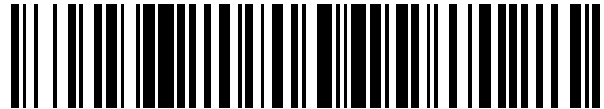


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 517 790**

21 Número de solicitud: 201330623

51 Int. Cl.:

A61K 8/49	(2006.01)
A61K 8/34	(2006.01)
A61K 8/97	(2006.01)
A61Q 5/02	(2006.01)
A61P 17/00	(2006.01)

12

SOLICITUD DE PATENTE

A1

22 Fecha de presentación:

30.04.2013

43 Fecha de publicación de la solicitud:

03.11.2014

71 Solicitantes:

**LACER, S.A. (100.0%)
C/ Sardenya, 350
08025 Barcelona ES**

72 Inventor/es:

**MATA MOLINER, Montserrat;
HUARTE FOURNIER, Elena y
VIVANCOS CUADRAS, Fernando**

74 Agente/Representante:

ZEA CHECA, Bernabé

54 Título: **Composición para el tratamiento de la caspa**

57 Resumen:

Composición para el tratamiento de la caspa.
Se refiere a una combinación que comprende
climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol, a
composiciones tópicas farmacéuticas y cosméticas
que contienen dicha combinación y a procedimientos
para su preparación. También se refiere al uso de la
combinación para el tratamiento de la caspa.

ES 2 517 790 A1

DESCRIPCIÓN

Composición para el tratamiento de la caspa

5 La presente invención se refiere a una combinación que comprende climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol, a composiciones tópicas farmacéuticas y cosméticas que contienen dicha combinación y a procedimientos para su preparación. También se refiere al uso de la combinación para el tratamiento de la caspa.

10 ESTADO DE LA TÉCNICA

La caspa es un trastorno común del cuero cabelludo que afecta una parte importante de la población adulta de cualquier sexo y origen étnico a partir de la adolescencia.

15 La epidermis del cuero cabelludo se renueva continuamente. A medida que va renovándose, las células muertas se desprenden en forma de escamas. En la mayoría de individuos, estas escamas de piel son demasiado pequeñas para ser visibles. Sin embargo, en ciertas condiciones se produce un aumento de la velocidad de descamación de la epidermis, de manera que las células de la capa basal precisan
20 mucho menos tiempo para alcanzar el estrato córneo o capa más externa de la epidermis. Esta proliferación rápida provoca un incremento del número de células córneas, acompañado de una anómala cimentación y aparición de grandes agregados de células que se separan del estrato córneo. En función del grado en que se produzca esta proliferación, las escamas de piel son visibles en el cuero cabelludo, la
25 piel y la ropa. Además, dicha descamación excesiva suele ir acompañada de prurito, enrojecimiento e irritación.

Existen dos tipos de caspa: la caspa grasa o seborreica y la caspa seca. La forma seca o *Pityriasis simplex* es la forma más frecuente y consiste en una descamación
30 con escamas blanquecinas, secas y finas, que se desprenden fácilmente o por rascado y que produce prurito y eritema. La forma seborreica o *Pityriasis esteatoide* presenta escamas englobadas con sebo; dichas escamas son mayores, más espesas, oleosas, amarillentas y más adheridas al cuero cabelludo y a los cabellos. Puede presentarse acompañada de eritema, con prurito más o menos intenso, e inflamación
35 del cuero cabelludo. Puede ser también causa de alopecia.

Algunos de los factores que influyen en la aparición de la caspa incluyen las condiciones ambientales (normalmente empeora en invierno), actividad hiperproliferativa de la epidermis y desequilibrio hormonal. Otro factor que influye en la aparición de la caspa es la proliferación local de la flora microbiana. El cuero cabelludo está colonizado por microorganismos tales como *Staphylococcus*, *Propionibacterium* y *Malassezia*. En determinadas situaciones, la proporción relativa de *Malassezia* se multiplica por 1.5-2.0 llegando hasta el 75% del total de la flora existente. Este hecho da lugar a un incremento en la cantidad de ácidos grasos libres existentes en el cuero cabelludo, especialmente ácido oleico, los cuales poseen una fuerte capacidad irritante. La caspa también puede ser un síntoma de la seborrea, la psoriasis, la micosis o de pediculosis.

Se han descrito distintas formulaciones anticaspas. Por ejemplo, el documento WO2004006876 describe formulaciones para el tratamiento o prevención de la caspa que contienen aceite de tulsi o alguno de sus componentes tales como terpinen-4-ol, linalool, eugenol y alfa-terpineol y un agente antimicrobiano sintético, tal como piritiona de zinc, climbazol, octopirox y ketoconazol.

Por otro lado, el documento US2002172648 describe formulaciones para el tratamiento o prevención de la caspa que contienen una combinación de tres agentes anticaspas: climbazol, piritiona de zinc y piroctona olamina. Esta combinación además, puede contener otros agentes anticaspas sintéticos o naturales, tales como ácido salicílico, azufre, preparados de alquitrán, derivados de ácido undecanoico, hinokitiol, extractos de raíz de bardana, extractos de álamo, extractos de ortiga, extractos de cáscara de nuez, extractos de abedul, extractos de corteza de sauce o extractos de árnica.

Las composiciones para el tratamiento de la caspa, además de tener una buena eficacia contra la caspa, deben ser fáciles de aplicar y retirar mediante lavado y deben proporcionar unas propiedades satisfactorias de acondicionamiento del cabello, tales como suavidad y brillo incluso después de un uso repetido de las mismas.

Por tanto, aunque se han propuesto diversas formulaciones anticaspas, todavía existe la necesidad de productos tópicos que proporcionen una acción más efectiva contra la

caspa y los síntomas asociados a la misma y proporcionen unas propiedades satisfactorias de acondicionamiento del cabello.

EXPLICACIÓN DE LA INVENCION

5

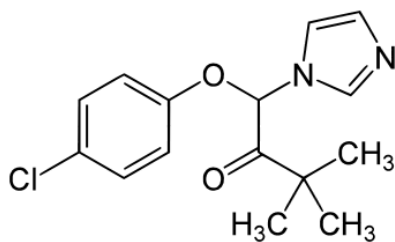
Los inventores han encontrado que la combinación de climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol presenta un efecto mejorado en el tratamiento y prevención de la caspa que es superior al efecto que se podría esperar, debido a que se produce un efecto sinérgico entre los mencionados ingredientes activos. En particular, la combinación de la invención es muy eficaz en la reducción de la caspa. En muchos casos permite la completa eliminación de la caspa y previene el efecto rebote que provoca la reaparición de la misma después de dejar el tratamiento.

Adicionalmente, la combinación de la invención favorece la eliminación de las escamas superficiales y presenta propiedades calmantes de la piel, aportando hidratación y confort.

Aunque se han descrito formulaciones que pueden ser útiles para el tratamiento de la caspa que incluyen cada uno de los tres componentes por separado y otros componentes adicionales, la combinación de estos tres componentes y su efecto sinérgico en el tratamiento y/o prevención de la caspa no ha sido descrito hasta el momento.

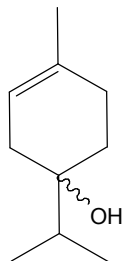
Así, un aspecto de la presente invención se refiere a una combinación que comprende climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol.

