

P.- 35.839
U.S. Serial Nº 566.732

343211

28 JUN 1968

Memoria descriptiva



343211

para solicitar PATENTE DE INVENCION

por 20 años

a nombre de COLGATE PALMOLIVE COMPANY

entidad / ~~de nacionalidad~~ norteamericana

con domicilio en 300 Avenue, Nueva York, N.Y., Estados Unidos de América

por: "UN PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR UNA COMPOSICION CONTRA LA TRANSPIRACION"



La presente invención se refiere a composiciones
contra la transpiración y a métodos para preparar tales
composiciones y en particular a composiciones contra la
transpiración que no solamente son superiores contra la
5 transpiración, sino que también son menos irritantes para
la piel que los productos convencionales contra la trans-
piración, especialmente los productos de aluminio contra
la transpiración no son perjudiciales para las telas y son
particularmente adaptables para ser envasados en aerosoles
10 y para la diseminación desde los mismos.

Las composiciones contra la transpiración astringen-
tes de la presente invención comprenden un portador o
vehículo cosmético y, como agente esencial contra la trans-
piración, una mezcla específica de sales de metal de las
15 tierras raras, solubles en agua. Las sales de metales de
las tierras raras solubles en agua, preferidas, son los
sulfonatos de didimio, pero otras sales apropiadas solubles
en agua incluyen los sulfatos, cloruros, acetatos, metio-
natos y similares de didimio. Didimio es el nombre que se
20 le da a una mezcla de elementos de las tierras raras obte-
nida, por ejemplo, de la arena de monacita por extracción
seguida por una eliminación substancial del cerio y torio
de la mezcla.

Una mezcla de sales de metales de las tierras ra-
25 ras solubles en agua, preferiblemente sales sulfamato so-
lubles en agua, da una acción sobresaliente e inocua contra
la transpiración cuando los metales de las tierras raras
están presentes en las proporciones indicadas a continua-
ción:

343211



Lantano	40 - 50%
Neodimio	30 - 40%
Praseodimio	5 - 15%

y aún más cuando el contenido de cerio y torio es menor que alrededor del 2%. También puede haber presentes sales de otros metales de las tierras raras en cantidades menores, hasta el extremo de menos que alrededor del 10%, incluyendo samario (3-6%), gadolinio (2-4%) e itrio (0,2-1,0%)
5 Todos los porcentajes de los metales dados aquí están basados en el contenido total de metal y todos los porcentajes son por peso.

Aunque la mezcla descrita arriba puede ser preparada a partir de los componentes individuales, este procedimiento no es ni práctico ni económicamente posible. El método más apropiado es el descrito arriba para obtener didimio de la arena de monacita o de otro mineral apropiado.
10

Una fuente comercialmente disponible de sales de metales de las tierras raras es una mezcla derivada del mineral de monacita conocida como carbonato de didimio. Para preparar la mezcla preferida de sulfamato usada en la presente invención, el carbonato de didimio es tratado con ácido sulfámico para rendir los sulfamatos de los metales de las tierras raras presentes en el carbonato de didimio. El siguiente ejemplo ilustra la preparación de sulfamato de didimio.
15
20

343211

EJEMPLO A



Se prepara una lechada o suspensión de 31,4 partes de carbonato de didimio en 31,4 partes de agua desionizada en un recipiente de vidrio y mientras se agita la lechada es agregada despacio 37,2 partes de ácido sulfámico. Después completa la adición de éste la mezcla se deja reposar toda la noche. Entonces se agrega una cantidad apropiada de un auxiliar para filtrar y la mezcla de reacción es filtrada a través de un filtro prensa forrado de vidrio, dentro de un recipiente de cristal. El pH del filtrado es ajustado a 3,1-3,2 añadiendo una solución acuosa de 1,5 partes de carbonato de sodio en 1000 partes de la solución. La mezcla es entonces filtrada de nuevo como arriba y se encuentra que contiene un total de sólidos de alrededor de 60% con el total de metales de las tierras raras alrededor de 17 a 20% de la solución acuosa. Esta solución, diluida con un volumen igual de agua para rendir una solución acuosa al 30%, es aplicada con una almohadilla humedecida con la misma, a un área seleccionada del antebrazo de una persona. Se nota un claro efecto astringente.

