

Composición antitranspirante

La presente solicitud reivindica la prioridad de la solicitud de Patente Europea EP21382105.1, presentada el 11 de febrero de 2022.

5

La presente invención se refiere al campo de los antitranspirantes y desodorantes. En particular, a un antitranspirante de emulsión de agua en aceite invisible y eficaz de larga duración. También se refiere a procedimientos para su preparación y sus usos en terapia y en cosmética; tal como un agente antitranspirante y desodorante.

10

Antecedentes de la técnica

15

Las composiciones antitranspirantes y desodorantes son productos populares para el cuidado personal que se usan para prevenir o eliminar la transpiración y el olor corporal causado por la transpiración. La mayoría de las composiciones antitranspirantes usadas comúnmente incluyen al menos un principio activo antitranspirante que minimiza o evita la secreción de transpiración bloqueando o taponando los conductos de las glándulas secretoras de sudor. Además, la mayoría de las composiciones desodorantes incluyen al menos un agente activo desodorante que minimiza, previene y/o elimina el mal olor asociado con la transpiración.

20

25

Los principios activos antitranspirantes más comunes usados típicamente en estas composiciones son sales de ácidos inorgánicos fuertes, tales como sales que contienen aluminio y/o circonio. Estas sales al entrar en contacto con la transpiración entran en el conducto sudoríparo por difusión o convección y reaccionan con los componentes básicos de la transpiración bloqueándola. Además, estos antitranspirantes y algunos otros componentes de la composición a menudo dejan una película calcárea sobre la piel. Cuando la composición se seca sobre la piel o sobre la ropa (que ha entrado en contacto con la piel después de la aplicación del antitranspirante), la sal antitranspirante a menudo permanece visible como un residuo blanco. Estas manchas blancas atacan los tejidos celulósicos por la liberación de ácidos fuertes de las sales, decolorándolos y estropeándolos con el tiempo, dejando la ropa con manchas difíciles de quitar. Además, la mayoría de las composiciones antitranspirantes contienen una elevada cantidad de componentes oleosos que aumentan el tiempo de secado al contacto con la piel, proporcionando una incómoda sensación grasa y pegajosa en la aplicación; y también conducen a la tinción de los tejidos.

30

35

Por este hecho, la industria de los antitranspirantes se ha apartado del uso de estos principios activos antitranspirantes para desarrollar principios activos antitranspirantes menos irritantes o no irritantes y una sensación más agradable estéticamente. Lamentablemente, la mayoría de estas composiciones que se han desarrollado se usan para reducir la irritación de la piel pero también reducen significativamente la eficacia antitranspirante y/o el efecto antitranspirante de larga duración.

Particularmente, se ha descrito el uso de sales de ácidos débiles que contienen aluminio como principios

activos antitranspirantes no irritantes. Sin embargo, estos compuestos han demostrado ser mucho menos eficaces para inhibir la transpiración y tampoco evitan los olores tan bien como las sales de ácidos fuertes usadas tradicionalmente.

- 5 Por lo tanto, de lo que se conoce en la técnica se deriva que todavía existe la necesidad de desarrollar una composición antitranspirante efectiva y no irritante que tenga una protección antitranspirante de larga duración y también una aceptabilidad cosmética adecuada.

Resumen de la invención

10

Los inventores han encontrado que una composición de emulsión de agua en aceite que comprende una cantidad efectiva de principios activos antitranspirantes, junto con al menos uno de los agentes filmógenos y al menos uno de los emolientes descritos en la presente solicitud, permite tener un efecto antitranspirante de larga duración estable y eficaz durante aproximadamente 48 horas después de su aplicación sin causar

15 irritación en la piel (véase la prueba de actividad antitranspirante de la sección experimental).

20

Particularmente, la composición de la presente invención contiene componentes naturales y suaves que no son irritantes para la piel, teniendo al mismo tiempo una fragancia suave agradable y duradera sin necesidad de usar siliconas. De hecho, como se demuestra en la prueba de uso de la sección experimental, la

composición de la presente invención no solo cuida la piel sino que también la fortalece e hidrata.

25

Además, los inventores también han demostrado que la composición de la invención presentaba una buena cosmeticidad, teniendo una aceptabilidad muy satisfactoria por parte de los usuarios. De hecho, después de su aplicación, la composición se distribuye uniformemente y se absorbe/seca rápidamente sin proporcionar

ninguna sensación aceitosa o pegajosa, dejando una piel seca con una sensación cómoda y un aspecto limpio.

30

Finalmente, la composición de la invención, después de su aplicación, no deja marcas blancas sobre la piel ni la ropa; así como ninguna mancha en los tejidos. De hecho, como se muestra en la prueba de uso, todos los

usuarios manifestaron que la composición de la invención previene la aparición de manchas en la ropa.

35

En resumen, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención reduce el grado de transpiración excesiva/anómala/normal durante un largo período de tiempo, así como también evita la aparición de marcas antiestéticas de sudor en la ropa y al mismo tiempo minimiza el olor corporal. Además, la composición de

emulsión de agua en aceite también permite tener una buena cosmeticidad cuidando la piel sin proporcionar una sensación aceitosa o pegajosa, dejando una piel seca con una sensación cómoda y un aspecto limpio.

Por lo tanto, el primer aspecto de la invención se refiere a una composición farmacéutica o cosmética de emulsión de agua en aceite que comprende: (a) una cantidad terapéutica o cosméticamente efectiva de uno

o más principios activos antitranspirantes; (b) uno o más agentes filmógenos seleccionados del grupo que consiste en copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico; poliéster-7 (y) diheptanoato de neopentilglicol; etilcelulosa (y) adipato de diisopropilo; copolímero de VP/acrilatos/metacrilato de laurilo; copolímero de VP/eicoseno; triacontanil PVP; y pentilenglicol (y) goma laca; y (c) uno o más emolientes seleccionados del grupo que consiste en dicaprilil éter; PPG-14 butil éter; triheptanoína (e) isoparafina (C₁₃-C₁₆); undecilenato de heptilo (y) alcano (C₁₃-C₁₅); triheptanoína (y) alcano (C₁₃-C₁₅); succinato de diisooctilo; diheptanoato de neopentilglicol; succinato de diheptilo; isododecano; carbonato de dipropilheptilo; caprilato/caprato de caprililo; caprilato de propilheptilo; isononanoato de cetearilo; undecano (y) tridecano; benzoato de alquilo (C₁₂-C₁₅), adipato de dibutilo; coco-caprilato; carbonato de dicaprililo; PPG-15 estearil éter; coco-caprilato/caprato; triglicérido caprílico/cáprico; cocoglicéridos; octildodecanol, miristato de isopropilo, y palmitato de isopropilo; (d) junto con uno o más excipientes o portadores farmacéutica o cosméticamente aceptables.

El segundo aspecto de la invención se refiere a la composición del primer aspecto de la invención para su uso en terapia, particularmente para la profilaxis o el tratamiento de una enfermedad o afección que implica una transpiración excesiva o anómala.

El tercer aspecto de la invención se refiere al uso de la composición del primer aspecto de la invención como agente antitranspirante y desodorante.

20

Descripción detallada de la invención

Todos los términos como se usan en el presente documento en la presente solicitud, a menos que se indique de otro modo, se entenderán en su significado habitual, como se conoce en la técnica. Otras definiciones más específicas para determinados términos como se usan en la presente solicitud son como se exponen a continuación y tienen por objeto aplicarse de manera uniforme a lo largo de la memoria descriptiva y las reivindicaciones a menos que una definición expuesta expresamente de otro modo proporcione una definición más amplia.

Para los fines de la presente invención, cualquier intervalo proporcionado incluye los extremos tanto inferior como superior del intervalo. Los intervalos proporcionados, tales como el peso, temperaturas, tiempos, pesos y similares, se deben considerar aproximados, a menos que se indiquen específicamente.

Las expresiones "porcentaje (%) en peso", "% peso/peso" y "% p/p" tienen el mismo significado y se usan indistintamente. Se refieren al porcentaje de cada ingrediente de la composición en relación con el peso total de la composición.

Para los fines de la invención, el término "alquilo" se refiere a una cadena hidrocarburo lineal o ramificada saturada que contiene el número de átomos de carbono especificado en la descripción o las reivindicaciones.

Los ejemplos incluyen, entre otros, el grupo metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, *sec*-butilo y *terc*-butilo. Y, el término "alcohol" se refiere a un "alcano" en donde al menos un átomo de hidrógeno está sustituido por un grupo hidroxilo y que contiene el número de átomos de carbono especificado en la descripción o las reivindicaciones. El término "alcano" se refiere a un hidrocarburo saturado, ramificado o

5 lineal que contiene el número de átomos de carbono especificado en la descripción o las reivindicaciones. Los ejemplos incluyen metanol, etanol, *n*-propanol, iso-propanol, butanol, *iso*-butanol y *sec*-butanol.

Como se ha mencionado anteriormente, la composición del primer aspecto de la invención es una emulsión de "agua en aceite". Las expresiones "agua en aceite", "agua en aceite" y emulsión "Ag./Ac." (W/O) tienen el

10 mismo significado y se usan indistintamente. Se refieren a una emulsión que incluye una fase discontinua, es decir, la fase "acuosa" (Ag.) o una fase predominantemente acuosa, y una fase continua, es decir, una fase "oleosa", o una fase líquida predominantemente orgánica. La fase oleosa es al menos parcialmente inmiscible con la fase acuosa. Esta "emulsión de agua en aceite" (Ag./Ac.) forma "partículas" en una fase acuosa discontinua. Los términos "partículas" o "gotas" tienen el mismo significado y se usan indistintamente.

15 La expresión "tamaño de partícula" se refiere al diámetro de partícula de las gotas de agua internas (Ag.) de la fase discontinua basándose en una forma esférica aproximada de la partícula basada en una medición volumétrica de la partícula. Además de partículas esféricas, las emulsiones de aceite en agua de la presente invención también pueden comprender, sin limitación, partículas elipsoidales y/o cilíndricas. El método para determinar el tamaño de partícula de las composiciones de la presente invención puede ser cualquier método

20 conocido en el estado de la técnica, para los fines de la invención el tamaño de partícula se mide mediante la técnica de dispersión de luz dinámica (DLS, por sus siglas en inglés).

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la presente invención comprende

(a) una cantidad terapéutica o cosméticamente efectiva de uno o más principios activos antitranspirantes;

25 (b) uno o más agentes filmógenos seleccionados del grupo que consiste en copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico; poliéster-7 (y) diheptanoato de neopentilglicol; etilcelulosa (y) adipato de diisopropilo; copolímero de VP/acrilatos/metacrilato de laurilo; copolímero de VP/eicoseno; triacontanil PVP; y pentilenglicol (y) goma laca; y

(c) uno o más emolientes seleccionados del grupo que consiste en dicaprilil éter; PPG-14 butil éter;

30 triheptanoína (e) isoparafina (C₁₃-C₁₆); undecilenato de heptilo (y) alcano (C₁₃-C₁₅); triheptanoína (y) alcano (C₁₃-C₁₅); succinato de diisooctilo; diheptanoato de neopentilglicol; succinato de diheptilo; isododecano; carbonato de dipropilheptilo; caprilato/caprato de caprililo; caprilato de propilheptilo; isononanoato de cetearilo; undecano (y) tridecano; benzoato de alquilo (C₁₂-C₁₅), adipato de dibutilo; coco-caprilato; carbonato de dicaprililo; PPG-15 estearil éter; coco-caprilato/caprato; triglicérido caprílico/cáprico; cocoglicéridos; y

35 palmitato de isopropilo;

(d) junto con uno o más excipientes o portadores farmacéutica o cosméticamente aceptables.

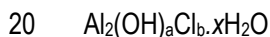
En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la presente invención tiene una viscosidad de 0 a 800 cps. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la presente

invención tiene una viscosidad de 100 a 400 cps (1 centipoise (cps) corresponde a 1 mPa·s). El método para determinar la viscosidad puede ser cualquier método conocido en el estado de la técnica. Para los fines de la invención, la viscosidad de la composición de emulsión de agua en aceite se mide con un viscosímetro digital de rango bajo Brookfield Dv-e Ametek LVDVE115 (husillo: 3 y velocidad: 30 rpm) siguiendo el método descrito en la Farmacopea Europea. 7.0 - 2.2.10. viscosidad - método del viscosímetro giratorio.

Además, la composición de emulsión de agua en aceite de la presente invención comprende (a) una cantidad terapéutica o cosméticamente efectiva de uno o más principios activos antitranspirantes. La expresión una "cantidad efectiva del principio activo antitranspirante" se refiere a la cantidad de los principios activos antitranspirantes que proporciona el efecto terapéutico y/o cosmético después de su aplicación sobre la piel (es decir, un efecto antitranspirante y/o desodorante).