Climbazol es el nombre genérico del compuesto (*RS*)-1-(4-clorofenoxi)-1-imidazol-1-il-3,3-dimetilbutan-2-ona, cuya estructura química es la siguiente:



30

El terpinen-4-ol es alcohol monoterpenoide, constituyente de los aceites esenciales de varias plantas aromáticas. Su nombre químico es 4-metil-1-propan-2-ilciclohex-3-en-1-ol y su estructura química es la siguiente:



5

El término "extracto de sauce" se utiliza aquí con su significado convencional para referirse a preparaciones concentradas obtenidas utilizando procedimientos de extracción a partir de sauce mediante los medios apropiados. Los medios apropiados para extraer los principios activos incluyen, por ejemplo, macerar el sauce con 2-
10 metilpropano-1,3-diol, recuperar el líquido de extracción y opcionalmente filtrar el líquido obtenido. Otros medios incluyen el uso de disolventes orgánicos, microondas o extracción con fluidos supercríticos (tal como CO₂ supercrítico). Principalmente, la parte utilizada para la preparación del extracto son las hojas y la corteza desecada de ramas de sauce.

15

El extracto de sauce contiene varios constituyentes, muchos de ellos activos, entre ellos polifenoles, flavonoides y derivados salicílicos. Generalmente, los polifenoles, que representan entre un 8 y un 20% en peso con respecto al peso total del extracto, se encuentran representados por taninos del tipo catéquico. Generalmente, los
20 flavonoides, que representan entre un 0,2 y un 1,5% en peso con respecto al peso total del extracto, están caracterizados por los glucósidos de isoquercitrina, naringina, isosalipurpósido, quercetina e isorhamnetina. Generalmente, los derivados salicílicos, que representan entre un 1,5 y un 11% en peso con respecto al peso total del extracto, se encuentran representados por la salicina o salicósido que es un glucósido de la
25 saligenina, salicortina, tremulacina y salirrepósido. El extracto de sauce contiene además ácidos orgánicos, tales como ácido salicílico, vainílico, siringico, cafeico, p-hidroxibenzoico, cumárico y ferúlico, así como oligo- y polisacáridos, tales como pectinas, galactanos y arabinanos. Otros componentes minoritarios también pueden estar presentes en el extracto sin afectar la utilidad del mismo.

30

En una realización particular, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, cada uno de los componentes de la combinación está en una cantidad suficiente para que en combinación con el resto de componentes de la combinación se produzca un efecto sinérgico de la combinación en su conjunto.

En otra realización particular, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, la presente invención se refiere a la combinación definida anteriormente, donde el extracto de sauce comprende polifenoles, flavonoides y derivados salicílicos. Más particularmente, el extracto de sauce comprende entre un 8 y un 20% en peso de polifenoles con respecto al peso total del extracto; entre un 0,2 y un 1,5% en peso de flavonoides con respecto al peso total del extracto y entre un 1,5 y un 11% en peso de derivados salicílicos con respecto al peso total del extracto. Aún más particularmente, el extracto de sauce comprende además uno o más ácidos orgánicos seleccionados del grupo que consiste en ácido salicílico, vainílico, siringico, cafeico, p-hidroxibenzoico, cumárico y ferúlico, y/o uno o más oligo- o polisacáridos seleccionados del grupo que consiste en pectinas, galactanos y arabinanos.

En otra realización particular, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, la presente invención se refiere a la combinación definida anteriormente, donde el extracto de sauce es obtenible mediante un procedimiento que comprende la extracción de hojas y/o la corteza desecada de ramas de sauce, preferiblemente de la corteza mediante una maceración del sauce con 2-metilpropano-1,3-diol, recuperación del líquido de extracción y opcionalmente filtración del mismo; o bien a) la extracción de hojas y/o la corteza desecada de ramas de sauce, preferiblemente de la corteza con disolventes orgánicos, microondas o fluidos supercríticos; b) separación del extracto obtenido y c) eliminación del disolvente.

En otra realización particular, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, el extracto de sauce es extracto de sauce blanco (*Salix Alba*), más particularmente extracto de hojas y/o de corteza de sauce blanco.

En una realización preferida, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, la presente invención se refiere a la combinación definida anteriormente, donde la relación en peso entre climbazol, extracto de sauce y terpinen-
5 4-ol es de entre 100 y 1000 partes de climbazol, entre 6 y 75 partes de extracto de sauce y entre 46 y 555 partes de terpinen-4-ol, es decir, la relación de peso entre los tres componentes es 100-1000:6-75:46-555, más preferiblemente es 250-500:15-25:100-300, y más preferiblemente es 500:25:185.

10 En otra realización particular, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, la combinación de la invención que comprende climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol, comprende además uno o más agentes antiseborreicos. Los agentes antiseborreicos se utilizan preferiblemente en
15 formulaciones para la caspa grasa.

Ejemplos de agentes antiseborreicos incluyen, sin limitación, undecilenoil glicina (Glycine, N-(1-oxo-10-undecenoyl)), sulfuro de selenio, piritiona de zinc o sus sales o ésteres, azufre sublimado, bioazufre, tioxolona, sulfato sódico del aceite de esquisto,
20 extractos vegetales y/o marinos como Cucurbita pepo, Epilobium angustifolium, Linum usitaissimum, extracto de quina, resorcina, urea y alquitrán de hulla.

En una realización preferida, los agentes antiseborreicos se seleccionan entre undecilenoil glicina (Glycine, N-(1-oxo-10-undecenoyl)).
25

En otra realización particular, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, la combinación de la invención que comprende climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol, comprende además uno o más agentes antiprurito.
30 Los agentes antiprurito alivian los picores producidos por la presencia de la caspa en el cuero cabelludo.

Ejemplos de agentes antiprurito incluyen, sin limitación, extracto de manzanilla, extracto de aloe vera, extracto de avena, extracto de cebada y extracto de caléndula.
35

En una realización preferida, el agente antiprurito comprende uno o más derivados del ácido gálico (ácido 3,4,5-trihidroxibenzoico). Más preferiblemente, el agente antiprurito comprende propil galato, galil glucósido, epigallocatequina y galatil glucósido.

5 La combinación de la invención puede formar parte de una composición tópica cosmética o farmacéutica. Así, la composición tópica cosmética o farmacéutica de la presente invención comprende una cantidad efectiva de la combinación definida anteriormente junto con uno o más excipientes o portadores tópicos farmacéuticamente o cosméticamente aceptables.

10

Las realizaciones particulares y preferidas descritas anteriormente en relación con la combinación de la invención son también realizaciones particulares y preferidas de las composiciones farmacéuticas y cosméticas de la invención.

15 En una realización particular, la composición tópica es una composición farmacéutica que comprende una cantidad efectiva de la combinación definida anteriormente junto con uno o más excipientes o portadores tópicos apropiados farmacéuticamente aceptables.

20 En otra realización particular, la composición tópica es una composición cosmética que comprende una cantidad efectiva de la combinación definida anteriormente junto con uno o más excipientes o portadores tópicos apropiados cosméticamente aceptables.

