Übersetzung der europäischen Patentschrift

(97) EP 1 043 971 B1
(21) Deutsches Aktenzeichen: 698 28 708.8
(86) PCT-Aktenzeichen: PCT/EP98/07323
(96) Europäisches Aktenzeichen: 98 963 462.1
(87) PCT-Veröffentlichungs-Nr.: WO 99/029290
(86) PCT-Anmeldetag: 10.11.1998
(87) Veröffentlichungstag
   der PCT-Anmeldung: 17.06.1999
(97) Erstveröffentlichung durch das EPA: 18.10.2000
(97) Veröffentlichungstag
   der Patenterteilung beim EPA: 19.01.2005
(47) Veröffentlichungstag im Patentblatt: 16.06.2005

(30) Unionspriorität:
    9726132  10.12.1997  GB

(73) Patentinhaber:
    Unilever N.V., Rotterdam, NL

(74) Vertreter:
   Lederer & Keller, 80538 München

(51) Int Cl.3: A61K 7/32

(84) Benannte Vertragsstaaten:
    DE, ES, FR, GB, IT, SE

(72) Erfinder:
    COX, Margaret, Caroline-Ann, St. Helens, Merseyside WA10 3HU, GB; STIRLING, Thomas, Bebington, Merseyside L63 3JW, GB

(54) Bezeichnung: DEODORANT-ZUSAMMENSETZUNG


Beschreibung


[0003] Zusammensetzungen, die die Schweißbildung vermindern, umfassen häufig ein Metallsalz, wie Aluminium- oder Zirkoniumsalz, das die Schweißporen blockiert. Dieses Verfahren ist sehr einfach; eine Schweißbildungsvermindering von mehr als 50% wird dennoch kaum erreicht.

[0004] Deodorantien vermindern andererseits die Anzahl von Mikroorganismen auf der Hautoberfläche. Es ist gut bekannt, dass Schweiß geruchlos ist, bis er durch die Hautmikroflora abgebaut wurde. Typische Deodorantien schließen Ethanol und Triclosan (2',4,4'-Trichlor-2-hydroxy-diphenylether) ein, welches als ein antimikrobielles Mittel gut bekannt ist. Der mit solchen Deodorantien erhaltene deodorierende Effekt verschwindet jedoch ziemlich schnell, da die Mikroflora bald ihre Höhe wiedererlangt.

[0005] Es gibt deshalb ein Erfordernis für wirksamere, länger anhaltende Deodorantien auf dem Markt.


[0011] Folglich stellt die Erfindung eine Deodorant-Zusammensetzung zur örtlichen Auftragung auf menschliche Haut, wie in Anspruch 1 beansprucht, bereit.

Die erfindungsgemäße Zusammensetzung kann auch andere Materialien umfassen, die üblicherweise in deodorierenden oder schweißhemmenden Zusammensetzungen gefunden werden. Bei der Ausführung enthält die erfindungsgemäße Zusammensetzung zusätzlich zu PHMB und Chlorhexidin gewöhnlich mindestens einen kosmetisch verträglichen Träger. Der kosmetisch verträgliche Träger kann einen flüssigen Träger, wie beispielsweise vorstehend beschrieben, und/oder Wasser und/oder einen hydrophoben Träger, der beispielsweise ein flüchtiges oder nichtflüchtiges Silikonöl sein kann, oder einen flüssigen Kohlenwasserstoff oder in Wasser unlöschlichen Alkohol oder aliphatische Ether oder aliphatische oder aromatische Ester, enthalten. Der Träger macht normalerweise 10 bis 80% Gewicht/Gewicht der Zusammensetzung aus.

