

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 812 540**

51 Int. Cl.:

A61K 8/27 (2006.01)
A61K 8/365 (2006.01)
A61K 8/368 (2006.01)
A61Q 15/00 (2006.01)
A61K 8/19 (2006.01)
C07C 63/08 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **13.11.2014 PCT/EP2014/074522**

87 Fecha y número de publicación internacional: **21.05.2015 WO15071374**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **13.11.2014 E 14798846 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **15.07.2020 EP 3068366**

54 Título: **Uso como agente desodorante de un derivado de ácido salicílico salificado, solo o en una mezcla**

30 Prioridad:
13.11.2013 FR 1361080

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
17.03.2021

73 Titular/es:
**L'OREAL (100.0%)
14 rue Royale
75008 Paris, FR**

72 Inventor/es:
**BROSSAT, MAUD y
TOURNIER-COUTURIER, LUCIE**

74 Agente/Representante:
SALVÀ FERRER, Joan

Observaciones:

Véase nota informativa (Remarks, Remarques o Bemerkungen) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

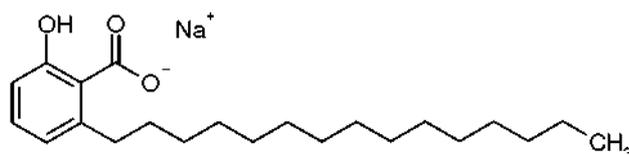
ES 2 812 540 T3

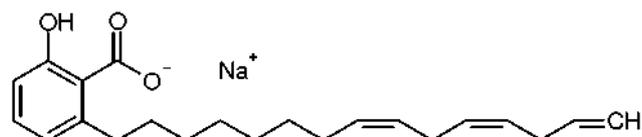
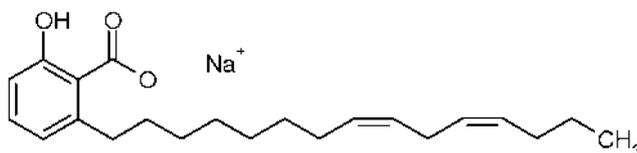
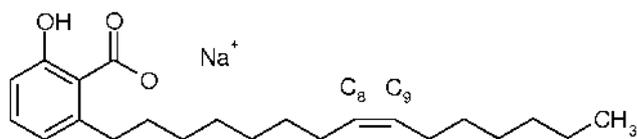
Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Uso como agente desodorante de un derivado de ácido salicílico salificado, solo o en una mezcla

- 5 **[0001]** La presente invención se refiere al uso de una mezcla de derivados de ácido salicílico salificado que tienen la fórmula (II) definida con más detalle en lo sucesivo, para tratar el olor corporal, en particular el olor de axila, particularmente en una composición que comprende un medio fisiológicamente aceptable.
- 10 **[0002]** La presente invención también describe novedosos derivados de ácido salicílico salificado que tienen la fórmula (IV) y (V) definida con más detalle en lo sucesivo y las composiciones que la contienen en un medio fisiológicamente aceptable.
- [0003]** La invención también se refiere a un procedimiento para tratar el olor corporal.
- 15 **[0004]** En el campo de la cosmética, es bien conocido el uso en la aplicación tópica de productos desodorantes que contienen sustancias activas de tipo antitranspirante o desodorante para reducir o eliminar el olor generalmente desagradable de las axilas.
- 20 **[0005]** El sudor ecrino o apocrino tiene un bajo olor cuando se secreta. Es la degradación de los mismos por bacterias a través de reacciones enzimáticas la que produce compuestos malolientes. La función de los agentes desodorantes es la de reducir o impedir la formación de olores desagradables.
- 25 **[0006]** Las sustancias desodorantes generalmente destruyen la flora bacteriana residente. De estas sustancias, las más utilizadas comúnmente son el triclosán (2,4,4'-tricloro-2'-hidroxidifeniléter) y el farnesol, que conllevan la desventaja de modificar la ecología de la flora de la piel de manera significativa. Existen sustancias que reducen el crecimiento bacteriano. De estas sustancias, se pueden mencionar los agentes quelantes de metales de transición, tales como EDTA o DPTA. Estos materiales privan al medio ambiente de los metales necesarios para el crecimiento bacteriano.
- 30 **[0007]** Por lo tanto, existe la necesidad de encontrar novedosos ingredientes adecuados para ser integrados en una formulación cosmética para tratar el olor corporal desagradable asociado con la transpiración humana, particularmente el olor de las axilas.
- 35 **[0008]** Sigue siendo necesario encontrar ingredientes activos novedosos que tengan una actividad desodorante mientras son fáciles de formular en composiciones para reducir la transpiración y/u olor, particularmente en seres humanos, y más particularmente para combatir el olor corporal, y más específicamente el olor de las axilas.
- 40 **[0009]** Algunos derivados de ácido salicílico tales como los descritos en la patente FR 2 581 542, las solicitudes WO97/15278 y WO 04/073745, en particular ácido n-octanoil-5-salicílico (o ácido capriloilsalicílico) fabricado bajo el nombre comercial MEXORYL SAB® por CHIMEX, se propusieron en las solicitudes WO2007/031117 y WO2007/111298 como agentes desodorantes. Sin embargo, la actividad desodorante de estos compuestos sigue siendo muy insuficiente.
- 45 **[0010]** En el artículo de Pharmaceutical Biology 2002, 40, 231-234), la mezcla de ácido anacárdico no salificado es conocida por su actividad antimicrobiana, particularmente con respecto a *C. xerosis*. Sin embargo, la actividad desodorante de dicha mezcla es baja.
- 50 **[0011]** Algunas sales de ácido 6-alkil- o 6-alkilen-salicílico y particularmente sales metálicas de ácido anacárdico se conocen en el documento J. Am. Mosquito Control Association 2009, 25, 386-389, en particular la siguiente mezcla de sales de ácido anacárdico

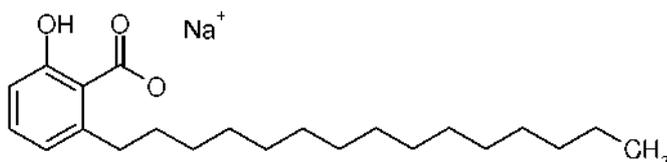




5 por sus propiedades insecticidas.

[0012] El documento Nature 1958, 182, 1299-1300 (medición de CMC y características de la actividad superficial, sin mencionar la aplicación sobre la piel) y el documento Phytotherapy Res. 1987, 1, 127-134 (inhibidor de la síntesis de PGE2), describen la siguiente sal de ácido 6-pentadecilsalicílico de sodio:

10



[0013] No se da ninguna indicación con respecto a la posibilidad de usar estos compuestos como un agente desodorante particularmente en una composición que comprende un medio fisiológicamente aceptable.

15

[0014] Algunas sales de 6-alkil o 6-alkilen-salicílico y particularmente sales metálicas o sales de aminoácidos de ácido anacárdico ya se han utilizado en composiciones cosméticas o dermatológicas tales como productos detergentes tales como champús, productos de fotoprotección, productos para el cuidado de la piel. Estos compuestos se utilizan particularmente por sus propiedades antibacterianas sus efectos fotoprotectores, sus efectos antioxidantes, sus propiedades antiinflamatorias, para tratar el acné. Este es el caso, por ejemplo, de las solicitudes de patente JP10001692, JP2010059070, JP10036887 (limpieza de la piel), JP10036884, JP10036883, JP10036244, JP10029918, JP09241675, JP07285826, JP06329536, JP06329526, JP06329516, JP06092837, JP03240721, JP03240718, JP04036238. No se da ninguna indicación con respecto a la posibilidad de usar estos compuestos como un agente desodorante particularmente en una composición que comprende un medio fisiológicamente aceptable.

25

[0015] Los inventores descubrieron sorprendentemente que los derivados de ácido salicílico salificado que tienen la fórmula (I) detallada en lo sucesivo, solos o en una mezcla, tenían una buena eficacia desodorante y podrían formularse fácilmente en un producto destinado a reducir el olor corporal, solo u opcionalmente en asociación con antitranspirantes o agentes desodorantes convencionales, sin los inconvenientes mencionados anteriormente.

30

[0016] Como tal, la invención es como se describe en las reivindicaciones.

[0017] Se refiere al uso de compuestos que tienen la fórmula (II), descrita con más detalle en lo sucesivo, en una mezcla, como un agente desodorante particularmente en una composición que comprende un medio fisiológicamente aceptable.

35

[0018] La presente invención también describe compuestos novedosos que tienen la fórmula (IV) o (V) descrita con más detalle en lo sucesivo.

40

[0019] La presente invención también describe una composición que comprende en un medio fisiológicamente aceptable al menos un compuesto o mezcla de compuestos que tienen la fórmula (IV) o (V) descrita en detalle en lo sucesivo.

45

[0020] La presente invención también se refiere a una composición que comprende en un medio fisiológicamente aceptable una mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II) en asociación con al menos un agente

antitranspirante y/o al menos un agente desodorante adicional.

[0021] La presente invención también se refiere a un procedimiento cosmético para tratar el olor corporal, particularmente el olor de axila, que consiste en aplicar en la superficie de un material de queratina humana una composición tal como se definió anteriormente.

[0022] El objeto adicional de la invención se describe en lo sucesivo. La invención se describe con más detalle en lo sucesivo.

[0023] Según la presente invención, el término "medio fisiológicamente aceptable" indica un medio adecuado para administrar una composición por vía tópica. Un medio fisiológicamente aceptable es preferentemente un medio cosmético o dermatológicamente aceptable, es decir, sin olor, o aspecto desagradable, y que es perfectamente compatible con la vía de administración tópica. En el presente caso en el que se pretende que la composición se administre por vía tópica, es decir, aplicándola sobre la superficie del material de queratina en cuestión, se considera en particular que un medio de este tipo es fisiológicamente aceptable cuando no da lugar a escozor, tirantez o enrojecimiento inaceptable para el usuario.

[0024] El término "agente desodorante" indica en el contexto de la presente invención cualquier agente, solo, con el efecto de enmascarar, absorber, mejorar y/o reducir el olor desagradable resultante de la descomposición del sudor humano. El significado de sustancia activa y agente desodorante es equivalente según la presente invención.

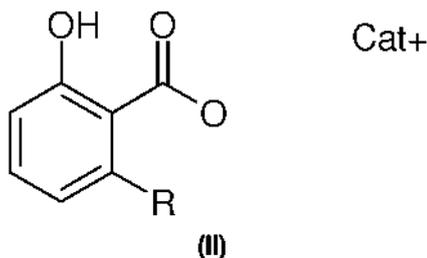
[0025] El término "agente antitranspirante" indica cualquier sustancia, sola, con el efecto de reducir el flujo de sudor, reducir la sensación húmeda en la piel asociada con el sudor humano, enmascarando el sudor humano. El significado de sustancia activa y agente antitranspirante es equivalente según la presente invención.

[0026] El término "material de queratina humana" indica en la presente invención piel (cuerpo, cara, contorno de ojos), apéndices de piel particularmente cabello, pestañas, cejas y uñas, y más particularmente piel.