Para los fines de la presente invención, una "cantidad efectiva" de la combinación se
25 refiere a la cantidad de los principios activos que, proporcionando un efecto terapéutico o cosmético después de su aplicación, es suficientemente baja como para evitar efectos secundarios a una relación beneficio/riesgo razonable. En el caso de composiciones farmacéuticas, la cantidad efectiva es la "cantidad terapéuticamente efectiva" y se refiere a la cantidad de la combinación de la invención que, cuando se
30 administra, es suficiente para prevenir el desarrollo de, o aliviar en cierta medida, la caspa o uno o más de los síntomas de la misma. La dosis particular del compuesto administrado de acuerdo con esta invención, por supuesto, se determinará por las circunstancias particulares que rodean al caso, la duración del tratamiento, la naturaleza de cualquier tratamiento concurrente, la combinación específica de
35 ingredientes activos empleados, los excipientes concretos utilizados y otros factores

conocidos por el experto.

El término “farmacéuticamente aceptable” se refiere aquí a los excipientes y/o portadores apropiados para su uso en la tecnología farmacéutica para la preparación
5 de las composiciones con uso médico.

El término “cosméticamente aceptable” se refiere aquí a los excipientes o portadores apropiados para su uso en contacto con la piel humana y/o cuero cabelludo sin toxicidad, incompatibilidad, inestabilidad, respuesta alérgica inapropiadas, entre otros.
10

La composición tópica de la presente invención puede aplicarse directamente sobre el cuero cabelludo con el fin de prevenir, reducir o eliminar completamente la caspa del cuero cabelludo y/o los síntomas asociados a la misma, sin que se produzca irritación debida a la aplicación de la misma.
15

La composición tópica de la presente invención puede formularse en varias formas, siempre que puedan aplicarse sobre la piel, en particular, sobre el cuero cabelludo. Dichas formas incluyen, sin estar limitadas a las mismas, lociones, tónicos, cremas, geles, espumas, champús, pulverizadores, aerosoles, etc. Una composición preferida
20 puede estar en forma de un producto de cuidado del cuero cabelludo, tal como una loción, un champú o un pulverizador.

Las composiciones tópicas farmacéuticas o cosméticas definidas anteriormente comprenden excipientes o portadores apropiados para la administración tópica que
25 pueden ser excipientes farmacéuticos o cosméticos e incluyen, sin limitación, conservantes, quelantes, espesantes, reguladores de pH, humectantes, tensioactivos, acondicionadores, nacarantes, perfumes y solubilizantes. Los excipientes o portadores utilizados tienen afinidad por la piel, son bien tolerados, estables, y se utilizan en una cantidad apropiada para proporcionar la consistencia deseada y facilidad en la
30 aplicación.

Ejemplos de agentes conservantes tópicos apropiados incluyen, sin estar limitados a los mismos, clorfenesina (Nombre INCI: Chlorphenesin; 1,2-Propanediol, 3-(4-chlorophenoxy)), metilisotiazolinona (MIT) (Nombre INCI: Aqua y
35 Methylisothiazolinone) y fenoxietanol (Nombre INCI: Phenoxyethanol).

Ejemplos de agentes quelantes tópicos apropiados incluyen, sin estar limitados a los mismos, fitato de sodio (Nombre INCI: Sodium Phytate y Aqua).

- 5 Ejemplos de espesantes apropiados incluyen, sin estar limitados a los mismos, Hydroxypropyl Guar Hydroxypropyltrimonium Chloride, PEG/PPG-120/10-Trimethylolpropane Trioleate y Laureth-2 y Aqua.

- 10 Ejemplos de agentes tópicos reguladores del pH incluyen, sin estar limitados a los mismos, NaOH y ácido cítrico. Ejemplos de humectantes apropiados incluyen, sin estar limitados a los mismos, glicerina

- 15 Ejemplos de agentes tensioactivos tópicos apropiados incluyen, sin estar limitados a los mismos, Cocamide DEA (Nombre INCI: Cocamide DEA y Glycerin y Aqua), Lauril Éter Sulfato Sódico (Nombre INCI: Aqua y Sodium Laureth Sulfate), PEG-7 Glyceryl Cocoate, TEA-Lauryl Sulfate (Nombre INCI: Aqua y TEA-Lauryl Sulfate) y Cocamidopropyl Betaine (Nombre INCI: Aqua y Cocamidopropyl Betaine).

- 20 Ejemplos de agentes solubilizantes apropiados incluyen, sin estar limitados a los mismos, Alcohol etílico 96 (Nombre INCI: Alcohol Denat), aceite de ricino hidrogenado PEG40 (Nombre INCI: PEG-40 Hydrogenated Castor Oil) y agua purificada

- 25 Adicionalmente, las composiciones de la presente invención pueden contener otros ingredientes, como por ejemplo, acondicionadores, nacarantes, perfumes y otros componentes conocidos en el estado de técnica anterior referente a formulaciones tópicas.

- 30 Las composiciones tópicas farmacéuticas y cosméticas de la invención pueden prepararse de acuerdo con métodos bien conocidos en el estado de la técnica. Los excipientes apropiados y/o portadores, y sus cantidades, pueden ser determinados fácilmente por los expertos en la técnica de acuerdo con el tipo de formulación preparada. La combinación concreta de componentes en la composición estará determinada en gran medida por su compatibilidad química. En particular, dicha selección tendrá en cuenta que el resto de los componentes no interfieran con el
- 35 efecto del climbazol, el extracto de sauce y el terpinen-4-ol.

Generalmente, la cantidad de climbazol en la composición tópica farmacéutica o cosmética de la invención está comprendida entre 0,10-1,00 % en peso con respecto al peso total de la composición, y preferiblemente es 0,50%.

5

La cantidad de extracto de sauce, preferiblemente, extracto de hojas y/o de corteza de sauce blanco, en la composición tópica farmacéutica o cosmética de la invención está comprendida generalmente entre 0,006-0,075% en peso con respecto al peso total de la composición, y preferiblemente es 0,025%.

10

Generalmente, la cantidad de terpinen-4-ol en la composición tópica farmacéutica o cosmética de la invención puede estar comprendida entre 0,046-0,555% en peso con respecto al peso total de la composición, y preferiblemente es 0,185%.

15

Generalmente, la cantidad de agente antiseborreico en la composición tópica farmacéutica o cosmética de la invención cuando está presente puede estar comprendida entre 1,0-3,0% en peso con respecto al peso total de la composición, más preferiblemente es 2,0%.

20

Generalmente, la cantidad de agente antiprurito en la composición tópica farmacéutica o cosmética de la invención cuando está presente puede estar comprendida entre 0,05-0,15% en peso con respecto al peso total de la composición, más preferiblemente es 0,062%. El agente antiprurito puede estar en forma de solución, por lo que las cantidades a añadir de estos componentes, que podrán ser determinadas fácilmente

25

por un experto en la materia, podrían cambiar.

En una realización preferida, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, la composición la invención contiene el producto Trikenol Plus disponible comercialmente (Provital). Dicho producto contiene un 71,5% en peso de 2-metilpropano-1,3-diol, un 18,5% en peso de terpinen-4-ol, un 7,5% en peso de ácido salicílico y 2,5% en peso de extracto de sauce, con respecto al peso total de Trikenol Plus.

