

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 656 618**

51 Int. Cl.:

A61K 8/49 (2006.01)

A61Q 5/00 (2006.01)

A61K 8/60 (2006.01)

A61Q 7/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.06.2013 PCT/FR2013/051363**

87 Fecha y número de publicación internacional: **19.12.2013 WO13186485**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.06.2013 E 13731414 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.12.2017 EP 2861205**

54 Título: **Composición que comprende un éster de ácido piridindicarboxílico y un éster de glucosa y de ácido graso**

30 Prioridad:

15.06.2012 FR 1255608

10.09.2012 US 201261698755 P

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

27.02.2018

73 Titular/es:

L'OREAL (100.0%)

14, rue Royale

75008 Paris, FR

72 Inventor/es:

DERKX, TIPHAINE;

DRILLON, DAMIEN y

RICHET, LAURENCE

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

Observaciones :

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

ES 2 656 618 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

Composición que comprende un éster de ácido piridindicarboxílico y un éster de glucosa y de ácido graso

5 La presente invención se refiere a una composición cosmética o farmacéutica que comprende al menos un derivado de ácido piridindicarboxílico en asociación con al menos un éster de glucosa y de ácido(s) graso(s), así como su utilización, en particular en el campo capilar.

10 El crecimiento del cabello y su renovación están determinados principalmente por la actividad de los folículos pilosos y su ambiente matricial. Su actividad es cíclica y comprende esencialmente tres fases, a saber la fase anágena, la fase catágena y la fase telógena. La cabellera se renueva permanentemente y de alrededor de 150000 cabellos aproximadamente que comprende una cabellera, el 10% aproximadamente están en reposo y se reemplazarán durante los meses siguientes.

15 La caída o pérdida natural del cabello se puede estimar, por término medio, de algunos cientos de cabellos al día para un estado fisiológico normal. Este proceso de renovación física permanente sufre una evolución natural durante el envejecimiento, los cabellos se vuelven más finos y sus ciclos más cortos.

20 Se conoce, por otro lado, que algunos factores tales como un desequilibrio hormonal, un estrés fisiológico o la malnutrición, pueden acentuar el fenómeno. Además, la caída o la alteración del cabello pueden estar relacionadas con fenómenos estacionales.

25 Así, se ha propuesto, en particular, por la patente EP1352629, la utilización de derivados de ácido piridindicarboxílico para inducir y/o estimular el crecimiento de las fibras queratínicas humanas, tales como el cabello o las pestañas, y/o frenar su caída y/o aumentar su densidad.

30 Sin embargo, se ha constatado que la utilización de tales compuestos, particularmente en presencia de disolvente, podía provocar sensaciones de incomodidad en el cuero cabelludo, tales como tirantezas, o también unos problemas de sequedad. En algunos casos, se han observado también unos cabellos apagados, sin vigor, o difíciles de peinar y de dominar.

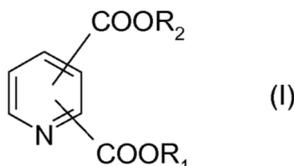
35 La presente invención tiene en particular como objetivo, paliar estos inconvenientes proponiendo una composición que permita obtener un efecto beneficioso lo más amplio posible, actuando dicha composición de manera amplia sobre el cuero cabelludo y el conjunto de la cabellera, desde el bulbo del cabello hasta su punta.

40 Gracias a la invención, se puede obtener así, por un lado, el efecto técnico relacionado con la utilización de los derivados de ácido piridin-dicarboxílico, teniendo al mismo tiempo un buen efecto cosmético sobre el conjunto de la cabellera.

45 Se ha constatado que la asociación según la invención permite obtener, por un lado, una distribución y un esparcimiento de la composición sobre la cabellera mejorados, y por otro lado una mejora de las propiedades de acondicionamiento del cabello, en particular en términos de suavidad, flexibilidad, alisado y desenredado.

La presente invención tiene por objeto una composición que comprende:

45 - (i) al menos un compuesto de fórmula general (I), o una de sus sales:



50 en la que R₁ y R₂ representan, independientemente el uno del otro, un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbonado alifático de C₁-C₁₈, lineal o ramificado, saturado o insaturado; un radical arilo de C₆-C₁₈;

55 estando dichos radicales eventualmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados entre OH, NH₂, -OR, -OCOR y -NHR, con R representando un grupo alquilo de C₁-C₁₈,

siendo al menos uno de los grupos R₁ y R₂ diferente de un átomo de hidrógeno; y

- (ii) al menos un éster de glucosa y de ácido(s) graso(s).

