

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
20 septembre 2007 (20.09.2007)

PCT

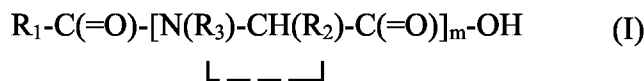
(10) Numéro de publication internationale
WO 2007/104898 A2

- (51) Classification internationale des brevets :
A61Q 19/00 (2006.01) A61K 8/64 (2006.01)
A61Q 19/02 (2006.01) A61K 8/44 (2006.01)
A61K 8/26 (2006.01)
- (21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2007/050930
- (22) Date de dépôt international : 15 mars 2007 (15.03.2007)
- (25) Langue de dépôt : français
- (26) Langue de publication : français
- (30) Données relatives à la priorité :
0650890 16 mars 2006 (16.03.2006) FR
- (71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : SOCI-
ETE D'EXPLOITATION DE PRODUITS POUR LES
INDUSTRIES CHIMIQUES SEPPIC [FR/FR]; 75 quai
d'Orsay, F-75007 Paris (FR).
- (72) Inventeur; et
- (75) Inventeur/Déposant (pour US seulement) : ROSO, Alicia
[FR/FR]; Impasse du Mercadel Bas, F-81710 Saix (FR).
- (74) Mandataire : CONAN, Philippe; C/o L'air Liquide SA,
75 quai d'Orsay, F-75321 Paris Cedex 07 (FR).
- (81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, 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, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ,
NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU,
SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR,
TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), eurasién (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: METHOD FOR REDUCING THE ODOUR INDUCED BY LIPOAMINO ACIDS IN TOPICAL COSMETIC AND/OR PHARMACEUTICAL FORMULATIONS

(54) Titre : PROCEDE POUR REDUIRE L'ODEUR INDUITE PAR LES LIPOAMINOACIDES DANS LES FORMULATIONS TOPIQUES COSMETIQUES ET/OU PHARMACEUTIQUES



(57) Abstract: The invention relates to a topical cosmetic and/or pharmaceutical formulation, characterised in that it comprises, in relation to 100 % of the mass thereof: between 0.05 and 10 mass % of a compound of formula (I), or one of the salts thereof,

or a mixture of said compounds of formula (I) or the salts thereof, wherein R1 represents the characterising chain of a saturated or unsaturated, linear or branched fatty acid comprising between 3 and 30 carbon atoms, R2 represents the characterising chain of an amino acid, R3 represents a hydrogen atom or a methyl group or R3 combined with R2 and N constitutes the characterising chain of a cyclic amino acid, m being between 1 and 50; between 0.1 and 20 mass % of magnesium and aluminium silicate; and up to 70 mass % of at least one topically acceptable ingredient. The invention also relates to the use of one such composition as a deodorising agent consisting of magnesium and aluminium silicate, in a topical cosmetic and/or pharmaceutical formulation comprising between 0.05 and 10 mass %, especially between 0.1 and 5 mass %, and preferably between 1 and 5 mass % of at least one compound of formula (I). The invention further relates to a method for reducing the odour induced by the presence of a compound of formula (I) in a topical cosmetic and/or pharmaceutical formulation, characterised in that magnesium and aluminium silicate are incorporated into said formulation.

(57) Abrégé : Formulation topique, cosmétique et/ou pharmaceutique, caractérisée en ce qu'elle comprend pour 100 % de sa masse: de 0,05% à 10% massique d'un composé de formule (I): ou d'un de ses sels, dans laquelle R₁ représente la chaîne caractérisante d'un acide gras, saturé ou insaturé, linéaire ou ramifié, comportant de 3 à 30 atomes de carbone, R₂ représente la chaîne caractérisante d'un acide aminé, R₃ représente un atome d'hydrogène, un radical méthyle ou bien R₃ constitue avec R₂ et N, la chaîne caractérisante d'un acide aminé cyclique, m est compris entre 1 et 50 ou d'un mélange desdits composés de formule (I) ou de leurs sels; de 0,1% à 20% massique de silicate de magnésium et d'aluminium; et jusqu'à 70% massique d'un ou plusieurs ingrédients topiquement acceptables. Utilisation comme agent déodorant, de silicate de magnésium et d'aluminium, dans une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique comprenant entre 0,05% à 10% massique, plus particulièrement de 0,1% à 5% massique et tout particulièrement de 1% à 5% massique d'au moins un composé de formule (I). Procédé pour réduire l'odeur induite par la présence d'un composé de formule (I), dans une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique en comprenant caractérisé en ce que l'on incorpore dans ladite formulation, du silicate de magnésium et d'aluminium.

WO 2007/104898 A2



Publiée :

— *sans rapport de recherche internationale, sera republiée dès réception de ce rapport*

abrégations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et

Procédé pour réduire l'odeur induite par les lipoaminoacides dans les formulations topiques cosmétiques et/ou pharmaceutiques

La présente demande de brevet se rapporte à l'utilisation de silicate d'aluminium
5 et de magnésium pour réduire l'odeur des lipoaminoacides.

Les lipoaminoacides sont des structures reconnues en tant qu'actifs cosmétiques ; leur activité dépend de la nature de la chaîne grasse et de celle de l'acide aminé.

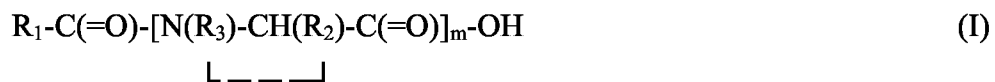
Comme exemples d'actifs cosmétique de cette famille, il y a les actifs purifiants tels que le LIPACIDE™ C8G (N-octanoyl glycine) ou le LIPACIDE™UG (N-undécylénoyl glycine) ; les actifs anti-oxydants tels que le LIPACIDE™ LML (N-lauroyl méthionine) et le LIPACIDE™ OM (N-oléyl méthionine), les actifs amincissants tels que l'ADIPOSLIM™ (N-lauroyl proline), les actifs blanchissants de la peau tels que le SEPIWHITE™ MSH (N-undécylénoyl phénylalanine), la linoléyl lysine ou la linoléyl leucine. Ces lipoaminoacides sont également incorporés dans des
15 compositions actives en mélanges avec d'autres ingrédients comme par exemple des minéraux ou des extraits de plantes : on peut citer notamment le SEPICALM™ VG (N-palmitoyl proline et extraits de fleurs de nénuphars), le SEPICALM™ S (N-cocoyl aminoacides et aspartate de magnésium) ou le SEPICONTROL™ A5 (N-octanoyl glycine et extraits de cannelle).