30

En una realización más preferida, la totalidad del extracto de sauce y de terpinen-4-ol de la invención provienen del producto Trikenol Plus. Así, en una realización preferida, la relación en peso entre climbazol y Trikenol Plus es de entre 10 y 100 partes de climbazol y entre 25 y 300 partes de Trikenol Plus, es decir, la relación de peso entre los dos componentes es 10-100:25-300, más preferiblemente 25-50:50-100 y más preferiblemente es 50:100.

En otra realización preferida, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, tópica farmacéutica o cosmética de la invención comprende o consiste en los siguientes componentes:

- (i) climbazol;
- (ii) extracto de sauce, preferiblemente de hojas y/o de corteza de sauce blanco;
- (iii) terpinen-4-ol;
- (iv) opcionalmente uno o más agentes antiseborreicos;
- (v) opcionalmente uno o más agentes antiprurito;
- (vi) uno o más excipientes y/o portadores apropiados cosméticamente o farmacéuticamente aceptables.

En una realización más preferida, la composición tópica farmacéutica o cosmética de la invención comprende o consiste en los siguientes componentes:

- (i) climbazol;
- (ii) extracto de sauce, preferiblemente de hojas y/o de corteza de sauce blanco;
- (iii) terpinen-4-ol;
- (iv) 2-metilpropano-1,3-diol;
- (v) ácido salicílico;
- (vi) opcionalmente uno o más agentes antiseborreicos;
- (vii) opcionalmente uno o más agentes antiprurito;
- (viii) uno o más excipientes y/o portadores apropiados cosméticamente o farmacéuticamente aceptables.

En otra realización preferida, opcionalmente en combinación con una o más características de las diversas realizaciones particulares o preferidas anteriormente o posteriormente definidas, tópica farmacéutica o cosmética de la invención comprende

además un agente queratolítico, como por ejemplo ácido salicílico, y/o un activador de la absorción, como por ejemplo 2-metilpropano-1,3-diol.

En una realización más preferida, la cantidad de climbazol está comprendida entre
5 0,10-0,50% en peso con respecto al peso total de la composición; la cantidad de extracto de sauce, preferiblemente extracto de hojas y/o de corteza de sauce blanco, está comprendida entre 0,006-0,075% en peso con respecto al peso total de la composición; la cantidad de terpinen-4-ol está comprendida entre 0,046-0,555% en peso con respecto al peso total de la composición; la cantidad de 2-metilpropano-1,3-
10 diol está comprendida entre 0,179-2,145% en peso con respecto al peso total de la composición, más preferiblemente es 0,715%; la cantidad de ácido salicílico está comprendida entre 0,019-0,225% en peso con respecto al peso total de la composición, más preferiblemente es 0,075%; la cantidad de agente antiseborreico está comprendida entre 1,0-3,0% en peso con respecto al peso total de la
15 composición; y la cantidad de agente antiprurito está comprendida generalmente entre 0,05 -0,15% en peso con respecto al peso total de la composición, siendo la suma de componentes de la composición tópica farmacéutica o cosmética 100%.

La combinación de la invención que comprende climbazol, extracto de sauce y
20 terpinen-4-ol se puede utilizar para propósitos no terapéuticos (i.e., cosméticos) como agente anticaspa. Así, otro aspecto de la presente invención se refiere al uso cosmético de la combinación tal como se ha definido anteriormente como agente anticaspa.

25 Para los fines de la presente invención, el término "cosmético" pretende denotar un uso para el cuidado del cabello, en particular un uso para proporcionar un efecto estético que comprende mejorar la apariencia del cabello.

Cuando la combinación de climbazol, el extracto de sauce y el terpinen-4-ol definida
30 anteriormente se utiliza con fines cosméticos, forma parte de una composición cosmética tópica.

Adicionalmente, la combinación de la invención se puede utilizar con propósitos
35 terapéuticos para el tratamiento de la caspa y/o síntomas asociados a la misma en individuos que padecen una descamación excesiva del cuero cabelludo y/o una

excesiva presencia de hongos del tipo *Malassezia* en el cuero cabelludo. La combinación de la invención también se puede utilizar para prevenir, el efecto rebote que provoca la reaparición de la caspa después de dejar el tratamiento, preferiblemente a corto plazo, es decir en un periodo de unas 2-3 semanas.

5

Generalmente, se considera que un individuo padece una descamación excesiva del cuero cabelludo cuando la descamación es superior a aproximadamente 487000 células/cm² después del lavado. En los individuos que padecen caspa, la descamación del cuero cabelludo puede llegar hasta aproximadamente 800000 células/cm².

10

Generalmente, se considera que la presencia de hongos del tipo *Malassezia* es excesiva cuando la densidad de estos microorganismos es superior a aproximadamente 10³-10⁵ microorganismos por mm². En los individuos que padecen caspa, la densidad de estos microorganismos suele aumentar de 1,5 a 2 veces su densidad normal.

15

Así, otro aspecto de la presente invención se refiere a la combinación definida anteriormente que comprende climbazol, el extracto de sauce y el terpinen-4-ol, para su uso en el tratamiento de la caspa y/o uno o más síntomas asociados a la misma. Otro aspecto de la presente invención se refiere a la combinación definida

20 anteriormente que comprende climbazol, el extracto de sauce y el terpinen-4-ol, para prevenir, el efecto rebote que provoca la reaparición de la caspa después de dejar el tratamiento.

25

Estos aspectos también pueden formularse como el uso de la combinación definida anteriormente que comprende climbazol, el extracto de sauce y el terpinen-4-ol, para la preparación de una composición para el tratamiento de la caspa y/o uno o más síntomas asociados a la misma; y como uso de la combinación definida anteriormente que comprende climbazol, el extracto de sauce y el terpinen-4-ol, para la preparación

30 de una composición para prevenir el efecto rebote que provoca la reaparición de la caspa después de dejar el tratamiento.

35

También forma parte de la invención un método para el tratamiento de la caspa y/o uno o más síntomas asociados a la misma que comprende administrar a un mamífero, preferiblemente un ser humano, una cantidad segura y terapéuticamente efectiva de la combinación definida anteriormente que comprende climbazol, el extracto de sauce y

el terpinen-4-ol, junto con uno o más excipientes y/o portadores apropiados farmacéuticamente aceptables.

5 También forma parte de la invención un método para prevenir, el efecto rebote que provoca la reaparición de la caspa después de dejar el tratamiento que comprende administrar a un mamífero, preferiblemente un ser humano, una cantidad segura y terapéuticamente efectiva de la combinación definida anteriormente que comprende climbazol, el extracto de sauce y el terpinen-4-ol, junto con uno o más excipientes y/o portadores apropiados farmacéuticamente aceptables.

10

A efectos de la presente descripción, el término "tratamiento" incluye reducción o eliminación de la caspa y/o uno o más síntomas asociados a la misma. Generalmente, los síntomas asociados a la caspa o descamación excesiva del cuero cabelludo, incluyen prurito, enrojecimiento e irritación.

15

En una realización particular, la caspa es caspa seca. En otra realización particular, la caspa es caspa grasa. En otra realización particular, los síntomas asociados a la caspa se seleccionan entre prurito, enrojecimiento e irritación.