60 Otro objeto de la invención se refiere a la utilización de una composición así definida para inducir y/o estimular el

crecimiento de las fibras queratínicas humanas y/o frenar su caída y/o aumentar su densidad.

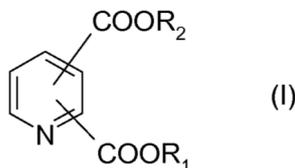
Se ha constatado que las composiciones según la invención presentaban buenos rendimientos cosméticos, a nivel de la calidad del cabello, y también a nivel de la comodidad del cuero cabelludo. Se calma el cuero cabelludo, y no se observa ninguna tirantez o calentamiento después de la aplicación de la composición. La cabellera se domina, es fácil de peinar, los cabellos son más fuertes y más resistentes.

En la presente descripción, la expresión "al menos un" es equivalente a la expresión "uno o varios" y puede ser sustituida; y la expresión "comprendido entre ... y ..." es equivalente a la expresión "que va de ... a ..." y puede ser sustituida.

1/ éster de ácido piridin-dicarboxílico

La composición según la invención comprende por lo tanto al menos un compuesto que es un éster de ácido piridin-dicarboxílico. El éster puede ser un monoéster o un diéster, preferentemente un diéster. Puede tratarse también de una sal de tal éster.

Dichos compuestos responden a la fórmula general (I), o una de sus sales:

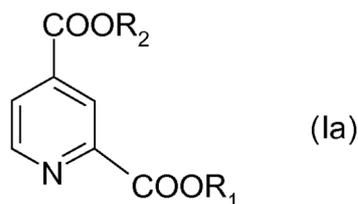


en la que R_1 y R_2 representan, independientemente el uno del otro, un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbonado alifático de C_1 - C_{18} , lineal o ramificado, saturado o insaturado; un radical arilo de C_6 - C_{18} ;

estando dichos radicales hidrocarbonado alifático o arilo eventualmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados entre OH, NH_2 , -OR, -OCOR y -NHR, con R representando un grupo alquilo de C_1 - C_{18} ,

siendo uno al menos de los grupos R_1 y R_2 diferente de un átomo de hidrógeno.

Preferentemente, los sustituyentes $COOR_1$ y $COOR_2$ están respectivamente en posición 2 y 3, o 2 y 4 del núcleo piridina. Preferiblemente, están en posición 2 y 4. Preferiblemente, los compuestos responden a la fórmula (Ia), o un de sus sales:



en la que R_1 y R_2 representan, independientemente el uno del otro, un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbonado alifático de C_1 - C_{18} , lineal o ramificado, saturado o insaturado (alquilo en particular); o un radical arilo de C_6 - C_{18} ;

estando dichos radicales hidrocarbonados alifáticos o arilo eventualmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados entre OH, NH_2 , -OR, -OCOR y -NHR con R representando un grupo alquilo de C_1 - C_{18} ,

estando uno al menos de los grupos R_1 y R_2 diferente de un átomo de hidrógeno.

Preferentemente, en las fórmulas (I) y (Ia), el radical hidrocarbonado alifático, en particular alquilo, de C_1 - C_{18} es un radical hidrocarbonado alifático, en particular alquilo, de C_1 - C_{10} , en particular de C_1 - C_6 , tal como metilo, etilo, terciobutilo, iso-propilo, hexilo. Dicho radical hidrocarbonado alifático puede también contener al menos un doble enlace o un triple enlace carbono-carbono, como por ejemplo $-CH=CH_2$, $-CH_2-CH=CH-CH_3$ y $-CH_2-C\equiv CH$.

El radical arilo puede representar el radical fenilo o naftilo.

En particular, en las fórmulas (I) y (Ia), R_1 y R_2 representan, independientemente el uno del otro, un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbonado alifático saturado, en particular alquilo, lineal o ramificado, de C_1 - C_{18} , mejor de C_1 - C_{10} , incluso de C_1 - C_6 , eventualmente sustituido con un grupo alcoxi o aciloxi (OR o OCOR, con R designando

un radical alquilo de C1-C18), siendo uno al menos de los grupos R1 y R2 diferente de un átomo de hidrógeno.