La expresión principio activo "antitranspirante" se refiere a cualquier compuesto que tenga actividad antitranspirante. Los principios activos antitranspirantes apropiados para la presente invención pueden incluir sales metálicas astringentes, especialmente sales inorgánicas y orgánicas de aluminio, circonio y cinc, y mezclas de las mismas. Incluso más específicamente, los principios activos antitranspirantes pueden incluir sales o materiales que contienen aluminio y/o circonio, tales como, por ejemplo, haluros de aluminio, clorhidrato de aluminio, hidroxihaluros de aluminio, oxihaluro de circonilo, hidroxihaluros de circonilo y mezclas de los mismos.

En una realización, el principio activo antitranspirante es al menos una sal que contiene aluminio de fórmula:



en donde:

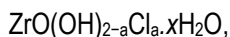
a está comprendido entre 2 y 5;

la suma de a y b es 6;

x está comprendido entre 1 y 6; y

a, b y x se seleccionan del grupo que consiste en un valor entero o no entero.

En una realización, el principio activo antitranspirante es una sal de circonio de fórmula:



en donde:

a está comprendido entre 1,5 y 1,87;

x está comprendido entre 1 y 7; y

a y x se seleccionan del grupo que consiste en un valor entero o no entero.

- Los ejemplos de sales que contienen aluminio apropiadas para la presente invención incluyen, pero sin limitación, cloruro de aluminio hidratado ($[Al_2(OH)_5Cl] \cdot nH_2O$), sesquihidrato cloruro alúmina hidratado ($[Al_2(OH)_4.5Cl_{1.5}] \cdot nH_2O$), diclorhidrato y alúmina hidratada ($[Al_2(OH)_4Cl_2] \cdot nH_2O$), hidrogenocloruro alúmina hidratada (sal que contiene aluminio clorohidrex) propilenglicol (PG) o polietilenglicol (PEG) ($[Al_2(OH)_5Cl] \cdot nH_2O + CH_3CHOHCH_2OH$ o $H(OCH)_2(CH_2)_2OH$), sesquihidrogenocloruro de aluminio hidratado PG o PEG, PG de aluminio o PEG de diclorhidrato hidratado, hidróxido de aluminio hidratado ($Al(OH)_3 \cdot nH_2O$), hidróxido de aluminio, cloruro de aluminio, aluminio potásico, cloruro de hidrato aluminio glicina y cloruro de calcio; sal hidratada de cloruro de circonio, tal como de aluminio circonio triclorosilano hidratado ($[Al_{3.8}Zr(OH)_{12.4}Cl_3] \cdot nH_2O$), hidróxido de aluminio hidratado, tetracloruro de circonio ($[Al_3Zr(OH)_{11.6}Cl_{3.2}] \cdot nH_2O$), hidróxido de circonio hidratado de pentaclorofenol ($[Al_8Zr(OH)_{23}Cl_5] \cdot nH_2O$), hidróxido de circonio de hidrato de ocho cloros ($[Al_8Zr(OH)_{20}Cl_8] \cdot nH_2O$), triclorosilano aluminio circonio glicina hidratado ($[Al_{3.8}Zr(OH)_{12.4}Cl_3] \cdot nH_2O + H_2NCH_2COOH$), hidróxido de glicina y aluminio de tetracloruro de circonio hidratado, hidróxido de circonio glicina pentaclorofenol y aluminio hidratado, hidróxido de aluminio, hidrato de cloro ocho circonio glicina, sal potásica de sulfato de aluminio ($KAl(SO_4)_2 \cdot 12H_2O$), aminoácidos de aluminio undecilenoil colágeno, lactato de aluminio + sulfato de aluminio ($Al_2(SO_4)_3 + Na_2HAl(OOCCHOHCH_3)_2 \cdot (OH)_6$), bromuro de sodio y aluminio de cloruro de ácido glicólico, sesquiclorhidrato de aluminio, hidróxido de aluminio, ($Al_2Br(OH)_5 \cdot nH_2O$) hidratado, cloruro de aluminio hidratado ($AlCl_3 \cdot 6H_2O$), compuesto complejo de cinc y sodio, complejos de lantano y cerio y sales que contienen aluminio de ácidos grasos.
- En una realización, el principio activo antitranspirante se selecciona del grupo formado por halohidrato de aluminio, halohidrato de aluminio-circonio, compuestos de nitrohidrato de aluminio y mezclas de los mismos. En una realización, el principio activo antitranspirante es cloruro de aluminio hidratado ($[Al_2(OH)_5Cl] \cdot nH_2O$), opcionalmente con glicina y cloruro de calcio.
- En una realización, la emulsión de agua en aceite comprende del 20 al 60 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes; particularmente una sal que contiene aluminio. En una realización, la emulsión de agua en aceite comprende del 40 al 55 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes; particularmente una sal que contiene aluminio. En una realización, la emulsión de agua en aceite comprende del 20 al 60 % en peso de cloruro de aluminio hidratado; particularmente del 40 al 55 % en peso.
- Además, la composición de emulsión de agua en aceite del primer aspecto de la invención comprende (b) uno o más agentes filmógenos descritos en el presente documento. Para el fin de la presente invención, la expresión "agente filmógeno" se refiere a un compuesto capaz de construir una capa delgada que cubre el área de aplicación, por ejemplo, dentro del área de la piel de la axila. La composición de emulsión de agua en aceite del primer aspecto de la invención comprende: (b) uno o más agentes filmógenos seleccionados del grupo que consiste en copolímero de capriloil glicerina/ácido sebácico; poliéster-7 (y) diheptanoato de neopentilglicol; etilcelulosa (y) adipato de diisopropilo; copolímero de VP/acrilatos/metacrilato de laurilo; copolímero de VP/eicoseno; triacontanil PVP; y pentilenglicol (y) goma laca. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende (b) al menos copolímero de capriloil

glicerina/ácido sebácico como agentes filmógenos. Para los fines de la presente invención, la expresión "capryloyl glycerine/sebacic acid copolymer" es el nombre INCI de un copolímero de monómeros de caprilol glicerina y ácido sebácico, que tiene el número CAS 1190099-88-7.

- 5 En una realización, la emulsión de agua en aceite comprende del 0,1 al 10 % en peso de uno o más agentes filmógenos como se describe en la presente solicitud; particularmente un copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico. En una realización, la emulsión de agua en aceite comprende del 1 al 5 % en peso de uno o más agentes filmógenos como se describe en la presente solicitud; particularmente un copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico.

10

- Todos los agentes filmógenos descritos en el presente documento están disponibles comercialmente. A continuación se describe el nombre del producto comercial: copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico (LEXFILM SUN NATURAL); poliéster-7 (y) diheptanoato de neopentilglicol (LEXFILM SUN); etilcelulosa (y) adipato de diisopropilo (ANTARON™ ECO GEL); copolímero de VP/acrilatos/metacrilato de laurilo (ANTARON™ SENSORY POLYMER); copolímero de VP/eicoseno (ANTARON™ V-220 POLYMER); PVP de triacontanilo (ANTARON™ WP-660 POLYMER); y pentilenglicol (y) goma laca (ACTISHELL WR).
- 15

- Además, la composición de emulsión de agua en aceite del primer aspecto de la invención comprende (c) uno o más emolientes descritos en el presente documento. El término "emoliente" se refiere a una sustancia que suaviza algo y, para los fines de la invención, es capaz de suavizar la piel. La composición de emulsión de agua en aceite del primer aspecto de la invención comprende (c) uno o más emolientes seleccionados del grupo que consiste en dicaprilil éter; PPG-14 butil éter; triheptanoína (e) isoparafina (C₁₃-C₁₆); undecilenato de heptilo (y) alcano (C₁₃-C₁₅); triheptanoína (y) alcano (C₁₃-C₁₅); succinato de diisooctilo; diheptanoato de neopentilglicol; succinato de diheptilo; isododecano; carbonato de dipropilheptilo; caprilato/caprato de caprililo; caprilato de propilheptilo; isononanoato de cetearilo; undecano (y) tridecano; benzoato de alquilo (C₁₂-C₁₅); adipato de dibutilo; coco-caprilato; carbonato de dicaprililo; PPG-15 estearil éter; coco-caprilato/caprato; triglicérido caprílico/cáprico; cocoglicéridos; y palmitato de isopropilo. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende (c) al menos uno de los emolientes seleccionados del grupo que consiste en dicaprilil éter y PPG-14 butil éter. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende (c) una mezcla de dicaprilil éter y PPG-14 butil éter como emolientes. Para los fines de la invención, la expresión "dicaprylyl ether" es el nombre INCI de dioctil éter, 1-octoxioctano que tiene el número CAS 629-82-3. Y, la expresión "PPG-14 butyl ether" es el nombre INCI de polipropilenglicol monobutil éter siendo 14 el número de unidades de propilenglicol que tiene el CAS número 9003-13-8.
- 20
- 25
- 30

35

En una realización, la emulsión de agua en aceite comprende del 12 al 40 % en peso de al menos uno de los emolientes descritos en la presente solicitud; particularmente al menos uno seleccionado de dicaprilil éter, PPG-14 butil éter y una mezcla de los mismos. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende (c) una mezcla de dicaprilil éter y PPG-14 butil éter; particularmente del 10

al 30 % en peso de dicaprilil éter y del 2 al 10 % en peso de PPG-14 butil éter. En una realización, la emulsión de agua en aceite comprende del 20 al 30 % en peso de al menos uno de los emolientes descritos en la presente solicitud; particularmente al menos uno seleccionado de dicaprilil éter, PPG-14 butil éter y una mezcla de los mismos. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención

5 comprende (c) una mezcla de dicaprilil éter y PPG-14 butil éter como emolientes; particularmente del 18 al 26 % en peso de dicaprilil éter y del 3 al 7 % en peso de PPG-14 butil éter

Todos los emolientes descritos en el presente documento están disponibles comercialmente. El nombre del producto comercial se describe en el presente documento: dicaprilil éter (CETIOL OE); PPG-14 butil éter

10 (TEGOSOFT PBE); triheptanoína (e) isoparafina (C₁₃-C₁₆) (LEXFEEL WOW); undecilenato de heptilo (y) alcano (C₁₃-C₁₅) (LEXFEEL WOW-A DT); triheptanoína (y) alcano (C₁₃-C₁₅) (LEXFEEL WOW A); succinato de diisooctilo (SUSTOLEO DCS); diheptanoato de neopentilglicol (LEXFEEL 7); succinato de diheptilo (LEXFEEL N50 MB); isododecano (CREASIL® ID JSQI); carbonato de dipropilheptilo (CETIOL 4 ALL); caprilato/caprato de caprililo (CETIOL RLF); caprilato de propilheptilo (CETIOL SENSOFT); isononanoato de

15 cetearilo (CETIOL SN); undecano (y) tridecano (CETIOL ULTIMATE); benzoato de alquilo (C₁₂-C₁₅) (CETIOL AB), adipato de dibutilo (CETIOL B); coco-caprilato (CETIOL C5); carbonato de dicaprililo (CETIOL CC); PPG-15 estearil éter (CETIOL E); coco-caprilato/caprato (CETIOL LC); triglicérido caprílico/cáprico (MYRITOL 318); cocoglicéridos (MYRITOL 331); y palmitato de isopropilo (WAGLINOL 6016).

20 En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende:

(a) al menos uno de los principios activos antitranspirantes es una sal que contiene aluminio;

(b) al menos uno de los agentes filmógenos es un copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico; y

(c) al menos uno de los emolientes se selecciona del grupo que consiste en dicaprilil éter y polipropilenglicol butil éter

25

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende:

(a) del 20 al 60 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes;

(b) del 0,1 al 10 % en peso de uno o más agentes filmógenos; y

(c) del 12 al 40 % en peso de uno o más emolientes;

30 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende:

(a) del 40 al 55 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes;

(b) del 1 al 5 % en peso de uno o más agentes filmógenos; y

35 (c) del 20 al 30 % en peso de uno o más emolientes;

siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

Como se ha mencionado anteriormente, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende uno o más (d) excipientes o portadores farmacéutica o cosméticamente aceptables. La expresión

"farmacéuticamente aceptable" se refiere a los excipientes o portadores adecuados para su uso en la tecnología farmacéutica para preparar composiciones de uso médico. Y las expresiones "cosméticamente aceptable" o "dermatológicamente aceptable" tienen el mismo significado y se usan en el presente documento indistintamente. Se refieren a los excipientes o portadores aptos para su uso en contacto con la piel humana sin demasiada toxicidad, incompatibilidad, inestabilidad, respuesta alérgica, entre otros. Los excipientes o portadores usados tienen afinidad por la piel, se toleran bien, son estables y se usan en una cantidad adecuada para proporcionar la consistencia deseada y facilidad de aplicación. Los excipientes y/o portadores apropiados, y sus cantidades, pueden determinarse fácilmente por los expertos en la técnica de acuerdo con el tipo de formulación que se prepara para proporcionar la consistencia deseada y facilitar la aplicación

Los ejemplos de excipientes o portadores apropiados pueden incluir, pero sin limitación, tensioactivo, vehículo, conservante, propulsor, agente regulador del pH, agentes estabilizantes, agente de viscosidad, agente acondicionador de la piel, antioxidante y una mezcla de los mismos.