20

En otra realización particular, la combinación de la invención forma parte de una composición farmacéutica que además comprende uno o más excipientes y/o portadores farmacéuticamente aceptables. En otra realización particular, la combinación de la invención forma parte de una composición cosmética que comprende además uno o más excipientes apropiados cosméticos y/o portadores

25

aceptables.

A lo largo de la descripción y las reivindicaciones la palabra "comprende" y sus variantes no pretenden excluir otras características técnicas, aditivos, componentes o pasos. Además, la palabra "comprende" incluye el caso "consiste en". Para los

30 expertos en la materia, otros objetos, ventajas y características de la invención se desprenderán en parte de la descripción y en parte de la práctica de la invención. Los siguientes ejemplos se proporcionan a modo de ilustración, y no se pretende que sean limitativos de la presente invención. Además, la presente invención cubre todas las posibles combinaciones de realizaciones particulares y preferidas descritas en el

35 presente documento.

EJEMPLOS

Ejemplo 1. Champú caspa grasa

- 5 Se preparó un champú con la siguiente composición:

Componente	% (p/p)
Climbazol	0,50
Trikenol Plus (1)	1,00
Undecilenoil glicina (2)	2,00
Reguladores de pH (6)	c.s.p. pH 5,80 ± 0,3
Conservantes (3), quelantes (4), espesantes (5), humectantes (7), tensioactivos (8), acondicionador (9), nacarantes (10), solubilizantes (11), perfumes	c.s.p. 100 g

c.s.p. = cantidad suficiente para

- 10 (1) Trikenol Plus contiene 71,5% en peso de 2-metilpropano-1,3-diol, 18,5% en peso de terpinen-4-ol, 7,5% en peso de ácido salicílico y 2,5% en peso de extracto de sauce, con respecto al peso total de la composición (Nombre INCI: Methylpropanediol y 4-Terpineol y Salicylic Acid y Salix Alba Bark Extract); (2) Nombre INCI: Undecylenoyl Glycine y Aqua; (3) clorfenesina (1,2-Propanediol, 3-(4-chlorophenoxy)-
- 15 Nombre INCI: Chlorphenesin), metilisotiazolinona (MIT) (Nombre INCI: Aqua y Methylisothiazolinone) y fenoxietanol (Nombre INCI: Phenoxyethanol); (4) Fitato de sodio (Nombre INCI: Sodium Phytate y Aqua); (5) Nombre INCI: Hydroxypropyl Guar Hydroxypropyltrimonium Chloride, Nombre INCI: PEG/PPG-120/10-Trimethylolpropane Trioleate y Laureth-2 y Aqua; (6) NaOH (Nombre INCI: Sodium Hydroxide y Aqua) y
- 20 ácido cítrico (Nombre INCI: Citric Acid); (7) Glicerina (Nombre INCI: Glycerin); (8) Cocamide DEA (Nombre INCI: Cocamide DEA y Glycerin y Aqua), Lauril Éter Sulfato Sódico (Nombre INCI: Aqua y Sodium Laureth Sulfate), PEG-7 Gliceril Cocoato (Nombre INCI: PEG-7 Glyceryl Cocoate), TEA-Lauril Sulfato (Nombre INCI: Aqua y TEA-Lauryl Sulfate) y Cocamidopropil Betaína (Nombre INCI: Aqua y Cocamidopropyl

Betaine); (9) Polyquaternium-47 (Nombre INCI: Aqua y Polyquaternium-47); (10) Nombre INCI: Aqua y Glycol Distearate y Laureth-4 y Cocamidopropyl Betaine y Glycerin; (11) agua purificada

- 5 Para la preparación del champú se disolvió uno de los espesantes mediante agitación en agua purificada y una vez disuelto se añadió el regulador de pH ácido. A parte, se disolvió el primer conservante (chlorfenesina) en agua, calentando la mezcla a 60 °C, hasta total transparencia, y se incorporó al reactor principal, siempre manteniendo la agitación. En otro reactor auxiliar, se preparó la disolución del compuesto
- 10 antiseborreico (Undecilenoil glicina) con agua y hidróxido sódico, calentando la mezcla hasta 85-90 °C, y mediante agitación, se incorporó también al reactor principal. A continuación, y siempre manteniendo la agitación, se añadieron y disolvieron la glicerina, los tensioactivos y el acondicionador. A continuación se añaden el segundo conservante (MIT), el quelante y el segundo espesante. Una vez comprobada la
- 15 transparencia y la disolución total de la mezcla, se adicionó con agitación, la mezcla completamente transparente del antifúngico (Climbazol) junto con fenoxietanol como conservante, y finalmente se añadieron el otro activo anticaspa (Trikenol Plus), el agente nacarante y el perfume. Se ajustó el pH final de la formulación mediante la adición del regulador de pH básico. Se comprobó el pH final y se descargó la mezcla
- 20 para envasado.

Ejemplo 2. Champú caspa seca

Se preparó un champú con la siguiente composición:

Componente	% (p/p)
Climbazol	0,50
Trikenol Plus (1)	1,00
Reguladores de pH (5)	c.s.p. pH= 5,0 ± 0,3
Conservantes (2), quelantes (3), espesantes (4), humectantes (6), tensioactivos (7), acondicionador (8), nacarantes (9), solubilizantes (10), perfumes	c.s.p. 100 g

(1) Trikenol Plus contiene 71,5% en peso de 2-metilpropano-1,3-diol, 18,5% en peso de terpinen-4-ol, 7,5% en peso de ácido salicílico y 2,5% en peso de extracto de sauce, con respecto al peso total de la composición (Nombre INCI: Methylpropanediol y 4-Terpineol y Salicylic Acid y Salix Alba Bark Extract); (2) clorfenesina (1,2-
 5 Propanediol, 3-(4-chlorophenoxy)- Nombre INCI: Chlorphenesin), metilisotiazolinona (Nombre INCI: Aqua y Methylisothiazolinone) y fenoxietanol (Nombre INCI: Phenoxyethanol); (3) Fitato de sodio (Nombre INCI: Sodium Phytate y Aqua); (4) Nombre INCI: Hydroxypropyl Guar Hydroxypropyltrimonium Chloride; Nombre INCI: PEG/PPG-120/10-Trimethylolpropane Trioleate y Laureth-2 y Aqua); (5) NaOH
 10 (Nombre INCI: Sodium Hydroxide y Aqua) y ácido cítrico (Nombre INCI: Citric Acid); (6) Glicerina (Nombre INCI: Glycerin); (7) Cocamide DEA (Nombre INCI: Cocamide DEA y Glycerin y Aqua), Lauril Éter Sulfato Sódico (Nombre INCI: Aqua y Sodium Laureth Sulfate), PEG-7 Gliceril Cocoato (Nombre INCI: PEG-7 Glyceryl Cocoate), TEA-Lauril Sulfato (Nombre INCI: Aqua y TEA-Lauryl Sulfate) y Cocamidopropil Betaína (Nombre
 15 INCI: Aqua y Cocamidopropyl Betaine); (8) Polyquaternium-47 (Nombre INCI: Aqua y Polyquaternium-47)); (9) Nombre INCI: Aqua y Glycol Distearate y Laureth-4 y Cocamidopropyl Betaine y Glycerin; (10) agua purificada

Para la preparación del champú se disolvió uno de los espesantes mediante agitación
 20 en agua purificada y una vez disuelto se añadió el regulador de pH ácido. A parte, se disolvió el primer conservante (clorfenesina) en agua, calentando la mezcla a 60 °C, hasta total transparencia, y se incorporó al reactor principal. A continuación, y siempre manteniendo la agitación, se añadieron y disolvieron los tensioactivos, la glicerina y el acondicionador. A continuación se añadieron el segundo conservante (MIT), el
 25 quelante y el segundo espesante. Una vez comprobada la transparencia y la disolución total de la mezcla, se adicionó con agitación, la mezcla completamente transparente del antifúngico (Climbazol) junto con fenoxietanol como conservante y finalmente se añadieron el otro activo anticaspa (Trikenol Plus), el agente nacarante y el perfume. Se ajustó el pH final de la formulación mediante la adición del regulador de
 30 pH básico. Se comprobó el pH final y se descargó la mezcla para envasado.