Die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen können zusätzlich, falls erwünscht, einen oder mehre re weitere deodorierende Wirkstoffe, häufig 0 bis 5% Gewicht/Gewicht; Parfüms, häufig 0 bis 2% Gewicht/Gewicht; schweißhemmende Wirkstoffe, wie schweißhemmende Aluminium- oder Zirkonium-Wirkstoffe, häufig 0 bis 40% Gewicht/Gewicht; und, falls vorliegend, insbesondere 5 bis 28% Gewicht/Gewicht; Hautvorteilmittel, einschließlich Erweichungsmittel, die durch eine Vielzahl von Trägern bereitgestellt werden können, wie Silikonöle oder zusätzlich durch beispielsweise feste Silikonpolymerie, wie weitere Erweichungsmittel, die häufig 0 bis 20% Gewicht/Gewicht umfassen; Färbenmittel, häufig 0 bis 2% Gewicht/Gewicht; Feuchtalmittel, wie Sorbit oder Glycerin, häufig 0 bis 10% Gewicht/Gewicht; Verdickungsmittel, wie Stärken oder Cellulosedervitate, häufig 0 bis 5% Gewicht/Gewicht und insbesondere 0 bis 2% Gewicht/Gewicht; Gelbildungsmittel, wie Dibenzylisorбит, Hydroxyethylcellulose, Stearylalkohol oder Amidierivate von Tricarbon säuren, häufig in einer Menge von 0 bis 15% Gewicht/Gewicht und insbesondere 0 bis 5% Gewicht/Gewicht; Suspensionsmittel, wie Tone oder Siliziumdioxi de, häufig in einer Menge von bis zu 5% Gewicht/Gewicht; Strukturierungsmittel, wie Silikonelastomere oder Silikon- oder Kohlenwasserstoffwachse, beispielsweise in einer Menge von 0 bis 15% Gewicht/Gewicht; Treibmittel, wie Kohlenwasserstoffe mit einem Siedepunkt unter 10°C, beispielsweise Butan- und Propanisomere, wie in einer Menge, falls angewendet, von 30 bis 95% Gewicht/Gewicht, insbeson-
dere 35 bis 75% Gewicht/Gewicht; und andere kosmetische Hilfsstoffe, die üblicherweise in solchen Zusammensetzungen angewendet werden, enthalten. Wenn Wasser und ein hydrophobes Material vorliegt, enthält die Zusammensetzung vorzugsweise ein Emulgator-System, typischerweise mit einem HLB- oder mittleren HLB-Wert von 6 bis 11, wie Polyethoxylatether oder -ester. Die Verwendung solcher Substanzen und die Anteile, zu denen sie eingearbeitet werden, hängen von der Form der Zusammensetzung ab, die ein Aerosol, Stift, Roll-on, Gel, Lotion, Creme, Salbe, Pulver, Suspension oder Seife sein kann.

[0021] Die Erfindung wird nun durch das nachstehende, nicht-begrenzende Beispiel beschrieben.

**BEISPIEL 1**


<table>
<thead>
<tr>
<th></th>
<th>A</th>
<th>B</th>
<th>C</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>Ethanol</td>
<td>60,0</td>
<td>51,93</td>
<td>60,0</td>
</tr>
<tr>
<td>Wasser</td>
<td>37,9</td>
<td>5,5</td>
<td>38,15</td>
</tr>
<tr>
<td>Klucel 99M¹</td>
<td>0,25</td>
<td>-</td>
<td>-</td>
</tr>
<tr>
<td>CAP Treibmittel</td>
<td>-</td>
<td>40,0</td>
<td>-</td>
</tr>
<tr>
<td>Myristinsäureisopropylester</td>
<td>-</td>
<td>1,0</td>
<td>-</td>
</tr>
<tr>
<td>Parfüm</td>
<td>1,5</td>
<td>1,5</td>
<td>1,5</td>
</tr>
<tr>
<td>Cosmocil CQ (20% PHMB)</td>
<td>0,25</td>
<td>0,05</td>
<td>0,25</td>
</tr>
<tr>
<td>Chlorhexidindigluconat</td>
<td>0,1</td>
<td>0,02</td>
<td>0,1</td>
</tr>
</tbody>
</table>

¹Hydroxypropylcellulose von Aqualon

Klucel 99M (Handelsmarke) ist Hydroxypropylcellulose von Aqualon

**Beispiel 2 und 3**

[0024] In diesen Beispielen wurde die Wirksamkeit der Kombinationen von Deodorantien durch den Deodorant-Wert-Test, ein nachstehend beschriebener Gruppentest, gemessen.

Der Deodorant-Wert-Test


Kategorieskale von schlechtem Geruch

<table>
<thead>
<tr>
<th>BEWERTUNG</th>
<th>GERUCHSNIVEAU</th>
<th>WÄSSRIGE KONZENTRIERTE ISOVALE-RIANSÄURE ml/Liter</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>0</td>
<td>kein Geruch</td>
<td>0</td>
</tr>
<tr>
<td>1</td>
<td>leicht</td>
<td>0,013</td>
</tr>
<tr>
<td>2</td>
<td>eindeutig</td>
<td>0,053</td>
</tr>
<tr>
<td>3</td>
<td>mittel</td>
<td>0,220</td>
</tr>
<tr>
<td>4</td>
<td>stark</td>
<td>0,870</td>
</tr>
<tr>
<td>5</td>
<td>sehr stark</td>
<td>3,57</td>
</tr>
</tbody>
</table>


[0031] Eine Standardprodukturauftragungstechnik wird verwendet; für Aerosole ein 2-Sekunden-Sprühen, 6 inch von der Achsel wird verwendet; für Pumpsprays wird eine konstante Anzahl von Pumpungen verwendet. Für Roll-on und Stifte kann das Produkt entweder als eine festgesetzte Anzahl von Strichen oder ein bekanntes Gewicht des Produkts, unter Verwendung eines Ausgleichs, aufgetragen werden, um den Gewichtsverlust des Produktes zu messen.