El término "tensioactivo" se refiere a un material que reduce la tensión superficial de un líquido y la tensión interfacial entre dos líquidos, lo que permite que se esparzan más fácilmente. Los tensioactivos tienen una cabeza hidrófila que es atraída hacia las moléculas de agua y una cola hidrófoba que repele el agua y simultáneamente se une por sí misma al aceite y la grasa en la suciedad. Estas fuerzas opuestas separan la suciedad y la suspenden en agua, por lo que tienen la capacidad de eliminarla de superficies tales como la piel humana, tejidos y otros sólidos, cuando los tensioactivos se disuelven en agua. Los ejemplos de agentes tensioactivos apropiados incluyen, pero sin limitación, tensioactivos no iónicos, tensioactivos catiónicos, tensioactivos anfóteros, tensioactivos zwitteriónicos y mezclas de los mismos. Los ejemplos de tensioactivos específicos apropiados para la presente invención incluyen, pero sin limitación, poligliceril-4 diisoestearato/Polihidroxiestearato/sebacato, aceite de ricino hidrogenado, polioxietileno 2 estearil éter, polioxietileno 20 estearil éter y mezclas de los mismos; particularmente poligliceril-4 diisoestearato/polihidroxiestearato/sebacato (ISOLAN GPS). Si está presente, la cantidad de tensioactivo en las composiciones de la presente invención es del 1 % al 8 % en peso; particularmente del 2 al 5 % en peso.

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende un sistema emulsionante que tiene un equilibrio hidrófilo-lipófilo (HLB) de 1 a 9. Para los fines de la invención, la expresión "sistema emulsionante" abarca uno o más tensioactivos, teniendo cada uno de ellos un HLB de 1 a 9; o una mezcla de tensioactivos que tienen en la mezcla un HLB de 1 a 9. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende del 2 al 5 % en peso de un sistema emulsionante que tiene un equilibrio hidrófilo-lipófilo (HLB) de 1 a 9; particularmente seleccionados de los mencionados anteriormente.

El término "vehículo" se refiere a una sustancia que facilita el uso de los principios activos mezclados con ella. Los ejemplos de vehículos incluyen, pero sin limitación, agua, glicoles tales como propilenglicol y

butilenglicol; alcoholes tales como etanol e isopropanol; particularmente agua.

- El término "conservante" se refiere a un material que previene o reduce o frena el crecimiento microbiano, siempre que la estabilidad de la emulsión no se vea afectada. Los ejemplos de agentes conservantes apropiados incluyen, pero sin limitación, ácido benzoico, butilparabeno, etilparabeno, propilparabeno, metilparabeno, ácido sórbico, sorbato de potasio, benzoato de sodio, sorbato de potasio, fenoxietanol, triclosán o sus mezclas. Si están presentes, la cantidad de conservantes en las composiciones de la presente invención es del 0,2 al 3 % en peso.
- La composición de la presente invención puede presentarse en forma de aerosol que comprende opcionalmente uno o más propulsores. El término "propulsor" se refiere a uno o más gases que se usan para presurizar la composición para facilitar la pulverización de la composición desde el recipiente. Algunos propulsores pueden ser una mezcla de gases (por ejemplo, A-46, que es una mezcla de isobutano, butano y propano). Un propulsor puede estar en forma de líquido (es decir, un gas licuado) cuando está bajo presión dentro del depósito de un dispositivo en aerosol. Además, un propulsor puede estar en estado gaseoso dentro del espacio superior del depósito. Un propulsor puede estar presente tanto en forma licuada como en estado gaseoso dentro del depósito. A menos que se especifique lo contrario (por ejemplo, propulsor líquido o gaseoso), el término propulsor pretende abarcar la forma licuada y el estado gaseoso individual y colectivamente. Un ejemplo de propulsor apropiado incluye, pero sin limitación, aire comprimido, nitrógeno, gases inertes, dióxido de carbono y mezclas de los mismos. Los propulsores también pueden incluir hidrocarburos gaseosos como propano, *n*-butano, isobutano, isobuteno, ciclopropano y mezclas de los mismos. Los hidrocarburos halogenados como 1,1-difluoroetano también se pueden usar como propulsores. Algunos ejemplos no limitantes de propulsores incluyen 1,1,1,2,2-pentafluoroetano, 1,1,1,2-tetrafluoroetano, 1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropano, trans-1,3,3,3-tetrafluoroprop-1-eno, dimetil éter, diclorodifluorometano (propulsor 12), 1,1-dicloro-1,1,2,2-tetrafluoroetano (propulsor 114), 1-cloro-1,1-difluoro-2,2-trifluoroetano (propulsor 115), 1-cloro-1,1-difluoroetileno (propulsor 142B), 1,1-difluoroetano (propulsor 152A), monoclorodifluorometano, y mezclas de los mismos. Algunos otros propulsores adecuados para su uso incluyen, pero sin limitación, A-46 (una mezcla de isobutano, butano y propano), A-31 (isobutano), A-17 (*n*-butano), A-108 (propano), AP70 (una mezcla de propano, isobutano y *n*-butano), AP40 (una mezcla de propano, isobuteno y *n*-butano), AP30 (una mezcla de propano, isobutano y *n*-butano), 152A (1,1 difluoroetano) y PROPEL-45 (una mezcla de isobutano, propano y butano). Si está presente, la cantidad del propulsor es del 70 al 90 % en peso. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención está en forma de aerosol y, opcionalmente, comprende además uno o más propulsores.
- La expresión "agente espesante" o "espesante" o "agente de viscosidad" que se usa indistintamente en el presente documento se refiere a un material que aumenta su viscosidad sin modificar sustancialmente sus otras propiedades. El espesante apropiado incluye, pero sin limitación, espesantes naturales y sintéticos o semisintéticos que proceden de diversas fuentes y consisten en estructuras moleculares muy diferentes, incluidos polisacáridos, proteínas y alcoholes. Los ejemplos de espesantes apropiados incluyen alcohol

cetilico, alcohol estearílico, ácido esteárico y derivados de celulosa tales como hidroxietilcelulosa, goma guar, goma de algarrobo, goma xantana y gelatina. Si está presente, la cantidad del agente de viscosidad es del 0,1 al 10 % en peso.

- 5 La expresión "agente estabilizante" se refiere a una sustancia que mejora la estabilidad de la formulación líquida. Los ejemplos de agentes conservantes apropiados incluyen, pero sin limitación, cloruro de sodio, dicloruro de magnesio, sulfato de magnesio o mezclas de los mismos. Si está presente, la cantidad del agente estabilizante es del 0,1 al 5 % en peso.
- 10 La expresión "agente acondicionador de la piel" se refiere a una sustancia que aumenta el contenido de agua de las capas superiores de la piel y/o da a la piel un aspecto suave y terso. Los ejemplos de agentes acondicionadores de la piel apropiados pueden incluir, pero sin limitación, ésteres de glicina y ácido graso C₁₅-C₂₅ tal como oleato de glicerilo; alcohol graso C₁₅-C₂₅ tal como alcohol laurílico, alcohol miristílico, alcohol palmítico, alcohol estearílico, alcohol linoleílico y alcohol oleílico; dioles tales como propilenglicol, propanodiol, 1,2-hexanodiol, etilhexilglicerina, glicerol, propilenglicol, butilenglicol, pentilenglicol, hexilenglicol y dipropilenglicol o dietilenglicol. Si está presente, la cantidad de agente acondicionador de la piel es del 0,1 al 10 % en peso.

- Las expresiones "agente regulador del pH" y "tampón" y "agente tamponante" tienen el mismo significado y se usan indistintamente. Se refieren a una sustancia que ajusta y regula activamente el valor del pH de una solución a la que se han añadido. Los ejemplos de agentes reguladores del pH pueden incluir, pero sin limitación, ácidos fuertes (es decir, ácidos que están completamente disociados en una solución acuosa) y bases fuertes (es decir, bases que están completamente disociadas en una solución acuosa), agentes tamponantes ácidos y agentes tamponantes alcalinos. Si está presente, la cantidad de agente regulador del pH es del 0,1 al 1 % en peso.

- El término "antioxidante" se refiere a cualquier sustancia que retrase o prevenga la oxidación de cualquier componente oxidable de la emulsión, tal como, por ejemplo, componentes grasos u oleosos. Los ejemplos de antioxidantes pueden incluir, pero sin limitación, vitamina C, vitamina E tal como acetato de tocoferilo, vitamina A, niacinamida, hidroxitolueno butilado (BHT), hidroxianisol butilado (BHA) y una mezcla de los mismos. Si están presentes, la cantidad de antioxidantes es del 0,05 al 1 % en peso.

- Como se ha mencionado anteriormente, la composición de emulsión de agua en aceite de la presente invención puede comprender además (e) uno o más principios farmacéuticos o cosméticamente activos adicionales. Se puede determinar fácilmente la presencia de principios activos adicionales y sus cantidades por los expertos en la técnica de acuerdo con el tipo de formulación que se esté preparando para proporcionar el efecto farmacéutico o cosmético apropiado.
- Los ejemplos de principios activos adicionales apropiados pueden incluir, pero sin limitación, agentes desodorantes. Si están presentes, la cantidad de principios farmacéuticos o cosméticamente activos

adicionales es del 0,1 al 5 %.

La expresión principio activo "desodorante" se refiere a cualquier material tópico que sea conocido o que sea eficaz en la prevención o eliminación del mal olor asociado con la transpiración. Los agentes activos

5 desodorantes adecuados pueden seleccionarse del grupo que consiste en agentes antimicrobianos (por ejemplo, bactericidas, fungicidas), material absorbente de malos olores y mezclas de los mismos. Los ejemplos de desodorantes apropiados pueden incluir, pero sin limitación, bromuro de cetil-trimetilamonio, cloruro de cetilpiridinio, cloruro de bencetonio, cloruro de diisobutil-fenoxi-etoxi-etil-dimetil-bencilamonio, 2-metil-5-ciclohexilpentanol, *N*-lauril-sarcosina de sodio, *N*-palmetil-sarcosina de sodio, lauril-sarcosina, *N*-

10 miristoil-glicina, *N*-lauril-sarcosina de potasio, cloruro de trimetilamonio, clorohidroxi-lactato de sodio y aluminio, citrato de trietilo, cloruro de tricetilmetilamonio, 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxi difenil éter, 3,4,4'-triclorocarbanilida, diaminoalquilamidas tales como hexadecilamida de L-lisina, sales de metales pesados de citrato, salicilato y piroctosa, especialmente sales de cinc y ácidos de las mismas, sales de metales pesados de piritona, especialmente piritona de cinc, fenolsulfato de cinc, farnesol, etilhexilglicerina y mezclas de los

15 mismos. Si están presentes, la cantidad de principios activos desodorantes es del 0,1 % al 1 % en peso.