Similarmente se pueden preparar sales de ácido sulfúrico, hidroclicórico, acético y metiónico a partir del carbonato de didimio y una solución al 30% de cada una de estas sales de didimio cuando son aplicadas al antebrazo con una almohadilla humedecida con la misma producen un efecto astringente similar.

Las sales de metales de las tierras raras, solubles en agua, como son preparadas arriba en el ejemplo A o de otra forma, son usadas como fuente abastecedora de un



agente contra la transpiración con el cual se puede preparar, con un portador cosmético apropiado, cualquier composición contra la transpiración incluyendo unguentos, cremas, lociones, geles, y pulverizaciones en la forma de emul
5 siones, suspensiones y soluciones. Una forma preferida la cual es excelente y conveniente para usar en una formulación de aerosol. Además de la aplicación desde un envase de aerosol, las composiciones contra la transpiración que incluyen las sales solubles en agua de las mezclas de me-
10 tales de las tierras raras aquí descritas, pueden también ser aplicadas por medio de un aplicador de rodillo o bola por pulverización con un frasco comprimible. La viscosidad y forma física de la composición contra la transpiración pueden ser ajustadas dependiendo del modo de aplicación
15 y forma física en particular que se desee por medio de los agentes usuales que controlan la viscosidad o por agentes para espesar bien conocidos en la técnica tales como los éteres de celulosa, es decir, metil celulosa, celulosa etil otros derivados de celulosatales como la carboximetilcelu-
20 losa, hidroxipropilmetilcelulosa, así como gomas convencionales y otras resinas solubles en agua y alcohol, para lograr las características deseadas de fluidez para los medios particulares de aplicación y para la forma física deseada de la composición.

25 Mientras que el rasgo sobresaliente de la presente invención reside en el empleo en la composición contra la transpiración de las sales específicas, solubles en agua, de las mezclas de metales de las tierras raras aquí descritas, otras sales liotrópicas que exhiben una acción contra
30 la transpiración pueden ser usadas mezclándolas con dichas



mezclas de sales de metales de las tierras raras. Tales
otros compuestos activos contra la transpiración incluyen
la clase general de sustancias astringentes de aluminio
tales como sulfato de aluminio, cloruro de aluminio, sul-
5 fonato de aluminio, clorhidróxido de aluminio, complejos
de clorhidróxido de aluminio y sales de los mismos, tales
como el complejo de etilato clorhidróxido de aluminio, clor
hidroxi lactato de sodio y aluminio, fenol sulfonato de
aluminio, dihidroxi sulfonato de aluminio, cloruros de al-
10 coxi de aluminio, es decir, cloruro de pentaetoxi dialumi-
nio, cloruro de diisopropiloxi aluminio, dicloruro de oc-
tadeciloxi aluminio y similares, la clase general de com-
puestos astringentes de zirconio y titanio incluyendo en
cloruro de zirconio octahidrato, el lactato de zirconio,
15 lactato de sodio y zirconio, lactato de titanio, lactato
de titanio y aluminio (dihidroxi dilactato de aluminio),
y similares, y mezclas de los mismos.

Puede ser deseable, particularmente en el caso de
lociones, cremas y similares, el emplear un agente apropia-
20 do de superficie activa (tensioactivo) en la composición
contra la transpiración. Puede ser empleado cualquier mate-
rial apropiado de superficie activa que sea compatible con
el principal portador líquido de la composición. Los agen-
tes de superficie activa preferidos son generalmente del
25 tipo no iónico que promueven la dispersión y solubilización
de los materiales en el vehículo de la composición, es de-
cir el medio disolvente. La cantidad de agente de superfi-
cie activa que es empleado es generalmente bastante pequeña
y usualmente está en el margen de alrededor de 0,1 a alre-
30 redor del 2% del total de la composición.

11.9.67

- 6 -

343211



Los materiales preferidos de superficie activa usualmente contienen un hidrofobo alifático de cadena larga de por lo menos alrededor de 5 átomos de carbono hasta alrededor de 30 átomos de carbono el cual ha sido condensado con un óxido de alquileno, usualmente un óxido de alquileno conteniendo desde 2 a 4 átomos de carbono, y preferiblemente óxido de etileno y/o propileno, en una cantidad suficiente para hacer el producto soluble en agua, Generalmente desde alrededor de 3 a 300 mols de óxido de alquileno pueden ser usados en esta condensación. Además de los hidrofobos alifáticos, se pueden también emplear alquifenoles y preferiblemente aquellos productos alquilados en los que el resto alquilo contiene por lo menos alrededor de 6 átomos de carbono.