Ejemplo 3. Loción anticaspa

Se preparó una loción con la siguiente composición:

Componente	% (p/p)
Climbazol	0,50
Trikenol Plus (1)	1,00
Agente antiprurito (2)	3,00
Acondicionador (3), solubilizantes distintos del agua (4), solubilizante (5), perfume	c.s.p. 100 g

(1) Trikenol Plus contiene 71,5% en peso de 2-metilpropano-1,3-diol, 18,5% en peso de terpinen-4-ol, 7,5% en peso de ácido salicílico y 2,5% en peso de extracto de sauce, con respecto al peso total de la composición (Nombre INCI: Methylpropanediol y 4-Terpineol y Salicylic Acid y Salix Alba Bark Extract); (2) (Nombre INCI: Aqua y Propyl Gallate y Gallyl Glucoside y Epigallocatechin Gallatyl Glucoside) ; (3) Pantenol (Nombre INCI: Panthenol); (4) Alcohol etílico 96 (Nombre INCI: Alcohol Denat), aceite de ricino hidrogenado PEG40 (Nombre INCI: PEG-40 Hydrogenated Castor Oil); (5) Agua purificada

Para la preparación de la loción anticasca se mezcló, agitó y disolvió el activo antifúngico (Climbazol) con el solubilizante (aceite de ricino hidrogenado PEG40). Con posterioridad se añadió alcohol etílico del 96% junto con el otro activo anticasca (Trikenol Plus) y el perfume. A continuación, y siempre manteniendo la agitación, se añadió agua purificada y el activo antiprurito agitándose hasta comprobar transparencia. A parte se calentó el hidratante hasta 70 °C junto con una pequeña cantidad de agua purificada, para su disolución, y se añadió al reactor principal. Se agitó hasta conseguir la total homogeneidad de la solución. Se comprobó el pH final y se descargó la mezcla para envasado.

Estudio de efectividad

Se realizó un estudio de eficacia de los champús y la loción descritos en los ejemplos 1, 2 y 3. El estudio se realizó durante 28 días en voluntarios y se evaluaron los siguientes parámetros:

- Caspa
- Seborrea

La evaluación se realizó mediante técnicas no invasivas sobre los voluntarios utilizándose las siguientes técnicas:

- Fotografía global del cuero cabelludo
- Observación con microcámara y microfotografía de las zonas con caspa
- 5 • Evaluación de la caspa
- Evaluación del sebo

Los voluntarios realizaron un «período de blanqueo» de dos semanas de duración para eliminar los restos de cualquier tratamiento anticaspa anterior sobre el cuero cabelludo. Trascurridos 28 días de tratamiento con los productos asignados se realizaron sobre los voluntarios los siguientes controles:

- Observación del estado del cuero cabelludo
- Fotografía el cuero cabelludo de forma global
- Toma de imágenes de la observación con microcámara del cuero cabelludo
- 15 • Evaluación de la intensidad de la descamación
- Recogida de muestra de las escamas medición del grado de seborrea del cuero cabelludo

Observación del estado del cuero cabelludo

20 Se evaluó la presencia y el grado de intensidad de caspa y seborrea, así como la presencia de alteraciones cutáneas como enrojecimiento, picor y heridas por rascado. Se realizaron fotografías de las zonas del cuero cabelludo más afectadas por la caspa de cada voluntario.

25 Fotografía el cuero cabelludo de forma global y toma de imágenes de la observación con microcámara del cuero cabelludo

La microcámara es un equipo diagnóstico profesional constituido por una sonda para la exploración del cuero cabelludo y un software de captación y visualización de imágenes. La función de la microcámara es permitir la visión directa ampliada de una zona del cuero cabelludo para observar el estado en que se encuentra: si hay presencia de descamación, grasa, enrojecimiento, etc.

30

Los atributos en estudio -caspa y seborrea- se evaluaron en una escala de 4 valores. El valor más bajo (0) corresponde al grado «ausencia» de dicho atributo y el valor más

alto (4) corresponde al grado «alto». Los valores intermedios 1, 2 y 3 corresponden a los grados «poco», «regular» y «bastante», respectivamente. Se descartan grados de caspa (5) por ser considerados patológicos, del tipo psoriásico, dermatitis seborreica, etc. Los resultados de la observación de la caspa y la seborrea en cada voluntario se
5 recogieron en su ficha.

Medida de la caspa (CORNEOFIX®)

La caspa del cuero cabelludo se midió antes de empezar el tratamiento (T0) y a los 28 días (T28) para valorar si los champús eran eficaces para el tratamiento de la caspa.
10 El voluntario no se había lavado el cabello en las 48 h anteriores a la medida para evitar la reducción artificial del valor de caspa que se obtiene poco después del lavado del cabello.

Zona de medición: Donde la descamación es más abundante

15 Método: Corneofix®, CKelectronic, Cologne, Germany

Condiciones ambientales: 21 ± 2 °C, $60 \pm 5\%$ humedad relativa (HR)

Medida de la grasa (SEBUFIX®)

La grasa del cuero cabelludo se midió antes de empezar el tratamiento (T0) y a los 28 días (T28) para valorar si los champús poseían propiedades seborreguladoras. El
20 voluntario no se había lavado el cabello en las 48 h anteriores a la medida para evitar la reducción artificial del valor de sebumetría que se obtiene cuando la medida se realiza poco después del lavado del cabello.

25 Zona de medición: Parte superior de cuero cabelludo, a 10 cm aprox. de la línea frontal de implantación del cabello

Método: Sebufix®, CKelectronic,

Champú Ejemplo 1

30 Tras 28 días de tratamiento un 70% de los voluntarios presentó una disminución en el grado de caspa, de los cuales un 78,5% presentó una eliminación completa (grado 0).

Champú Ejemplo 2

35 Tras 28 días de tratamiento un 90% presentó una disminución del grado de caspa, de los cuales un 44.4% presentó una eliminación completa (grado 0).

Loción Ejemplo 3

Tras 28 días de tratamiento un 76% presentó una reducción en el grado de caspa, de los cuales un 62,5% presentó una eliminación completa (grado 0).