20 D'une façon générale, la dose de lipoaminoacide requise au sein de la formule pour obtenir l'effet attendu se situe aux alentours de 1% en matières sèches. Cependant, à cette dose, les lipoaminoacides présentent l'inconvénient de générer une odeur caractéristique au sein de la formulation, plus ou moins importante en fonction de la nature des acides aminés mis en jeu et de la longueur de la chaîne grasse ; cette
25 production d'odeur est accentuée par le fait que la solubilisation des lipoaminoacides passe le plus souvent par une étape de chauffage en phase aqueuse ou huileuse. On a remarqué que cette odeur caractéristique des lipoaminoacides s'accroît dans le temps ou lorsque que la température dépasse 30°C.

Aujourd'hui, soit cette odeur est cachée en incorporant dans les formulations, des
30 parfums choisis pour cet effet masquant, soit la concentration en lipoaminoacide est diminuée au risque d'en annihiler leur activité.

Les inventeurs se sont donc attachés à développer une méthode qui permette de mettre en œuvre les acides aminés N-acylés dans les formulations cosmétiques et/ou pharmaceutiques sans être gêné par l'odeur induite par ces composés..

C'est pourquoi l'invention a pour objet une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique, caractérisée en ce qu'elle comprend pour 100 % de sa masse :
 5 de 0,05% à 10 % massique d'un composé de formule (I) :



10

ou d'un de ses sels, dans laquelle R_1 représente la chaîne caractérisante d'un acide gras, saturé ou insaturé, linéaire ou ramifié, comportant de 3 à 30 atomes de carbone, R_2 représente la chaîne caractérisante d'un acide aminé, R_3 représente un atome d'hydrogène, un radical méthyle ou bien R_3 constitue avec R_2 et N, la chaîne caractérisante d'un acide aminé cyclique, m est compris entre 1 et 50, ou d'un mélange
 15 desdits composés de formule (I) ou de leurs sels ;

de 0,1% à 20% massique de silicates de magnésium et d'aluminium ;

et jusqu'à 70% massique d'un ou plusieurs ingrédients topiquement acceptables.

Dans la formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique telle que définie
 20 ci-dessus, le composé de formule (I) telle que définie ci-dessus, peut être sous forme d'acide libre ou sous forme partiellement ou totalement salifiée. Lorsque le composé de formule (I) est sous forme salifiée, il s'agit notamment de sels alcalins tels que les sels de sodium, de potassium ou de lithium, de sels alcalino-terreux tels que les sels de calcium, de magnésium ou de strontium ; de sel d'ammonium ou de sel d'un
 25 aminoalcool comme le sel de (2-hydroxy éthyl) ammonium. Il peut aussi s'agir de sels métalliques tels que les sels divalents de zinc ou de manganèse, les sels trivalents de fer, de lanthane, de cérium ou d'aluminium.

Dans l'exposé suivant, par composé de formule (I), on entend composé de formule (I) sous forme libre ou sous forme partiellement ou totalement salifiée.

30 L'expression "chaîne caractérisante" utilisée pour définir les radicaux R_1 et R_2 , désigne la chaîne principale non fonctionnelle de l'acide gras ou de l'acide aminé considéré.

Ainsi, pour un acide gras répondant à la formule générale $R_1-C(=O)-OH$, la chaîne caractérisante sera la chaîne représentée par R_1 .

L'invention a principalement pour objet, une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique telle que définie précédemment pour laquelle dans la formule (I),
5 le groupe $R_1-C(=O)-$ comporte de 7 à 22 atomes de carbone.

$R_1-C(=O)-$ représente notamment l'un des radicaux octanoyle, décanoyle, undécylénoyle, dodécanoyle, tétradécanoyle, hexadécanoyle, octadécanoyle, eicosanoyle, docosanoyle, 8-octadécénoyle, éicosénoyle, 13-docosénoyle, 9,12-octadécadiénoyle ou 9,12,15-octadécatriénoyle.

10 Dans la formule (I) telle que définie précédemment, R_2 représente notamment la chaîne caractérisante d'un acide aminé choisi parmi la glycine, l'alanine, la sérine, l'acide aspartique, l'acide glutamique, la valine, la thréonine, l'arginine, la lysine, la proline, la leucine, la phénylalanine, l'isoleucine, l'histidine, la tyrosine, le tryptophane, l'asparagine, la glutamine, la cystéine, la cystine, la méthionine, l'hydroxy proline,
15 l'hydroxy lysine, la sarcosine ou l'ornithine.

L'invention a plus particulièrement pour objet une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique telle que définie précédemment, pour laquelle dans la formule (I), m est un nombre décimal compris entre 1 et 10 et est de préférence inférieur à 5.

20 Selon un aspect tout particulier de la présente invention, dans la formule (I) telle que définie précédemment, m inférieur ou égal à 2 et est plus particulièrement inférieur ou égal à 1,4.

Selon un autre aspect tout particulier de la présente invention, dans la formule (I) telle que définie précédemment, m égal à 1.

25 Selon une autre variante particulière de la présente invention, la formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique telle que définie précédemment, comprend un seul composé de formule (I), telle que définie précédemment.

