángulo cónico en el punto de la aguja específico en $9^{\circ}10' \pm 15'$ (ASTM D1321; IP376: DIN 51579).

Condiciones

Límite de profundidad = 50 mm

Tiempo de caída = 5 segundos.

Operación

Las medidas de penetración en la barra se realizaron en el barril de la barra. La barra se empujó hacia fuera por encima de la superficie del barril, y luego se cortó para dejar una superficie plana y uniforme. La aguja se bajó cuidadosamente hacia la superficie de la barra, y luego se condujo la medida de dureza por penetración dejando que la aguja y su soporte cayeran bajo su peso combinado de 50 g por un período de 5 segundos, entonces se midió la profundidad de penetración. Este proceso se llevó a cabo en seis puntos distintos de la superficie de la barra. Cada barra se empujó hacia a fuera por 1 cm más, y se cortó una nueva superficie. Se hicieron 6 medidas más de dureza por penetración.

La lectura de la dureza registrada es el valor promedio de las 12 medidas.

La dureza adecuada para un material antitranspirante a ser usado en un contenedor dispensador de extremo abierto es menor que 30 mm, particularmente en el rango entre 5 y 20 mm.

Medida de los Depósitos

El procedimiento involucra la aplicación instrumental de una muestra de un barra AP a un sustrato empleando un aparato bajo condiciones estándar y luego midiendo el nivel medio de blancura de los depósitos empleando análisis de imagen.

I) Aplicación de la Muestra al Sustrato

Los sustratos fueron:

A: Tiras de papel carborundum abrasivo gris de 12x28 cm de 3M™ P800 WeterDry™

B: Tiras de tela de lana negra Worsted de 12x28 cm, que fue reforzado con cinta quirúrgica hipoalergénica [3M™ Transpore 1527-2]

Las barras AP no fueron usadas antes y tenían la forma de domo original inalterada.

El aparato comprendía una base plana sobre la cual se adhirió un sustrato plano con un clip en cada extremo. La barra fue frotada sobre el sustrato bajo condiciones estándar – una fuerza hacia abajo estándar sobre el sustrato y una velocidad de movimiento estandar.

Cada barra fue condicionada a la temperatura del laboratorio durante la noche antes de realizar la medición. La barra se pasó lateralmente sobre el sustrato ocho veces. El sustrato se removió cuidadosamente

del aparato y se registró el depósito; esto es, evaluación de blancura, medida 24 horas más tarde mediante análisis de imagen.

II) Análisis de Imagen

La medición se condujo empleando una cámara de video SonyTM XC77 Monocromática con un lente CosmicalTM de longitud focal 16 mm posicionado verticalmente por encima de una mesa negra que se iluminó desde un ángulo alto utilizando tubos fluorescentes para eliminar las sombras. El aparato fue inicialmente calibrado empleando una tarjeta gris de referencia, después de que los tubos fluorescentes habían estado encendidos durante un tiempo suficiente para que la salida de luz fuera estable. El sustrato muestra con el depósito resultante de la prueba de depósito se colocó en la mesa y la cámara capturó la imagen. Se seleccionó un área de la imagen y se analizó empleando un analizador de imagen Kontron IBAS. Este dividió la imagen por noción en un amplio espectro de pixels y midió el nivel de gris de cada pixel en una escala entre 0 (negro) hasta 255 (blanco). El promedio de la intensidad del gris fue calculado. Esto dio una indicación de la blancura del depósito, en donde los números altos del promedio indicaban un depósito más blanco.

REIVINDICACIONES

1. Una composición antitranspirante que comprende un activo antitranspirante, un portador líquido y un estructurante que incluye un esterol para espesar o solidificar la composición caracterizada en que el estructurante comprende una concentración efectiva de una combinación de por lo menos un esterol y por lo menos un ester esterol.
2. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 1 caracterizada en que el estructurante comprende un esterol y un ester esterol en una proporción molar de entre 6:1 a 1:4, preferiblemente 3:1 a 1:2.
3. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que el peso combinado del esterol y del ester esterol está entre 0.5 y 20%, y preferiblemente entre 1 y 15%.
4. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que el esterol comprende 4 anillos fusionados substituidos por un grupo alifático, cicloalifático o aromático.
5. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 4 caracterizada en que el esterol es substituido por un hidrocarburo alifático no saturado o saturado lineal o ramificado que contiene hasta 20 y preferiblemente entre 4 y 14 átomos de carbono.

6. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 5 caracterizada en que el esteroi es β sitoesteroi o campesteroi o coilesteroi, o un derivado hidrogenado del mismo.
7. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 6 caracterizada en que el esteroi es β sitoesteroi.
8. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que el ester (esteroi) es un ester de ácido fenólico.
9. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 8 caracterizada en que la estructura de anillos del ester esteroi coincide con la estructura de anillos del esteroi. *óxis $\rightarrow$ ciclo pentano per hidro fenantreno*
10. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que el ester esteroi es substituido por un hidrocarburo alifático saturado o no saturado lineal o ramificado que contiene hasta 20 y preferiblemente entre 4 y 14 átomos de carbono.
11. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 10 caracterizada en que el hidrocarburo alifático substituyente es un substituyente no saturado que contiene entre 5 y 10 carbonos.

12. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 11 caracterizada en que el ester esteroide es γ orizanol.
13. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que contiene entre 1 y 10% en peso de un peso combinado de β sitoesteroide y orizanol en una proporción molar entre 3:1 y 1:2.
14. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que el activo antitranspirante comprende aluminio, circonio o halohidrato de aluminio / circonio, aluminio activado, halohidrato de circonio o de aluminio / circonio, o un complejo de aluminio, circonio o aluminio/circonio, o un complejo de aluminio activado, circonio o aluminio / circonio.
15. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 14 caracterizada en que el antitranspirante es seleccionado entre clorohidratos de aluminio, circonio o una mezcla de aluminio circonio, y complejos de dichos clorohidratos, cualquiera clorhidrato o complejo es opcionalmente activado.
16. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 14 o 15 caracterizada en que el activo antitranspirante en una mezcla de clorohidrato de circonio-aluminio, o un clorohidrato de aluminio activado o un complejo de un clorohidrato de aluminio más circonio con glicina, activado opcionalmente,

17. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que la proporción del activo antitranspirante está entre 5 y 40% en peso.
18. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que contiene una silicona volatil y opcionalmente una silicona no volatil y/o un portador orgánico hidrofóbico no silicona líquido seleccionado entre hidrocarburos, esterés alifáticos hidrofóbicos, esterés aromáticos, alcoholes hidrofóbicos y eterés hidrofóbicos.
19. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que es anhidro y contiene un activo antitranspirante particulado suspendido.
20. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17 caracterizada en que el portador comprende una fase acuosa que contiene por lo menos una fracción de un activo antitranspirante.
21. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 20 caracterizada en que la fase acuosa contiene un di o poliol.
22. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 20 o 21 caracterizada en que está en forma de una emulsión.

o. m. p. + G_p
y + l / w } Compos.
B-10

23. Una composición de acuerdo con la Reivindicación 22 caracterizada en que la fase dispersa en la emulsión es entre 5 y 80% en peso y la fase continua entre 95 y 20 % en peso.
24. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 20 a 23 caracterizada en que contiene entre 0.1 y 10% en peso de un emulsificante.
25. Una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizada en que contiene un humectante seleccionado entre glicerol y sorbitol.
- * 26. Un proceso para la producción de una barra antitranspirante que comprende los pasos de
1. incorporar un estructurante en un portador líquido en una concentración efectiva y en una cantidad suficiente para espesar o estructurar el portador para producir un sólido o un sólido blando,
 2. llevar la mezcla que contiene el estructurante o uno o más de sus constituyentes a una elevada temperatura,
 3. mezclar el portador líquido con un activo antitranspirante para formar una mezcla que contenga el antitranspirante, una vez se hayan realizado los pasos 2 y 3, antes, después o simultáneamente con el paso 1.
 4. Introducir la mezcla móvil en un molde que sea preferiblemente un contenedor dispensador y
 5. Enfriar o dejar que la mezcla móvil se enfríe a una temperatura en la cual se espese o estructure, caracterizada en que el estructurante comprende una

combinación de por lo menos un esteroide y por lo menos un esteroide esteroide.

27. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 26 caracterizado en que el esteroide y el esteroide esteroide se introducen de manera simultánea o secuencial, en una fracción hidrofóbica del portador o en fracciones separadas del mismo a una elevada temperatura y se mezclan hasta que se disuelvan, y la solución o soluciones resultantes se mezclan con el activo antitranspirante y cualquier constituyente acuoso.