5

A tenor de los resultados obtenidos a través de las pruebas realizadas en el estudio de valoración de la eficacia anticasca de los tres productos testados champú ejemplo 1, champú ejemplo 2 y loción ejemplo 3 en una serie de voluntarios, se obtienen las siguientes conclusiones:

10

Champú Ejemplo1:

- Se obtuvo un buen resultado a la hora de tratar a voluntarios con un tipo de caspa grasa de un grado medio-bajo de (1 y 2). Este grado de caspa disminuyó o se eliminó del todo al cabo de 28 días de tratamiento y favoreció la no reaparición tras 15 días de dejar el tratamiento en el 75 % de los casos.
- El champú del ejemplo 1 minimizó los picores producidos por la presencia de la caspa en el cuero cabelludo en el 60% de los voluntarios.

15

Champú Ejemplo 2:

- El champú del ejemplo 2 tuvo una buena eficacia para tratar la caspa en voluntarios con cuero cabelludo seco.
- Estos voluntarios presentaban un tipo de caspa seca, que mejoró con el champú ejemplo 2, ya que éste favoreció la eliminación de las escamas superficiales y aportó al mismo tiempo hidratación y confort a la piel.
- El champú del ejemplo 2 también calmó la piel y aportó confort en el 65% de los voluntarios y en el 70% de los voluntarios alivió la sensación de picor.

20

25

Loción Ejemplo 3:

- El uso de la loción del ejemplo 3 dio buen resultado en el tratamiento de caspa grasa en voluntarios con grado medio-alto. Por ello es recomendable este tipo de tratamientos en caso de caspa aguda o en brotes de la misma.
- Más del 70 % de los voluntarios valoraron positivamente la capacidad de reducir el picor que aporta el producto.

30

35

REFERENCIAS CITADAS EN LA SOLICITUD

WO2004006876

US2002172648

5

REIVINDICACIONES

1. Combinación que comprende climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol.
- 5 2. Combinación según la reivindicación 1, donde cada uno de los componentes de la combinación está en una cantidad suficiente para que en combinación con el resto de componentes de la combinación se produzca un efecto sinérgico de la combinación en su conjunto.
- 10 3. Combinación según cualquiera de las reivindicaciones 1-2, donde el extracto de sauce es extracto de hojas y/o de corteza de sauce blanco.
4. Combinación según cualquiera de las reivindicaciones 1-3, donde la relación en peso (peso/peso/peso) entre climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol es
15 100-1000:6-75:46-555.
5. Combinación según la reivindicación 4, donde la relación en peso (peso/peso/peso) entre climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol es 500:25:185.
- 20 6. Combinación según cualquiera de las reivindicaciones 1-5, que además comprende uno o más agentes antiseborreicos.
7. Combinación según la reivindicación 6, donde el agente antiseborreico es undecilenoil glicina.
25
8. Combinación según cualquiera de las reivindicaciones 1-7, que además comprende uno o más agentes antiprurito.
9. Combinación según la reivindicación 8, donde el agente antiprurito comprende uno
30 o más derivados del ácido gálico.
10. Composición tópica farmacéutica o cosmética que comprende una cantidad efectiva de la combinación definida en cualquiera de las reivindicaciones 1-9, junto con uno o más excipientes y/o portadores tópicos apropiados farmacéuticamente o
35 cosméticamente aceptables.

11. Composición tópica farmacéutica o cosmética según la reivindicación 10, donde los excipientes y/o portadores tópicos apropiados farmacéuticamente o cosméticamente aceptables se seleccionan del grupo que consiste en conservantes, quelantes, espesantes, reguladores de pH, humectantes, tensioactivos, acondicionadores, nacarantes, perfumes y solubilizantes.
12. Composición tópica farmacéutica o cosmética según cualquiera de las reivindicaciones 10-11, que comprende los siguientes componentes:
- (i) climbazol;
 - (ii) extracto de sauce, preferiblemente de hojas y/o de corteza de sauce blanco;
 - (iii) terpinen-4-ol;
 - (iv) opcionalmente uno o más agentes antiseborreicos;
 - (v) opcionalmente uno o más agentes antiprurito;
 - (vi) uno o más excipientes y/o portadores apropiados cosméticamente o farmacéuticamente aceptables.
13. Composición tópica farmacéutica o cosmética según la reivindicación 12, que comprende además un agente queratolítico y/o un activador de la absorción.
14. Composición tópica farmacéutica o cosmética según cualquiera de las reivindicaciones 10-13, que es una loción o un champú.
15. Uso de la combinación tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-11, para la preparación de una composición para el tratamiento de la caspa y/o uno o más síntomas asociados a la misma.
16. Uso según la reivindicación 15, donde la caspa es caspa seca o caspa grasa.
17. Uso según cualquiera de las reivindicaciones 15-16, donde los síntomas asociados a la caspa se seleccionan entre prurito, enrojecimiento e irritación.
18. Uso de la combinación tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-11, para la preparación de una composición para prevenir el efecto rebote que provoca la reaparición de la caspa después de dejar el tratamiento.



- ②① N.º solicitud: 201330623
②② Fecha de presentación de la solicitud: 30.04.2013
③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TECNICA

⑤① Int. Cl.: Ver Hoja Adicional

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
Y	TRIKENOL PLUS. Raw material documentation. Provital group. 24.07.2012. Recuperado de Internet [en línea] [recuperado el 24.03.2014] http://www.centerchem.com/Products/DownloadFile.aspx?FileID=6725	1-18
Y	US 2006013796 A1 (CHANDRA LALITESH) 19.01.2006, párrafos 3,9,12,13,14,17,127; ejemplo 1; reivindicaciones 14,15.	1-18
A	US 2011014248 A1 (CASTIEL ISABELLE et al.) 20.01.2011, párrafos 3,23,24,202,269-282.	1,6-8,10-18
A	US 2012121737 A1 (VIELHABER GABRIELE et al.) 17.05.2012, párrafos 22,84,85,100,110,169.	1,8-18
A	US 2010215775 A1 (SCHMAUS GERHARD et al.) 26.08.2010, párrafos 9,16,26,27; reivindicaciones 1,3.	1,8,10-18
A	US 2002172648 A1 (HEHNER URSULA et al.) 21.11.2002, párrafos 20,46,48,54; reivindicación 3.	1,10-18

Categoría de los documentos citados

X: de particular relevancia
Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la misma categoría
A: refleja el estado de la técnica

O: referido a divulgación no escrita
P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación de la solicitud
E: documento anterior, pero publicado después de la fecha de presentación de la solicitud

El presente informe ha sido realizado

para todas las reivindicaciones

para las reivindicaciones nº:

Fecha de realización del informe
24.03.2014

Examinador
A. I. Polo Díez

Página
1/5

CLASIFICACIÓN OBJETO DE LA SOLICITUD

A61K8/49 (2006.01)
A61K8/34 (2006.01)
A61K8/97 (2006.01)
A61Q5/02 (2006.01)
A61P17/00 (2006.01)

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación)

A61K, A61Q, A61P

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

INVENES, EPODOC, WPI, BIOSIS, HCAPLUS, INTERNET

Fecha de Realización de la Opinión Escrita: 24.03.2014

Declaración

Novedad (Art. 6.1 LP 11/1986)	Reivindicaciones 1-18	SI
	Reivindicaciones	NO
Actividad inventiva (Art. 8.1 LP11/1986)	Reivindicaciones	SI
	Reivindicaciones 1-18	NO

Se considera que la solicitud cumple con el requisito de aplicación industrial. Este requisito fue evaluado durante la fase de examen formal y técnico de la solicitud (Artículo 31.2 Ley 11/1986).