Selon une autre variante particulière de la présente invention, la formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique telle que définie précédemment, comprend :

30 ou bien un mélange de composés de formules (I) comportant toutes le même fragment $R_1-C(=O)$,

Tableau A

	Origine de la protéine (proportions en acides aminés exprimées en % pondéraux)			
	Avoine	Soja	Blé	Tournesol
Glycine	6,9	4,2	3,2	6,2
Alanine	5,9	4,2	2,6	4,8
Serine	5,6	5,1	1,7	5,1
Acide aspartique	16,2	11,7	3,4	10,6
Acide glutamique	28,3	19,1	37,9	23,6
Valine	2,9	5,0	4,2	4,8
Thréonine	3,1	3,9	2,7	4,4
Arginine	6,6	7,8	3,7	8,4
Lysine	3,6	6,2	1,9	3,2
Proline	4,7	5,4	11,7	3,0
Leucine	6,4	8,1	7,1	6,4
Phénylalanine	1,4	5,0	5,4	4,3
Isoleucine	2,2	4,8	3,7	4,1
Histidine	1,7	2,6	2,4	2,0
Tyrosine	1,5	3,5	3,1	2,7
Méthionine	1,2	1,2	1,6	1,8
Cystéine / Cystine	1,9	1,5	1,9	1,9
Tryptophane	-	1,0	1,0	1,3

Tableau A (suite)

	Origine de la protéine (proportions en acides aminés exprimées en % pondéraux)			
	Lupin	Pomme de terre	Féverole	Maïs
Glycine	0,9	4,8	4,0	2,4
Alanine	2,4	5,0	4,0	7,95
Serine	6,1	5,8	4,9	5,1
Acide aspartique	15,8	12,5	10,5	10,6
Acide glutamique	8,0	11,5	16,8	23,6
Valine	7,9	7,1	4,5	4,8
Thréonine	8,1	6,1	3,6	4,4
Arginine	16,1	5,0	9,21	8,4
Lysine	7,1	7,8	6,5	6,2
Proline	-	5,1	4,4	3,0
Leucine	7,45	10,4	7,4	8,1
Phénylalanine	8,6	6,4	4,4	4,3
Isoleucine	8,7	6,1	3,9	4,1
Histidine	-	2,2	2,6	2,0
Tyrosine	-	5,7	3,6	2,7
Méthionine	0,6	2,4	0,8	1,8
Cystéine / Cystine	-	1,6	1,7	1,9
Tryptophane	1,2	1,4	1,2	1,3
Ornithine	0,4	-	-	-

La réaction d'acylation est connue de l'homme du métier. Elle est décrite par
5 exemple dans la demande internationale publiée sous le numéro WO 98/09611. Elle est
mise en œuvre indifféremment sur un acide aminé ou sur un mélange d'acides aminés.
L'agent d'acylation consiste généralement en un dérivé activé d'un acide carboxylique
de formule $R_1C(=O)-OH$, tel qu'un anhydride symétrique de cet acide ou un halogénure
d'acide comme le chlorure d'acide ou le bromure d'acide. Il peut aussi consister en un
10 mélange de dérivés activés d'acides carboxyliques issus d'huiles ou graisses naturelles

d'origine animales ou végétales telles que les huiles de coprah, de palmiste, de palme, de soja, de colza, de maïs, le suif de bœuf, l'huile spermaceti ou l'huile de hareng.

Les silicates de magnésium et d'aluminium préférés mis en œuvre dans la formulation telle que définie précédemment, sont ceux commercialisés par la société
5 FUJI sous le nom NEUSILIN™ ; comme exemples de telles poudres de silicates, il y a le silicate de magnésium et d'aluminium NEUSILIN UFL 2™ ou le métasilicate d'aluminium et de magnésium NEUSILIN™ US 2.

Par ingrédients, on entend dans la définition de la formulation cosmétique et/ou pharmaceutique telle que définie précédemment, des excipients ou des principes actifs.

10 Comme exemples d'excipients qui peuvent être présents dans la formulation telle que définie précédemment, il y a les tensioactifs tels que les esters de sorbitan, les esters de sorbitan éthoxylés, les éthers de sucres, tels que les éthers de lactose, de saccharose, de xylose, de glucose, les alcools gras éthoxylés, les acides gras et leurs sels, les acides
15 gras éthoxylés, les esters de polyglycérols, les copolymères d'oxyde de propylène et d'oxyde d'éthylène, les phospholipides ou lécithines, les acylâts à chaîne grasse d'acides aminés, les triglycérides d'origine végétale ou synthétique et leurs dérivés éthoxylés, les monoglycérides acétylés, le lauryl sulfate de sodium et ses dérivés ou encore l'acide taurocholique et ses dérivés. Parmi les tensioactifs cités ci-dessus, il y a
20 plus particulièrement le monooléate de sorbitan, (HLB = 4,3), commercialisé sous le nom de marque MONTANE™ 80, l'isostéarate de sorbitan commercialisé par la demanderesse sous le nom MONTANE™ 70, l'oléate de sorbitan éthoxylé avec 5 moles d'oxyde d'éthylène (5 OE) commercialisé par la demanderesse sous le nom MONTANOX™ 81, l'alcool oléocétylique diéthoxylé (2 OE), commercialisé par la
25 demanderesse sous le nom SIMULSOL™ OC 72, le sesquioléate de sorbitan commercialisé par la demanderesse sous le nom MONTANE™ 83, le monooléate de sorbitan eicosaéthoxylé (nombre de moles d'OE = 20 ; HLB = 15 ; liquide à température ambiante), commercialisé par exemple sous le nom de marque MONTANOX™ 80, le trioléate de sorbitan eicosaéthoxylé (nombre de moles d'OE =
30 20 ; HLB = 12 ; liquide à température ambiante), commercialisé par exemple sous le nom de marque MONTANOX™ 85, le monolaurate de sorbitan eicosaéthoxylé (nombre de moles d'OE = 20 ; HLB = 15 ; liquide à température ambiante), commercialisé par exemple sous le nom de marque MONTANOX™ 20, l'alcool laurique tricosaeéthoxylé (nombre de moles d'OE = 23 ; HLB = 16,9 ; cire à température

ambiante), commercialisé par exemple sous le nom de marque SIMULSOL™ P23, l'huile de ricin hydrogénée pentacosaéthoxylée (nombre de mole d'OE = 25 ; HLB = 12 ; liquide visqueux à température ambiante), commercialisé par exemple sous le nom de marque SIMULSOL™ 1292, l'huile de ricin hydrogénée tétracontaéthoxylée (nombre
5 de moles d'OE = 40 ; HLB 14, liquide pâteux à température ambiante), commercialisé par exemple sous le nom de marque SIMULSOL™ 4000 ou SIMULSOL™ 1293, l'huile de ricin hexacontaéthoxylée (nombre de moles d'OE = 60 ; HLB = 14 ; liquide pâteux à température ambiante), commercialisé par exemple sous le nom de marque SIMULSOL™ 1285, l'acide oléique décaéthoxylée (nombre de mole d'OE = 10 ; HLB
10 = 13 ; liquide à température ambiante), commercialisé par exemple sous le nom de marque SIMULSOL™ 2599.