Preferentemente, R1 y R2 son idénticos.

- 5 Preferiblemente, R₁ y R₂ son idénticos y representan un radical alquilo saturado y lineal de C1-C18, preferentemente de C1-C10, y aún mejor de C1-C6; y muy particularmente un radical etilo.

Se pueden utilizar en particular los compuestos de fórmula (I) siguientes:

- 10 - el piridin-2,4-dicarboxilato de dimetilo,
 - el piridin-2,3-dicarboxilato de dimetilo,
 - el piridin-2,4-dicarboxilato de dietilo,
 15 - el piridin-2,3-dicarboxilato de dietilo,
 - el piridin-2,5-dicarboxilato de dietilo,
 20 - el piridin-2,5-dicarboxilato de dimetilo,
 - el piridin-2,4-dicarboxilato de diisopropilo,
 - el piridin-2,4-dicarboxilato de di(acetiloximetilo) (derivado de fórmula (I) tal que R₁ y R₂ representan -CH₂-O-COCH₃).

Preferiblemente, la composición comprende, como compuesto de fórmula (I) o (Ia), el piridin-2,4-dicarboxilato de dietilo.

- 30 Por sales de los compuestos de fórmula (I), se entiende según la invención las sales orgánicas o minerales de un compuesto de fórmula (I), siendo estas sales fisiológicamente aceptables. Como sales minerales, se pueden citar las sales de sodio o de potasio así como las sales de zinc (Zn²⁺), de calcio (Ca²⁺), de cobre (Cu²⁺), de hierro (Fe²⁺), de estroncio (Sr²⁺), de magnesio (Mg²⁺), de manganeso (Mn²⁺); los hidróxidos, los carbonatos y los cloruros. Como sales orgánicas, se pueden citar las sales trietanolamina, mono-etanolamina, dietanolamina, hexadecilamina,
 35 N,N,N',N'-tetrakis-(hidroxi-propil-2)etilen-diamina y tris-hidroximetilaminoetano.

Los compuestos de fórmula (I) son conocidos como tales; son descritos en particular, así como su fabricación, en la patente EP1352629.

- 40 Preferentemente, la composición según la invención comprende el o los compuestos de fórmula (I) en una cantidad comprendida entre el 0,001 y el 10% en peso, en particular del 0,01 al 5% en peso, con respecto al peso total de la composición.

2/ éster de glucosa y de ácido(s) graso(s)

- 45 La composición según la invención comprende también al menos un éster de glucosa y de ácido(s) graso(s).

El éster de glucosa y de ácido(s) graso(s) según la invención responde a la fórmula (II) siguiente: (RCOO)_n-Glu (II)

- 50 en la que

- Glu representa el radical glucosa;
 - R representa un radical alquilo o alqueno de C8-C40 eventualmente hidroxilado;
 55 - n representa un número entero que va del 1 al 5.

- Los grupos RCOO proceden preferentemente de los ácidos grasos saturados o insaturados de C8-C32, más preferiblemente seleccionados entre los ácidos láurico, mirístico, palmítico, cetílico, esteárico, oleico, linoleico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico, linoléico, y sus mezclas.

En una variante preferida de la invención, el éster de glucosa y de ácido(s) graso(s) es un éster de glucosa y de vitamina F.

- 65 La vitamina F, compuesto naturalmente presente en los cuerpos grasos y en particular en el aceite de lino, el aceite de girasol o el aceite de cártamo, está constituida de una mezcla de ácidos grasos, principalmente de C12-C20. En

el ámbito de la presente invención, se considera que la vitamina F está generalmente constituida (% en peso):

- del 70 al 80% en peso de ácido linoleico, y

5 - del 10 al 15% en peso de ácido oleico,

- del 4 al 8% en peso de ácido palmítico,

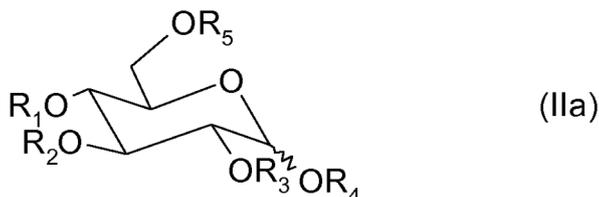
10 - del 0,5 al 5% en peso de ácido esteárico, y

- del 0 al 10% en peso de uno o varios otros ácidos seleccionados entre los ácidos láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico y linolénico.