Base de la Opinión.-

La presente opinión se ha realizado sobre la base de la solicitud de patente tal y como se publica.

1. Documentos considerados.-

A continuación se relacionan los documentos pertenecientes al estado de la técnica tomados en consideración para la realización de esta opinión.

Documento	Número Publicación o Identificación	Fecha Publicación
D01	TRIKENOL PLUS.	24.07.2012
D02	US 2006013796 A1 (CHANDRA LALITESH)	19.01.2006
D03	US 2011014248 A1 (CASTIEL ISABELLE et al.)	20.01.2011
D04	US 2012121737 A1 (VIELHABER GABRIELE et al.)	17.05.2012
D05	US 2010215775 A1 (SCHMAUS GERHARD et al.)	26.08.2010
D06	US 2002172648 A1 (HEHNER URSULA et al.)	21.11.2002

2. Declaración motivada según los artículos 29.6 y 29.7 del Reglamento de ejecución de la Ley 11/1986, de 20 de marzo, de Patentes sobre la novedad y la actividad inventiva; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

La invención se refiere, según la primera reivindicación, a una composición que comprende climbazol, extracto de sauce y terpinen-4-ol.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 14 aportan detalles de la composición (cantidades) así como aditivos opcionales de la composición (agentes antiseborreicos, agentes antiprurito, etc.)

También es objeto de la invención el uso de la composición para la preparación de una composición para el tratamiento de la caspa o los síntomas asociados a la misma (reivindicaciones 15 a 18)

El documento D1 detalla la composición de TRIKENOL PLUS, composición disponible en el mercado con funciones anticaspa, antiacné, etc., y que comprende, entre otros ingredientes, **terpinen-4-ol** (de un 16 a un 21%) y **extracto de corteza de sauce** (de un 1 a un 4%).

El documento D2 prueba el aceite de tulsi (albahaca) o algunos de sus componentes para el tratamiento del pelo, con objeto de prevenir o tratar la caspa. En el documento se demuestra que el **terpinen-4-ol**, uno de los componentes del aceite de tulsi, tiene efecto sinérgico con el **climbazol**, agente antifúngico sintético (párrafos 3, 9, 12, 13, 14, 17, 127, ejemplo 1, reivindicaciones 14 y 15)

El documento D3 trata de una composición para el tratamiento del cuero cabelludo, concretamente de la caspa grasa y de los problemas asociados a ella como la seborrea o el prurito. La composición puede llevar incorporado un agente anticaspa (se citan como posibles el **climbazol**, el ácido salicílico y el **aceite del árbol del té**, planta del género *Malaleuca* rica en terpinen-4-ol) un agente antiseborreico (entre los que se cita la **undecilenoil glicina**) (párrafos 3, 23, 24, 202, 269-282)

El documento D4 describe composiciones para disminuir la irritación de la piel que contienen trans-4-ter-butil-ciclohexanol. Dichas composiciones pueden encontrarse en forma de champús, tónicos o lociones y contener, entre otros muchos aditivos, agentes contra el prurito o el enrojecimiento, como el **extracto de sauce**, agentes contra la caspa como el **climbazol**, agentes antiarrugas o antiedad como el **propil galato**, aromas como el **4-terpineol**, etc. (párrafos 22, 85, 100, 110, 169)

El documento D5 cita el **climbazol**, y el **aceite del árbol del té** por su actividad anti-caspa como posibles ingredientes solos o mezclados en una composición anticaspa. A estas composiciones se pueden añadir productos naturales de propiedades antiinflamatorias o que alivian el picor y la rojez como el **extracto de sauce** (párrafo 20, 46, 48, 54; reivindicación 3)

El documento D6 trata de composiciones anti-caspa que utilizan combinaciones sinérgicas de antimicrobianos sintéticos entre los que figura el **climbazol**. Además, a estas combinaciones sinérgicas de antimicrobianos, se pueden añadir productos naturales anticaspa como el **extracto de corteza de sauce** (párrafos 9, 16, 26, 27; reivindicaciones 1 y 3).

Novedad (art. 6.2)

Ningún documento del estado de la técnica describe una composición que contenga a la vez los tres compuestos a los que se refiere la reivindicación 1. Por lo tanto, dicha reivindicación, y las reivindicaciones dependientes 2 a 14 cumple el requisito de novedad. También son nuevas las reivindicaciones que se refieren al uso de la composición nueva (15 a 18)

Actividad inventiva (art. 8.2)

Sin embargo, todos los ingredientes de la composición de la reivindicación 1 han formado parte de composiciones anticasca. Es más, se ha demostrado que tomados de dos en dos tiene propiedades sinérgicas (ver documentos D1 y D2).

Consideramos el documento D1 como el más cercano del estado de la técnica ya que se refiere a una composición para tratar la caspa que contiene dos de los ingredientes de la reivindicación 1 (el terpinen-4-ol y el extracto de corteza de sauce). La diferencia entre D1 y la solicitud es que en la composición de la solicitud contiene además climbazol.

El problema a solucionar por la solicitud en estudio sería encontrar una composición alternativa a la D1 con propiedades mejoradas. La solución de añadir a la composición de D1 (que ya tiene extracto de sauce y terpinen-4-ol) el climbazol sería evidente para el experto en la materia a la vista del documento D2, que demuestra el sinergismo entre el terpinen-4-ol y el climbazol.

La utilización conjunta de productos que se han usado previamente con el mismo objetivo y en composiciones del mismo tipo no implica actividad inventiva a no ser que se demuestre una ventaja o efecto técnico sorprendente o mejorado.

En su caso, no existen en la descripción evidencias (no hay ejemplos comparativos) de que la combinación de los tres componentes de la reivindicación 1 sea mejor (sinérgica) que cada uno de los ingredientes por separado o que las combinaciones de los productos tomados de dos en dos.

En consecuencia, teniendo en cuenta la combinación de documentos D1 y D2, la reivindicación 1 no cumple el requisito de actividad inventiva. A la vista de estos documentos tampoco tienen actividad inventiva las reivindicaciones 2 a 5, 10-18.

Las reivindicaciones 6 a 9 se refieren a aditivos que se añaden opcionalmente a la composición, como agentes antiseborreicos (la undecilenoil glicina) y agentes antiprurito (derivados del ácido gálico).

Los documentos del estado de la técnica demuestran que las composiciones anticasca suelen incluir otros muchos productos como agentes antiseborreicos, antiprurito, antiinflamatorios, etc. Además, concretamente, los productos a los que hacen referencia las reivindicaciones 7 y 9 han sido citados como posibles componentes de lociones y champús anticasca (ver documentos D3 y D4). Por ello, se considera que el añadir estos productos a la composición de la reivindicación 1 sería una de las muchas opciones obvias de que dispone un experto en la materia a la hora de formular una loción o champú anticasca y, por lo tanto, dicha elección no implica actividad inventiva.

En resumen, ninguna de las reivindicaciones 1 a 18 cumple el requisito de actividad inventiva.