Cualesquiera otros materiales coadyuvantes pueden ser incorporados en las composiciones contra la transpiración de la presente invención en cantidades convenientes y apropiadas. Los agentes humectantes catiónicos son de particular importancia como tales materiales adicionales para obtener un potencial electrofisiológico óptimo. Tales agentes humectantes catiónicos son generalmente compuestos cuaternarios de amonio conteniendo por lo menos un resto de hidrocarburo graso de cadena larga, así como o un resto aromático o un resto heterocíclico. Ejemplos específicos de tales agentes humectantes catiónicos son el bromuro de laurilo isoquinolino y el cloruro de lauril dimetil bencil amonio. Otros aditivos apropiados considerados por la invención incluyen materiales conservadores, substancias anti-bacterianas, absorbentes de luz ultravioleta (U.V.), agentes opacificantes, perfumes, materias colorantes, com-



posiciones emolientes y similares. Ejemplos específicos de cada uno de tales compuestos incluyen los siguientes:

5 Como sustancias emolientes pueden ser empleadas glicerina, alantoína y derivados de lanolina, tales como un derivado de lanolina, solubles en agua, acetilado y etoxilado. Como absorbentes de luz ultravioleta puede utilizarse la clase general de compuestos de 2-hidroxi benzofenona tales como la fenona-2,4-dihidroxi benzofenona, 10 2,2',4,4'-tetra hidroxi-benzofenona, 2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetoxi-benzofenona y similares. Aun otros ejemplos de absorbentes de luz ultravioleta utilizables aquí son de la clase general de compuestos de 2-hidroxi-fenilo-benzotriazol. Como bacterizidas pueden ser utilizados la neomicina y, particularmente, sulfato de neomicina el cual sobresale 15 por su actividad antibacteriana en las composiciones de la invención. Como opacificantes pueden ser usados compuestos tales como el ácido esteárico, siliconas y similares.

 Como se ha indicado arriba uno de los aspectos sobresalientes de esta invención es una composición de aerosol. Tales composiciones generalmente comprenden una proporción mayor de un concentrado líquido conteniendo los ingredientes deseados y una proporción menor de un propulsor apropiado. El concentrado usado contiene como su componente esencial la mezcla de sales de tierras raras descritas 25 aquí anteriormente, en una solución acuosa. Además, cualquier coadyuvante deseable de los mencionados arriba puede estar presente también en el concentrado. Como se ha descrito arriba el empleo de un agente humectante catiónico en estas composiciones es particularmente ventajoso. Además 30 es usualmente necesario para obtener la compatibilidad del



concentrado acuoso con el propulsor, el emplear un codisolvente mutuo el cual es generalmente y más aceptablemente alcohol etílico.

5 El propulsor o mezcla de propulsores que pueden ser usados con el concentrado contra la transpiración puede variar considerablemente dependiendo de la formulación específica, y en particular de los coadyuvantes empleados de la presión que se desee dentro del recipiente aplicador y de las restricciones de envasador impuestas por diver-
10 sas autoridades. En general pueden ser usadas cualquiera de las sustancias propulsoras usadas convencionalmente, las cuales incluyen hidrocarburos, hidrocarburos fluorados dióxido de carbono, nitrógeno y otros gases que se pueden licuar a temperatura ambiente.

15 Los propulsores preferidos son los hidrocarburos fluorados. Ejemplos específicos de estos compuestos son el clorodifluorometano, triclorofluorometano, diclorodifluorometano, difluoroetano y diclorotetrafluoroetano.

Una combinación particularmente excelente de pro-
20 pulsos para el concentrado acuoso preferido de sulfamato de tierras raras, es una mezcla de una parte por peso de diclorodifluorometano y tres partes por peso de diclorotetrafluoroetano.