X

28. Un método para prevenir o reducir la transpiración en la piel humana que comprende normalmente la aplicación sobre la piel de una composición antitranspirante que comprende un activo antitranspirante, un portador líquido y un estructurante que comprende una concentración efectiva de una combinación de por lo menos un esteroide y por lo menos un esteroide esteroide.

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCION []

MODELO DE UTILIDAD []

- | | |
|---|-----|
| • Nombre e identificación del Solicitante / | [] |
| • Nombre e identificación del Inventor / | [] |
| • Título o nombre de la Invención / | [] |
| • Descripción 10 | [] |
| • Reivindicaciones 44 | [] |
| • Resumen 1 | [] |
| • Comprobante de Pago 2 | [] |

COMPLETA ☒

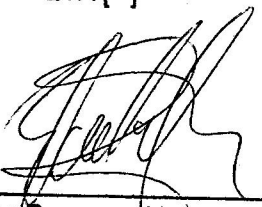
INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- | | |
|--|-----|
| • Nombre e identificación del peticionario | [] |
| • Nombre e identificación del inventor o diseñador | [] |
| • Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse | [] |
| • Representación gráfica | [] |
| • Comprobante de pago | [] |

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha: 2000-04-10

INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 00-0260094.

Fecha: 11 de abril del 2000.

Se certifica que:

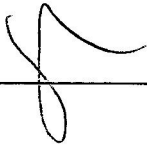
Desde fecha 25 de abril de 1990,
del folio 60.830 al folio 60.835 del
libro de Protocolo N° 202, obra el poder
N° 12.817 conferido por UNILEVER N.V.

domiciliado(a) en Rotterdam - Holanda

al doctor JOSE LLOREDA CAMACHO y/o ALFONSO
LLOREDA CAMACHO y/o JOSE ANTONIO LLOREDA

Representante en Santafé de Bogotá D.C. Los
mismos.

Facultad para desistir SI.

Revisado .

89
56

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

2000-04-11
430

EXPEDIENTE 00-026094

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

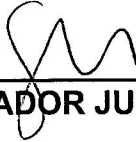
- SI** ☒ **NO** ☐ **NO APLICABLE** ☐ Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a).
- SI** ☒ **NO** ☐ **NO APLICABLE** ☐ Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94).
- SI** ☒ **NO** ☐ **NO APLICABLE** ☐ Presentó, en forma correcta el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de enero del 2000).
- SI** ☒ **NO** ☐ **EXTEMPORANEAMENTE** ☐ Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de París.
- SI** ☐ **NO** ☒ **NO APLICABLE** ☐ Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional.
- SI** ☐ **NO** ☒ **NO APLICABLE** ☐ Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.).
- SI** ☐ **NO** ☒ **CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS**

OBSERVACIONES JURIDICAS CONVENIO DE PARIS: En todo caso, deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, **en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses**, contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud posterior. La omisión de esta formalidad implicará la pérdida del derecho de prioridad.

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

- SI** ☐ **NO** ☒ Se ajusta a los aspectos **FORMALES** indicados en la Decisión 344 y por tanto,
- SI** ☐ **NO** ☒ Se recomienda **PUBLICAR** el extracto correspondiente.

Santafé de Bogotá, D.C., 11 de abril del 2000.


EXAMINADOR JURIDICO

DIVISIÓN NUEVAS CREACIONES
1º EXAMEN DE FORMA

10-05-2000
430

EXPEDIENTE N°00-26094
CONCEPTO TÉCNICO N° 718

IPC:A61K 7/32

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | |
|---|--|
| SI X NO ☐ | Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a). |
| SI X NO ☐ | Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a). |
| SI X NO ☐ | Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e). |
| SI X NO ☐ | Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b). |
| SI X NO ☐ | Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c). |
| SI ☐ NO ☐ | Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94). |
| SI X NO ☐ | Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980). |
| SI X NO ☐ | Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d). |
| SI X NO ☐ | Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94. |
| SI ☐ NO ☐ | Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94. |
| SI X NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI X NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI X NO ☐ | CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS |

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☐ NO X ver hoja(s) anexa(s)

Santa Fe de Bogotá, D.C., 10 de mayo de 2000

202012