15 Como resultado, el éster de vitamina F y de glucosa empleado en el ámbito de la invención, que es susceptible de obtenerse por esterificación, parcial o total de la vitamina F, está, por su parte, constituido preferentemente de una mezcla de diferentes ésteres, que deriva de la presencia de los diferentes ácidos, formados durante esta reacción. Por otra parte, la glucosa, que posee cinco sitios susceptibles de reaccionar durante la reacción de esterificación, el éster de vitamina F y de glucosa empleado en el ámbito de la invención puede comprender también una mezcla de los ésteres formados sobre diferentes posiciones de la glucosa. Finalmente, el éster de vitamina F y de glucosa
20 empleado en el ámbito de la invención puede comprender también una mezcla de los monoésteres y diésteres susceptibles de formarse.

25 En la presente descripción, se entiende por "éster de vitamina F y de glucosa", la mezcla constituida por el conjunto de los ésteres, mono o di, formados durante la reacción de esterificación, parcial o total, de la vitamina F y de la glucosa.

Dicho éster de vitamina F y de glucosa empleado en el ámbito de la presente invención comprende, por lo tanto, principalmente una mezcla de compuestos que se pueden representar por la fórmula (IIa) siguiente:



30 en la que R1, R2, R3, R4 y R5, independientemente los unos de los otros, representan el átomo de hidrógeno o un radical -COR', con R' representando una cadena hidrocarbonada alifática, saturada o insaturada (preferentemente alquilo), lineal y que comprende de 11 a 21 átomos de carbono, con la condición de que al menos uno de los radicales R1 a R5 sea diferente del hidrógeno.
35

La relación entre el número de funciones ésteres del producto esterificado y el número de funciones hidroxilos iniciales, o porcentaje de esterificación, para una molécula de glucosa, está preferentemente comprendida entre 0,2 y 1, en particular de 0,2 a 0,6 y en particular de 0,21 a 0,4.
40

La glucosa está esterificada preferentemente en posición 1, en posición 2, en posición 3 y/o en posición 6. Preferiblemente, la glucosa está esterificada principalmente en posición 1 y/o 6.

45 La relación entre el número de funciones ésteres en posición 6 y el número total de funciones ésteres, para una molécula de glucosa, está preferentemente comprendida entre 0,55 y 1, en particular entre 0,70 y 0,98 y preferiblemente entre 0,90 y 0,97.

50 En particular, el éster de vitamina F y de glucosa empleado en el ámbito de la invención puede comprender al menos un éster, en particular un monoéster, de glucosa y de ácido linoleico; al menos un éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido oleico; al menos un éster, en particular un monoéster, de glucosa y de ácido palmítico; y al menos un éster, en particular un monoéster, de glucosa y de ácido esteárico.

55 Puede comprender además al menos un éster, en particular monoéster, de glucosa y de uno o varios ésteres de glucosa y de ácido láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico y/o linolénico.

Puede además comprender al menos un diéster de glucosa y de uno o varios ácidos seleccionados entre los ácidos láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico, linoleico, oleico, palmítico, esteárico y/o linolénico.

Así, preferentemente, el éster de vitamina F y de glucosa empleado en el ámbito de la invención comprende generalmente, todas las posiciones combinadas:

- 5 - del 40 al 80% en peso, preferentemente del 60 al 75% en peso, preferiblemente del 68 al 72% en peso, de éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido linoleico,
- del 10 al 20% en peso, preferentemente del 12 al 17% en peso, preferiblemente del 14 al 15% en peso, de éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido oleico,
- 10 - del 5 al 20% en peso, preferentemente del 7 al 15% en peso, preferiblemente del 9 al 12% en peso, de éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido palmítico,
- del 0,5 al 7% en peso, preferentemente del 1 al 5% en peso, preferiblemente del 2 al 4% en peso, de éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido estearico,
- 15 - del 0 al 10% en peso, en particular del 0,10 al 4% en peso, incluso del 0,15 al 2% en peso, de uno o varios monoésteres de glucosa y de ácido láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico y/o linolénico,
- 20 - del 0 al 10% en peso, en particular del 0,10 al 4% en peso, incluso del 0,15 al 2% en peso, de diésteres de glucosa y de uno o varios ácidos seleccionados entre los ácidos láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico, linoleico, oleico, palmítico, esteárico y/o linolénico.

