

(19) Weltorganisation für geistiges

Eigentum

Internationales Büro

(43) Internationales

Veröffentlichungsdatum

26. Juli 2012 (26.07.2012)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 2012/098189 A2

(51) Internationale Patentklassifikation:

A61K 8/26 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2012/050789

(22) Internationales Anmeldedatum:

19. Januar 2012 (19.01.2012)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

10 2011 002 863.3

19. Januar 2011 (19.01.2011) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme

von US): HENKEL AG & CO. KGAA [DE/DE];

Henkelstr. 67, 40589 Düsseldorf (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ANDERHEGGEN,

Bernd [DE/DE]; Am Büschgen 1, 41189

Mönchengladbach (DE). CLAAS, Marcus [DE/DE];

Schützenstr. 70b, 40723 Hilden (DE). BANOWSKI,

Bernhard [DE/DE]; Benrode Str. 6, 40597 Düsseldorf

(DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für

jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,

AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für

jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,

GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ,

TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ,

MD, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH,

CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE,

IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO,

RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,

GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu
veröffentlichen nach Erhalt des Berichts (Regel 48 Absatz
2 Buchstabe g)

(54) Title: ANTIPERSPIRANT STICK WITH IMPROVED LONG-TERM STABILITY

(54) Bezeichnung : ANTITRANSPIRANT-STIFTE MIT VERBESSERTER LANGZEITSTABILITÄT

(57) Abstract: The invention relates to anhydrous antiperspirant sticks based on wax. In order to improve the long-term stability of the release properties and the resistance to the influence of humidity, said sticks contain, respectively in relation to the total weight thereof, a total of between 1 and 4 wt. %, preferably between 2 and 3.5 wt. %, especially preferably between 2.5 and 3 wt. % of at least one oil-in-water emulsifier selected from ethoxylates of C₁₀-C₂₂ alkanols comprising between 8 and 16, preferably between 0 and 14, especially preferably 12 ethylene units in the molecule.

(57) Zusammenfassung: Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind wasserfreie Antitranspirant-Stiften auf Wachsbasis, die zur Verbesserung der Langzeitstabilität der Abgabeeigenschaften und der Resistenz gegenüber Feuchtigkeitseinfluss, jeweils bezogen auf ihr Gesamtgewicht, insgesamt 1-4 Gew.-%, bevorzugt 2-3,5 Gew.-%, besonders bevorzugt 2,5-3 Gew.-%, mindestens eines Öl-in-Wasser-Emulgators, ausgewählt aus Ethoxylaten von C₁₀-C₂₂-Alkanolen mit 8 bis 16, bevorzugt 0-14, besonders bevorzugt mit 12



WO 2012/098189 A2

„Antitranspirant-Stifte mit verbesserter Langzeitstabilität“

Die vorliegende Anmeldung beschäftigt sich mit wasserfreien Antitranspirant-Stiften auf Wachs-basis, die eine verbesserte Langzeitstabilität aufweisen.

Wasserfreie Antitranspirant-Zusammensetzungen, die als Stift auf Wachs-basis konfektioniert sind, enthalten neben teilchenförmigen schweißreduzierenden Wirkstoffen in der Regel mindestens ein kosmetisches Öl als Träger für den teilchenförmigen schweißreduzierenden Wirkstoff. Damit sich der im Öl suspendierte Antitranspirantwirkstoff bei der Lagerung nicht absetzt, enthalten handelsübliche Stifte Verdickungsmittel, wie Fettalkohole und/oder Wachse.

Bei den handelsüblichen Antitranspirant-Stiften ist der in dem wasserfreien, ölhaltigen Träger suspendierte Antitranspirantwirkstoff mit einer Ölschicht bedeckt. Diese Ölschicht verzögert allerdings die Freisetzung des Antitranspirantwirkstoffs in die wirksame wasserlösliche Form. Um dies zu vermeiden, enthalten wasserfreie Antitranspirant-Stifte auf Wachs-basis üblicherweise einen Öl-in-Wasser-Emulgator, der auf der Haut unter dem Einfluss der Hautfeuchtigkeit und des Schweißes die Freisetzung des Antitranspirantwirkstoffs aus der Wachsmatrix begünstigt.