DERIVADOS DE ÁCIDO SALICÍLICO SALIFICADO

a) Definiciones

[0027] Los derivados de ácido salicílico salificado según la invención, utilizados en una mezcla, se eligen entre aquellos que cumplen con la siguiente fórmula (II), junto con sus formas tautoméricas, sus isómeros ópticos, sus isómeros geométricos y sus solvatos tales como hidratos:



donde

R indica un radical hidrocarburo saturado o insaturado lineal o ramificado que comprende de 12 a 20 átomos de carbono, donde dicho radical R puede comprender una o una pluralidad de insaturaciones de etileno (del tipo de doble enlace) y Cat+ representa un catión o una mezcla de cationes, orgánicos o inorgánicos, que opcionalmente son + o 2+, independientemente de la carga catiónica y adecuados para obtener la electroneutralidad del compuesto o mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II).

[0028] Según la invención, se utiliza una mezcla de al menos 4 compuestos que tienen la fórmula (II), compuestos indicados (IIA), (IIB) (IIC), (IID), donde:

- 50 - los radicales R de cada uno de los compuestos (IIA), (IIB), (IIC), (IID) indican un radical hidrocarburo lineal que comprende de 12 a 18 átomos de carbono, y preferentemente que tiene el mismo número de átomos de carbono para cada uno de los compuestos (IIA), (IIB), (IIC), (IID):
 - el compuesto (IIA), que tiene un radical saturado R; y
 - el compuesto (IIB), que tiene un radical R monoinsaturado; y
 - 55 - el compuesto (IIC), que tiene un radical R diinsaturado; y
 - el compuesto (IID), que tiene un radical R triinsaturado; y
 - Cat+ que tiene el mismo significado para cada uno de los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID).

[0029] Particularmente preferentemente, R indica un radical hidrocarburo C₁₄-C₁₆ lineal saturado o insaturado.

[0030] Ventajosamente, el catión Cat⁺ se elige de modo que el compuesto que tiene la fórmula (II) sea fisiológicamente aceptable.

[0031] Según la presente invención, la expresión "compuesto fisiológicamente aceptable que tiene la fórmula (II)" indica cualquier compuesto que tiene la fórmula (II) adecuado para administrar una composición que lo contiene por vía tópica.

10

[0032] De los cationes inorgánicos Cat⁺, se pueden mencionar metales alcalinos tales como sodio (Na⁺), potasio (K⁺); metales alcalinotérreos tales como calcio (Ca²⁺), estroncio (Sr²⁺) y magnesio (Mg²⁺); metales de transición tales como cobre (Cu²⁺), hierro (Fe²⁺) y manganeso (Mn²⁺).

15 **[0033]** De los cationes orgánicos Cat⁺, se pueden mencionar la forma catiónica de aminas o amonios cuaternarios y, más particularmente, la forma catiónica de trietanolamina, monoetanolamina, dietanolamina, hexadecilamina, N,N,N',N'-tetrakis-(hidroxipropil-2) etileno di-amina y tris-hidroximetil aminometano.

20 **[0034]** Según una forma particular de la invención, el catión Cat⁺ es la forma catiónica de un aminoácido de forma L o D, tal como, por ejemplo, la forma catiónica de lisina, arginina, alanina, triptófano o un N⁺R₁R₂R₃-L-CO₂H de amonio cuaternario, donde R₁, R₂, R₃, idénticos o diferentes, indican un radical alquilo saturado lineal que comprende de 1 a 12 átomos de carbono y L indica un radical hidrocarburo lineal saturado divalente que comprende de 2 a 6 átomos de carbono.

25 **[0035]** Ventajosamente en una realización, el catión inorgánico Cat⁺ indica Mg²⁺, Zn²⁺ o Cu²⁺.

[0036] Ventajosamente en una realización, el catión Cat⁺ indica Na⁺.

30 **[0037]** Ventajosamente en una realización, el catión orgánico Cat⁺ indica la forma catiónica de trietanolamina, monoetanolamina o dietanolamina,

[0038] Ventajosamente en una realización, el catión orgánico Cat⁺ indica la forma catiónica de un aminoácido elegido entre lisina, arginina, alanina o triptófano.

35 **[0039]** Ventajosamente, según una realización adicional, el catión Cat⁺ indica la forma catiónica de lisina.

[0040] Más preferentemente, se utiliza una mezcla de compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID) tal como se definió anteriormente, donde:

40 - la proporción del compuesto (IIA) varía del 0,001 al 5 %,
 - la proporción del compuesto (IIB) varía del 20 al 45 %,
 - la proporción del compuesto (IIC) varía del 5 al 35 %,
 - la proporción del compuesto (IID) varía del 25 al 50 %, siendo los porcentajes en masa en relación con la masa total de la mezcla de compuestos (IIA), (IIB) (IIC) y (IID).

45

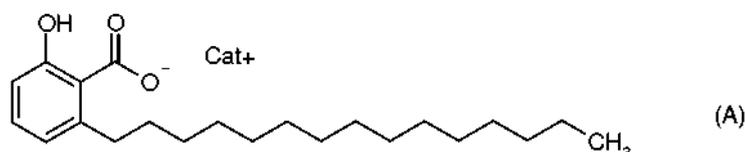
[0041] Preferentemente, se utiliza una mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II), donde:

- la proporción del compuesto (IIA) varía del 0,5 al 1 %,
 - la proporción del compuesto (IIB) varía del 30 al 35 %,
 50 - la proporción del compuesto (IIC) varía del 15 al 25 %, la proporción del compuesto (IID) varía del 35 al 40 %, siendo los porcentajes en masa en relación con la masa total de la mezcla de compuestos (IIA), (IIB) (IIC) y (IID)

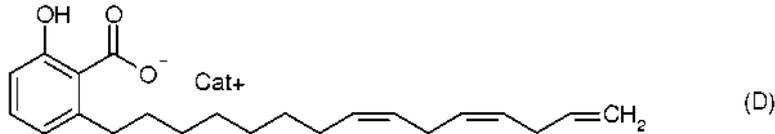
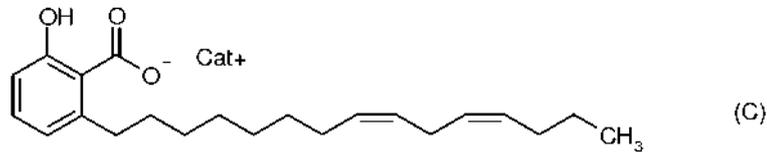
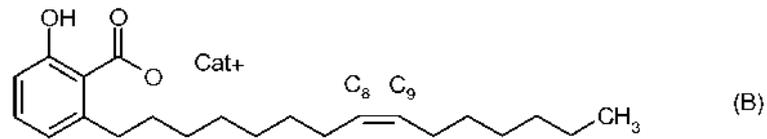
[0042] Según una realización particularmente preferida de la invención, se utiliza una mezcla de compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID), donde R indica un radical hidrocarburo que tiene 15 átomos de carbono.

55

[0043] Según una forma particularmente preferida de la invención, los siguientes compuestos (A), (B), (C) y (D) se utilizan en una mezcla:



60



teniendo Cat+ el significado dado anteriormente.

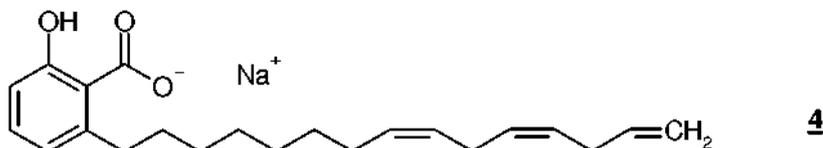
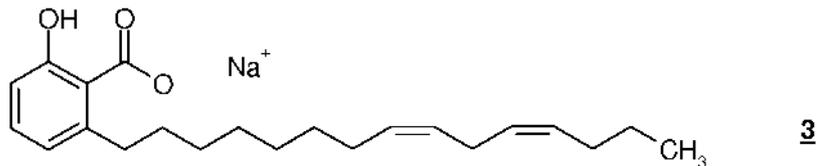
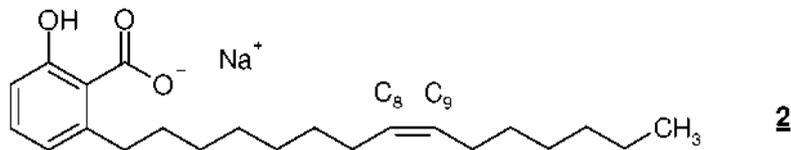
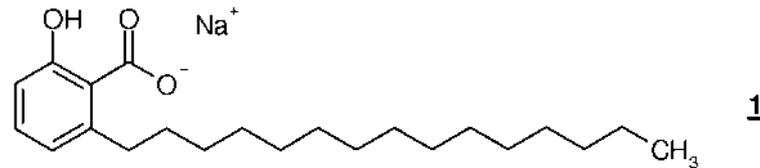
[0044] Particularmente preferentemente, se utiliza una mezcla específica de compuestos (A), (B), (C) y (D),
10 donde:

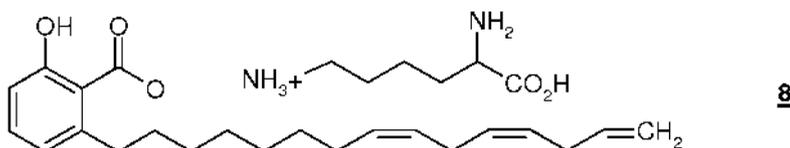
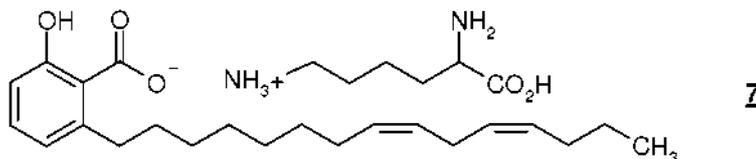
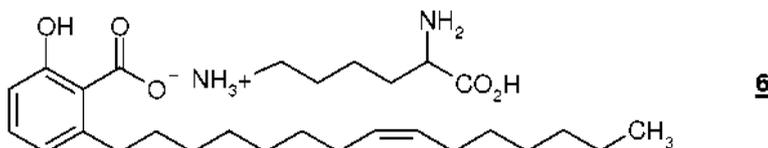
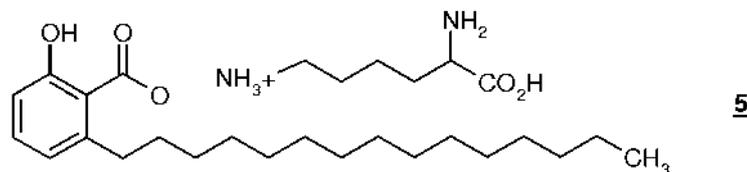
- la proporción del compuesto (A) varía del 0,001 al 5 %,
- la proporción del compuesto (B) varía del 20 al 45 %,
- la proporción del compuesto (C) varía del 5 al 35 %,
- 15 - la proporción del compuesto (D) varía del 25 al 50 %, siendo los porcentajes en masa en relación con la masa total de la mezcla de compuestos (A), (B), (C) y (D).

[0045] Preferentemente,

- 20 - la proporción del compuesto (A) varía del 0,5 al 1 %,
- la proporción del compuesto (B) varía del 30 al 35 %,
- la proporción del compuesto (C) varía del 15 al 25%,
- la proporción del compuesto (D) varía del 35 al 40 %.