Comme exemples d'excipients qui peuvent être présents dans la formulation telle que définie précédemment, il y a aussi les solvants comme l'eau ou les hydrotropes, tels que par exemple le glycérol, les glycols comme l'hexylène glycol ou les huiles
15 minérales ou végétales topiquement acceptables ou les alcools légers comme l'éthanol.

Comme exemples d'excipients qui peuvent être présents dans la formulation telle que définie précédemment, il y a aussi, les huiles minérales, les huiles végétales, les huiles végétales éthoxylées, les huiles animales ou les huiles de synthèse.

Comme huiles d'origine végétale, il y a par exemple l'huile d'amandes douces,
20 l'huile de coprah, l'huile de ricin, l'huile de jojoba, l'huile d'olive, l'huile de colza, l'huile d'arachide, l'huile de tournesol, l'huile de germes de blé, l'huile de germes de maïs, l'huile de soja, l'huile de coton, l'huile de luzerne, l'huile de pavot, l'huile de potiron, l'huile d'onagre, l'huile de millet, l'huile d'orge, l'huile de seigle, l'huile de carthame, l'huile de bancoulier, l'huile de passiflore, l'huile de noisette, l'huile de palme, le beurre
25 de karité, l'huile de noyau d'abricot, l'huile de calophyllum, l'huile de sysymbrium, l'huile d'avocat, l'huile de calendula, les huiles issues de fleurs ou de légumes.

Comme huile d'origine animale, il y a par exemple le squalène ou le squalane.

Comme huile minérale, il y a par exemple les paraffines, les isoparaffines, les huiles blanches minérales, telles que l'huile de paraffine, l'huile de vaseline et les
30 isoparaffines ;

Comme huiles synthétiques, il y a notamment les esters d'acides gras tels que le myristate de butyle, le myristate de propyle, le myristate de cétyle, le palmitate d'isopropyle, le stéarate de butyle, le stéarate d'hexadécyle, le stéarate d'isopropyle, le

stéarate d'octyle, le stéarate d'isocétyle, l'oléate dodécyle, le laurate d'hexyle, le dicaprylate de propylèneglycol, les esters dérivés d'acide lanolique, tels que le lanolate d'isopropyle, le lanolate d'isocétyle, les monoglycérides, diglycérides et triglycérides d'acides gras comme le triheptanoate de glycérol, les alkylbenzoates, les polyalphaoléfines, les polyoléfines comme le polyisobutène, les isoalcane de synthèse comme l'isohexadecane, l'isododécane, les huiles perfluorées et les huiles de silicone. Parmi ces dernières, on peut plus particulièrement citer les diméthylpolysiloxanes, méthylphénylpolysiloxanes, les silicones modifiés par des amines, les silicones modifiés par des acides gras, les silicones modifiés par des alcools, les silicones modifiés par des alcools et des acides gras, des silicones modifiés par des groupements polyéther, des silicones époxy modifiés, des silicones modifiés par des groupements fluorés, des silicones cycliques et des silicones modifiés par des groupements alkyles.

Comme exemples d'excipients qui peuvent être présents dans la formulation telle que définie précédemment, il y a aussi les alcools gras ou les acides gras.

Comme exemples d'excipients qui peuvent être présents dans la formulation telle que définie précédemment, il y a aussi les homopolymères ou copolymères de l'acide acrylique ou de dérivés de l'acide acrylique, les homopolymères ou copolymères de l'acrylamide, les homopolymères ou copolymères de dérivés de l'acrylamide, les homopolymères ou copolymères de l'acide acrylamidométhyl propanesulfonique, de monomère vinylique, de chlorure de triméthylaminoéthylacrylate, les hydrocolloïdes d'origine végétale ou biosynthétique comme par exemple la gomme de xanthane, la gomme de karaya, les carraghénates, les alginates ; les silicates ; la cellulose et ses dérivés ; l'amidon et ses dérivés hydrophiles ; les polyuréthanes. Comme exemples de tels excipients commerciaux il y a le CARBOPOL™ l'ULTREZ™ 10, le PEMULEN™ TR1, le PEMULEN™ TR2, le SIMULGEL™ A, le SIMULGEL™ NS, le SIMULGEL™ EPG, le SIMULGEL™ EG, le LUVIGEL™ EM, le SALCARE™ SC 91, le SALCARE™ SC 92, le SALCARE™ SC 95, le SALCARE™ SC 96, le FLOCARE™ ET 100, l'HISPAGEL™, le SEPIGEL™ 305, le SEPIGEL™ 501, le SEPIGEL™ 502, le SEPIPLUS™ 400, le SEPINOV™, le FLOCARE™ ET 58, le STABILEZE™ 06 ; le NOVEMER™ EC 1, l'ARISTOFLEX™ AVC, l'ARISTOFLEX HMB, le RAPITHIX™ A60, le RAPITHIX™ A100 ou le COSMEDIA™ SP.

Comme exemples d'excipients qui peuvent être présents dans la formulation telle que définie précédemment, il y a aussi les cires telles que la cire d'abeille, la cire de

Carnauba, la cire de Candelilla, la cire d'Ouricoury, la cire du Japon, la cire de fibre de liège ou de canne à sucre, les cires de paraffines, les cires de lignite, les cires microcristallines, la cire de lanoline, l'ozokérite, la cire de polyéthylène, les huiles hydrogénées, les cires de silicone, les cires végétales, les alcools gras et les acides gras solides à température ambiante, les glycérides solides à température ambiante.