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende:

- (a) del 20 al 60 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes, particularmente sales que contienen aluminio;
- 20 (b) del 0,1 al 10 % en peso de uno o más agentes filmógenos, particularmente un copolímero de capriloil glicerina/ácido sebácico;
- (c) del 12 al 40 % en peso de uno o más emolientes, particularmente dicaprilil éter, PPG-14 butil éter y una mezcla de los mismos;
- (d) del 0 al 8 % en peso de tensioactivos, particularmente poligliceril-4 diisostearato/
- 25 polihidroxiestearato/sebacato;
- del 0 al 3 % en peso de conservantes;
- del 0 al 5 % de agente estabilizante;
- del 0 al 10 % de acondicionador para la piel; y
- (e) del 0 al 5 % en peso de principios activos adicionales;
- 30 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende:

- (a) del 20 al 60 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes, particularmente sales que contienen aluminio;
- 35 (b) del 0,1 al 10 % en peso de uno o más agentes filmógenos, particularmente un copolímero de capriloil glicerina/ácido sebácico;
- (c) del 12 al 40 % en peso de uno o más emolientes, particularmente dicaprilil éter, PPG-14 butil éter y una mezcla de los mismos;
- (d) del 1 al 8 % en peso de tensioactivos, particularmente poligliceril-4 diisostearato/

polihidroxiestearato/sebacato;
 del 0,1 al 3 % en peso de conservantes;
 del 0,1 al 3 % de agente estabilizante;
 del 0,1 al 10 % de acondicionador para la piel; y

- 5 (e) del 0,1 al 1 % en peso de principios activos desodorantes;
 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende:

- (a) del 40 al 55 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes, particularmente sales que
 10 contienen aluminio;
 (b) del 1 al 5 % en peso de uno o más agentes filmógenos, particularmente un copolímero de caprilol
 glicerina/ácido sebácico;
 (c) del 20 al 30 % en peso de uno o más emolientes, particularmente dicaprilil éter, PPG-14 butil éter y una
 mezcla de los mismos;
 15 (d) del 0 al 5 % en peso de tensioactivos, particularmente poligliceril-4 diisostearato/
 polihidroxiestearato/sebacato;
 del 0 al 3 % en peso de conservantes;
 del 0 al 3 % de agente estabilizante;
 del 0 al 6 % de acondicionador para la piel; y
 20 (e) del 0 al 5 % en peso de principios activos adicionales;
 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención comprende:

- (a) del 40 al 55 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes, particularmente sales que
 25 contienen aluminio;
 (b) del 1 al 5 % en peso de uno o más agentes filmógenos, particularmente un copolímero de caprilol
 glicerina/ácido sebácico;
 (c) del 20 al 30 % en peso de uno o más emolientes, particularmente dicaprilil éter, PPG-14 butil éter y una
 mezcla de los mismos;
 30 (d) del 2 al 5 % en peso de tensioactivos, particularmente poligliceril-4 diisostearato/
 polihidroxiestearato/sebacato;
 del 0,1 al 3 % en peso de conservantes;
 del 0,1 al 3 % de agente estabilizante;
 del 0,1 al 6 % de acondicionador para la piel; y
 35 (e) del 0,3 al 1 % en peso de principios activos desodorantes;
 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la presente invención es una
 composición farmacéutica o cosmética tópica que comprende uno o más excipientes o portadores

farmacéutica o cosméticamente aceptables tópicos apropiados. Las composiciones tópicas de emulsión de agua en aceite de la invención se pueden formular en varias formas que incluyen, pero sin limitación, cremas, barras, roll-on, aerosol, sólidos blandos, geles, espumas, ungüentos y pastas. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite tópica de la presente invención está en forma de aerosol, 5 opcionalmente, la composición comprende además uno o más propulsores como se ha definido anteriormente. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite tópica de la presente invención está en forma de aerosol, y la composición comprende además uno o más propulsores como se ha definido anteriormente.

- 10 Adicionalmente, la composición de la presente invención puede contener otros ingredientes, tales como fragancias, colorantes y otros componentes conocidos en el estado de la técnica para su uso en formulaciones tópicas.

En una realización, la composición de la presente invención está "sustancialmente libre" de siliconas. Para 15 los fines de la invención, los términos "silicona", "siloxanos polimerizados" y "polisiloxanos" tienen el mismo significado y se usan indistintamente. Se refieren a una cadena principal inorgánica de silicio-oxígeno (-Si-O-Si-O-Si-O-) con dos grupos orgánicos unidos a cada átomo de silicio. Comúnmente, los grupos orgánicos son restos alquilo, particularmente metilo. Las siliconas pueden ser cíclicas o lineales; y de cadena lineal o ramificada (tal como en forma de jaula). Al variar las longitudes de la cadena -Si-O-, los grupos laterales y 20 la reticulación, las siliconas pueden tener una amplia diversidad de consistencias (de líquido a gel, a caucho, a plástico duro), propiedades y composiciones. Para los fines de la invención, el término "silicona" incluye dimeticona, dimeticona copoliol, estearil dimeticona, dimeticonol, amodimeticona, ciclometicona, cetil dimeticona, behenoxi dimeticona, estearoxi dimeticona, trimetilsililamodimeticona, lauril meticona copoliol, hidroxipropil polisiloxano, fenil trimeticona, cetearil meticona, trimetilsiloxisilicato, polidimetilsiloxano, 25 ciclopentasiloxano y ciclosiloxano. Para los fines de la invención, la expresión "sustancialmente libre" se refiere a una composición que comprende menos del 1 % en peso de siliconas. En una realización, la composición de la invención está "libre" de siliconas. La expresión "libre de" se refiere a una composición cuyo contenido en siliconas no es detectable por ninguna de las técnicas comúnmente usadas definidas en el estado de la técnica. Para los fines de la invención, el método para determinar el contenido de siliconas 30 iónicas puede ser la cromatografía de gases acoplada a la espectrometría de masas. En una realización, la composición de la invención está "sustancialmente libre" o "libre" de siliconas.

También forma parte de la invención un procedimiento para la preparación de la composición de emulsión de agua en aceite de la presente invención. Los expertos en la técnica pueden determinar fácilmente el 35 procedimiento apropiado a partir de los descritos en el estado de la técnica de acuerdo con el tipo de formulación que se esté preparando. Típicamente, el procedimiento para la preparación de emulsiones comprende: (i) en primer lugar, preparar la una o más fases acuosas y la fase oleosa por separado; y, (ii) en segundo lugar, mezclar ambas fases hasta obtener la emulsión de agua en aceite como se muestra en la sección experimental.

A modo de ilustración, la composición de emulsión de agua en aceite se puede preparar siguiendo el procedimiento general que se define a continuación en el presente documento:

- (i) Preparar la Fase A mezclando los emolientes, los agentes filmógenos y opcionalmente los tensioactivos, principios activos adicionales (tales como principios activos desodorantes) y fragancias.
- (ii) Preparar la Fase B mezclando los principios activos antitranspirantes, y opcionalmente los agentes estabilizantes, con agua.
- (iii) Opcionalmente, preparar la Fase C mezclando los conservantes, los agentes acondicionadores de la piel, los antioxidantes y los principios activos adicionales.
- (iv) Mezclar la Fase A y la Fase B; y
- (v) opcionalmente, mezclar la mezcla resultante de la etapa (iv) con la Fase C.

La emulsión de agua en aceite de la presente invención se puede definir por su procedimiento de preparación. Por lo tanto, una composición de emulsión de agua en aceite del primer aspecto de la invención obtenible mediante el procedimiento definido anteriormente también forma parte de la invención. Para los fines de la invención, las expresiones "obtenible", "obtenido/a" y expresiones equivalentes se usan indistintamente y, en cualquier caso, la expresión "obtenible" engloba la expresión "obtenido/a". Todas las realizaciones descritas anteriormente para el procedimiento de la invención se aplican también a la composición de emulsión de agua en aceite obtenible mediante este procedimiento.

También forma parte de la invención una composición de emulsión de agua en aceite para su uso en terapia, con la condición de que la composición comprenda: una cantidad terapéuticamente efectiva de uno o más antitranspirantes y excipientes o portadores farmacéuticamente aceptables. En una realización, la composición de emulsión de agua en aceite de la invención es útil para la profilaxis y/o el tratamiento de una enfermedad o afección que implica una transpiración excesiva o anómala. Las enfermedades o afecciones que implican una transpiración excesiva o anómala incluyen hiperhidrosis, cromhidrosis y bromhidrosis. Este aspecto también podría formularse como el uso de una composición de emulsión de agua en aceite como se ha definido anteriormente para la preparación de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento de una enfermedad o afección que implica una transpiración excesiva o anómala. También se refiere a un método para la profilaxis y/o el tratamiento de un mamífero que padece o es susceptible de padecer una enfermedad o afección que implica una sudoración excesiva o anómala, y el método comprende administrar a dicho mamífero una cantidad efectiva de una composición de emulsión de agua en aceite de la presente invención.

La composición de emulsión de agua en aceite de la invención puede usarse para reducir la transpiración normal de la piel. Por lo tanto, otro aspecto de la presente invención es una composición de emulsión de agua en aceite de la invención como se ha definido anteriormente en cosmética; particularmente como agente antitranspirante y agente desodorante. A continuación, la composición comprende: una cantidad cosméticamente efectiva de principios activos antitranspirantes y excipientes o portadores cosméticamente aceptables. La composición de emulsión de agua en aceite cosmética tópica de la invención reduce el grado

de sudoración, la aparición de marcas antiestéticas de sudor en la ropa y minimiza el olor corporal. Además, la composición de emulsión de agua en aceite también permite fortalecer e hidratar la piel. La composición cosmética tópica de la presente invención está diseñada para aplicarse sobre el cuerpo para mejorar su aspecto o para embellecer, conservar, limpiar y proteger la piel. Por lo tanto, las composiciones cosméticas anteriores se usan adjetivamente para una aplicación no médica.

A lo largo de la descripción y las reivindicaciones, la palabra "comprende" y las variaciones de la palabra no pretenden excluir otras características técnicas, aditivos, componentes o etapas. Además, la palabra "comprende" abarca el caso de "que consiste en". Objetos adicionales, ventajas y características de la invención serán evidentes para los expertos en la materia tras examinar la descripción o pueden aprenderse poniendo en práctica la invención. Los siguientes ejemplos se proporcionan a modo de ilustración y no pretenden ser limitantes de la presente invención. Además, la presente invención cubre todas las posibles combinaciones de realizaciones particulares y preferidas descritas en el presente documento.

15 Ejemplos

1. Composiciones de emulsión de agua en aceite

1.1. Composición de emulsión de agua en aceite en forma de aerosol de la presente invención (Ejemplo 1)

1.1.1. Composición

20 Este ejemplo ilustra una composición de emulsión de agua en aceite en forma de aerosol (Aerosol 1) de acuerdo con la presente invención. La Tabla 1 muestra la composición cualitativa y cuantitativa de la emulsión de agua en aceite (Emulsión 1) que forma parte del aerosol de la presente invención.

Tabla 1

FASE	INGREDIENTES (NOMBRE INCI)	FUNCIÓN	% EN PESO
Fase A	Polyglyceryl-4 Diisostearate/ Polyhydroxystearate/Sebacate	Tensioactivo	3,5
	Dicaprylyl Ether	Emoliente	20
	Agente desodorante	Principio activo	0,3
	Capryloyl Glycerine/Sebacic Acid Copolymer	Agente filmógeno	3
	Perfume (Fragrancia)	Perfume	6
	PPG-14 Butyl Ether	Emoliente	5
Fase B	Agua destilada	Vehículo-disolvente	6,25
	Sodium Chloride	Agente estabilizante	1,5
	Aluminium Chlorohydrate Solution	Antitranspirante	50^(a)
Fase C	Conservante	Conservante	1
	Acondicionador para la piel	Acondicionador para la piel	3,25

FASE	INGREDIENTES (NOMBRE INCI)	FUNCIÓN	% EN PESO
	Tocopheryl Acetate	Antioxidante	0,2

(a) Corresponde al 15 % en peso del principio activo antitranspirante clorhidrato de aluminio

Y, la Tabla 2 muestra la composición cualitativa y cuantitativa de la composición en aerosol de agua en aceite (Aerosol 1) de la presente invención que contiene la composición de emulsión de agua en aceite (emulsión 1) descrita en la Tabla 1.

Tabla 2

INGREDIENTES	FUNCIÓN	% EN PESO
Emulsión de agua en aceite 1	Antitranspirante	15
isobutano, propano y butano	Propulsor	85

1.1.2. Procedimiento de preparación

Emulsión de agua en aceite 1 (emulsión 1)

La emulsión de agua en aceite 1 se preparó a temperatura ambiente siguiendo el procedimiento descrito en el presente documento a continuación:

1. Preparación de la Fase A. Los ingredientes de la Fase A se mezclaron uno a uno con agitación en un primer reactor.
2. Preparación de la Fase B. En un segundo reactor separado, todos los ingredientes de la Fase B se mezclaron uno a uno con agitación.
3. Preparación de la emulsión. La Fase B se añadió a la Fase A con un mezclador de alto cizallamiento y la mezcla resultante se agitó durante 25 minutos. A continuación, todos los ingredientes de la Fase C, uno por uno, se añadieron a la mezcla resultante (es decir, fase A+B) con agitación.

Composición en aerosol de emulsión de agua en aceite 1 (Aerosol 1)

La composición en aerosol de emulsión de agua en aceite 1 de la presente invención descrita en la Tabla 2 se preparó siguiendo el procedimiento descrito en el presente documento a continuación.

La emulsión de agua en aceite 1 se cargó en un recipiente y se cargó con el 85 % en peso de la mezcla propulsora.

1.2. Composición comparativa de emulsión de agua en aceite en aerosol fuera del alcance de la presente invención (Ejemplo comparativo 1)

1.2.1. Composición

Este ejemplo ilustra una composición comparativa de emulsión de agua en aceite en forma de aerosol

(Aerosol comparativo 1) fuera del alcance de la presente invención porque la emulsión de agua en aceite no contiene ningún agente filmógeno. La Tabla 3 muestra la composición cualitativa y cuantitativa de la emulsión de agua en aceite comparativa (Emulsión comparativa 1) que forma parte del aerosol comparativo 1 fuera de la presente invención.