25 **[0046]** Según una realización particularmente preferida de la invención, de los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID), se utilizarán los siguientes compuestos **1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8**, en una mezcla:





5

10 **[0047]** Ventajosamente, de los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID), se utilizará una mezcla de los compuestos 1, 2, 3 y 4, particularmente en las proporciones dadas anteriormente para los compuestos (A), (B), (C) y (D) respectivamente, e incluso más preferentemente una mezcla que comprende 5 % en masa del compuesto 1, 35 % del compuesto 2, 23 % en masa del compuesto 3 y 37 % en masa del compuesto 4.

15 **[0048]** Según una realización adicional, de los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID), se utilizará una mezcla de los compuestos 5, 6, 7 y 8, particularmente en las proporciones descritas anteriormente para los compuestos (A), (B), (C) y (D) respectivamente, e incluso más preferentemente una mezcla que comprende 5 % en masa del compuesto 5, 35 % del compuesto 6, 23 % en masa del compuesto 7 y 37 % en masa del compuesto 8.

20 **[0049]** El compuesto o compuestos que tienen la fórmula (II) están preferentemente presentes en cantidades que varían del 0,01 al 10 % en masa y más preferentemente del 0,02 al 5 % en masa en relación con la masa total de la composición.

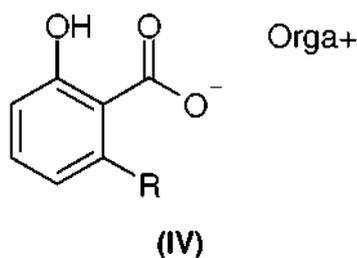
b) Novedosos compuestos

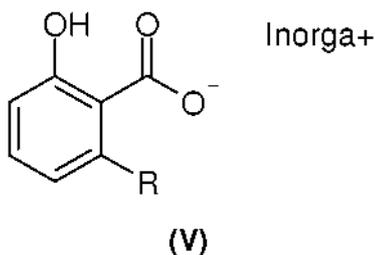
25

[0050] Se describen algunos compuestos que tienen la fórmula (II).

[0051] Los compuestos que tienen las siguientes fórmulas (IV) y (V) se describen junto con sus formas tautoméricas, sus isómeros ópticos, sus isómeros geométricos y sus solvatos:

30





donde R indica un radical hidrocarburo lineal o ramificado que tiene de 12 a 20 átomos de carbono (C₁₂-C₂₀), que está saturado o insaturado (una o una pluralidad de insaturaciones de etileno), y

5

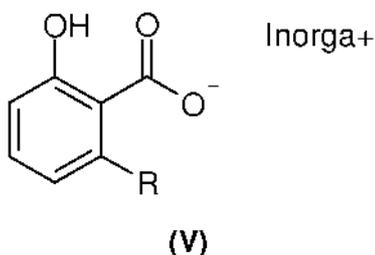
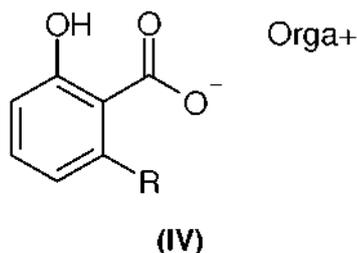
- Orga+ representa un catión orgánico elegido entre la forma catiónica de monoetanolamina, dietanolamina, hexadecilamina, N,N,N',N'-tetrakis-(hidroxipropil-2)etileno di-amina o tris-hidroximetil aminometano, alanina o triptófano, N⁺R₁R₂R₃-L-CO₂H de amonio cuaternario, donde R₁, R₂, R₃, idénticos o diferentes, indican un radical alquilo saturado lineal que comprende de 1 a 12 átomos de carbono y L indica un radical hidrocarburo lineal saturado divalente que

10

comprende de 2 a 6 átomos de carbono.

- Inorga+ representa un catión inorgánico elegido entre zinc (Zn²⁺), cobre (Cu²⁺), hierro (Fe²⁺), estroncio (Sr²⁺), magnesio (Mg²⁺) o manganeso (Mn²⁺).

15 **[0052]** Como tal, los compuestos que tienen las siguientes fórmulas (IV) y (V) son novedosos junto con sus formas tautoméricas, sus isómeros ópticos, sus isómeros geométricos y sus solvatos:



20

donde R indica un radical hidrocarburo lineal o ramificado que tiene de 12 a 20 átomos de carbono (C₁₂-C₂₀), que está saturado o insaturado (una o una pluralidad de insaturaciones de etileno), y

25 - Orga+ representa un catión orgánico elegido entre la forma catiónica de monoetanolamina, hexadecilamina, N,N,N',N'-tetrakis-(hidroxipropil-2)etileno di-amina o tris-hidroximetil aminometano, alanina o triptófano, N⁺R₁R₂R₃-L-CO₂H de amonio cuaternario, donde R₁, R₂, R₃, idénticos o diferentes, indican un radical alquilo saturado lineal que comprende de 1 a 12 átomos de carbono y L indica un radical hidrocarburo lineal saturado divalente que comprende de 2 a 6 átomos de carbono.

30 - Inorga+ representa estroncio (Sr²⁺).

[0053] Cuando Orga+ indica una sal de amonio cuaternario, R₁, R₂, R₃ son preferentemente idénticos y indican un radical alquilo saturado lineal C₁-C₄, L indica un diradical hidrocarburo lineal saturado C₂-C₄ y, particularmente preferentemente, R₁, R₂ y R₃ indican un radical metilo y L indica un diradical -CH₂-.

35

[0054] El radical R de las estructuras (IV) y (V) puede contener una o una pluralidad de insaturaciones de etileno.

[0055] Preferentemente, R indica un radical hidrocarburo saturado o insaturado, lineal o ramificado, que tiene de 12 a 18 átomos de carbono (C₁₂-C₁₈) y que contiene opcionalmente una o una pluralidad de insaturaciones de

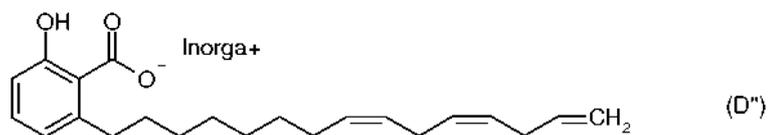
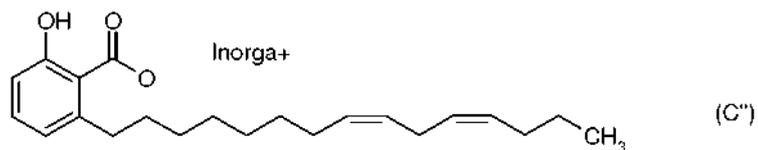
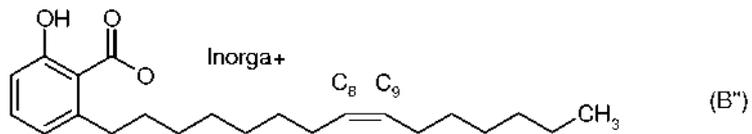
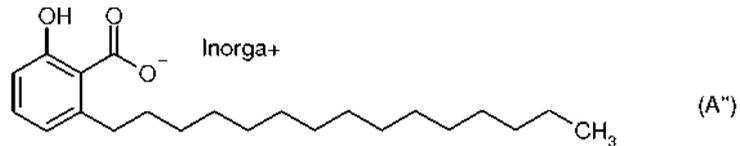
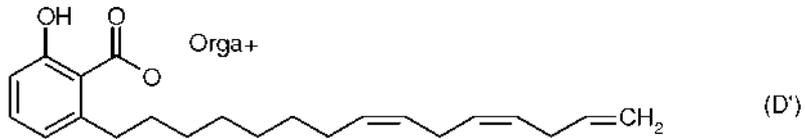
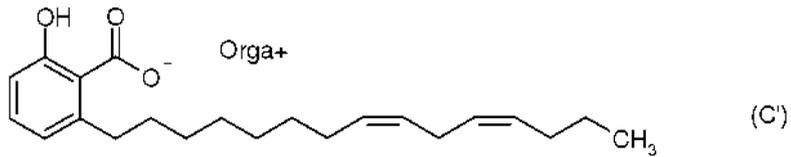
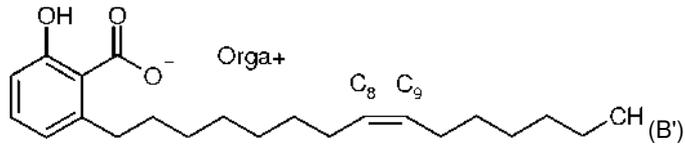
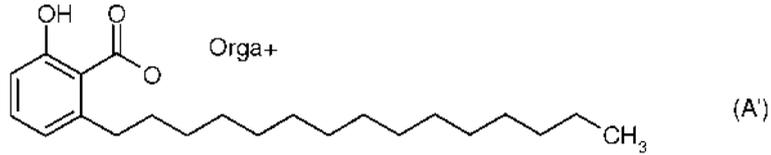
40

etileno.

[0056] Particularmente preferentemente, R indica un radical hidrocarburo lineal C₁₂-C₁₈, conteniendo dicho radical opcionalmente 1, 2 o 3 insaturaciones de etileno,

5

[0057] De los compuestos novedosos que tienen la fórmula (IV) o (V), se pueden mencionar los siguientes compuestos (A'), (B'), (C'), (D'), (A''), (B''), (C'') (D'') y sus mezclas:

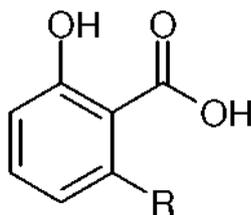


donde Orga+ e Inorga+ tienen el mismo significado que se describió anteriormente.

c) Preparación de compuestos que tienen la fórmula (II)

5

[0058] Los compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención se pueden obtener mediante una reacción de salificación de los compuestos ácidos correspondientes que tienen la fórmula (I).



(I)

10

[0059] Los compuestos que tienen la fórmula (I) se pueden preparar usando procedimientos conocidos por los expertos en la materia. Más particularmente, se pueden usar los procedimientos descritos en lo sucesivo a modo de ejemplo.

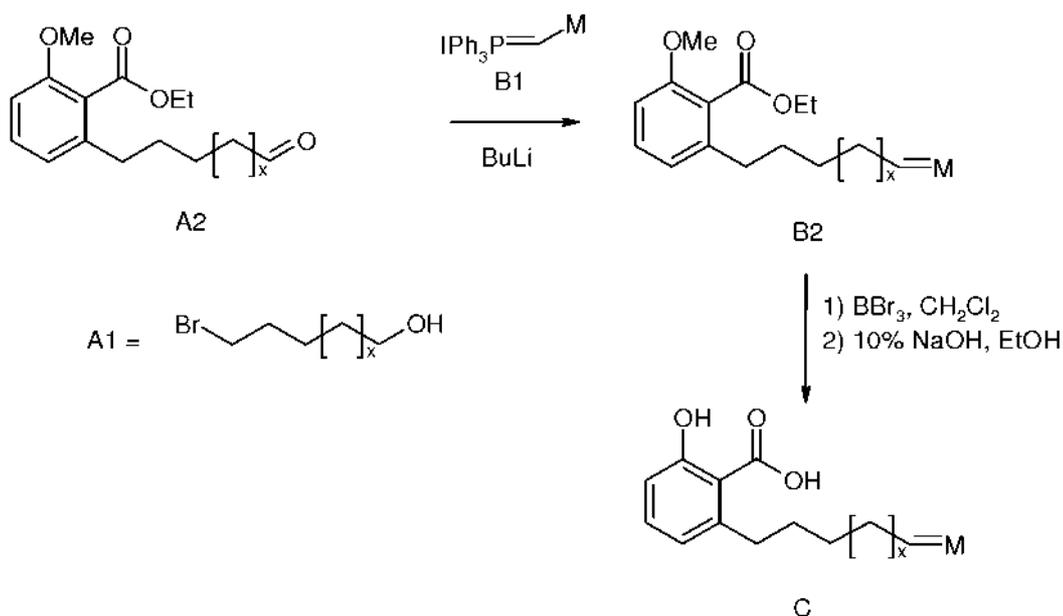
15 **[0060]** Los compuestos que tienen la fórmula (I) se pueden obtener en 2 o 3 etapas a partir de los compuestos A2 y B1 con referencia al diagrama en lo sucesivo. El compuesto A2 ($x = 1-9$) se puede obtener mediante la síntesis en 8 etapas como se describe en Chem. Pharm. Bull. 2001, 49, 18-22 del compuesto A1.