Der vorliegenden Anmeldung lag die Beobachtung zu Grunde, dass bei solchen Stiften des Standes der Technik die Interaktion zwischen Antitranspirantwirkstoff, Öl-in-Wasser-Emulgator und Luftfeuchtigkeit (bei längerer Lagerung) bzw. Hautfeuchtigkeit oder Schweiß (durch Hautkontakt bei der Applikation) negative Veränderungen der Stiftoberfläche hervorruft. Die Stiftoberfläche wird hart, die Produktabgabe beim Bestreichen der Haut verringert sich und die kosmetischen Eigenschaften des Stiftes verschlechtern sich. Die schweißhemmende Wirkung des Produkts lässt bereits nach 2 bis 3 Wochen regelmäßiger Gebrauchszeit merklich nach.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es daher, wasserfreie Antitranspirant-Stifte auf Wachs-basis bereitzustellen, die auch nach vielen Gebrauchszyklen unter Feuchtigkeitseinfluss (Luft/ Haut/Schweiß) keine Verschlechterung der Abgabeeigenschaften zeigen, wobei unter Abgabeeigenschaften insbesondere das Anschmelzverhalten und Gleitvermögen des Stiftes beim Auftragen auf die Haut, aber auch die Freisetzung des Antitranspirantwirkstoffs und damit die Antitranspirantleistung, zu verstehen ist.

Überraschend wurde nun gefunden, dass bei wasserfreien Antitranspirant-Stiften auf Wachs-basis die vorstehend genannten Nachteile beseitigt oder zumindest deutlich vermindert und die Langzeitstabilität der Abgabeeigenschaften und die Resistenz gegenüber Feuchtigkeitseinfluss deutlich verbessert werden kann, wenn die Stifte, jeweils bezogen auf ihr Gesamtgewicht, 1 – 4 Gew.-%, bevorzugt 2 – 3,5 Gew.-%, besonders bevorzugt 2,5 – 3 Gew.-%, mindestens eines Öl-in-Wasser-Emulgators, ausgewählt aus Ethoxylaten von C₁₀-C₂₂-Alkanolen mit 8 bis 16, bevorzugt 10 – 14, besonders bevorzugt mit 12 Ethylenoxid-Einheiten im Molekül enthalten.

Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind Antitranspirant-Wachsstifte, enthaltend

insgesamt 3 – 27 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der kristallwasserfreien Aktivsubstanz (USP) in der Gesamtzusammensetzung, Antitranspirant-Wirkstoff(e),
0 bis maximal 8 Gew.-% freies Wasser,
insgesamt 30 – 70 Gew.-% an mindestens einem unter Normalbedingungen flüssigen kosmetischen Öl, darin 10 – 50 Gew.-% mindestens eines flüchtigen Öls, das ausgewählt ist aus flüchtigen cyclischen Siliconen, flüchtigen linearen Siliconen und flüchtigen aliphatischen Kohlenwasserstoffen sowie Mischungen hiervon, und zusätzlich zu dem mindestens einen flüchtigen Öl insgesamt 1 – 30 Gew.-% mindestens eines nicht-flüchtigen Öls,
insgesamt 15 – 25 Gew.-% mindestens einer unter Normalbedingungen festen Wachskomponente,
darin 12 – 22 Gew.-% mindestens eines linearen und gesättigten C₁₄-C₂₂-Alkanols,
0,5 – 5 Gew.-% mindestens eines Wachses mit einem Schmelzpunkt von 65 – 150 °C,
0,5 – 8 Gew.-% mindestens eines Wachses mit einem Schmelzpunkt von 25 bis < 50°C,
0,5 – 6 Gew.-% mindestens eines wasserunlöslichen teilchenförmigen Füllstoffs,
1 – 4 Gew.-%, bevorzugt 2 – 3,5 Gew.-%, besonders bevorzugt 2,5 – 3 Gew.-%, mindestens eines Öl-in-Wasser-Emulgators, ausgewählt aus Ethoxylaten von C₁₀-C₂₂-Alkanolen mit 8 bis 16 Ethylenoxid-Einheiten im Molekül,
wobei sich, sofern nichts anderes vermerkt ist, alle Gew.-%-Angaben auf das Gesamtgewicht des Antitranspirant-Wachsstifts beziehen.

Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind auch Antitranspirant-Wachsstifte, enthaltend insgesamt 3 – 27 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der kristallwasserfreien Aktivsubstanz (USP) in der Gesamtzusammensetzung, Antitranspirant-Wirkstoff(e),
0 bis maximal 8 Gew.-% freies Wasser,
insgesamt 30 – 70 Gew.-% an mindestens einem unter Normalbedingungen flüssigen kosmetischen Öl, darin 10 – 50 Gew.-% mindestens eines flüchtigen Öls, das ausgewählt ist aus flüchtigen cyclischen Siliconen, flüchtigen linearen Siliconen und flüchtigen aliphatischen Kohlenwasserstoffen sowie Mischungen hiervon, und zusätzlich zu dem mindestens einen flüchtigen Öl insgesamt 1 – 30 Gew.-% mindestens eines nicht-flüchtigen Öls,
insgesamt 15 – 25 Gew.-% mindestens einer unter Normalbedingungen festen Wachskomponente, darin
insgesamt 12 – 22 Gew.-% mindestens eines linearen und gesättigten C₁₄-C₂₂-Alkanols,
insgesamt 0,5 – 5 Gew.-% mindestens eines Wachses mit einem Schmelzpunkt von 65 – 150 °C,
insgesamt 0,5 – 8 Gew.-% mindestens eines Wachses mit einem Schmelzpunkt von 25 bis < 50°C,
weiterhin insgesamt 0,5 – 6 Gew.-% mindestens eines wasserunlöslichen teilchenförmigen Füllstoffs,

insgesamt 1 – 4 Gew.-%, bevorzugt 2 – 3,5 Gew.-%, besonders bevorzugt 2,5 – 3 Gew.-%, mindestens eines Öl-in-Wasser-Emulgators, ausgewählt aus Ethoxylaten von C₁₀-C₂₂-Alkanolen mit 8 bis 16 Ethylenoxid-Einheiten im Molekül, wobei sich, sofern nichts anderes vermerkt ist, alle Gew.-%-Angaben auf das Gesamtgewicht des Antitranspirant-Wachsstifts beziehen.

„Normalbedingungen“ sind im Sinne der vorliegenden Anmeldung eine Temperatur von 20 °C und ein Druck von 1013 hPa. Schmelzpunktangaben beziehen sich ebenfalls auf einen Druck von 1013 hPa.

Der Gehalt der erfindungsgemäßen Stifte an freiem Wasser beträgt 0 - 8 Gew.-%, bevorzugt 0,1 - 6 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,2 - 4 Gew.-%, außerordentlich bevorzugt 0,5 – 3 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht des Antitranspirant-Wachsstifts.

„Freies Wasser“ im Sinne der vorliegenden Anmeldung ist Wasser, das nicht in Form von Kristallwasser, Hydratationswasser oder ähnlich molekular gebundenem Wasser in der Antitranspirant-Zusammensetzung enthalten ist. Der Gehalt an Kristallwasser, Hydratationswasser oder ähnlich molekular gebundenem Wasser, der in den eingesetzten Bestandteilen, insbesondere in den schweißhemmenden Wirkstoffen, enthalten ist, stellt im Sinne der vorliegenden Anmeldung kein freies Wasser dar. Freies Wasser ist beispielsweise solches Wasser, das als Lösemittel, als Gelaktivator oder als Lösemittelbestandteil anderer Wirkstoffe zur erfindungsgemäßen Zusammensetzung zugegeben wird.