Comme exemples d'excipients qui peuvent être présents dans la formulation telle que définie précédemment, il y a aussi les acides gras, les acides gras éthoxylés, les esters d'acide gras et de sorbitol, les esters d'acides gras éthoxylés, les polysorbates, les esters de polyglycérol, les alcools gras éthoxylés, les esters de sucrose, les alkylpolyglycosides, les alcools gras sulfatés et phosphatés ou les mélanges d'alkylpolyglycosides et d'alcools gras décrits dans les demandes de brevet français 2 668 080, 2 734 496, 2 756 195, 2 762 317, 2 784 680, 2 784 904, 2 791 565, 2 790 977, 2 807 435 et 2 804 432, tels que le SENSANOV™, le FLUIDANOV™ ou l'EASYNOV™.

Comme exemples de principes actifs qui peuvent être présents dans la formulation telle que définie précédemment, il y a les actifs connus pour leur action, oxygénante, antirides, décontractante, émolliente, antipelliculaire, séborégulatrice, purifiante, apaisante, relaxante, décontractante, antistress, éclaircissante, dépigmentante ou pro-pigmentante, neuromodulatrice ou immunomodulatrice ; les actifs ayant une action amincissante comme par exemple la caféine ou ses dérivés, les actifs améliorant la microcirculation cutanée comme par exemple les veinotoniques, les actifs drainants ; les actifs à visée décongestionnante notamment au niveau des poches ; les actifs ayant une activité anti-microbienne ou les dérivés de cuivre ou de zinc ou l'octopirox ou le Sensiva™ SC50 ; les actifs ayant une propriété énergisante ou stimulante comme le Physiogényl™, les actifs favorisant l'oxygénation, les actifs favorisant le métabolisme des mitochondries, le panthénol et ses dérivés ; les actifs connus pour une activité anti-âge comme par exemple le Sepivinol™, le Sepivital™, le Manoliva™, le Phyto age™ ; les actifs hydratants ; les actifs anti-age ciblés "anti-photo vieillissement" ; les actifs ciblés protecteurs de l'intégrité de la jonction dermo-épidermique ; les actifs augmentant la synthèse des composants de la matrice extracellulaire, comme par exemple le collagène, les élastines ou les glycosaminoglycanes ; les actifs à visée restructurante ; les actifs à visée cicatrisante ; les actifs à visée raffermissante ; les actifs à visée « botox like » ; les actifs à visée « surgery like » ; les actifs à visée « laser

like » ; les actifs agissant sur les rides d'expression ; les actifs agissant sur les canaux calciques ; les actifs présentant une action neuromodulatrice bénéfique sur le vieillissement ; les actifs améliorant l'intégrité de la barrière cutanée ; les actifs agissant sur des enzymes cutanées spécifiques ; les actifs agissant sur des récepteurs cellulaires spécifiques ; les actifs agissant sur le métabolisme des mitochondries ; les actifs agissant sur le champ magnétique cutané ; les actifs protecteurs des ondes magnétiques ; les actifs améliorant la communication cellulaire ; les actifs à visée anti-radicalaire ou anti-oxydante, par exemple les superoxydes dismutases, les catalases, les peroxydases, le coenzyme Q10, les vitamines, les caroténoïdes, l'acide lipoïque, les minéraux, les polyphénols, le glutathion ; les actifs à visée « tenseur » ; les actifs à visée antipelliculaire, anti-acnéique, apaisante, neuromodulatrice, anti-Substance P, anti-allergique, antidouleur, anti-stress, anti-rougeur, immunomodulatrice ; les actifs, molécules ou enzymes connues pour leur action amincissante, drainante ou modulatrice de la circulation ; les actifs favorisant l'élimination des graisses ; les actifs favorisant le métabolisme de la mitochondrie ; les actifs limitant l'entrée du glucose ou des acides gras dans les adipocytes, les actifs favorisant la lipolyse ; les actifs inhibant la lipogénèse ; les actifs inhibant la différenciation des adipocytes ; les actifs agissant sur l'angiogénèse ; les actifs agissant sur les canaux à glycérol ; les actifs limitant le stockage des graisses et favorisant leur élimination ; les actifs agissant sur l'affinement du grain de peau comme l'Actisculp™, la Biosculptine™, Remoduline™, l'Isoslim Complex™, Sveltine™, Slimfit™, Sveltonyl™, Unislim™, Lipocare™, PleurimincyI™, Phytocal SL™ ou Cyclolipase™ ; les filtres solaires par exemple, ceux figurant dans la directive cosmétique 76/768/CEE modifiée annexe VII, tels que les filtres solaires lipophiles, comme l'octocrylène, l'etocrylène, l'homosalate comme l'EUSOLEX™ HMS, le paraméthoxy cinnamate d'éthyle hexyle comme le PARSOL™ MCX encore appelé l'octinoxate, l'octisalate, l'avobenzone, la benzophénone-1, la benzophénone-2, la benzophénone-3 comme l'UVINUL M-40 encore appelé oxybenzone, la benzophénone-8, la benzophénone-12, l'éthyl dihydroxypropyl PABA, le glycéryl PABA, l'éthylhexyl diméthyl PABA, l'anthranilate de menthyle, le 3-benzylidene camphor, le 4-méthylbenzylidene camphor ou l'isopropyl dibenzoyl méthane ; les écrans solaires tels que par exemple le dioxyde de titane, l'oxyde de zinc, les filtres hydrosolubles tels que les dérivés de l'acide phénylbenzimidazole sulfonique, la benzophénone-4, le salicylate de TEA, le PABA et le méthoxycinnamate de DEA ou

encore les filtres solaires encapsulés tels que le SILASOMA™ commercialisé par la société SEIWA KASEI ou l'UV PEARL™ commercialisée par la société MERCK.