20 **[0061]** El compuesto B1 puede obtenerse en cuatro etapas a partir de 3-butinol como se describe en Chem. Pharm. Bull. 2001, 49, 18-22.

[0062] El compuesto B2 se puede obtener mediante el acoplamiento Wittig entre los compuestos A2 y B1 en presencia de butillitio en un disolvente no polar tal como hexano, por ejemplo, a temperatura ambiente, en una atmósfera inerte.

25

[0063] El compuesto C puede obtenerse a partir del compuesto B2 haciendo reaccionar con BBr₃ en diclorometano, por ejemplo, seguido de tratamiento con sosa en un disolvente prótico tal como etanol.



30

donde M indica un radical hidrocarburo C₆-C₁₄ saturado, tal como por ejemplo C₆H₁₃, o C_nH_{2n-1} monoinsaturado donde n varía de 6 a 14 de modo que -CH₂-CH=CH-C₅H₁₁, o -CH₂-CH=CH-C₃H₇, o un radical hidrocarburo que comprende dos insaturaciones de etileno (diinsaturadas) C_mH_{2m-3} donde m varía de 6 a 14, de modo que -CH₂-CH=CH-CH₂-CH=CH₂.

35

[0064] Según la naturaleza del radical M, el compuesto C obtenido comprende una cadena de hidrocarburos que contiene 1, 2 o 3 insaturaciones (C corresponde a los compuestos mono, di o triinsaturados que tienen la fórmula (I)).

5 **[0065]** Para obtener los compuestos saturados correspondientes que tienen la fórmula (I), se utiliza preferentemente un radical saturado M y el doble enlace introducido durante la reacción de Wittig se reduce mediante hidrogenación catalítica, por ejemplo, con Pd/C en un disolvente prótico, llevándose a cabo esta hidrogenación opcionalmente ya sea en el compuesto B2 o después de la reacción con BBr₃/NaOH, en el compuesto C.

10 **[0066]** Los compuestos que tienen la fórmula (II) se obtienen mediante salificación de los compuestos que tienen la fórmula (I) obtenida, según el protocolo descrito en lo sucesivo en el caso específico de la mezcla de ácidos anacárdicos.

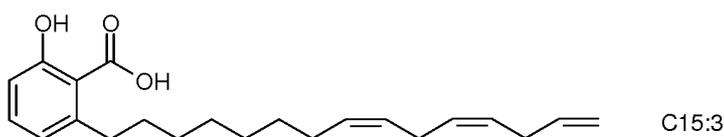
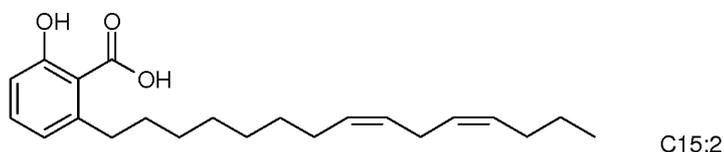
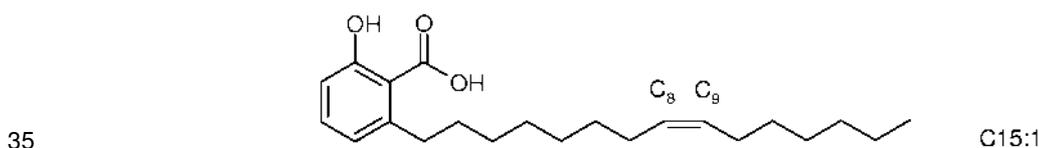
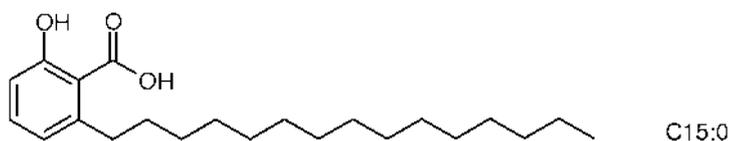
15 **[0067]** En una realización alternativa preferida de la invención, los compuestos que tienen la fórmula (II) en una mezcla también se pueden obtener de una materia prima de origen natural. Como tal, la mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II) para la cual R indica una cadena de hidrocarburos lineal C₁₅ se puede obtener en 2 etapas a partir de la mezcla de ácido anacárdico.

20 **[0068]** En una realización alternativa preferida de la invención, los compuestos que tienen la fórmula (II) en una mezcla también se pueden obtener de una materia prima de origen natural. Como tal, la mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II) donde R indica una cadena de hidrocarburos lineal C₁₅ se puede obtener en 2 etapas a partir de ácido anacárdico.

25 **[0069]** El ácido anacárdico es una mezcla de cuatro compuestos de ácido 6-alkilsalicílico: ácido 6-pentadecilsalicílico (A), ácido 6-[8(Z)-pen- tadecenil]salicílico (B), ácido 6-[8(Z),-11(Z)-pentadecadienil]salicílico (C) y ácido 6-[8(Z),11(Z),-14-pentadecatrienil] salicílico (D) (RN: 11034-77-8 para la mezcla (A), (B), (C), (D); RN: 16611-84-0 para el ácido 6-pentadecilsalicílico (A)).

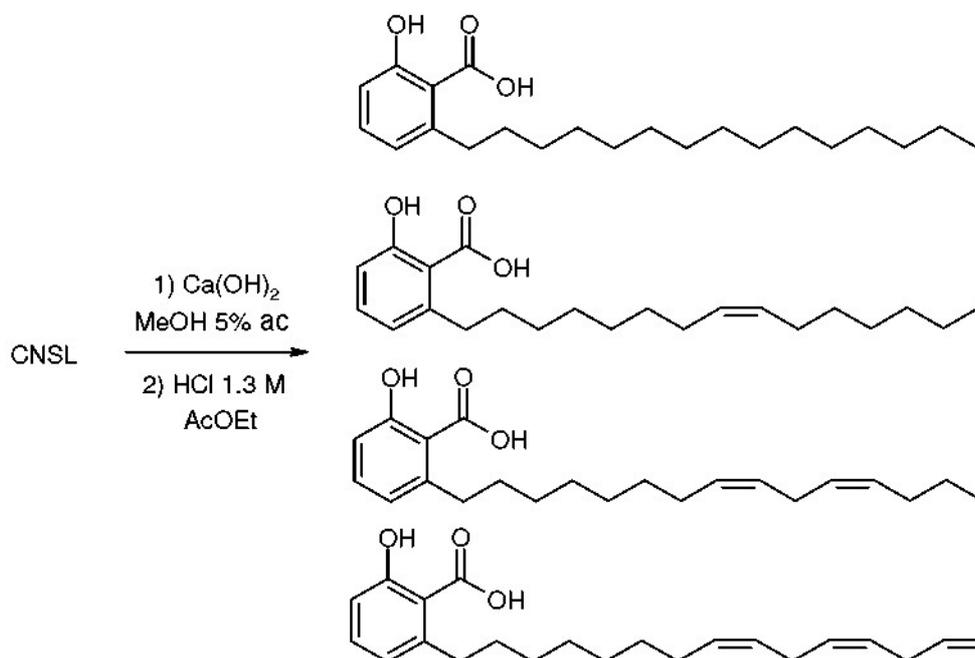
30 **[0070]** En una primera etapa, la mezcla de ácido anacárdico RN: 11034-77-8 puede obtenerse de una materia "prima" o "natural" llamada CNSL ("Cashew Nut Shell Liquid", líquido de cáscara de anacardo), extraída de la cáscara de anacardo (*Anacardium occidentale*), que contiene generalmente del 60 al 80 % de ácido anacárdico.

[0071] Esta mezcla comprende los siguientes compuestos:



40 **[0072]** Consiste en una "mezcla C15" de origen natural.

[0073] La "mezcla C15" puede aislarse del CNSL natural según el procedimiento descrito en J. Agric. Food Chem. 2001 49 2548-2551:

**Salificación:**

5

[0074] La preparación de la sal sódica de la "mezcla C15" (ácido anacárdico, RN: 11034-77-8) se describe en J. Am. Mosquito Control Association 2009, 25, 386-389 y en Proceedings of the Institution of Chemists 1961, 81-85.

[0075] Las sales que tienen la fórmula (II) se pueden obtener mediante la adición de 1 equivalente del compuesto salificante al compuesto (I) o a la mezcla de compuestos (I).

[0076] Particularmente, las sales que tienen la fórmula (II) se pueden obtener mediante la adición de 1 equivalente del compuesto salificante en forma de solución acuosa a una solución en un alcohol tal como isopropanol del compuesto (I), o la mezcla de compuestos (I). Las sales que tienen la fórmula (II) se aíslan mediante evaporación del disolvente.

[0077] Las sales de sodio o lisina se pueden obtener, por ejemplo, mediante la adición de soluciones acuosas, respectivamente de sosa o lisina (un equivalente), al compuesto ácido solo o en una mezcla disuelta en un disolvente tal como metanol seguido de la evaporación del disolvente.

20

[0078] La invención describe además composiciones que comprenden en un medio fisiológicamente aceptable al menos un compuesto o mezcla de compuestos que tienen la fórmula (IV) o (V) o cualquiera de sus formas tautoméricas, cualquiera de sus isómeros ópticos, cualquiera de sus isómeros geométricos o cualquiera de sus solvatos tales como hidratos.

25

[0079] La invención se refiere particularmente a una composición, particularmente una composición cosmética, que comprende en un medio fisiológicamente aceptable:

i) una mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II) tal como se definió anteriormente o cualquiera de sus formas tautoméricas, cualquiera de sus isómeros ópticos, cualquiera de sus isómeros geométricos o cualquiera de sus solvatos tales como hidratos y ii) al menos un agente antitranspirante y/o al menos un agente desodorante adicional (desodorante adicional) en un medio fisiológicamente aceptable.

30

Composición cosmética

[0080] La composición según la invención puede contener uno o una pluralidad de agentes desodorantes adicionales distintos de los que tienen la fórmula (II), y más particularmente distintos de los que tienen la fórmula (IV) o (V).