Bei den kosmetischen Ölen unterscheidet man flüchtige und nicht-flüchtige Öle. Unter nicht-flüchtigen Ölen versteht man erfindungsgemäß solche Öle, die bei 20 °C und einem Umgebungsdruck von 1013 hPa einen Dampfdruck von weniger als 2,66 Pa (0,02 mm Hg) aufweisen. Unter flüchtigen Ölen versteht man erfindungsgemäß solche Öle, die bei 20 °C und einem Umgebungsdruck von 1013 hPa einen Dampfdruck von 2,66 Pa – 40000 Pa (0,02 mm – 300 mm Hg), bevorzugt 10 – 12000 Pa (0,1 – 90 mm Hg), besonders bevorzugt 13 – 3000 Pa, außerordentlich bevorzugt 15 – 500 Pa, aufweisen.

Die Begriffe „Antitranspirant-Wachsstift“, „Antitranspirant-Stift“, „Antitranspirant-Stift auf Wachs-basis“, „Stiftzusammensetzung“ und „erfindungsgemäße Zusammensetzung“ werden mit Bezug auf den Gegenstand der vorliegenden Anmeldung synonym gebraucht.

Die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen enthalten mindestens einen schweißhemmenden Wirkstoff, der auch als Antitranspirant-Wirkstoff bezeichnet wird, in einer Gesamtmenge von 3 – 27 Gew.-%, bevorzugt 5 – 22 Gew.-% und besonders bevorzugt 10 – 20 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der kristallwasserfreien Aktivsubstanz (USP) in der Gesamtzusammensetzung.

Bevorzugte Antitranspirant-Wirkstoffe sind ausgewählt aus den wasserlöslichen adstringierenden anorganischen und organischen Salzen des Aluminiums, Zirconiums und Zinks bzw. beliebigen

Mischungen dieser Salze.

Erfindungsgemäß wird unter Wasserlöslichkeit eine Löslichkeit von wenigstens 5 Gew.-% bei 20 °C verstanden, das heißt, dass Mengen von wenigstens 5 g des Antitranspirant-Wirkstoffs in 95 g Wasser bei 20 °C löslich sind.

Die schweißhemmenden Wirkstoffe liegen in ungelöster, suspendierter Form vor. Aus Gründen der Produktstabilität ist es bevorzugt, dass die Wirkstoffpartikel eine zahlenmittlere Partikelgröße von 0,1 – 200 µm, bevorzugt 1 – 50 µm, besonders bevorzugt 3 – 20 µm und außerordentlich bevorzugt 5 – 10 µm, aufweisen.

Besonders bevorzugte Antitranspirant-Wirkstoffe sind ausgewählt aus Aluminiumchlorhydrat, insbesondere Aluminiumchlorhydrat mit der allgemeinen Formel $[Al_2(OH)_5Cl \cdot 1-6 H_2O]_n$, bevorzugt $[Al_2(OH)_5Cl \cdot 2-3 H_2O]_n$, das in nicht-aktivierter oder in aktivierter (depolymerisierter) Form vorliegen kann, sowie Aluminiumchlorhydrat mit der allgemeinen Formel $[Al_2(OH)_4Cl_2 \cdot 1-6 H_2O]_n$, bevorzugt $[Al_2(OH)_4Cl_2 \cdot 2-3 H_2O]_n$, das in nicht-aktivierter oder in aktivierter (depolymerisierter) Form vorliegen kann.

Die Herstellung bevorzugter Antitranspirant-Wirkstoffe ist beispielsweise in US 3887692, US 3904741, US 4359456, GB 2048229 und GB 1347950 offenbart.