En particular, el éster de vitamina F y de glucosa empleado en el ámbito de la invención puede comprender:

- 25 - del 40 al 80% en peso, preferentemente del 60 al 75% en peso, preferiblemente del 68 al 72% en peso, de éster de glucosa y de ácido linoleico, incluyendo principalmente la 6-O-octadeca-9,12-dienoil-D-glucopiranososa, la 1-O-octadeca-9,12-dienoil-D-glucopiranososa, la 2-O-octadeca-9,12-dienoil-D-glucopiranososa y/o la 3-O-octadeca-9,12-dienoil-D-glucopiranososa,
- 30 - del 10 al 20% en peso, preferentemente del 12 al 17% en peso, preferiblemente del 14 al 15% en peso, de éster de glucosa y de ácido oleico, incluyendo principalmente la 6-O-octadeca-9-enoil-D-glucopiranososa, la 3-O-octadeca-9-enoil-D-glucopiranososa, la 1-O-octadeca-9-enoil-D-glucopiranososa y/o la 2-O-octadeca-9-enoil-D-glucopiranososa,
- 35 - del 5 al 20% en peso, preferentemente del 7 al 15% en peso, preferiblemente del 9 al 12% en peso, de éster de glucosa y de ácido palmítico, incluyendo principalmente la 6-O-hexadecanoil-D-glucopiranososa, la 3-O-hexadecanoil-D-glucopiranososa, la 1-O-hexadecanoil-D-glucopiranososa y/o la 2-O-hexadecanoil-D-glucopiranososa;
- del 0,5 al 7% en peso, preferentemente del 1 al 5% en peso, preferiblemente del 2 al 4% en peso, de éster de glucosa y de ácido estearico, incluyendo principalmente la 6-O-octadecanoil-D-glucopiranososa, la 3-O-octadecanoil-D-glucopiranososa, la 1-O-octadecanoil-D-glucopiranososa y/o la 2-O-octadecanoil-D-glucopiranososa,
- 40 - del 0 al 10% en peso, en particular del 0,10 al 4% en peso, incluso del 0,15 al 2% en peso, de uno o varios monoésteres de glucosa y de ácido láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico y/o linolénico,
- 45 - del 0 al 10% en peso, en particular del 0,10 al 4% en peso, incluso del 0,15 al 2% en peso, de diésteres de glucosa y de uno o varios ácidos seleccionados entre los ácidos láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico, linoleico, oleico, palmítico, esteárico y/o linolénico.
- 50

Los ésteres de vitamina F y de glucosa son conocidos como tales; están descritos en particular, así como su fabricación, en las patentes EP1837341 y EP1371658.

- 55 Preferentemente, la composición según la invención comprende el o los ésteres de ácido(s) graso(s) y de glucosa en una cantidad comprendida entre el 0,01 y el 20% en peso, en particular del 0,05 al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición.

3. Ingredientes complementarios

- 60 La composición según la invención puede ser de uso cosmético o farmacéutico. Preferiblemente, la composición según la invención es de uso cosmético. Por "cosmético" se entiende, en el sentido de la invención, una composición de aspecto, olor y tacto agradables. Preferentemente, la composición es de aplicación tópica sobre la piel y las fibras queratínicas, y más especialmente sobre el cuero cabelludo, el cabello y las pestañas.
- 65 Según el modo de aplicación, esta composición puede presentarse en todas las formas galénicas normalmente utilizadas en el campo considerado, en particular en cosmética.