35

Agentes desodorantes adicionales

40

[0081] De los agentes desodorantes adicionales distintos de los compuestos según la invención, se pueden mencionar, por ejemplo:

- Agentes bacteriostáticos u otros agentes bactericidas tales como 2,4,4'-tricloro-2'-hidroxidifeniléter (Triclosan), 2,4-dicloro-2'-hidroxidifeniléter, 3',4',5'-triclorosalicilanilida, 1-(-3',4'-diclorofenil)-3- (4'clorofenil)urea (Triclocarbán) o 3,7,11-trimetildodeca-2,5,10-trienol (Farnesol); sales de amonio cuaternario tales como sales de cetiltrimetilamonio, sales de cetilpiridinio; clorhexidina y sales; monocaprato de diglicerol, monolaurato de diglicerol, monolaurato de glicerol; sales de biguanida de polihexametileno;
- sales de zinc tales como salicilato de zinc, fenolsulfonato de zinc, carboxilato de pirrolidona de zinc (más comúnmente denominado pidolato de zinc), sulfato de zinc, cloruro de zinc, lactato de zinc, gluconato de zinc, ricinoleato de zinc, glicinato de zinc, carbonato de zinc, citrato de zinc, cloruro de zinc, laurato de zinc, oleato de zinc, ortofosfato de zinc, estearato de zinc, tartrato de zinc, acetato de zinc o mezclas de los mismos;
- absorbentes de olores tales como zeolitas, ciclodextrinas, silicatos de óxidos metálicos tales como los descritos en la solicitud US2005/063928; partículas de óxido metálico modificadas por un metal de transición tales como las descritas en las solicitudes US2005084464 y US2005084474 aluminosilicatos tales como los descritos en la solicitud EP1658863, partículas derivadas de quitosano tales como las descritas en la patente US6916465;
- sustancias que inhiben las reacciones enzimáticas responsables de la formación de compuestos olorosos tales como arilsulfatasa, 5-lipoxigenasa, aminociclasa, inhibidores de β -glucuronidasa; y mezclas de los mismos.

[0082] Los agentes desodorantes adicionales pueden estar presentes en la composición según la invención a una tasa del 0,01 al 20 % en masa en relación con la masa total de la composición, y preferentemente a una tasa del 0,1 al 10 % en masa.

[0083] Las composiciones según la invención pueden contener uno o una pluralidad de agentes antitranspirantes distintos de los que tienen la fórmula (II), y más particularmente distintos de los que tienen la fórmula (IV) o (V).

Agentes antitranspirantes

[0084] Los agentes antitranspirantes se eligen preferentemente entre sales de aluminio y/o circonio; complejos de hidroxiclورو de circonio e hidroxiclورو de aluminio con un aminoácido tal como los descritos en la patente US-3792068. Dichos complejos se conocen generalmente con el nombre ZAG (cuando el aminoácido es glicina). Los complejos ZAG generalmente tienen un cociente Al/Zr que varía de aproximadamente 1,67 a 12,5 y un cociente metal/Cl que varía de 0,73 a 1,93. De estos productos, se pueden mencionar octaclorohidrato GLY de aluminio y circonio, pentacloro-rohidrex GLY de aluminio y circonio, tetraclorohidrato GLY de aluminio y circonio y triclorohidrato GLY de aluminio y circonio.

[0085] De las sales de aluminio, se pueden mencionar clorohidrato de aluminio, clorohidrex de aluminio, clorohidrex PEG de aluminio, clorohidrex PG de aluminio, diclorohidrato de aluminio, diclorohidrex PEG de aluminio, diclorohidrex PG de aluminio, sesquiclorohidrato de aluminio, sesquiclorohidrex PEG de aluminio, sesquiclorohidrex PG de aluminio, sales de aluminio, sulfato de aluminio, octaclorohidrato de aluminio y circonio, pentaclorohidrato de aluminio y circonio, tetraclorohidrato de aluminio y circonio, triclorohidrato de aluminio y circonio y, más particularmente, hidroxiclورو de aluminio comercializado por REHEIS como REACH 301® o por GUILINI CHEMIE como ALOXICOLL PF 40®. Las sales de aluminio y circonio son, por ejemplo, las comercializadas por REHEIS como REACH AZP-908-SUF®.

[0086] Se utilizará más particularmente el clorohidrato de aluminio en forma activada o no activada.

[0087] Los agentes antitranspirantes pueden estar presentes en la composición según la invención a una tasa de 0,001 a 30 % en masa en relación con la masa total de la composición, y preferentemente a una tasa de 0,5 a 25 % en masa.

Formas de dosificación

[0088] La composición según la invención se puede presentar en cualquiera de las formas de dosificación usadas convencionalmente para aplicación tópica y particularmente en forma de geles acuosos, soluciones acuosas o hidroalcohólicas. También pueden, mediante la adición de una fase grasa u oleosa, presentarse en forma de dispersiones tales como loción, emulsiones de consistencia líquida o semilíquida, tal como la leche, obtenida dispersando una fase grasa en una fase acuosa (O/W) o a la inversa (W/O), o suspensiones o emulsiones de consistencia suave, semisólida o sólida, tales como crema o gel, o emulsiones múltiples (W/O/W u O/W/O), microemulsiones, dispersiones de vesículas iónicas y/o de tipo no iónico, o dispersiones de cera/fase acuosa. Estas composiciones se preparan según los procedimientos habituales.

[0089] Las composiciones pueden envasarse particularmente en forma presurizada en un dispositivo de aerosol o en un frasco dispensador; envasarse en un dispositivo equipado con una pared perforada, particularmente una rejilla; envasarse en un dispositivo equipado con un aplicador de bola; envasarse en forma de barra, en forma de polvo suelto o compacto. A este respecto, contienen los ingredientes generalmente utilizados en este tipo de productos

y bien conocidos por los expertos en la materia.

[0090] Según una forma específica adicional de la invención, las composiciones según la invención pueden ser anhidras.

5

[0091] El término composición anhidra indica una composición que contiene menos del 2 % en masa de agua, o menos del 0,5 % de agua, y particularmente libre de agua, sin añadirse agua durante la preparación de la composición excepto la correspondiente al agua residual proporcionada por los ingredientes mezclados.

10 **[0092]** Según una forma específica adicional de la invención, las composiciones según la invención pueden ser sólidas particularmente en forma de barra.

[0093] El término "composición sólida" indica que la medición de la fuerza máxima medida por medio del análisis texturométrico al insertar una sonda en la muestra de fórmula debe ser al menos igual a 0,25 Newton, en particular al menos igual a 0,30 Newton, particularmente al menos igual a 0,35 Newton, evaluado en condiciones de medición precisas de la siguiente manera.

15

[0094] Las fórmulas se vierten cuando se calientan en tarros de 4 cm de diámetro y 3 cm en el fondo. El enfriamiento se realiza a temperatura ambiente. La dureza de las fórmulas producidas se mide después de esperar 24 horas. Los tarros que contienen las muestras se caracterizan por medio de un análisis texturométrico usando un texturómetro tal como el comercializado por Rheo TA-XT2, según el siguiente protocolo: una sonda tipo bola de acero inoxidable de 5 mm de diámetro se pone en contacto con la muestra a una velocidad de 1 mm/s. El sistema de medición detecta la interfaz con la muestra con un umbral de detección igual a 0,005 Newtons. La sonda se inserta 0,3 mm en la muestra, a una velocidad de 0,1 mm/s. El aparato de medición registra la progresión de la fuerza de compresión medida en el tiempo, durante la fase de penetración. La dureza de la muestra corresponde a la media de los valores máximos de la fuerza detectada durante la penetración, para al menos 3 mediciones.

20

25

Fase acuosa

30 **[0095]** Las composiciones según la invención destinadas al uso cosmético pueden comprender al menos una fase acuosa. Están particularmente formuladas en lociones acuosas o en agua en aceite, emulsión de aceite en agua o en emulsión múltiple (triple aceite en agua en aceite o agua en aceite en agua) (dichas emulsiones son conocidas y descritas, por ejemplo, por C. FOX en "Cosmetics and Toiletries" noviembre de 1986, vol. 101, páginas 101-112).

35 **[0096]** La fase acuosa de dichas composiciones contiene agua y generalmente otros disolventes solubles en agua o miscibles. Los disolventes solubles en agua o miscibles comprenden monoalcoholes de cadena corta, por ejemplo, C1-C4 tales como etanol, isopropanol; dioles o polioles tales como etilenglicol, 1,2-propilenglicol, 1,3-butilenglicol, hexilenglicol, dietilenglicol, dipropilenglicol, 2-etoxietanol, dietilenglicol monometiléter, trietilenglicol monometiléter y sorbitol. El propilenglicol y la glicerina, el propano 1,3 diol se utilizarán más particularmente.

40

[0097] La composición según la invención tiene preferentemente un pH que varía de 3 a 9 según el sustrato elegido.

[0098] Cuando la composición está en forma de emulsión, generalmente contiene según la naturaleza de la emulsión una o una pluralidad de tensioactivos emulsionantes.

45

[0099] La cantidad total de emulsionantes estará preferentemente en la composición según la invención a concentraciones de sustancia activa que varían del 1 al 8 % en masa y más particularmente del 2 al 6 % en masa en relación con la masa total de la composición.

50

Fase grasa

[0100] Las composiciones según la invención pueden contener al menos una fase líquida orgánica no miscible con agua, conocida como fase grasa. Esto generalmente incluye uno o una pluralidad de compuestos hidrófobos que hacen que dicha fase no sea miscible en agua. Dicha fase es líquida (en ausencia de un agente estructurante) a temperatura ambiente (20-25 °C). Preferentemente, la fase líquida orgánica no miscible con agua según la invención generalmente comprende al menos un aceite volátil y/o un aceite no volátil y opcionalmente al menos un agente estructurante.

55

60 **[0101]** El término "aceite" indica una grasa líquida a temperatura ambiente (25 °C) y presión atmosférica (760 mm Hg, es decir, $1,05 \times 10^5$ Pa). El aceite puede ser volátil o no volátil.

[0102] El término "aceite volátil" según la invención indica cualquier aceite capaz de evaporarse en contacto con la piel o la fibra de queratina, en menos de una hora, a temperatura ambiente y a presión atmosférica. Los aceites volátiles según la invención son aceites cosméticos volátiles, que son líquidos a temperatura ambiente, que tienen una

65

presión de vapor diferente a cero, a temperatura ambiente y presión atmosférica, que varía particularmente de 0,13 Pa a 40.000 Pa (de 10^{-3} a 300 mm Hg), que varía particularmente de 1,3 Pa a 13.000 Pa (de 0,01 a 100 mm Hg), y que varía más específicamente de 1,3 Pa a 1300 Pa (de 0,01 a 10 mm Hg).

5 **[0103]** El término "aceite no volátil" indica un aceite que permanece en la piel o en la fibra de queratina a temperatura ambiente y presión atmosférica durante al menos varias horas y, en particular, que tiene una presión de vapor inferior a 10^{-3} mm Hg (0,13 Pa).

10 **[0104]** El aceite se puede elegir entre cualquier aceite fisiológicamente aceptable y particularmente cosméticamente aceptable, en particular aceites minerales, animales, vegetales, sintéticos; en particular, hidrocarburos volátiles o no volátiles y/o siliconas y/o aceites fluorados y mezclas de los mismos.

15 **[0105]** Más específicamente, el término "aceite de hidrocarburo" indica un aceite que comprende esencialmente átomos de carbono e hidrógeno y, opcionalmente, una o una pluralidad de funciones elegidas entre funciones hidroxilo, éster, éter, carboxílico. En general, el aceite tiene una viscosidad de 0,5 a 100.000 mPa.s, preferentemente de 50 a 50.000 mPa.s y más preferentemente de 100 a 300.000 mPa.s.