Weiterhin bevorzugt sind Aluminiumsesquichlorhydrat, Aluminiumdichlorhydrat, Aluminiumchlorhydrat-Polyethylenglycol (PG) oder Aluminiumchlorhydrat-Polyethylenglycol (PEG), Aluminium- oder Aluminiumzirconium-Glycol-Komplexe, z. B. Aluminium- oder Aluminiumzirconium-Polyethylenglycol-Komplexe, Aluminiumsesquichlorhydrat-PG oder Aluminiumsesquichlorhydrat-PEG, Aluminium-PG-dichlorhydrat oder Aluminium-PEG-dichlorhydrat, Aluminiumhydroxid, weiterhin ausgewählt aus den Aluminiumzirconiumchlorhydraten, wie Aluminiumzirconiumtrichlorhydrat, Aluminiumzirconiumtetrachlorhydrat, Aluminiumzirconiumpentachlorhydrat und Aluminiumzirconiumoctachlorhydrat sowie den Aluminium-Zirconium-Chlorhydrat-Glycin-Komplexen, wie Aluminiumzirconiumtrichlorhydratglycin, Aluminiumzirconiumtetrachlorhydratglycin, Aluminiumzirconiumpentachlorhydratglycin und Aluminiumzirconiumoctachlorhydratglycin, weiterhin aus Kaliumaluminiumsulfat ($KAl(SO_4)_2 \cdot 12 H_2O$, Alaun), Aluminiumundecylenoylcollagenaminosäure, Natriumaluminiumlactat + Aluminiumsulfat, Natriumaluminiumchlorhydroxylactat, Aluminiumbromhydrat, Aluminiumchlorid, den Komplexen von Zink- und Natriumsalzen, den Komplexen von Lanthan und Cer, den Aluminiumsalzen von Lipoaminosäuren, Aluminiumsulfat, Aluminiumlactat, Aluminiumchlorhydroxyallantoinat, Natrium-Aluminium-Chlorhydroxylactat, Zinkchlorid, Zinksulfocarbolat, Zinksulfat, Zirconyloxyhalogeniden, insbesondere Zirconyloxychloriden, Zirconylhydroxyhalogeniden, insbesondere Zirconylhydroxychloriden (Zirconiumchlorhydrat). Erfindungsgemäß besonders bevorzugte Antitranspirant-Wirkstoffe sind ausgewählt aus Aluminiumchlorhydrat und Aluminiumzirconiumchlorhydraten, insbesondere aus Aluminium-Zirconium-Tetrachlorhydrat-Glycin-Komplexen.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugte Antitranspirant-Wirkstoffe sind ausgewählt aus so

Explore Litigation Insights

Docket Alarm provides insights to develop a more informed litigation strategy and the peace of mind of knowing you're on top of things.

Real-Time Litigation Alerts



Keep your litigation team up-to-date with **real-time alerts** and advanced team management tools built for the enterprise, all while greatly reducing PACER spend.

Our comprehensive service means we can handle Federal, State, and Administrative courts across the country.

Advanced Docket Research



With over 230 million records, Docket Alarm's cloud-native docket research platform finds what other services can't. Coverage includes Federal, State, plus PTAB, TTAB, ITC and NLRB decisions, all in one place.

Identify arguments that have been successful in the past with full text, pinpoint searching. Link to case law cited within any court document via Fastcase.

Analytics At Your Fingertips



Learn what happened the last time a particular judge, opposing counsel or company faced cases similar to yours.

Advanced out-of-the-box PTAB and TTAB analytics are always at your fingertips.

API

Docket Alarm offers a powerful API (application programming interface) to developers that want to integrate case filings into their apps.

LAW FIRMS

Build custom dashboards for your attorneys and clients with live data direct from the court.

Automate many repetitive legal tasks like conflict checks, document management, and marketing.

FINANCIAL INSTITUTIONS

Litigation and bankruptcy checks for companies and debtors.

E-DISCOVERY AND LEGAL VENDORS

Sync your system to PACER to automate legal marketing.