5

Tabla 3

FASE	INGREDIENTES (NOMBRE INCI)	FUNCIÓN	% EN PESO
Fase A	Polyglyceryl-4 Diisostearate/ Polyhydroxystearate/Sebacate	Tensioactivo	3,5
	Dicaprylyl Ether	Emoliente	23
	Agente desodorante	Principio activo	0,3
	Perfume (Fragrancia)	Perfume	6
	PPG-14 Butyl Ether	Emoliente	5
Fase B	Agua destilada	Vehículo-disolvente	6,25
	Sodium Chloride	Agente estabilizante	1,5
	Aluminium Chlorohydrate Solution	Antitranspirante	50^(a)
Fase C	Conservante	Conservante	1
	Acondicionador para la piel	Acondicionador para la piel	3,25
	Tocopheryl Acetate	Antioxidante	0,2

(a) Corresponde al 15 % en peso del principio activo antitranspirante clorhidrato de aluminio

- 10 Y, la Tabla 4 muestra la composición cualitativa y cuantitativa de la composición comparativa de agua en aceite en aerosol (Aerosol comparativo 1) fuera del alcance de la presente invención que contiene la composición de emulsión de agua en aceite comparativa (emulsión comparativa 1) descrita en la Tabla 3.

Tabla 4

INGREDIENTES	FUNCIÓN	% EN PESO
Emulsión agua en aceite comparativa 1	Antitranspirante	15
isobutano, propano y butano	Propulsor	85

15 Procedimiento de preparación

Emulsión de agua en aceite comparativa 1 (emulsión comparativa 1)

La emulsión de agua en aceite comparativa 1 se preparó siguiendo el mismo procedimiento definido anteriormente para la emulsión de agua en aceite 1 usando los ingredientes y las cantidades que se describen en la Tabla 3, lo que implica que el agente filmógeno no se incorpora a la emulsión.

20

Composición en aerosol de emulsión de agua en aceite comparativa 1 (aerosol comparativo 1)

La composición en aerosol de emulsión de agua en aceite comparativa 1 se preparó siguiendo el mismo procedimiento definido anteriormente para la composición en aerosol de emulsión de agua en aceite 1 usando los ingredientes y las cantidades que se describen en la Tabla 4.

5 **2. Actividad antitranspirante**

2.1. Evaluación del efecto antitranspirante *in vivo*

El objetivo de este estudio fue la evaluación de la eficacia antitranspirante de la composición de la presente invención (Emulsión 1) mediante la evaluación olfativa del olor corporal por parte de examinadores entrenados. Se reclutaron 20 voluntarios y se realizó la evaluación olfativa a las 0 h, 24 h y 48 h tras una
10 única aplicación de dos dosis de aerosol en la axila a una distancia de 10-15 cm. El estudio se ha realizado bajo responsabilidad médica, de acuerdo con el protocolo experimental correspondiente y siguiendo las normas de Buena Práctica Clínica en sus secciones correspondientes.

Selección de voluntarios

15 Los participantes del estudio fueron seleccionados de acuerdo con los siguientes criterios de inclusión y exclusión:

Criterios de inclusión

Los criterios de inclusión más importantes, definidos en el protocolo, fueron los siguientes:

- Edad: 18-65 años
- 20 - Sexo: Ambos
- Usuarios habituales de desodorantes en aerosol
- Nivel cultural y comprensión del estudio clínico adecuados por parte de los participantes.
- Acuerdo de participación voluntaria y consentimiento informado por escrito.

Criterios de no inclusión

25 Los criterios específicos de no inclusión, definidos en el protocolo, fueron los siguientes:

- Patologías agudas o crónicas al momento de iniciar el estudio o dentro de las 3 semanas previas al estudio.
- Patologías en el área experimental dentro de las 3 semanas previas al estudio.
- Tratamiento con cualquier medicamento.
- Mujeres embarazadas o lactantes
- 30 - Alergias a los componentes de la composición de la invención
- No usuarios de desodorantes en aerosol
- Nivel cultural y comprensión del estudio clínico adecuados por parte de los participantes.
- Acuerdo de participación voluntaria y consentimiento informado por escrito.

35 Los voluntarios deben seguir estas recomendaciones:

- No aplicar ningún producto cosmético en el área experimental.
- No vacunarse durante el estudio
- No afeitarse ni depilarse las axilas dentro de las 72 horas previas al estudio
- No exponerse a la radiación solar intensa dentro de 1 semana antes del estudio y durante el estudio.

Procedimiento experimental

Método de uso:

1. Agitar el aerosol antes de su uso

5 2. Aplicar la composición de la invención (Aerosol 1) en la axila derecha; y aplicar el aerosol invisible de uso común del estado de la técnica fuera del alcance de la invención como prueba comparativa en la axila izquierda.

3. Pulverizar dos veces en cada axila, manteniendo el aerosol a 10-15 cm.

La evaluación olfativa se realizó durante 45 horas.

10

Fase de selección

Antes de incluir a los participantes en el estudio, a los participantes se les entregó la Hoja de Información del Participante y una vez que entendieron todo sobre el estudio, dieron su consentimiento informado por escrito para su participación.

15 El investigador principal examinó y entrevistó a cada uno de los participantes antes del inicio de la fase experimental para recopilar información sobre sus datos personales y demográficos y completar su historial médico, con especial énfasis en los aspectos relacionados con la salud axilar. El investigador también verificó que los participantes cumplieran con todos los criterios de inclusión y ninguno de los criterios de exclusión.

20 El estudio implica las siguientes visitas:

- Día 0 (Valor inicial) (D0/T0)

Después de verificar que se había firmado el formulario de consentimiento informado, el investigador confirmó que los participantes cumplían con todos los criterios de inclusión y ninguno de los criterios de exclusión y les entregó los envases del producto, explicó el modo de uso y las recomendaciones a seguir durante el estudio. El voluntario se lavó las axilas con esponjas impregnadas de jabón neutro sin perfume. En la investigación se realizó la evaluación olfativa en ambas axilas y se aplicó la composición de la invención en la axila derecha. Se pidió a los voluntarios que volvieran a la consulta pasadas 24 h.

- Día 1 (24 h después de la aplicación) (D1/T24)

En la investigación se realizó la evaluación olfativa en ambas axilas y un registro de efectos secundarios, en caso de haberlos.

- Día 2 (48 h después de la aplicación) (D2/T48)

35 En la investigación se realizó la evaluación olfativa en ambas axilas y un registro de efectos secundarios, en caso de haberlos.

Resultados

El olor corporal se evaluó mediante una escala ordinal de 0 a 10:

0 = olor muy agradable

5 = olor neutro y

10 = olor muy desagradable.

El olor corporal el día 0 debe ser de olor neutro.

5

Valores absolutos

Los resultados promedio de la puntuación del olor se muestran en la Tabla a continuación, así como el número y porcentaje de voluntarios "reactivos":

Evaluación olfativa promedio +/- D.E.	Tiempo experimental		
	D0/T0	D1/T24	D2/T48
Área tratada	4,9 ± 0,0	5,1 ± 0,51	6,1 ± 0,510
Área de control	4,95 ± 0,224	8,2 ± 0,523	8,6 ± 0,503
Número y % de voluntarios reactivos	-	20/100 %	20/100 %
Mejora de la puntuación para voluntarios reactivos	-	3,10	2,6

10

Valores estadísticos

El análisis estadístico (prueba de la t de Student para series emparejadas) de los resultados muestra una gran diferencia significativa entre el área de control estadístico y el área tratada en cualquier tiempo experimental posterior a la aplicación de la composición de la presente invención.

15

Los resultados obtenidos después del tratamiento estadístico mediante una prueba paramétrica, prueba de la t de Student ($p < 0,05$, 95 % de IC), permiten concluir que existieron diferencias significativas entre el área control y el área tratada con la composición de la presente invención en todos los tiempos experimentales (es decir, T24H y T48H).

20

Porcentaje promedio de eficacia antitranspirante

Los resultados promedio se muestran en la siguiente tabla:

% promedio	D1/T24	D2/T48
de variación en relación a D0/T0 en la axila tratada	1 %	21 %
de variación en relación a D0/T0 en la axila de control	66 %	74,25 %
Promedio [área tratada-área de control]	65 %	53,25 %
% de eficacia antitranspirante	65 %	53 %

25

Conclusión

El análisis de los resultados individuales expresados en porcentaje de eficacia antitranspirante en cada tiempo experimental muestra un efecto antitranspirante MUY BUENO 24 horas después de la aplicación de la

composición de la presente invención, con un 65 % de eficacia promedio. Además, se observó un efecto antitranspirante BUENO 48 horas después de la aplicación de la composición de la presente invención con un 53 % del efecto antitranspirante promedio.

5 **2.2. Evaluación del efecto antitranspirante comparativo *in vitro* (prueba de presión de rotura)**

El objetivo de esta prueba es determinar la resistencia última a la presión. En particular, la medición de la resistencia última a la presión para romper la obstrucción (película) obtenida tras la aplicación de la composición de la presente invención sobre la piel de la axila permite deducir la eficiencia de la composición antitranspirante. La prueba se realizó con la composición de la presente invención (Emulsión 1) y la emulsión comparativa 2 (sin un agente filmógeno) que estaba fuera del alcance de la presente invención usando el instrumento SOD4.

Materiales y métodos

La máquina SOD4 está diseñada para probar la eficacia de las formulaciones antitranspirantes. La máquina es un sistema biomimético totalmente automatizado que imita el procedimiento de sudoración. Permite recrear el contacto entre el sudor y el antitranspirante, para observar la reacción dentro de los poros miméticos transparentes. Cuando crea una obstrucción, es posible caracterizar la resistencia de la obstrucción y deducir la eficacia del antitranspirante.

20 Para realizar ese experimento la máquina incluye:

- Smart-Pore™, un chip de microfluidos de silicona que contiene microcanales que imitan los poros de la piel.
- Un sistema de presión integrado que controla el flujo de sudor en los poros con una precisión de nanolitros.
- Una cámara climática regulada en humedad/temperatura, que reproduce las condiciones reales de transpiración.
- 25 - Un sistema óptico para controlar y registrar la evolución de la interacción entre el antitranspirante y el sudor

El sudor artificial usado en la presente prueba es el siguiente:

- Cloruro de sodio al 0,5 %
- Ácido láctico al 0,1 %
- 30 Urea al 0,1 %
- Albúmina de suero bovino al 0,1 %
- Agua Millipore hasta el 100 %
- Fluoresceína al 0,1 %
- Hidróxido de amonio para tener un pH = 6,5

35

Todos los ingredientes se mezclan durante la preparación de un lote de sudor. Después del ajuste del pH, la solución se filtra y se divide en alícuotas de 10 ml que se congelan hasta su uso. Cada día se descongela una alícuota para las mediciones. Aunque la fluoresceína no es un componente del sudor humano, es de gran ayuda para la visualización del proceso de obstrucción. Los experimentos de control mostraron

previamente que la fluoresceína no afecta al proceso de obstrucción. Este modelo de sudor es conocido en el estado de la técnica y es el más sencillo e inespecífico usado en el campo cosmético. Es posible sustituir este sudor por uno natural u otra formulación artificial.

5 Cantidad de componentes

Chip de microfluidos: SMART-PORE™

La red de canales está compuesta por 4 canales independientes. Las partes más anchas son los canales de entrada y miden aproximadamente 500 µm x 60 µm x 10 mm. Cada línea fluida termina con un canal de microfluidos delgado: el bioporo. Son canales biomiméticos que representan el conducto de sudor de un cuerpo humano. Tienen 60 µm de ancho, 60 µm de alto y 2 mm de largo. Estos bioporos terminan en una superficie plana que representa la piel.

Protocolo experimental

A continuación se describe en el presente documento un resumen que describe el método usado para las composiciones ensayadas con una aplicación directamente sobre la superficie del Smart-pore™.

Se eliminó el líquido del recipiente y a continuación también se eliminó el propulsor presente en el aerosol. Se usó un estencil que tenía un espesor de 100 µm, con el fin de asegurar que la cantidad de composición sea suficiente para reaccionar con el sudor y respetar las normas impuestas por la FDA (2 mg/cm²).

Cada experimento se realizó en un Smart-pore™ de 4 canales, proporcionando 4 resultados en paralelo. Los experimentos se realizaron en un entorno controlado donde la humedad relativa se mantuvo al 80 % y a 30 °C.

El protocolo fue el siguiente: En primer lugar, se llenó un nuevo Smart-Pore™ con el sudor artificial. Una vez que los canales estuvieron llenos, se inició el proceso de estabilización del flujo. A continuación, se eliminó la gota de sudor que colgaba para crear condiciones de "axila en un chip" y se aplicó la composición a ensayar. El contacto entre el sudor y el producto tuvo una duración de 1 hora, durante la cual se registró la imagen de cada obstrucción mientras crecía.