Comme autres exemples de principes actifs connus, il y a l'arbutine, l'acide kojique, l'hydroquinone, l'acide ellagique, la vitamine C et ses dérivés, le Stay™ C, le magnésium ascorbyl phosphate et ses dérivés, l'ascorbyl glucoside, l'acide phytique, les acides de fruits, le rucinol ou résorcinol, l'acide azélaïque, l'acide lipoïque, le Vegewhite™, la Gatuline™, le Synerlight™, le Biowhite™, le Phytolight™, le Dermalight™, la Clariskin™, le Melaslow™, le Dermawhite™, l'Ethioline™, le Melarest™, le Gigawhite™, l'Albatine™, le Lumiskin™, les extraits de polyphénols, les extraits de raisin, les extraits de pin, les extraits de vin, les extraits d'olives, les extraits de thé, les extraits de cacao, les extraits végétaux de la forêt amazonienne, les extraits de légumes, les extraits de fleurs, les extraits de fruits, les extraits de marc, les acides aminés, les peptides comme par exemple l'Agireline™, les hydrolysats totaux de protéines, les hydrolysats partiels de protéines, les polyols (comme par exemple, la glycérine, le butylène glycol ...), les dérivés de lait, les structures associant un sucre et un polyol comme par exemple l'Aquaxyl™, l'urée, l'acide pyrrolidonecarboxylique ou les dérivés de cet acide, l'acide glycyrrhétinique, l'alpha-bisabolol, les sucres ou les dérivés des sucres, les polysaccharides ou leurs dérivés, les hydroxyacides comme par exemple l'acide lactique, l'acide salicylique, les vitamines, les dérivés de vitamines comme par exemple le Rétinol ou l'Extramel™ C, les dérivés du rétinol, la vitamine E et ses dérivés, les minéraux, les oligo-éléments, les extraits de roches ou pierres, les enzymes ou leurs dérivés, les co-enzymes ou leur dérivés, comme, le Coenzyme Q10, les hormones ou "hormone like" comme par exemple le Phyto age™, les extraits de soja comme par exemple, la Raffermine™, les extraits de blé comme par exemple la Tensine™ ou la Gliadine™, les extraits de Sésame comme par exemple le Sesaflash™, la carnitine et ses dérivés, la taurine et ses dérivés, la caféine et ses dérivés, la théine et ses dérivés, les extraits végétaux comme par exemple le Myoxinol™ LS9736, les extraits végétaux riches en tanins, les extraits riches en isoflavones ou les extraits riches en terpènes, les extraits d'algues d'eau douce ou marines, les extraits marins en général dont les coraux, les cires essentielles, les extraits bactériens, les minéraux comme par exemple la gamme des Givobio™ et notamment les dérivés de calcium, de magnésium, de cuivre, de cobalt, de zinc, de manganèse, les lipides tels que les céramides ou les phospholipides ainsi que les dérivés.

Parmi les principes actifs qui peuvent être présents dans la formulation cosmétique et/ou pharmaceutique telle que définie précédemment, il y a aussi les extraits naturels de plantes, comme les extraits de thé, les extraits de cannelle ou de nénuphar.

5 Selon un mode particulier, la présente invention a pour objet une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique, caractérisée en ce qu'elle comprend pour 100% de sa masse :

de 0,1% à 5% massique d'un composé de formule (I) :

telle que définie précédemment,

10 de 1% à 10% massique de silicates de magnésium et d'aluminium ;

et jusqu'à 85% massique d'un ou plusieurs ingrédients topiquement acceptables.

Selon un autre mode particulier de la présente invention, la formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique comprend pour 100% de sa masse :

de 1% à 5% massique d'un composé de formule (I) :

15 telle que définie précédemment,

de 2% à 5% massique de silicates de magnésium et d'aluminium ;

et jusqu'à 90% massique d'un ou plusieurs ingrédients topiquement acceptables.

Selon un autre aspect de la présente invention, celle-ci a pour objet l'utilisation comme agent déodorant, de silicate de magnésium et d'aluminium, dans une formulation
20 topique cosmétique et/ou pharmaceutique comprenant entre 0,05% à 10% massique, plus particulièrement de 0,1% à 5% massique et tout particulièrement de 1% à 5% massique d'au moins un composé de formule (I) telle que définie précédemment.

Selon un dernier aspect de la présente invention, celle-ci a pour objet un procédé pour réduire l'odeur induite par la présence d'un composé de formule (I) telle que
25 définie précédemment, dans une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique en comprenant entre 0,05% à 10% massique, plus particulièrement de 0,1% à 5% massique et tout particulièrement de 1% à 5% massique caractérisé en ce que l'on incorpore dans ladite formulation, de 0,1% à 20% de sa masse totale, plus particulièrement de 1% à 10% de sa masse totale et tout particulièrement de 2% à 5% de
30 sa masse totale de silicate de magnésium et d'aluminium.

Les exemples suivants illustrent l'invention sans toutefois la limiter.

Exemple 1 : Evaluation de la réduction de l'odeur d'une formulation contenant les dérivés N-palmitoyl d'hydrolysats totaux de protéine de blé

(1) - Préparation des formulations

- 5 On prépare les émulsions huile dans eau simples suivantes (les proportions en constituants sont exprimés en pourcentages massiques) :

		Emulsion (I) (invention)	Emulsion (II) ² (Etat de la technique)	Emulsion (III) Témoin sans composé de formule (I)
Phase A	Cire de Lanol CTO™	5,0%	5,0%	5,0%
	LANOL™ 1688	20,0%	20,0%	20,0%
	DEEPALINE™ PVB	1,0%	1,0%	0
	NEUSILIN™ UF L2	3,0%	0	0
Phase B	ULTREZ™ 10	0,1%	0,1%	0,1%
	Eau	Q.S.P. 100%	Q.S.P. 100%	Q.S.P. 100%
Phase C	SEPICIDE™ HB	0,3%	0,3%	0,3%
	SEPICIDE™ CI	0,2%	0,2%	0,2%
	Triéthanolamine	Q.S.P. pH = 7	Q.S.P. pH = 7	Q.S.P. pH = 7
	PH	7,1	6,8	7,0
	Viscosité (Brookfield RVT ; M 4: V6 :	28400 mPas	40200 mPas	39400 mPas
	Stabilité à 20°C	Stable après un mois de stockage	Stable après un mois de stockage	Stable après un mois de stockage
	Stabilité à 45°C	Stable après un mois de stockage	Déphase après un mois de stockage	Déphase après un mois de stockage