La cantidad de agente activo contra la transpira-
25 ción en una formulación particular de la invención puede variar considerablemente pero, en general, cantidades desde alrededor de 5% a alrededor del 50% del mismo basado en la formulación final son factibles y utilizables para alcanzar los objetos de la presente invención. El concen-
30 trado acuoso producido en el Ejemplo A en el cual los sulfa-
14.9.67



matos de tierras raras mezclados constituyen alrededor del 60% de la composición total, representa el límite superior práctico de concentración del agente activo contra la transpiración. En casi todas las aplicaciones y formulaciones
5 la concentración del ingrediente activo será menor que el 60% de las composiciones debido a la incorporación en las mismas del portador cosmético y de cualesquiera coadyuvantes apropiados.

En las formulaciones del tipo de aerosol el margen preferido de agente activo contra la transpiración es de alrededor del 10% a alrededor del 30% del total de la formulación de aerosol.
10

Los márgenes de concentración de los otros componentes de las composiciones contra la transpiración de esta invención variarán dependiendo del tipo de formulación es decir, solución, emulsiones, gel, crema o similares, del modo de diseminación y aplicación, y de las propiedades específicas deseadas. Por lo tanto, para aplicaciones tópicas de una solución transparente mediante un aplicador de bola o rodillo, el principal componente del vehículo es agua, con un mínimo, si lo lleva, de alcohol. En la forma de aerosol es necesaria una cantidad considerable de alcohol u otro codisolvente aceptable para obtener homogeneidad en la formulación final de propulso reducido. No hay, por lo tanto, límites críticos para los componentes de agua y/o alcohol.
15
20
25

Los diversos coadyuvantes empleados son usados en cantidades convencionales y generalmente estas cantidades son menores que alrededor del 2% de la composición total. Los márgenes ilustrativos para los varios aditivos, si es-
30
14.9.67

tán presentes, son como sigue:



Perfume	0,1 a 1,0%
Espesante	0,1 a 2,0%
Agentes bactericida y bacteriostático	0,01 a 1,0%
Agente de superficie activa	0,25 a 1,0%
Absorbente de luz ultravioleta	0,01 a 2,0%
Emoliente	0,05 a 5,0%
Fungicida	0,01 a 1,0%
Agente humectante catiónico	0,1 a 2,0%
Inhibidor de la corrosión de la tela	0,1 a 1,0%
Opacificante	Como se desee

Los siguientes ejemplos servirán para ilustrar aun más la presente invención y se entenderá que la invención no está limitada a los mismos.

EJEMPLO I

Se prepara una composición conteniendo los siguientes ingredientes:



	<u>%</u>
Sulfamato de didimio (60% en agua)	40,0
Cloruro de lauril dimetil bencil amonio (50% en isopropanol)	0,6
Bromuro de lauril isoquinolinio (75% en isopropanol)	0,6
Agua desionizada	39,4
Glicol de propileno	1,0
Perfume	0,4
Etanol SD 40	18,0

La composición contra la transpiración de este ejemplo es sorprendentemente efectiva en inhibir la transpiración y está substancialmente por completo desprovista de características irritantes no deseables.

EJEMPLO II

- 5 Se prepara una composición conteniendo los siguientes ingredientes:

	<u>%</u>
Sulfamato de didimio (55,5% en agua)	25,0
Oleato de poliglicerina (conteniendo 5 grupos de glicerina)	1,0
Glicerina etoxilada (conteniendo 10 moles de óxido de etileno)	1,0
Perfume	0,4
Etanol SD-40	50,0
Agua desionizada	16,2

343211



Esta composición es excepcionalmente efectiva contra la transpiración teniendo la ventaja adicional de no ser tóxica, ni irritante, ni dañina para las telas.

EJEMPLO III

Se prepara una formulación de crema conteniendo:

	<u>%</u>
Sulfamato de didimio	15
Monoestearato de glicerilo	10
Bromuro de lauril isoquinolinio	1
Glicol de propileno	2
Agente bacteriostático	1
Perfume	0,5
Agua	70,5

Se

5 Se obtienen excelentes resultados con la formulación dada arriba.

Los procedimientos de los Ejemplos II y III son repetidos reemplazando en cada caso la mitad del metal de las tierras raras contra la transpiración, por una cantidad igual de los siguientes agentes contra la transpiración respectivamente:

10

A. Cloruro de aluminio

B. Cloruro de didimio

C. Clorohidróxido de aluminio

D. Sulfamato de aluminio

E. Clorohidroxi lactato de sodio y aluminio

Se obtuvieron excelentes resultados en cada caso.