Durante estos experimentos, se midieron los siguientes parámetros:

- 30 • Tasa de cobertura (%): Se realizaron al menos 20 mediciones independientes. Se observó un número variable de formación de obstrucciones. La tasa de cobertura fue la relación entre la obstrucción total que se formó y el número total de canales de sudor. Este es un indicador de la capacidad de la composición para hacer una capa homogénea.
- 35 • La presión de rotura (mbares) que es el promedio de la presión máxima aplicada para expulsar la obstrucción al canal.
- La longitud de la obstrucción (µm) que se observó correspondiente a la penetración de la composición en los poros.
- La estimación de afirmaciones (24 h/48 h/72 h/96 h): Indicaciones sobre la posible afirmación asociada a cada composición ensayada.

Resultados

Los valores de la presión de rotura, la tasa de cobertura y la longitud de la obstrucción, así como la estimación de afirmaciones del antitranspirante se resumen a continuación:

5

Parámetros	Emulsión 1	Emulsión comparativa 1
Tasa de cobertura (%)	65	42
La presión de rotura (mbar)	972	646
La longitud de la obstrucción (µm)	428	311
La estimación de afirmaciones	48 H	menos de 24 H

Como se muestra en los resultados anteriores, la composición de la presente invención permite obtener una obstrucción más grande con una alta tasa de cobertura que la composición comparativa. Además, la composición de la presente invención también tiene un aumento de aproximadamente el 50 % en el valor de la presión de rotura en comparación con la composición comparativa sin el agente filmógeno. Significa que la composición de la presente invención es más efectiva en términos de efecto antitranspirante durante un período de tiempo prolongado (48 h).

10

Por lo tanto, se concluye que solo las composiciones de emulsión de agua en aceite de la presente invención con la combinación específica de antitranspirantes, agentes filmógenos y emolientes descrita en la presente solicitud permiten tener un efecto antitranspirante eficaz y prolongado.

15

3. Prueba de uso

El objetivo de la prueba de uso es la evaluación de la aceptabilidad y seguridad en la piel de la composición de la presente invención. El estudio se ha realizado bajo responsabilidad médica, de acuerdo con el protocolo experimental correspondiente y siguiendo las normas de Buena Práctica Clínica en sus secciones correspondientes.

20

Este estudio se realizó bajo control dermatológico en voluntarias adultas sanas. Se reclutaron 20 mujeres voluntarias. El estudio se realizó para verificar la ausencia de molestias y reacciones acumulativas de irritación (signos funcionales y físicos) asociadas a la aplicación de la composición de la presente invención (Aerosol 1) objeto de estudio durante 2 semanas, en condiciones normales de uso. Al final del estudio, se recogió la valoración realizada por las participantes basándose en un cuestionario específico, dirigido y adaptado, lo que permitió evaluar la tolerancia de la composición de la presente invención objeto de investigación y su aceptabilidad.

25

30

Selección de voluntarios

Los participantes del estudio fueron seleccionados de acuerdo con los siguientes criterios de inclusión y exclusión:

Criterios de inclusión

- Mujeres sanas.
- Edad entre 25 y 55 años.
- Voluntarias con fototipos de piel I a IV.
- 5 - Usuaris habituales de desodorante en aerosol.
- Nivel cultural y comprensión del estudio clínico adecuados por parte de los participantes.
- Acuerdo de participación voluntaria y consentimiento informado por escrito.

Criterios de no inclusión

- 10 - Presentar enfermedad crónica o aguda al momento de iniciar el estudio o durante las 3 semanas previas al estudio.
- Presentar patologías cutáneas durante las 3 semanas previas al inicio del estudio.
- Estar bajo tratamiento farmacológico.
- Mujeres con marcas cutáneas en la zona experimental que puedan interferir en la evaluación de reacciones cutáneas (trastornos pigmentarios, cicatrices, efélides y nevus en cantidad, quemaduras solares, etc.).
- 15 - Mujeres con alergia a alguno de los componentes de la composición de la invención objeto de estudio.
- Haber recibido alguna vacuna dentro de las 3 semanas previas al estudio.
- Mujeres embarazadas o lactantes.
- Mujeres que no sean usuarias de desodorantes en aerosol.
- 20 Los voluntarios deben seguir estas recomendaciones:
 - No aplicar productos cosméticos (diferentes al ensayado) en el área experimental.
 - No exponerse a radiación solar extensa durante 1 semana antes de la prueba.

Procedimiento experimental25 Método de uso:

Agitar el aerosol de la invención (Aerosol 1) antes de su uso. Pulverizar dos segundos sobre la axila derecha, manteniendo el aerosol a 10-15 cm.

Fase de selección

- 30 Antes de incluir a los participantes en el estudio, a los participantes se les entregó la Hoja de Información del Participante y una vez que entendieron todo sobre el estudio, dieron su consentimiento informado por escrito para su participación.
- El investigador principal examinó y entrevistó a cada uno de los participantes antes del inicio de la fase experimental para recopilar información sobre sus datos personales y demográficos y completar su historial médico, con especial énfasis en los aspectos relacionados con la salud axilar. El investigador también verificó
- 35 que los participantes cumplieran con todos los criterios de inclusión y ninguno de los criterios de exclusión.

El estudio implicó las siguientes visitas:

- Día 0 (Valor inicial) (D0/T0)

Después de verificar que se había firmado el formulario de consentimiento informado, el investigador

confirmó que las participantes cumplieron con todos los criterios de inclusión y ninguno de los criterios de exclusión y les entregó los envases de la composición de la invención, explicó el modo de uso y las recomendaciones a seguir durante el estudio.

- 5 La primera aplicación se realizó en la consulta para confirmar el correcto uso de la composición de la invención, bajo control dermatológico. Durante el estudio, las voluntarias se aplicaron la composición de la presente invención objeto de estudio en la axila derecha y su desodorante habitual en la axila izquierda, que será su propio control. Aplicarán al menos una aplicación al día; si aplican más, esto se reflejará en la tabla que describe la muestra participante en este informe.

10 - Día 7

El día 7 del estudio, visitaron la clínica para la evaluación dermatológica. No se observaron incidencias en la zona de aplicación de la composición de la invención objeto de estudio ni en el área de control.

- Día 14

- 15 En la visita final del estudio, cada participante se sometió a un examen clínico dermatológico y, de haberlos, se registraron los eventos adversos. Además, se solicitó a las participantes que completaran el cuestionario de evaluación subjetiva de la composición de la invención.

Resultados

20 Evaluación de las reacciones observadas por las participantes.

El cuestionario de satisfacción cumplimentado por las participantes se evaluó mediante escalas de 4 puntos:

0 = No me gusta nada (Totalmente en desacuerdo)

1 = No me gusta (en desacuerdo)

2 = me gusta (de acuerdo)

- 25 3 = Me gusta mucho (Muy de acuerdo)

- 30 Los resultados se expresaron en % de voluntarias satisfechas con la composición de la invención (puntuación 2 y 3). Se consideró que las voluntarias estaban satisfechas con un ítem si respondían 2 o 3 y no satisfechas si respondían 0 o 1. Los intervalos para el cálculo de la satisfacción global obtenida teniendo en cuenta todos los ítems del cuestionario siguen el siguiente esquema:

Igual o superior al 75 % de los puntos de toda la prueba (Muy satisfecha)

Igual al 50 % e inferior al 75 % de los puntos de toda la prueba (Satisfecha)

Igual al 25 % e inferior al 50% de los puntos de toda la prueba (poco satisfecha)

- 35 Inferior al 25 % de los puntos de toda la prueba (Nada satisfecha)

Se realizó un análisis descriptivo de la frecuencia de reacciones consideradas como efectos no deseados relacionados con la composición de la presente invención objeto de estudio observados por el dermatólogo y otro de la frecuencia de reacciones observadas por las participantes.

Resultados de la evaluación de reacciones cutáneas no deseadas

Para la evaluación de las reacciones cutáneas no deseadas, se realizó un análisis de la frecuencia de aparición de estas reacciones observada por el dermatólogo en las participantes, después de 14 días de uso de la composición de la invención objeto de estudio. Además, se evaluaron las reacciones informadas por las

5

propias participantes.

- Reacciones cutáneas observadas por el dermatólogo:

Ninguna de las participantes incluidas en el estudio presentó reacciones cutáneas no deseadas tras el uso de la composición de la invención durante 14 días.

10

- Reacciones informadas por las voluntarias:

El investigador consultó a las participantes sobre cualquier reacción no deseada observada por ellas durante el estudio, relacionada o no con el uso de la composición de la invención objeto de estudio. En todos los casos las respuestas dadas por las participantes fueron negativas.

15

Resultados de la encuesta de satisfacción del producto

Durante la visita final, y tras 14 días de uso de la composición de la invención, se solicitó a las participantes que cumplimentaran un cuestionario sobre su satisfacción con la composición de la invención y con la eficacia subjetiva observada tras su uso.

20

A continuación se incluye un resumen de la evaluación de la composición de la invención:

A. Opinión general

- El 65 % de las participantes confirmaron que les gustó MUCHO la composición de la invención y al otro 35 % les GUSTÓ la composición de la invención.

- El 60 % de las participantes confirmaron que les gustó MUCHO la composición en aerosol de la invención y al otro 40 % les GUSTÓ la composición de la invención.

25

B. Efecto antitranspirante y desodorante

- El 80 % de las participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que la composición de la invención protege 24 horas o hasta la próxima aplicación y el 24 % restante estuvo DE ACUERDO con esta afirmación.

30

- El 90 % de las participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que la composición de la invención protege contra el olor, y el 10 % restante estuvo DE ACUERDO con esta afirmación.

- El 65 % de las participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que la composición de la invención reduce la aparición de sudor y el 65 % restante estuvo DE ACUERDO con esta afirmación.

35

B. Cosmetividad

- El 75 % de las participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que la composición de la invención seca rápidamente la piel de las axilas y el 25 % restante estuvo DE ACUERDO con esta afirmación.

- El 85 % de las participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que la composición de la invención no es pegajosa y el 15 % restante estuvo DE ACUERDO con esta afirmación.

C. Marcas blancas y aparición de manchas

- El 100 % de los participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que la composición de la invención previene la aparición de manchas en la ropa.

5

D. Opinión organoléptica

- El 10 % de las participantes estuvo completamente de acuerdo en que la composición de la invención tiene una fragancia agradable, el 80 % estuvo de acuerdo y el 10 % restante estuvo en desacuerdo con esta afirmación.

10 - El 75 % de las participantes estuvo totalmente de acuerdo en que la fragancia dura todo el día y el 25 % restante estuvo de acuerdo con esta afirmación.

E. Cuidado de la piel

- El 75 % de las participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que la composición de la invención

15 CUIDA la piel de las axilas y el 25 % restante estuvo DE ACUERDO con esta afirmación.

- El 50 % de las participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que la composición de la invención fortalece la piel de la axila y el 50 % restante estuvo DE ACUERDO con esta afirmación.

- El 65 % de las participantes estuvo TOTALMENTE DE ACUERDO en que el producto mantiene la piel de las axilas hidratada y el 35 % restante estuvo DE ACUERDO con esta afirmación.

20

Conclusión

Después de realizar la presente prueba de uso, se obtuvieron las siguientes conclusiones:

1. La composición de la presente invención no produjo ninguna reacción cutánea indeseable después de 14 días de uso, según la evaluación de los investigadores.

25 2. Durante los 14 días del estudio, ninguno de las participantes informó reacciones perceptivas no deseadas.

3. En cuanto a la valoración subjetiva de la composición de la presente invención, el cuestionario reveló que la opinión general de la composición de la presente invención fue positiva para el 100 % de las encuestas.

Particularmente:

30 a. El 100 % de las participantes manifestaron estar muy satisfechas o satisfechas con la composición de la presente invención en general, el aerosol y el envase.

b. El 90 % de las participantes estaban satisfechas o muy satisfechas con las propiedades organolépticas generales, tal como, por ejemplo, el olor, la fragancia agradable y con la afirmación de que es el mejor que han probado.

35 c. El 100 % de las participantes estaban muy satisfechas o satisfechas con la afirmación de que protege 24 horas, previene la aparición de manchas, tiene fragancia duradera y fortalece la piel.

d. El 100 % de las participantes se mostró muy satisfecha o satisfecha con la afirmación de que protege contra el mal olor, reduce la aparición de sudor, se seca rápidamente y no es pegajosa.

e. El 100 % de las participantes manifestaron que cumple con sus expectativas.

f. Entre el 95 %-90 % de las participantes afirmaron que les gusta más que su producto habitual y es

el mejor que han probado.