[0106] A modo de ejemplos de aceites volátiles adecuados para su uso en la invención, se pueden mencionar

20 -aceites de hidrocarburos volátiles elegidos entre los aceites de hidrocarburos que tienen de 8 a 16 átomos de carbono, y en particular isoalcanos C_8-C_{16} a base de petróleo (también denominados isoparafinas) tales como isododecano (también denominado 2,2,4,4,6-pentametilheptano), isodecano, isohexadecano, y por ejemplo los aceites vendidos con los nombres comerciales Isopars o Permetyls, ésteres C_8-C_{16} ramificados, neopentanoato de isohexilo, y mezclas de los mismos.

25 -siliconas volátiles, tales como por ejemplo aceites volátiles de silicona lineales o cíclicos, particularmente aquellos que tienen una viscosidad ≤ 8 centistokes ($8 \cdot 10^{-6} \text{ m}^2/\text{s}$), y que tienen en particular de 2 a 7 átomos de silicio, comprendiendo estas siliconas opcionalmente grupos alquilo o alcoxi que tienen de 1 a 10 átomos de carbono, y mezclas de los mismos.

30 **[0107]** Se puede mencionar, como un aceite de silicona volátil adecuado para su uso en la invención, en particular, el octametil ciclotetrasiloxano, decametil ciclopentasiloxano, dodecametil ciclohexasiloxano, heptametil hexiltrisiloxano, heptametiloctil trisiloxano, hexametil disiloxano, octametil trisiloxano, decametil tetrasiloxano, dodecametil pentasiloxano, y mezclas de los mismos.

35 - aceites de hidrocarburos de origen vegetal, tales como los triglicéridos de ácidos grasos líquidos que tienen de 4 a 24 átomos de carbono, tales como triglicéridos heptanoicos u octanoicos o germen de trigo, aceites de oliva, almendra dulce, palma, colza, algodón, alfalfa, semilla de amapola, calabaza, calabacita, semilla de grosella negra, onagra, mijo, cebada, quinoa, centeno, cártamo, calumbán, pasiflora, rosa mosqueta, girasol, maíz, soja, calabacita, semilla de uva, sésamo, avellana, albaricoque, macadamia, ricino, aguacate, triglicéridos de ácido caprílico/cáprico tales como los vendidos por Stearineries Dubois o los vendidos con los nombres comerciales Miglyol 810, 812 y 818 por Dynamit Nobel, aceite de jojoba;

- hidrocarburos lineales o ramificados de origen mineral o sintético, tales como parafinas líquidas y derivados de las mismas, vaselina, polidecenos, polibutenos, poliisobuteno hidrogenado, tal como Parleam, escualano;

- éteres sintéticos que tienen de 10 a 40 átomos de carbono tales como dicapriléter;

45 - ésteres sintéticos, en particular de ácidos grasos, tales como los aceites que tienen la fórmula $R^1\text{COOR}^2$ donde R^1 representa el residuo de un ácido graso superior lineal o ramificado que comprende de 1 a 40 átomos de carbono y R^2 representa una cadena de hidrocarburo, particularmente ramificada, que contiene de 1 a 40 átomos de carbono donde $R^1 + R^2 \geq 10$ tales como isononanoato de isononilo, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, benzoato de alcohol C_{12} a C_{15} ,

50 - alcoholes grasos líquidos a temperatura ambiente con una cadena carbonada ramificada e/o insaturada que tiene de 12 a 26 átomos de carbono tales como octil dodecanol;

- aceites de silicona, tales como polidimetilsiloxanos (PDMS) que son no volátiles, lineales (dimeticona) o cíclicos (ciclometiconas); polidimetilsiloxanos que comprenden grupos alquilo, alcoxi o fenilo que están suspendidos o al final de la cadena de silicona, teniendo dichos grupos de 2 a 24 átomos de carbono; siliconas feniladas, tales como fenil

55 trimeticonas, fenil dimeticonas, feniltrimetilsiloxidifenilsiloxanos, difenil dimeticonas, difenilmetildifenil-trisiloxanos o (2-feniletil)trimetilsiloxisilicatos, y

- mezclas de los mismos.

Aditivos

60 **[0108]** Las composiciones cosméticas según la invención pueden comprender además adyuvantes cosméticos elegidos entre suavizantes, antioxidantes, opacificantes, estabilizantes, agentes hidratantes, vitaminas, bactericidas, conservantes, polímeros, perfumes, un agente estructurante de fase grasa elegido particularmente entre ceras, compuestos pastosos, agentes gelificantes; cargas orgánicas o inorgánicas; agentes espesantes o de suspensión,

65 propulsores o cualquier otro ingrediente utilizado habitualmente en cosméticos para este tipo de aplicación.

[0109] Obviamente, los expertos en la materia tendrán cuidado de escoger el compuesto o compuestos opcional(es) de manera que las propiedades ventajosas asociadas intrínsecamente con la composición cosmética según la invención no se alteren, o prácticamente no se alteren, por la adición prevista.

5

Aerosoles

[0110] Las composiciones según la invención se pueden presurizar y envasar en un dispositivo de aerosol que consiste en:

10

- (A) al menos un recipiente que comprende una composición según la invención,
 (B) al menos un propulsor y al menos un medio para dispensar dicha composición en forma de aerosol.

[0111] Los propulsores generalmente utilizados en este tipo de producto y bien conocidos por los expertos en la materia, tales como por ejemplo dimetiléter (DME); hidrocarburos volátiles tales como n-butano, propano, isobutano y mezclas de los mismos, opcionalmente con al menos un hidrocarburo clorado y/o fluorado; de este último, se pueden mencionar los compuestos vendidos por Dupont de Nemours con los nombres comerciales Freon® y Dymel®, y en particular monofluorotriclorometano, difluorodichlorometano, tetrafluorodichloroetano y 1,1-difluoroetano particularmente vendidos con el nombre comercial DYMELE 152 A® por DUPONT. También se puede usar dióxido de carbono, óxido nitroso, nitrógeno o aire comprimido como propulsor.

[0112] Las composiciones que contienen partículas de perlita tal como se definió anteriormente y el propulsor o propulsores pueden ubicarse en el mismo compartimiento o en compartimientos diferentes en el recipiente de aerosol. Según la invención, la concentración del propulsor varía generalmente del 5 al 95 % en masa presurizada y más preferentemente del 50 al 85 % en masa en relación con la masa total de la composición presurizada.

[0113] Los medios dispensadores, que forman parte del dispositivo de aerosol, generalmente consisten en una válvula dispensadora controlada por un cabezal dispensador, que a su vez comprende una boquilla a través de la cual se pulveriza la composición de aerosol. El recipiente que contiene la composición presurizada puede ser opaco o transparente. Puede estar hecho de vidrio, material polimérico o metálico, opcionalmente recubierto con una capa de barniz protector.

[0114] Las expresiones "entre ... y ..." y "que varía de ... a ..." deben entenderse como que incluyen los límites, a menos que se especifique lo contrario.

35

[0115] Los siguientes ejemplos ilustran la presente invención sin limitar su alcance.

[0116] En los ejemplos, la temperatura es ambiente (20-25 °C), la presión atmosférica (101.325 Pa), a menos que se especifique lo contrario. La masa de los ingredientes se expresa como un porcentaje en relación con la masa de la composición total en cuestión.

40

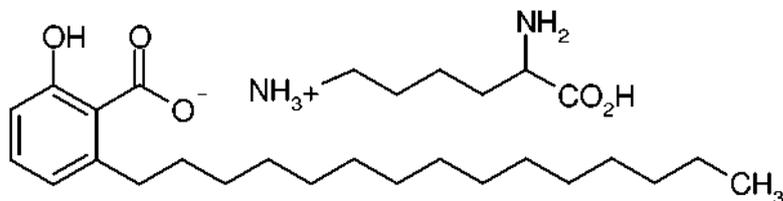
Ejemplos

Ejemplo 1: Síntesis

45

Ejemplo 1.1: Preparación de la mezcla de sal de lisina M1

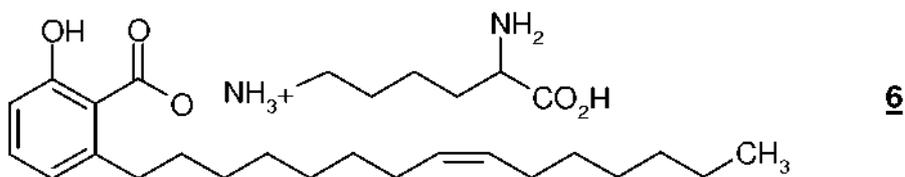
[0117] Se preparó la mezcla M1 que consiste en los siguientes compuestos salificados 5, 6, 7 y 8:



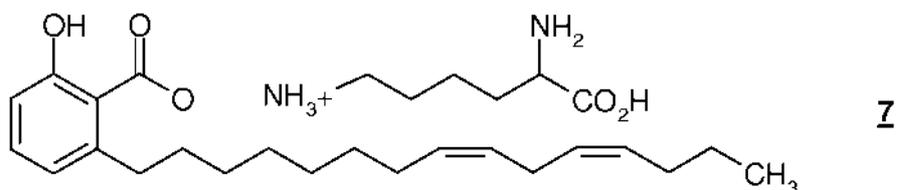
5

50

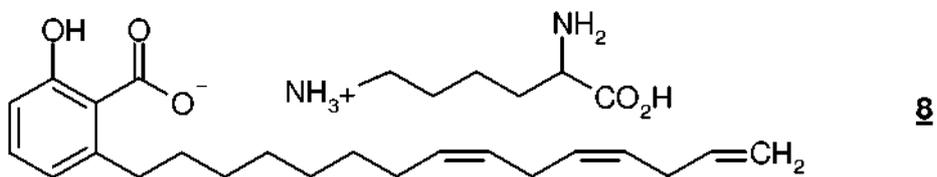
5 % en peso



35 % en peso



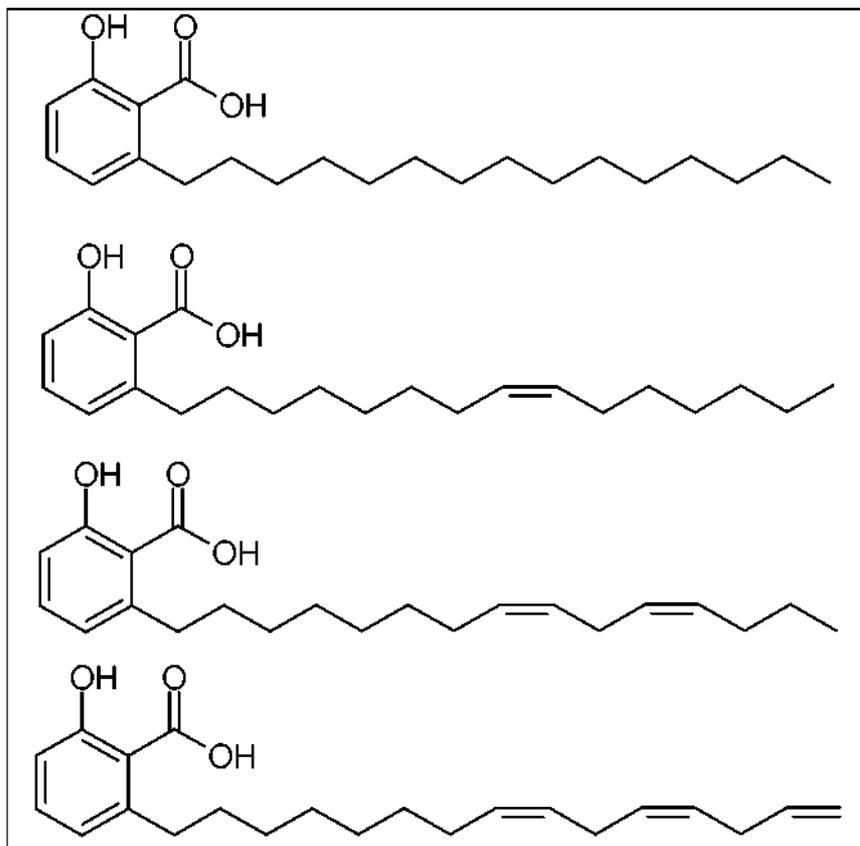
23 % en peso



37 % en peso

5

10 Se añaden lentamente 32,82 g (1 equivalente) de L-lisina (referencia Aldrich L5501) en 150 ml de agua a 80 g de la mezcla **MO** de los siguientes compuestos:



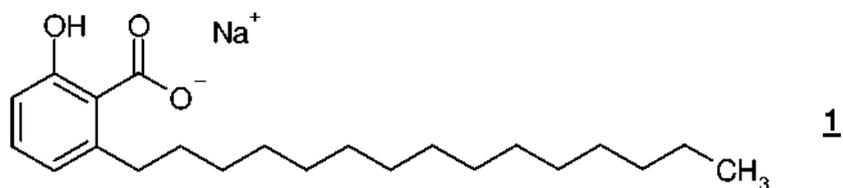
15 (masa molar media = 356 g/mol) solubilizada en 500 ml de MeOH a una temperatura de 10/15 °C. Al final de la adición, pH=7. La solución se evapora a sequedad para producir un polvo beige.