EJEMPLO IV

Un recipiente de aerosol es llenado con la siguiente composición:

	<u>%</u>
Composición del Ejemplo I	60
Mezcla propulsora (1 parte de dicloro difluorometano y 3 partes de dicloro tetrafluoroetano)	40

Esta formulación es rociada sobre la piel y da una acción excelente contra la transpiración. La capa no es ni irritante ni pegajosa.

Las composiciones contra la transpiración de la presente invención que contienen sales de didimio solubles en agua exhiben una mayor inhibición del sudor y, no siendo tóxicas, ni irritantes, ni perjudiciales para las telas rinden formulaciones muy superiores a las composiciones conocidas contra la transpiración al presente en el mercado. Pruebas comparativas para la inhibición del sudor han mostrado que el sulfamato de didimio es más superior contra la transpiración que el cloruro de aluminio, así como muy superior al sulfamato de lantano, a pesar, del hecho de que el último constituye el principal sulfamato de tierras raras que está presente en el sulfamato de didimio. Un efecto beneficioso sorprendente es producido por la interacción de la mezcla de los sulfamatos de metal de tierras raras que están presentes en el sulfamato de didimio. La aplicación de las composiciones contra la transpiración a zonas de las axilas ha resultado en una reducción substan



27

cial del sudor, si se compara con las zonas de las axilas no tratadas, y también de una reducción del sudor cuando se compara con zonas de axila tratadas con otras composiciones contra la transpiración.

5 A pesar de que el presente invento ha sido descrito refiriéndose a aspectos y ejemplos particulares, será evidente y obvio para los expertos en la técnica que pueden hacerse variaciones y modificaciones del invento descrito y que pueden emplearse equivalentes para los
10 diversos ingredientes descritos aquí, sin apartarse de los principios y espíritu de la invención como se ha definido en las siguientes reivindicaciones.

15 Esta solicitud que corresponde a la presentada en Estados Unidos de América el 21 de Julio de 1.966, bajo el número 566.732, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

N O T A

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los

343211



siguientes:

- 5 1.- Un procedimiento para preparar una composición contra la transpiración, el cual comprende tratar con ácido sulfámico una suspensión de las correspondientes sales carbonato de metales de las tierras raras, para producir los correspondientes sulfamatos de metales de las tierras raras, comprendiendo esta suspensión de sales de metales de las tierras raras los siguientes porcentajes de metales de las tierras raras en términos de contenido total de metal de las tierras raras de la misma: lan-
10 tano desde alrededor de 40% hasta alrededor de 50%, neodimio desde alrededor de 30% hasta alrededor de 40%, praseodimio desde alrededor del 5% hasta alrededor del 15%, cerio y torio menos de alrededor del 2%.
- 15 2.- Un procedimiento como se define en la reivindicación 1, en el cual las sales de metales de las tierras raras, solubles en agua, comprenden sales sulfamato.
- 20 3.- Un procedimiento como se define en la reivindicación 1, en el que dicha composición incluye un agente bacteriostático.
- 25 4.- Un procedimiento como se define en la reivindicación 1, en el que dicha composición incluye una sal liotrópica diferente de dicha mezcla de sales de metales de las tierras raras, además de ella.
- 30 5.- Un procedimiento como se define en la reivindicación 1, en el cual dicha composición incluye además un propulsor, por lo cual se aplica como una pulverización de aerosol.
- 6.- Un procedimiento como se define en la reivindicación 1, en el que dicha composición incluye un

343211



agente humectante catiónico.

7.- Un procedimiento como se define en la reivindicación 1, en la cual la mezcla de sales de metales de las tierras raras es sulfamato de didimio.

5 8.- Un procedimiento como se define en la reivindicación 2, en el que dicha composición incluye un agente humectante estiónico, un alcohol y un propulsor.

9.- Un procedimiento para preparar una composición contra la transpiración.

10 Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede, y con los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de diecisiete hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid.

27 JUN. 1968

P.A.

Alberto de Elzabur
Por Fuder.

21-6-68

PBG.

343211