4. Ejemplos adicionales de composiciones de emulsión de agua en aceite de la presente invención

4.1. Composición de emulsión de agua en aceite en forma de aerosol de la presente invención

5

(Ejemplos 2-5)

4.1.1. Composiciones que comprenden sales de aluminio como agentes antitranspirantes

Estos ejemplos ilustran adicionalmente las composiciones de emulsión de agua en aceite en forma de aerosol (Aerosoles 2-5) de acuerdo con la presente invención. La Tabla 5 muestra la composición cualitativa y cuantitativa de las emulsiones de agua en aceite (Emulsiones 2-5) que forman parte de los aerosoles de la presente invención.

10

Tabla 4

FASE	INGREDIENTES (NOMBRE INCI)	FUNCIÓN	% EN PESO			
			Ej. 2	Ej. 3	Ej. 4	Ej. 5
Fase A	Polyglyceryl-4 Diisostearate/ Polyhydroxystearate/Sebacate	Tensioactivo	3,5	3,5	3,5	3,5
	Dicaprylyl Ether	Emoliente	20	20	-	-
	Coco-Caprylate		-	-	20	-
	Caprylyl Caprylate/Caprato		-	-	-	20
	Cocoglycerides		-	-	-	-
	Coco-Caprylate/Caprato		-	-	-	-
	Agente desodorante	Principio activo	0,3	0,3	0,3	0,3
	Capryloyl Glycerine/Sebacic Acid Copolymer	Agente filmógeno	-	-	3	3
	VP/Eicosene Copolymer		1	-	-	-
	Polyester-7 (and) Neopentyl Glycol Diheptanoate		-	2	-	-
	Perfume (Fragrancia)	Perfume	6	6	6	6
	PPG-14 Butyl Ether	Emoliente	5	5	5	5
Fase B	Agua destilada	Vehículo- disolvente	c.s.	c.s.	c.s.	c.s.
	Sodium Chloride	Agente estabilizante	1,5	1,5	1,5	1,5
	Aluminium Chlorohydrate Solution	Antitranspirante	50^(a)	50^(a)	50^(a)	50^(a)
	Conservant	Conservante	1	1	1	1
	Acondicionador para la piel	Acondicionador para la piel	3,25	3,25	3,25	3,25

FASE	INGREDIENTES (NOMBRE INCI)	FUNCIÓN	% EN PESO			
			Ej. 2	Ej. 3	Ej. 4	Ej. 5
	Tocopheryl Acetate	Antioxidante	0,2	0,2	0,2	0,2
Fase C	Conservante	Conservante	1	1	1	1
	Acondicionador para la piel	Acondicionador para la piel	3,25	3,25	3,25	3,25
	Tocopheryl Acetate	Antioxidante	0,2	0,2	0,2	0,2

(a) Corresponde al 15 % en peso del principio activo antitranspirante clorhidrato de aluminio c.s. se refiere a la cantidad suficiente de agua destilada para alcanzar el 100 % en peso de la composición

- 5 Y, la Tabla 5 muestra la composición cualitativa y cuantitativa de las composiciones en aerosol de agua en aceite (Aerosoles 2-5) de la presente invención que contienen la composición de emulsión de agua en aceite (emulsiones 2-5) descrita en la Tabla 4.

Tabla 5

INGREDIENTES	FUNCIÓN	% EN PESO
Emulsión de agua en aceite 2, 3, 4 o 5	Antitranspirante	15
isobutano, propano y butano	Propulsor	85

10

Las emulsiones de agua en aceite del Ej. 3-5 se prepararon siguiendo el procedimiento de preparación descrito en la sección 1.1.2. usando los componentes descritos en la Tabla 4. Las emulsiones de agua en aceite del Ej. 2 se prepararon siguiendo el procedimiento de preparación descrito en la sección 1.1.2, pero calentando la mezcla resultante de ingredientes de la fase A a aproximadamente 65 °C antes de su posterior mezcla con la fase B.

15

Además, las composiciones en aerosol de emulsión de agua en aceite del Ej. 2-5 también se prepararon mediante el procedimiento definido en la sección 1.1.2 usando las emulsiones de agua en aceite del Ej. 2-5.

4.1.2. Composiciones que comprenden sales de circonio como agentes antitranspirantes

20

Estos ejemplos ilustran adicionalmente las composiciones de emulsión de agua en aceite en forma de aerosol (Aerosoles 6-7) de acuerdo con la presente invención. La Tabla 6 muestra la composición cualitativa y cuantitativa de las emulsiones de agua en aceite (Emulsiones 6-7) que forman parte de los aerosoles de la presente invención.

25

Tabla 6

FASE	INGREDIENTES (NOMBRE INCI)	FUNCIÓN	% EN PESO	
			Ej. 6	Ej. 7
Fase A	Polyglyceryl-4 Diisostearate/ Polyhydroxystearate/Sebacate	Tensioactivo	3,5	3,5
	(C12-C15) Alkyl Benzoate	Emoliente	8	-
	Isopropyl Myristate		17	-
	Dicaprylyl Ether		-	20
	PPG-14 Butyl Ether		-	5
	Agente desodorante	Principio activo	0,3	0,3
	Polyester-7 (and) Neopentyl Glycol Diheptanoate	Agente filmógeno	1	1
	Perfume (Fragrancia)	Perfume	6	6
Fase B	Agua destilada	Vehículo-disolvente	c.s.	c.s.
	Sodium Chloride	Agente estabilizante	1,5	1,5
	Aluminum Zirconium Chloride Hydroxide Solution	Antitranspirante	45^(a)	45^(a)
Fase C	Conservante	Conservante	1	1
	Acondicionador para la piel	Acondicionador para la piel	3,25	3,25
	Tocopheryl Acetate	Antioxidante	0,2	0,2

(a) Corresponde al 15 % en peso del principio activo antitranspirante hidróxido de cloruro de aluminio y circonio

c.s. se refiere a la cantidad suficiente de agua destilada para alcanzar el 100 % en peso de la composición

5

Y la Tabla 7 muestra la composición cualitativa y cuantitativa de las composiciones en aerosol de agua en aceite (Aerosoles 6-7) de la presente invención que contienen la composición de emulsión de agua en aceite (emulsiones 6-7) descrita la Tabla 6.

10

Tabla 7

INGREDIENTES	FUNCIÓN	% EN PESO
Emulsión de agua en aceite 6 o 7	Antitranspirante	15
isobutano, propano y butano	Propulsor	85

15

Las emulsiones de agua en aceite del Ej. 6-7 se prepararon siguiendo el procedimiento de preparación descrito en la sección 1.1.2. usando los componentes descritos en la Tabla 6. Además, las composiciones

en aerosol de emulsión de agua en aceite del Ej. 6-7 también se prepararon mediante el procedimiento definido en la sección 1.1.2 usando las emulsiones de agua en aceite del Ej. 6-7.

4.2. Apariencia

5 4.2.1. Evaluación a simple vista

La observación de las emulsiones del Ej. 2-7 (justo después de su preparación) se realizó a simple vista.

Resultados: Se confirmó que todas las emulsiones del Ej. 1-7 de la presente invención eran emulsiones de agua en aceite estables.

10 4.2.2. Aspecto microscópico

Se determinó el aspecto microscópico de las emulsiones de agua en aceite de los Ejemplos 1-7:

1. Con una tira limpia y seca, se colocó en el centro del portaobjetos una gota de la emulsión de la invención (Ej. 1-7);
2. Con cuidado de no ensuciar ni llenar la tira, se colocó un cubreobjetos en un ángulo de aproximadamente
- 15 45° en el que un extremo toca la tira y la muestra queda debajo.
3. Bajar gradualmente el cubreobjetos, evitando la generación de burbujas de aire.
4. La tira resultante se colocó en la platina de un microscopio LEICA DM1000LED;
5. Se realizó la observación de la muestra a través del mismo.

La observación se realizó comenzando con los objetivos de menor aumento, para tener una vista general y

20 siguiendo con mayores aumentos para poder visualizar en detalle. Todas las muestras se observaron con un aumento de 40x.

Resultado: En todas las emulsiones de la presente invención (Ej. 1-7) se observó una emulsión estable formada por una fase continua oleosa y una fase dispersa acuosa con un tamaño de partícula pequeño (de

25 aproximadamente 0,2 a 100 μm).

Por lo tanto, Por lo tanto, se concluyó que las emulsiones de los Ejemplos 1-7 eran emulsiones de agua en aceite estables.

4.3. Propiedades filmógenas

30 4.3.1. Prueba de formación de película

El objetivo de la prueba de formación de película fue la evaluación de las propiedades filmógenas de las emulsiones de agua en aceite de los Ejemplos 1-7 de la presente invención mediante la técnica de la caja esparcidora.

Por lo tanto, se preparó una película de 30 mm y 100 mm de grosor siguiendo el método que se describe en

35 el presente documento a continuación:

1. Seleccionar el espacio de 30 micrómetros o 100 micrómetros respectivamente de un aplicador Quadruplex
2. Colocar el aplicador en la superficie plana y lisa (tal como una placa de vidrio)
3. Aplicar la emulsión de la invención en el centro del aplicador Quadruplex cerca de la abertura correcta.
4. Pasar el aplicador por la superficie.

5. Dejar secar la película obtenida de este modo durante 1 hora a 20 °C y al 40 % de humedad relativa;
6. Una vez seca, se observó el aspecto visual de la película creada.

Resultados: En todas las emulsiones de la presente invención, las películas de 30 mm y 100 mm obtenidas de este modo se consideraron apropiadas porque la película era continua y uniforme; y no se apreciaron surcos sin producto. En el caso particular de la prueba de formación de película de 100 micrómetros, los resultados obtenidos de este modo aseguran que se cumplieron las normas impuestas por la Food and Drug Administration (FDA) (es decir, 2 mg/cm²)

10 **4.4. Propiedades de humectabilidad y actividad antitranspirante**

4.4.1. Medición del ángulo de contacto

El objetivo de esta medición del ángulo de contacto es la evaluación de las propiedades de humectabilidad de la película creada después de la deposición de las emulsiones de la emulsión de agua en aceite de la presente invención (Ej. 1-7) sobre el soporte de PMMA.

- 15 Particularmente, las propiedades de humectabilidad de la película se correlacionan directamente con la reacción de la película hecha por la emulsión de la invención con el sudor y, por lo tanto, se correlacionan directamente con la actividad antitranspirante de las emulsiones de la invención.

De hecho, un ángulo de contacto en un intervalo de 0 a 30 garantiza las propiedades hidrófilas apropiadas de la emulsión de la presente invención para lograr el efecto antitranspirante apropiado en un corto período de tiempo después de su aplicación.

Material:

- 25 Se usó una placa de polimetilmetacrilato (PMMA) que simula la rugosidad de la piel humana (placas ISO (Ra = 2 y 5 µm) suministradas por Schöneberg GmbH & Co.) como soporte para la creación de la película y para simular el comportamiento de la película creada por las emulsiones de la invención sobre la piel.

Método:

1. La placa de PMMA se taró en la báscula para controlar el peso de la emulsión
2. La emulsión se aplicó en el centro de la placa (0,17 g de emulsión/placa)
- 30 3. A continuación, la emulsión se extendió en sentido circular con dos dedos (usando guantes), ampliando gradualmente el área de extensión hasta llegar a los bordes.
4. Para asegurar la extensión, se hizo una extensión en forma de óvalo de izquierda a derecha de la placa y de arriba hacia abajo.
5. Finalmente, para asegurar una buena lectura, se hace una extensión recta de arriba hacia abajo, tan junta como sea posible para que la línea quede recta.
- 35 6. Una vez bien extendida la emulsión, las placas se dejaron secar durante una hora y media a 20 °C y al 40 % de humedad relativa;
7. Posteriormente, se realizó la medición del ángulo de contacto.

La medición del ángulo de contacto se realizó con el instrumento DSA25E de la marca Krüss, mediante el método de "gota sésil" y la medición se realizó 15 segundos después de que la gota de agua haya caído sobre el soporte con la película formada por la emulsión de la invención.

5 Resultados:

Los valores de los ángulos de contacto y su desviación estándar se resumen a continuación:

	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3	Ej. 4	Ej. 5	Ej. 6	Ej. 7
Ángulo de contacto	10,3 ± 1 ⁽¹⁾	12,4 ± 1 ⁽¹⁾	10,3 ± 1 ⁽¹⁾	11,7 ± 1 ⁽¹⁾	12,0 ± 0 ⁽¹⁾	13,7 ± 1 ⁽¹⁾	8,2 ± 1 ⁽¹⁾

(1) desviación estándar

- 10 Como se muestra en la Tabla anterior, los valores del ángulo de contacto de todas las emulsiones de agua en aceite de la presente invención son similares, estando todas ellas dentro del intervalo adecuado mencionado anteriormente (0-30). Significa que todas las emulsiones de agua en aceite de la invención tienen la humectabilidad apropiada (carácter hidrófilo), y por lo tanto, son útiles como antitranspirantes durante un largo período de tiempo, evitando la aparición de antiestéticas marcas de sudor en la ropa; minimizando el
- 15 olor corporal; y tienen una buena cosmeticidad cuidando la piel sin aportar sensación aceitosa o pegajosa, dejando una piel seca con una sensación cómoda y un aspecto limpio; como se demuestra para la emulsión del ejemplo 1 (véase la sección 3).