[0118] Análisis: RMN, análisis elemental que confirma que se obtuvo el compuesto esperado.

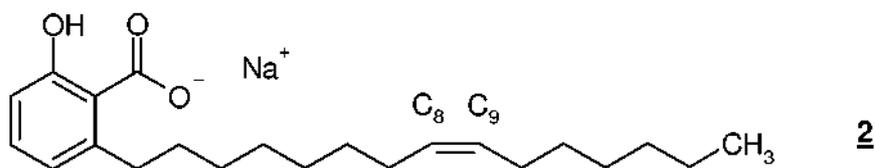
Ejemplo 1.2: Preparación de la mezcla de sal sódica M2:

5

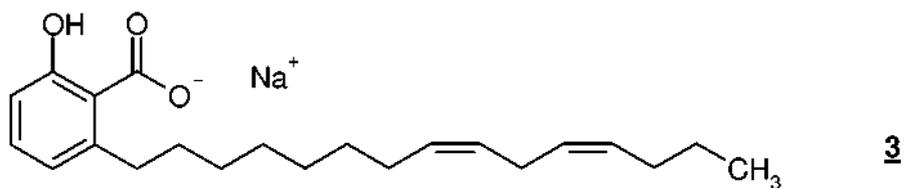
[0119] Se preparó la mezcla M2 que consiste en los siguientes compuestos salificados 1, 2, 3 y 4:



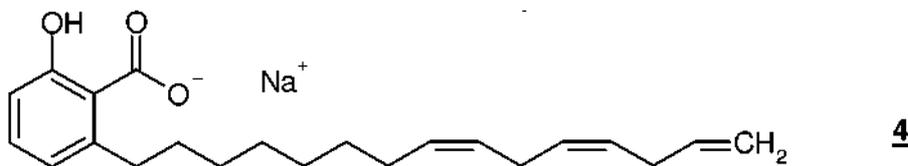
5 % en peso



35 % en peso

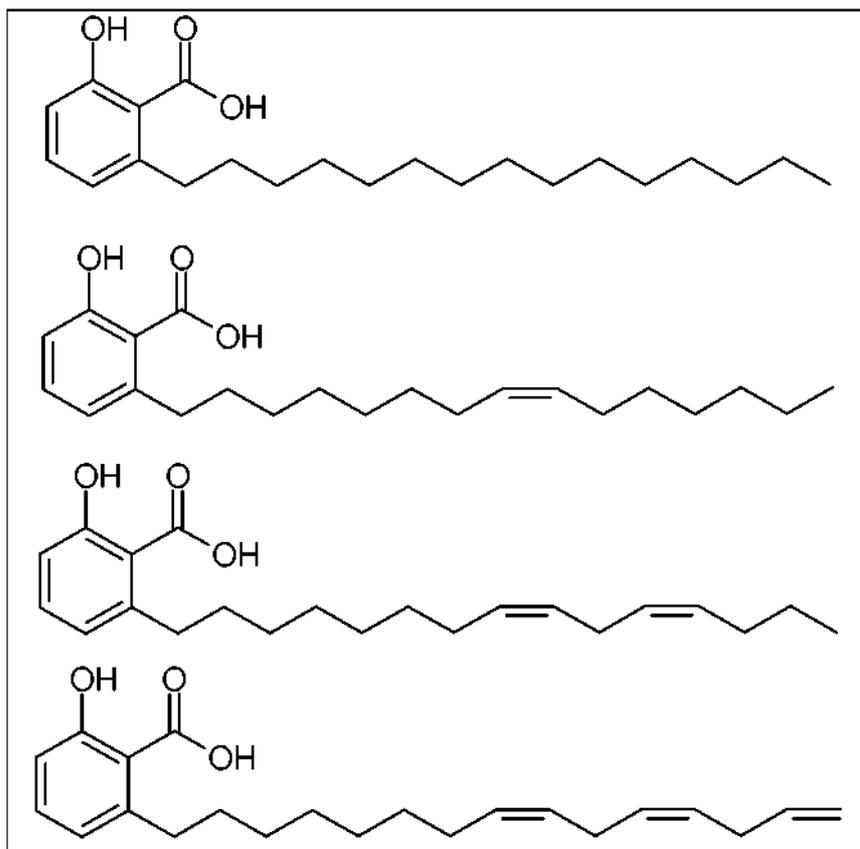


23 % en peso



37 % en peso

15
20 Se añaden lentamente 8,98 g (1 equivalente) de sosa (NaOH) en 100 ml de agua a 80 g de la mezcla M0 de los siguientes compuestos:



(masa molar media = 356 g/mol) solubilizada en 500 ml de MeOH a una temperatura de 10/15 °C. Al final de la adición, pH=7,4. La solución se evapora a sequedad a presión reducida para producir un polvo beige.

5

[0120] Los análisis confirmaron que se obtuvo la mezcla esperada M2.

Ejemplo 2: Efecto sobre *Corynebacterium xerosis*:

10 [0121]

- **Principio de ensayo:** contacto de concentraciones decrecientes de compuestos en evaluación con un inóculo idéntico de microorganismos en un medio de cultivo adecuado para el crecimiento de *C. xerosis*. Después de incubar la microplaca durante 24 a 48 horas según las cepas, se mide la densidad óptica (620 nm) y los resultados se expresan como un porcentaje de crecimiento calculado en relación con un control de crecimiento libre del compuesto en evaluación.

15

- **Definición de CMI (concentración mínima inhibitoria):** se considera inhibitoria la concentración más baja del compuesto en evaluación que limita significativamente el crecimiento en comparación con el control.

20

[0122] Las diluciones de los compuestos en evaluación se realizan en agar a 1:1000, lo que permite, para los compuestos dispersables en evaluación, eliminar el uso de un disolvente que podría introducir sesgos en la evaluación de los compuestos. El intervalo de concentración elegido fue: 1 %, 0,3 %, 0,03 % y 0,003 %. Cada concentración se probó por triplicado.

25

[0123] Para asegurar que la actividad inhibitoria potencial no estuviera asociada con un efecto de pH, se verificó el pH del medio de cultivo al final de la incubación.

[0124] Las mezclas de compuestos M0 y M2 se evaluaron en función de este protocolo, junto con ácido n-octanoil-5-salicílico (comparación).

30

[0125] La mezcla M0 es la mezcla de ácidos anacárdicos (comparación) ("mezcla C15") descrita anteriormente.

[0126] La mezcla M2 es la "mezcla de sal sódica C15" (invención) según el ejemplo 1.2

35

[0127] Se observó que las mezclas M0 y M2 y el compuesto ácido n-octanoil-5-salicílico inhiben el crecimiento de *C. xerosis*, pero la mezcla M2 que tiene la fórmula (II) es mucho más eficaz en el crecimiento de *C. xerosis* que la mezcla M0 que tiene la fórmula (I) como se indica en la tabla 1.

5

Tabla 1

Mezcla compuesta	CMI <i>C. xerosis</i>	pH final del medio de cultivo
Mezcla M0	0,03 %	7
Mezcla M2	<0,003 %	7
Ácido N-octanoil-5-salicílico (MEXORYL SAB®-CHIMEX)	<0,003 %	7

Ejemplo 3: Efecto antiolor (sobre el sudor incubado):

[0128] La actividad desodorante se evaluó en la prueba de evaluación olfativa *ex vivo*, en el sudor incubado.

10

[0129] Cada compuesto en evaluación se introdujo a una velocidad de 0,3 mg en 1 ml de sudor. Los compuestos en evaluación se pesaron en frascos de píldoras de 25 o 30 ml y a continuación se añadió 1 ml de un grupo de sudor fresco. Los frascos de píldora se sellaron herméticamente y se colocaron en una incubadora a 35 °C durante 24 horas. Después de retirarlos de la incubadora, se abrieron los frascos de píldoras y se dejaron enfriar a temperatura ambiente.

15

[0130] Un panel de dieciséis personas realizó un análisis olfativo de cada frasco de pastillas. La eficacia de cada compuesto evaluado se determinó en comparación con un control negativo (sudor incubado solo).

20

Tabla 2

Mezcla en prueba	% Variación de la intensidad del sudor incubado
Mezcla M0	-45
Mezcla M2	-90
Ácido N-octanoil-5-salicílico (MEXORYL SAB® - CHIMEX)	-57
Sudor incubado solo (control)	0

[0131] Se observó que las mezclas M0 y M2 y el compuesto ácido n-octanoil-5-salicílico reducen el olor desagradable del sudor incubado y que el compuesto M2 permite reducir el olor del sudor mucho más significativamente que la mezcla M0 o el compuesto ácido n-octanoil-5-salicílico.

25

Ejemplo 4: Formulaciones Ejemplo 4.1: Formulación desodorante

[0132]

Carbopol ®	0
Conservantes	1
Mezcla M2	0,1 %
Agua	cs 100

30 (% masa en relación con la masa de la composición total).

[0133] La composición produce un efecto desodorante.

Ejemplo 4.2: Formulación desodorante

35

[0134]

Carbopol ®	0
Conservantes	1
Mezcla M2	0,3 %
Agua	cs 100

(% masa en relación con la masa de la composición total)

40 [0135] La composición produce un efecto desodorante.

Ejemplo 4.3: Formulación desodorante y antitranspirante

[0136]

Carbopol ®	0
Conservantes	1
Clorhidróxido de aluminio al 50 %	18 %
Cloruro de aluminio hexahidratado al 50 %	6 %
Mezcla M2	0,1 %
Agua	cs 100

5

(% masa en relación con la masa de la composición total)

[0137] La composición produce un efecto desodorante y antitranspirante.