Cire de LANOL CTO™ : Cire à base d'alcool cétéarylique et de cétéareth 33

LANOL™ 1688 : octanoate de cétéaryle

DEEPALINE™ PVB : hydrolysât total de protéine de blé N-palmitoylé

NEUSILIN™ UF L2 : Poudre de silicate mixte amorphe d'aluminium et de magnésium

5 SEPICIDE™ HB : mélange de phénoxyéthanol, de méthyl paraben, d'éthyl paraben, de propyl paraben et de butyl paraben ;

SEPICIDE™ CI : imidazolidyl urée

ULTREZ™ 10 : homopolymère de l'acide acrylique

Mode opératoire :

10 Préparation de la phase B : On disperse l'ULTREZ™ 10 dans l'eau sous agitation puis on chauffe cette phase à 75°C ;

Préparation de la phase A : On mélange la cire de LANOL CTO™ et le LANOL™ 1688, on chauffe à 75°C, puis on ajoute au mélange la DEEPALINE™ PVB et le NEUSILIN™ UF L2.

15 On verse la phase B dans la phase A en mélangeant pour rendre le tout homogène

On laisse refroidir sous agitation puis on verse la phase C préparée par mélange de ses constituants.

(2) - Evaluation de l'odeur des formulations

20 Cette analyse sensorielle est réalisée avec un panel de sept experts entraînés à l'évaluation de l'odeur des lipoaminoacides, dans les deux situations suivantes :

(i) - Au débouché du flacon en verre : Cette évaluation est faite selon les recommandations de la norme AFNOR NF V 09 - 006. Les émulsions sont conditionnées dans des flacons en verre codés, en laissant une durée suffisante pour
25 permettre l'équilibre de tension de vapeur. Les échantillons sont conditionnés au moins 24 heures avant le début de l'essai sensoriel. L'expert ouvre les flacons l'un après l'autre et sent la phase vapeur afin d'en identifier le produit odorant.

(ii) - Lors de l'application sur la peau : L'émulsion est prélevée à l'aide d'une spatule doseuse puis déposée sur le dos de la main. L'émulsion est étalée
30 rapidement en mouvements circulaires sur le dos de la main en 5 secondes, puis l'expert évalue immédiatement l'odeur exhalée au niveau de la partie de la peau du dos de la main traitée.

L'intensité de l'odeur est évaluée sur une échelle de 0 à 5, 0 indiquant une absence d'odeur et 5 une très forte odeur en lipoaminoacide.

L'évaluation est réalisée 1 mois après la fabrication des émulsions, sur des échantillons stockés à 20°C et à 45 °C, (les émulsions déphasées à cette dernière
5 température, ayant été préalablement re-homogénéisées pour effectuer le test). Les résultats sont consignés dans le tableau suivant :

		Emulsion I	Emulsion II	Emulsion III
Après 1 mois de stockage à 20°C	Odeur au débouché	1	2	0
	Odeur sur la peau	2	4	0
Après 1 mois de stockage à 45°C	Odeur au débouché	1	2	0
	Odeur sur la peau	3	5	0

Ces résultats font apparaître que la présence de silicate d'aluminium et de
10 magnésium dans l'émulsion (I) selon l'invention, permet de réduire très significativement l'odeur boisée/moisie caractéristique de la DEEPALINE™ PVB.

Exemple 2 Evaluation de la réduction de l'odeur d'une formulation contenant de la N-undécylénoyl phénylalanine

15

(1) - Préparation des formulations

On prépare les émulsions huile dans eau simples suivantes (les proportions en constituants sont exprimés en pourcentages massiques) :

		Emulsion (IV) (invention)	Emulsion (V) (Etat de la technique)	Emulsion (VI) Témoin sans composé de formule (I)
Phase A	Cire de Lanol CTO™	5,0%	5,0%	5,0%
	LANOL™ 1688	20,0%	20,0%	20,0%
Phase B	SEPIWHITE™ MSH	2,0%	2,0%	0
	Triéthanolamine	Q.S.P. pH = 7	Q.S.P. pH = 7	Q.S.P. pH = 7
	Eau	Q.S.P. 100%	Q.S.P. 100%	Q.S.P. 100%
	ULTREZ™ 10	0,1%	0,1%	0,1%
	NEUSILIN™ UF L2	3,0%	0	0
Phase C	SEPICIDE™ HB	0,3%	0,3%	0,3%
	SEPICIDE™ CI	0,2%	0,2%	0,2%
	PH	7,1	6,7	7,0
	Viscosité (Brookfield RVT ; (Mobile 4: Vitesse 6)	9900 mPas	4580 mPas	39400 mPas
	Stabilité à 20°C	Stable après un mois de stockage	Déphase après un mois de stockage	Stable après un mois de stockage
	Stabilité à 45°C	Déphase après un mois de stockage	Déphase après un mois de stockage	Déphase après un mois de stockage

Cire de LANOL CTO™ : Cire à base d'alcool cétéarylique et de cétéareth 33

LANOL™ 1688 : octanoate de cétéaryle

5 SEPIWHITE™ MSH : N- undecylenoyl phenylalanine

NEUSILIN™ UF L2 : Poudre de silicate mixte amorphe d'aluminium et de magnésium

SEPICIDE™ HB : mélange de phénoxyéthanol, de méthyl paraben, d'éthyl paraben, de propyl paraben et de butyl paraben ;

SEPICIDE™ CI : imidazolidyl urée

ULTREZ™ 10 : homopolymère de l'acide acrylique

5 Mode opératoire :

Préparation de la phase B : On chauffe l'eau à 80°C puis on y ajoute le SEPIWHITE™ MSH, après solubilisation complète, on ajout à cette température le triéthanolamine, l' ULTREZ™ 10 puis le NEUSILIN™ UF L2.;

10 Préparation de la phase A : On mélange la cire de LANOL CTO™ et le LANOL™ 1688, on chauffe à 75°C ;

On verse la phase B dans la phase A en mélangeant pour rendre le tout homogène

On laisse refroidir sous agitation puis on verse la phase C préparée par mélange de ses constituants.