5. Uso médico

20 5.1. Evaluación del efecto terapéutico *in vitro* de una transpiración anómala (hiperhidrosis)

Materiales y métodos

- La máquina SOD4 está diseñada para probar la eficacia de las formulaciones antitranspirantes. La máquina es un sistema biomimético totalmente automatizado que imita el proceso de sudoración. Permite recrear el
- 25 contacto entre el sudor y el antitranspirante, para observar la reacción dentro de los poros miméticos transparentes. Cuando crea una obstrucción, es posible caracterizar la resistencia de la obstrucción y deducir la eficacia del antitranspirante.

Para realizar ese experimento la máquina incluye:

- 30 - Smart-Pore™, un chip de microfluidos de silicona que contiene microcanales que imitan los poros de la piel.
- Un sistema de presión integrado que controla el flujo de sudor en los poros con una precisión de nanolitros.
- Una cámara climática regulada en humedad/temperatura, que reproduce las condiciones reales de transpiración.
- Un sistema óptico para controlar y registrar la evolución de la interacción entre el antitranspirante y el sudor

35

El sudor artificial usado en la presente prueba es el siguiente:

Cloruro de sodio al 0,5 %

Ácido láctico al 0,1 %

Urea al 0,1 %

Albúmina de suero bovino al 0,1 %

5 Agua Millipore hasta el 100 %

Fluoresceína al 0,1 %

Hidróxido de amonio para tener un pH = 6,5

10 Todos los ingredientes se mezclan durante la preparación de un lote de sudor. Después del ajuste del pH, la solución se filtra y se divide en alícuotas de 10 ml que se congelan hasta su uso. Cada día se descongela una alícuota para las mediciones. Aunque la fluoresceína no es un componente del sudor humano, es de gran ayuda para la visualización del proceso de obstrucción. Los experimentos de control mostraron previamente que la fluoresceína no afecta al proceso de obstrucción. Este modelo de sudor es conocido en el estado de la técnica y es el más sencillo e inespecífico usado en el campo cosmético. Es posible sustituir
15 este sudor por uno natural u otra formulación artificial.

Cantidad de componentes

Chip de microfluidos: SMART-PORE™

La red de canales está compuesta por 4 canales independientes. Las partes más anchas son los canales de entrada y miden aproximadamente 500 µm x 60 µm x 10 mm. Cada línea fluida termina con un canal de microfluidos delgado: el bioporo. Son canales biomiméticos que representan el conducto de sudor de un cuerpo humano. Tienen 60 µm de ancho, 60 µm de alto y 2 mm de largo. Estos bioporos terminan en una superficie plana que representa la piel.
20

25 Protocolo experimental

A continuación se describe en el presente documento un resumen que describe el método usado para las composiciones ensayadas con una aplicación directamente sobre la superficie del Smart-pore™.

Se eliminó el líquido del recipiente y a continuación también se eliminó el propulsor presente en el aerosol.

Se usó un estencil que tenía un espesor de 100 µm, con el fin de asegurar que la cantidad de composición
30 sea suficiente para reaccionar con el sudor y respetar las normas impuestas por la FDA (2 mg/cm²).

Cada experimento se realizó en un Smart-poretm de 4 canales, proporcionando 4 resultados en paralelo. Los experimentos se realizaron en un entorno controlado donde la humedad relativa se mantuvo al 80 % y a 30 °C.

35 Contrariamente a la prueba *in vitro* realizada en la sección 2.2. para condiciones normales de transpiración que impliquen un caudal de sudor de 0,02 µl/min; las condiciones de hiperhidrosis de la prueba *in vitro* actual implican un caudal de sudor de 0,06 µl/min.

El protocolo fue el siguiente: En primer lugar, se llenó un nuevo Smart-Pore™ con el sudor artificial. Una vez

que los canales estuvieron llenos, se inició el proceso de estabilización del flujo. A continuación, se eliminó la gota de sudor que colgaba para crear condiciones de "axila en un chip" y se aplicó la composición a ensayar. El contacto entre el sudor y el producto tuvo una duración de 1 hora, durante la cual se registró la imagen de cada obstrucción mientras crecía.

5

Durante estos experimentos, se midieron los siguientes parámetros:

- La presión de rotura (mbares) que es el promedio de la presión máxima aplicada para expulsar la obstrucción al canal.
- La longitud de la obstrucción (μm) que se observó correspondiente a la penetración de la

10

composición en los poros.

Muestras sometidas a ensayo:

- Composición de emulsión de agua en aceite en forma de aerosol de la presente invención (Ejemplo 1)
- Composición comparativa de emulsión de agua en aceite en forma de aerosol fuera del alcance de la

15

presente invención (Ejemplo comparativo 1)

Resultados

La muestra comparativa NO formó obstrucciones. Por otro lado, los valores de la presión de rotura, la tasa de cobertura y la longitud de obstrucción de la obstrucción formada por la composición ensayada de la presente

20

invención se resumen en el presente documento a continuación:

Parámetros	Emulsión 1	Emulsión comparativa 1
La presión de rotura (mbar)	1095	Sin formación de obstrucciones
La longitud de la obstrucción (μm)	383	Sin formación de obstrucciones

Como se muestra en los resultados anteriores, la composición de la presente invención permite obtener una obstrucción en condiciones de transpiración anómalas (es decir, condiciones de hiperhidrosis) con una

25

presión de rotura y una longitud apropiadas para tener un efecto antitranspirante durante un período prolongado de tiempo en condiciones de hiperhidrosis.

Por lo tanto, se concluye que solo las composiciones de emulsión de agua en aceite de la presente invención con la combinación específica de antitranspirantes, agentes filmógenos y emolientes descrita en la presente

30

solicitud permiten tener un efecto antitranspirante terapéutico eficaz y prolongado; y que es útil para el tratamiento o la prevención de una enfermedad o afección que implique una transpiración excesiva o anómala tal como hiperhidrosis,

Por razones de exhaustividad, se exponen diversos aspectos de la invención en las siguientes cláusulas numeradas:

35

Cláusula 1. Una composición farmacéutica o cosmética de emulsión de agua en aceite que comprende:

- (a) una cantidad terapéutica o cosméticamente efectiva de uno o más principios activos antitranspirantes;
- (b) uno o más agentes filmógenos seleccionados del grupo que consiste en copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico; poliéster-7 (y) diheptanoato de neopentilglicol; etilcelulosa (y) adipato de diisopropilo;
- 5 copolímero de VP/acrilatos/metacrilato de laurilo; copolímero de VP/eicoseno; triacontanil PVP; y pentilenglicol (y) goma laca; y
- (c) uno o más emolientes seleccionados del grupo que consiste en dicaprilil éter; PPG-14 butil éter; triheptanoína (e) isoparafina (C₁₃-C₁₆); undecilenato de heptilo (y) alcano (C₁₃-C₁₅); triheptanoína (y) alcano (C₁₃-C₁₅); succinato de diisooctilo; diheptanoato de neopentilglicol; succinato de diheptilo; isododecano;
- 10 carbonato de dipropilheptilo; caprilato/caprato de caprililo; caprilato de propilheptilo; isononanoato de cetearilo; undecano (y) tridecano; benzoato de alquilo (C₁₂-C₁₅), adipato de dibutilo; coco-caprilato; carbonato de dicaprililo; PPG-15 estearil éter; coco-caprilato/caprato; triglicérido caprílico/cáprico; cocoglicéridos; y palmitato de isopropilo;
- (d) junto con uno o más excipientes o portadores farmacéutica o cosméticamente aceptables.

15

Cláusula 2. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con la cláusula 1, en donde:

- (a) el uno o más principios activos antitranspirantes se seleccionan del grupo que consiste en sales que contienen aluminio, sales que contienen circonio y sales que contienen cinc.

20

Cláusula 3. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1 o 2, en donde: (a) al menos uno de los principios activos antitranspirantes es una sal que contiene aluminio.

Cláusula 4. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-3,

en donde: (b) al menos uno de los agentes filmógenos es un copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico.

25

Cláusula 5. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-4, en donde: (c) al menos uno de los emolientes se selecciona del grupo que consiste en dicaprilil éter y PPG-14 butil éter.

30

Cláusula 6. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-5, que comprende:

- (a) al menos uno de los principios activos antitranspirantes es una sal que contiene aluminio;
- (b) al menos uno de los agentes filmógenos es un copolímero de caprilol glicerina/ácido sebácico; y
- (c) al menos uno de los emolientes se selecciona del grupo que consiste en dicaprilil éter y polipropilenglicol
- 35 butil éter.

Cláusula 7. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-6, que comprende:

- (a) del 20 al 60 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes;

(b) del 0,1 al 10 % en peso de uno o más agentes filmógenos; y

(c) del 12 al 40 % en peso de uno o más emolientes;

siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

5 Cláusula 8. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-7, que comprende:

(a) del 40 al 55 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes;

(b) del 1 al 5 % en peso de uno o más agentes filmógenos; y

(c) del 20 al 30 % en peso de uno o más emolientes;

10 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

Cláusula 9. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-7, en donde:

(d) los excipientes o portadores farmacéutica o cosméticamente aceptables se seleccionan del grupo que
15 consiste en un tensioactivo, vehículo, conservante, propulsor, agente regulador del pH, agentes estabilizantes, agente de viscosidad, agente acondicionador de la piel, antioxidante y una mezcla de los mismos;

y, opcionalmente, la composición de emulsión de agua en aceite comprende además: (e) uno o más principios activos farmacéuticos o cosméticos adicionales.

20

Cláusula 10. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-7 o 9 que comprende:

(a) del 20 al 60 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes;

(b) del 0,1 al 10 % en peso de uno o más agentes filmógenos;

25 (c) del 12 al 40 % en peso de uno o más emolientes;

(d) del 0 al 8 % en peso de tensioactivos;

del 0 al 3 % en peso de conservantes;

del 0 al 5 % de agente estabilizante;

del 0 al 10 % de acondicionador para la piel; y

30 (e) del 0 al 5 % en peso de principios activos adicionales;

siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

Cláusula 11. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-7, 9 o 10 que comprende:

35 (a) del 20 al 60 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes;

(b) del 0,1 al 10 % en peso de uno o más agentes filmógenos;

(c) del 12 al 40 % en peso de uno o más emolientes;

(d) del 1 al 8 % en peso de tensioactivos;

del 0,1 al 3 % en peso de conservantes;

del 0,1 al 3 % de agente estabilizante;
 del 0,1 al 10 % de acondicionador para la piel; y
 (e) del 0,1 al 1 % en peso de principios activos desodorantes;
 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

5

Cláusula 12. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-11 que comprende:

- (a) del 40 al 55 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes;
- (b) del 1 al 5 % en peso de uno o más agentes filmógenos;
- 10 (c) del 20 al 30 % en peso de uno o más emolientes;
- (d) del 0 al 5 % en peso de tensioactivos;
 del 0 al 3 % en peso de conservantes;
 del 0 al 3 % de agente estabilizante;
 del 0 al 6 % de acondicionador para la piel; y
- 15 (e) del 0 al 5 % en peso de principios activos adicionales;
 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

Cláusula 13. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-12 que comprende:

- 20 (a) del 40 al 55 % en peso de uno o más principios activos antitranspirantes;
- (b) del 1 al 5 % en peso de uno o más agentes filmógenos;
- (c) del 20 al 30 % en peso de uno o más emolientes;
- (d) del 2 al 5 % en peso de tensioactivos;
 del 0,1 al 3 % en peso de conservantes;
- 25 del 0,1 al 3 % de agente estabilizante;
 del 0,1 al 6 % de acondicionador para la piel; y
- (e) del 0,3 al 1 % en peso de principios activos desodorantes;
 siendo la suma de los componentes de hasta el 100 % en peso.

- 30 Cláusula 14. La composición de emulsión de agua en aceite de acuerdo con cualquiera de las cláusulas 1-13, que es una composición tópica de emulsión de agua en aceite en aerosol, que comprende opcionalmente uno o más propulsores.

- 35 Cláusula 15. La composición de emulsión de agua en aceite como se define en cualquiera de las cláusulas 1-14 para su uso en terapia;
 o, alternativamente, el uso de una composición de emulsión de agua en aceite en cosmética; particularmente como agente antitranspirante y desodorante.