10 **Ejemplo 4.4: Formulación desodorante y antitranspirante**

[0138]

Carbopol ®	0
Conservantes	1
Clorhidróxido de aluminio al 50 %	15 %
Cloruro de aluminio hexahidratado al 50 %	8 %
Compuesto M2	0,3 %
Agua	cs 100

(% masa en relación con la masa de la composición total)

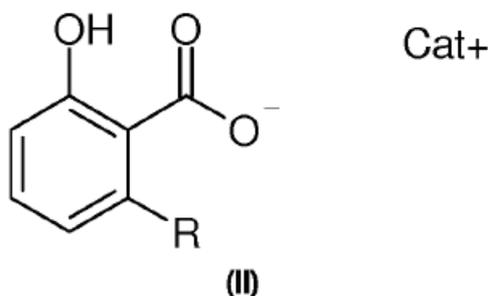
15

[0139] La composición produce un efecto desodorante y antitranspirante.

REIVINDICACIONES

1. Uso como agente desodorante de una mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II) para tratar el olor corporal, particularmente el olor de axila:

5



donde R indica un radical hidrocarburo saturado o insaturado lineal o ramificado que comprende de 12 a 20 átomos de carbono, donde dicho radical R puede comprender una o una pluralidad de insaturaciones de etileno (del tipo de doble enlace) y

10

Cat+ representa un catión o una mezcla de cationes, orgánicos o inorgánicos, adecuados para obtener la electroneutralidad del compuesto o mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II),

caracterizado porque se utiliza una mezcla de al menos 4 compuestos que tienen la fórmula (II), compuestos indicados (IIA), (IIB) (IIC), (IID), donde:

15

- los radicales R de cada uno de los compuestos (IIA), (IIB), (IIC), (IID) indican un radical hidrocarburo lineal que comprende de 12 a 18 átomos de carbono, y preferentemente que tiene el mismo número de átomos de carbono para cada uno de los compuestos (IIA), (IIB), (IIC), (IID):

20

- el compuesto (IIA), que tiene un radical R saturado; y
- el compuesto (IIB), que tiene un radical R monoinsaturado; y
- el compuesto (IIC), que tiene un radical R diinsaturado; y
- el compuesto (IID), que tiene un radical R triinsaturado; y
- Cat+ que tiene el mismo significado para cada uno de los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID).

25 2. Uso según la reivindicación 1, **caracterizado porque** R indica un radical hidrocarburo lineal C₁₄-C₁₆.

3. Uso según la reivindicación 1 o 2, **caracterizado porque**

- el catión inorgánico Cat+ se elige entre metales alcalinos, metales alcalinotérreos, metales de transición;
- el catión orgánico Cat+ se elige entre la forma catiónica de una amina o un amonio cuaternario.

30

4. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, **caracterizado porque** el Cat+ orgánico es la forma catiónica de un aminoácido de forma L o D o un N⁺R₁R₂R₃-L-CO₂H de amonio cuaternario, donde R₁, R₂, R₃, idénticos o diferentes, indican un radical alquilo saturado lineal que comprende de 1 a 12 átomos de carbono y L indica un radical hidrocarburo saturado divalente que comprende de 2 a 6 átomos de carbono.

35

5. Uso según la reivindicación 3, **caracterizado porque** Cat+ representa Na+.

6. Uso según la reivindicación 3, **caracterizado porque** Cat+ es la forma catiónica de lisina.

40

7. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, **caracterizado porque** se utiliza una mezcla de los compuestos (IIA), (IIB), (IIC), (IID), donde:

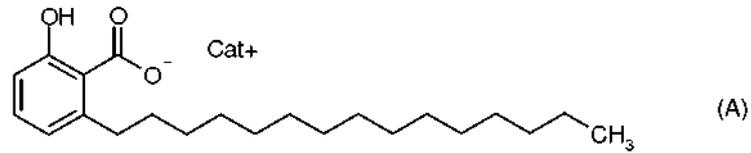
45

- la proporción del compuesto (IIA) varía del 0,001 al 5 %,
- la proporción del compuesto (IIB) varía del 20 al 45 %,
- la proporción del compuesto (IIC) varía del 5 al 35 %,
- la proporción del compuesto (IID) varía del 25 al 50 %, siendo los porcentajes en masa en relación con la masa total de la mezcla de compuestos (IIA), (IIB) (IIC) y (IID).

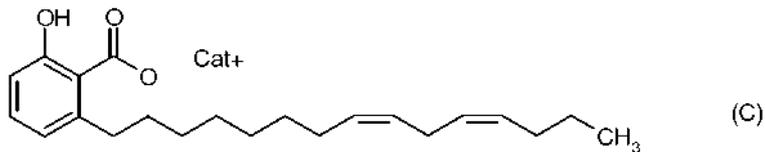
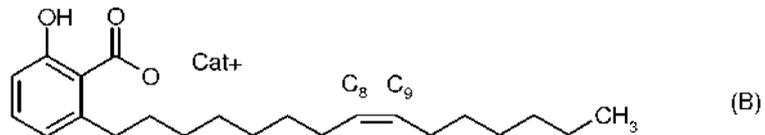
50 8. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, **caracterizado porque** se utiliza una mezcla de los compuestos (IIA), (IIB), (IIC), (IID), donde R indica un radical hidrocarburo que tiene 15 átomos de carbono.

9. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, **caracterizado porque** los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID),

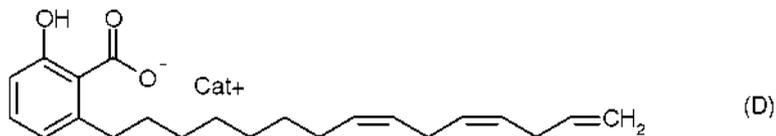
se eligen entre:



5



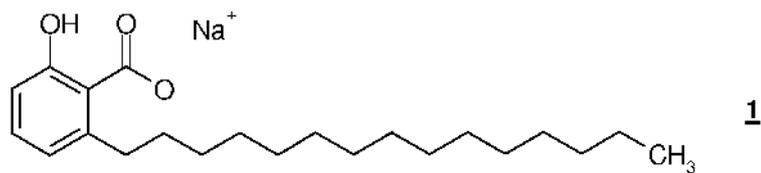
10



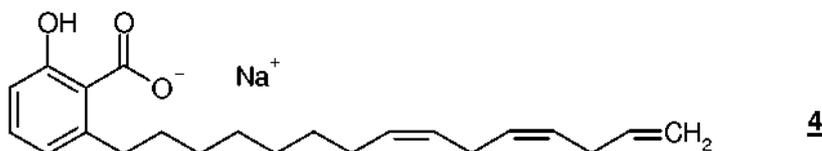
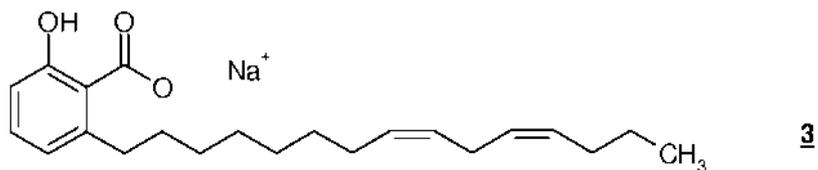
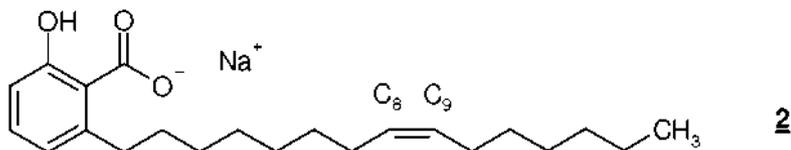
y más particularmente los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID) son una mezcla donde:

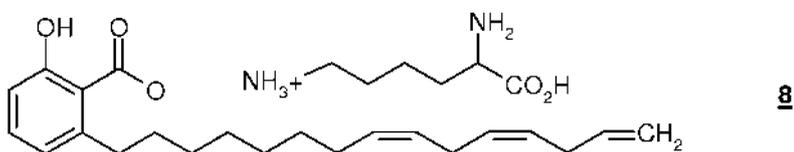
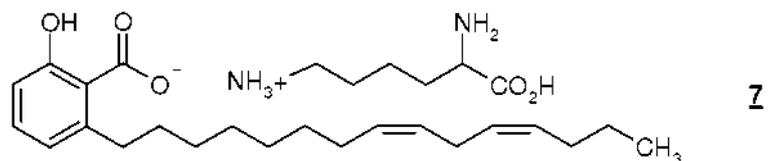
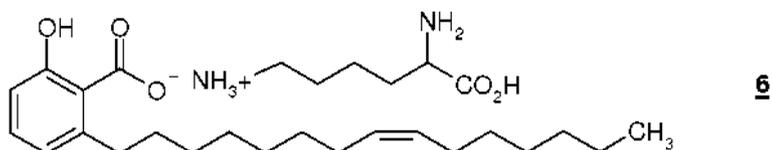
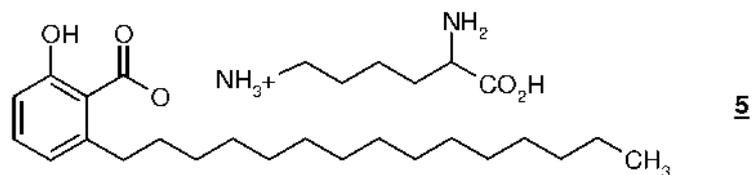
- la proporción del compuesto (A) varía del 0,001 al 5 %,
- la proporción del compuesto (B) varía del 20 al 45 %,
- 15 - la proporción del compuesto (C) varía del 5 al 35 %,
- la proporción del compuesto (D) varía del 25 al 50 %, siendo los porcentajes en masa en relación con la masa total de la mezcla de compuestos (A), (B), (C) y (D).

10. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, **caracterizado porque** los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID),
 20 se eligen entre los siguientes compuestos 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8:



25





5

10 y más preferentemente los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID) son una mezcla de los compuestos 1, 2, 3 y 4 o una mezcla de los compuestos 5, 6, 7 y 8, e incluso más preferentemente una mezcla donde los **compuestos 1, 2, 3, 4** o los compuestos **5, 6, 7 y 8** están en las mismas proporciones que los compuestos (A), (B), (C) y (D) según la reivindicación 7, respectivamente.

11. Uso según la reivindicación 10, **caracterizado porque** los compuestos (IIA), (IIB) (IIC), (IID), se eligen entre las 15 siguientes mezclas:

- (i) una mezcla que comprende 5 % en masa del compuesto 1, 35 % del compuesto 2, 23 % en masa del compuesto 3 y 37 % del compuesto 4;
- (ii) una mezcla que comprende 5 % en masa del compuesto 5, 35 % del compuesto 6, 23 % en masa del compuesto 7 y 37 % del compuesto 8.

20

12. Composición que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable:

- i) una mezcla de compuestos que tienen la fórmula (II) o cualquiera de sus formas tautoméricas, sus isómeros ópticos, sus isómeros geométricos o sus solvatos, tal como se define según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11,
- ii) al menos un agente antitranspirante y/o al menos un agente desodorante adicional.

25

13. Dispositivo de aerosol que consiste en:

30

- (A) al menos un recipiente que comprende una composición tal como se define según la reivindicación 12.
- (B) al menos un propulsor y al menos un medio para dispensar dicha composición en forma de aerosol.

14. Procedimiento cosmético para tratar el olor corporal, particularmente el olor de axila, que consiste en aplicar sobre 35 la superficie de un material de queratina humana una composición según la reivindicación 12.