15 **(2) - Evaluation de l'odeur**

Cette analyse sensorielle est réalisée avec un panel de sept experts entraînés à l'évaluation de l'odeur des lipoaminoacides, dans les deux situations suivantes :

20 **(i) - Au débouché du flacon en verre :** cette évaluation est faite selon les recommandations de la norme AFNOR NF V 09 - 006. Les émulsions sont conditionnées dans des flacons en verre codés, en laissant une durée suffisante pour permettre l'équilibre de tension de vapeur. Les échantillons sont conditionnés au moins 24 heures avant le début de l'essai sensoriel. L'expert ouvre les flacons l'un après l'autre et sent la phase vapeur afin d'identifier le produit odorant.

25 **(ii) - Lors de l'application sur la peau :** L'émulsion est prélevée à l'aide d'une spatule doseuse puis déposée sur le dos de la main. L'émulsion est étalée rapidement en mouvements circulaires sur le dos de la main en 5 secondes, puis l'expert évalue immédiatement l'odeur exhalée au niveau de la partie de la peau du dos de la main traitée.

30 L'intensité de l'odeur est évaluée sur une échelle de 0 à 5, 0 indiquant une absence d'odeur et 5 une très forte odeur de lipoaminoacide.

L'évaluation est réalisée 1 mois après la fabrication des émulsions, sur des échantillons stockés à 20°C et à 45 °C (les émulsions déphasées à cette dernière

température, ayant été préalablement re-homogénéisées pour effectuer le test). Les résultats sont consignés dans le tableau suivant :

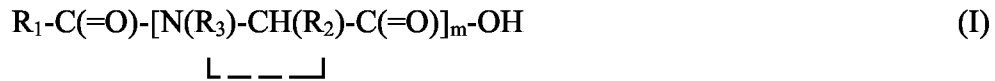
		Emulsion IV	Emulsion V	Emulsion VI
Après 1 mois de stockage à 20°C	Odeur au débouché	0,5	1	0
	Odeur sur la peau	1	2	0
Après 1 mois de stockage à 45°C	Odeur au débouché	0,8	1	0
	Odeur sur la peau	1	2	0

- 5 Ces résultats font apparaître que la présence de silicate d'aluminium et de magnésium dans la l'émulsion (IV) selon l'invention permet de réduire très significativement l'odeur piquante caractéristique du SEPIWHITE.

Revendications

1. Formulation topique, cosmétique et/ou pharmaceutique, caractérisée en ce qu'elle comprend pour 100 % de sa masse :

5 de 0,05% à 10% massique d'un composé de formule (I) :



10 ou d'un de ses sels, dans laquelle R_1 représente la chaîne caractérisante d'un acide gras, saturé ou insaturé, linéaire ou ramifié, comportant de 3 à 30 atomes de carbone, R_2 représente la chaîne caractérisante d'un acide aminé, R_3 représente un atome d'hydrogène, un radical méthyle ou bien R_3 constitue avec R_2 et N, la chaîne caractérisante d'un acide aminé cyclique, m est compris entre 1 et 50 ou d'un mélange
15 desdits composés de formule (I) ou de leurs sels ;

de 0,1% à 20% massique de silicate de magnésium et d'aluminium ;

et jusqu'à 70% massique d'un ou plusieurs ingrédients topiquement acceptables.

2. Formulation topique telle que définie à la revendication 1, pour laquelle dans la
20 formule (I), le groupe $R_1-C(=O)-$ comporte de 7 à 22 atomes de carbone.

3. Formulation topique telle que définie à l'une des revendications 1 ou 2, pour laquelle dans la formule (I), m est un nombre décimal compris entre 1 et 10 et est de préférence inférieur à 5.

25

4. Formulation topique telle que définie à l'une des revendications 1 ou 2, pour laquelle dans la formule (I), m égal à 1.

5. Formulation topique telle que définie à l'une des revendications 1 à 4,
30 caractérisée en ce qu'elle comprend pour 100 % de sa masse :

de 0,1% à 5% massique d'un composé de formule (I) :

telle que définie précédemment,

de 1% à 10% massique de silicates de magnésium et d'aluminium ;

et jusqu'à 85% massique d'un ou plusieurs ingrédients topiquement acceptables.

6. Formulation topique telle que définie à la revendication 5, caractérisée en ce qu'elle comprend pour 100 % de sa masse :

5 de 1% à 5% massique d'un composé de formule (I) :

telle que définie précédemment,

de 2% à 5% massique de silicates de magnésium et d'aluminium ;

et jusqu'à 90% massique d'un ou plusieurs ingrédients topiquement acceptables.

10 7. Utilisation comme agent déodorant, de silicate de magnésium et d'aluminium, dans une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique comprenant entre 0,05% à 10% massique, plus particulièrement de 0,1% à 5% massique et tout particulièrement de 1% à 5% massique d'au moins un composé de formule (I) telle que définie à l'une des revendications 1 à 6.

15

8. Procédé pour réduire l'odeur induite par la présence d'un composé de formule (I) telle que définie à l'une des revendications 1 à 6, dans une formulation topique cosmétique et/ou pharmaceutique en comprenant entre 0,05% à 10% massique, plus particulièrement de 0,1% à 5% massique et tout particulièrement de 1% à 5% massique
20 caractérisé en ce que l'on incorpore dans ladite formulation, de 0,1% à 20% de sa masse totale, plus particulièrement de 1% à 10% de sa masse totale et tout particulièrement de 2% à 5% de sa masse totale de silicate de magnésium et d'aluminium.