[0034] Die Bewertungen des schlechten Geruchs für 5 und 24 Stunden Tragezeiträume werden gesondert behandelt. Die Bewertungen der 4-Tages-Bewertungen für alle Geruchsbewertungsexperten werden gemittelt, um ein Ergebnis für jedes Testprodukt für die Woche zu ergeben, und diese werden dann gemittelt, um eine Gruppenbewertung zu ergeben. Die Ergebnisse werden unter Verwendung einer auf SAS basierenden Variance-Analyse-Routine analysiert, die Faktoren berücksichtigt, welche zu Variabilität führen, beispielsweise Person, Tag, linke/rechte Richtung. Die Analyse ergibt auch den Unterschied bei der Bewertung des schlechten Geruchs, der als ein Ergebnis benötigt wird, um bei dem Niveau p = 0.05 statistisch signifikant zu sein. Der Deodorantwert gemäß einer Testzusammensetzung ist der Unterschied in der Einstufung zwischen der Test-
zusammensetzung und einem Placebo.


[0036] Der in jener Veröffentlichung beschriebene Test wurde jedoch im Allgemeinen in dreierlei Weise modifiziert: erstens, das Produkt wird direkt auf die Achseln aufgetragen, anstatt mit Hilfe einer Wäsche mit einem Seifenriegel; zweitens, eine 0 bis 5 anstelle eine 0 bis 10 graduiende Skale wurde angewendet, und drittens, das Graduieren der Geruchsintensität wurde 5 Stunden und 24 Stunden, anstelle nur 24 Stunden nach Behandlung, durchgeführt. Dieser Test wird hierin als der Deodorantwerttest bezeichnet.


<table>
<thead>
<tr>
<th>Deodorantwirkstoff</th>
<th>Mittlere Bewertung des schlechten Geruchs nach 24 Stunden</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>D 0,204% CHDG</td>
<td>2,04</td>
</tr>
<tr>
<td>E 0,50% Cosmocil CQ (20% Wirkstoff)</td>
<td>1,88</td>
</tr>
<tr>
<td>F 0,102% CHDG + 0,25% Cosmocil CQ (20% Wirkstoff)</td>
<td>1,58</td>
</tr>
<tr>
<td>Signifikant Unterschied (95%)</td>
<td>0,15</td>
</tr>
</tbody>
</table>

[0038] Aus Tabelle 2 kann ersichtlich werden, dass die erfindungsgemäße Kombination F; d. h. die Kombination von CHDG und PHMB in Ethanol zu einem statistisch signifikanten Ausmaß wirksam war als jede der Vergleichszusammensetzungen D und E, nämlich CHDG oder PHMB in Ethanol.

[0039] In Beispiel 3 wurden nicht-verdickende alkoholische Aerosolformulierungen hergestellt, die die Konzentrationen von CHDG und PHMB, die nachstehend in Tabelle 3 gezeigt werden, enthalten.

<table>
<thead>
<tr>
<th>Deodorantwirkstoff</th>
<th>Mittlere Bewertung des schlechten Geruchs nach 24 Stunden</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>G 0,04% CHDG</td>
<td>1,73</td>
</tr>
<tr>
<td>H 0,10% Cosmocil CQ (20% Wirkstoff)</td>
<td>1,88</td>
</tr>
<tr>
<td>I 0,02% CHDG + 0,05% Cosmocil CQ (20% Wirkstoff)</td>
<td>1,52</td>
</tr>
<tr>
<td>Signifikant Unterschied (95%)</td>
<td>0,15</td>
</tr>
</tbody>
</table>

[0040] Aus Tabelle 3 kann ersichtlich werden, dass die erfindungsgemäße Kombination I; d. h. die Kombination von CHDG und PHMB in Ethanol zu einem statistisch signifikanten Ausmaß wirksam war als jede der Vergleichszusammensetzungen G und H, nämlich CHDG oder PHMB in Ethanol.

**Patentansprüche**

1. Deodorantzusammensetzung zur örtlichen Auftragung auf menschliche Haut, dadurch gekennzeichnet, dass sie in Kombination eine wirksame Menge von Polyhexamethylenbiguanid und eine wirksame Menge Chlorhexidin in einem kosmetisch verträglichen Träger, umfassend einen einwertigen C1–C4-Alkohol, umfasst.
2. Deodorantzusammensetzung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass das Polyhexamethylenbiguanid in Form eines kosmetisch verträglichen Salzes vorliegt.

3. Deodorantzusammensetzung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass das Chlorhexidin in Form eines kosmetisch verträglichen Salzes vorliegt.

4. Deodorantzusammensetzung nach einem vorangehenden Anspruch, dadurch gekennzeichnet, dass das Polyhexamethylenbiguanid 0,001 bis 1,0 Gewichtsprozent der Zusammensetzung umfasst.

5. Deodorantzusammensetzung nach einem vorangehenden Anspruch, dadurch gekennzeichnet, dass das Chlorhexidin 0,005 bis 0,5 Gewichtsprozent der Zusammensetzung umfasst.


7. Deodorantzusammensetzung nach einem vorangehenden Anspruch, dadurch gekennzeichnet, dass der Träger Ethanol umfasst.


Es folgt kein Blatt Zeichnungen