- 5 Para una aplicación tópica sobre la piel, incluyendo el cuero cabelludo, la composición puede tener la forma en particular de una solución o suspensión acuosa, alcohólica o hidroalcohólica, de una suspensión o de una solución oleosa, de una emulsión o dispersión de consistencia líquida o semilíquida obtenida por dispersión de una fase
- 10 5 grasa en una fase acuosa (H/E) o inversamente (E/H), de una dispersión o emulsión de consistencia blanda, de un gel acuoso o hidroalcohólico u oleoso (anhidro), de un polvo libre o compactado para utilizar tal cual o para incorporar en un medio fisiológicamente aceptable (excipiente), o también de microcápsulas o micropartículas, o de dispersiones vesiculares de tipo iónico y/o no iónico.
- 15 Se puede considerar también una composición en forma de una espuma o también en forma de composición para aerosol que comprende también un agente propulsor bajo presión.
- 20 En particular, la composición según la invención puede ser una composición capilar, susceptible de aplicarse sobre el cuero cabelludo o el cabello, y puede presentarse en forma de una loción de cuidado capilar, por ejemplo de aplicación diaria o bisemanal, de un champú o de un acondicionador capilar, en particular de aplicación bisemanal o
- 25 15 semanal, de un jabón líquido o sólido de limpieza del cuero cabelludo de aplicación diaria, de un producto de moldeado del peinado (laca, producto para el marcado, gel de peinado), de una mascarilla de tratamiento, de una crema o de un gel espumante de limpieza del cabello. Puede también presentarse en forma de tinte o de mascarilla capilar a aplicar con pincel o con peine.
- 30 Para una aplicación sobre las pestañas o el pelo, la composición según la invención puede presentarse en forma de una mascarilla, pigmentada o no, a aplicar con cepillo sobre las pestañas o también sobre el pelo de la barba o del bigote.
- 35 Según un modo de realización particular, la composición según la invención se presente en forma de crema o loción capilar, de champú, de acondicionador capilar, o de mascarilla capilar o para pestañas.
- 40 Las cantidades de los diferentes constituyentes de la composición según la invención son las clásicamente utilizadas en los campos considerados. Además, esta composición se prepara según los métodos habituales. Puede así presentarse en forma de una loción, suero, leche, crema H/E o E/H, gel, ungüento, pomada, polvo, bálsamo, parche, tampón empapado, jabón, pastilla, espuma.
- 45 Cuando la composición es una emulsión, la proporción de la fase grasa puede ir del 2 al 80% en peso, preferiblemente del 5 al 50% en peso con respecto al peso total de la composición.
- 50 La fase grasa puede contener unos compuestos grasos u oleosos, líquidos a temperatura ambiente (25°C) y presión atmosférica (1 atm), generalmente denominados aceites. Estos aceites pueden ser compatibles o no entre sí y formar una fase grasa líquida macroscópicamente homogénea o un sistema bi- o trifásico.
- 55 La fase grasa puede, además de los aceites, contener unas ceras, unas gomas, unos polímeros lipófilos, unos productos "pastosos" o viscosos que contienen unas partes sólidas y unas partes líquidas.
- 60 La fase acuosa se ajusta en función del contenido en fase grasa y en compuesto(s) de fórmula (I) así como en la de los eventuales ingredientes adicionales, para obtener el 100% en peso. En la práctica, la fase acuosa representa preferentemente del 5 al 99,9% en peso.
- 65 La fase acuosa contiene agua y eventualmente un disolvente orgánico miscible en cualquier proporción al agua como los alcoholes inferiores de C₁ a C₈ tal como el etanol, el isopropanol, los polioles como el propilenglicol, el glicerol, el sorbitol o también la acetona.
- Los emulsionantes y los coemulsionantes utilizados en la composición en forma de emulsión se pueden seleccionar entre los clásicamente utilizados en el campo cosmético o farmacéutico. El emulsionante y/o el coemulsionante están presentes preferentemente en la composición en una proporción que va del 0,1 al 30% en peso, preferentemente del 0,5 al 20% en peso con respecto al peso total de la composición, mejor del 1 al 8%. Su naturaleza depende, además, del sentido de la emulsión. La emulsión puede, además, comprender unas vesículas lipídicas y en particular unos liposomas.
- Cuando la composición es una solución o un gel oleoso, la fase grasa puede representar más del 90% del peso total de la composición.
- 60 Ventajosamente, para una aplicación capilar, la composición es una solución o suspensión acuosa, alcohólica o hidroalcohólica, y mejor una solución o una suspensión agua/etanol. La fracción alcohólica puede representar del 5% al 99,9% y mejor del 8% al 80%.
- 65 Para una aplicación de mascarilla, la composición es preferentemente una dispersión de cera en agua o de cera en aceite, un aceite gelificado o un gel acuoso, pigmentado o no.

En un modo de realización particular, la composición según la invención puede comprender al menos una vitamina B y/o uno de sus análogos o derivados.

5 Por vitamina B, se entiende al menos una de las vitaminas que pertenecen a este grupo, a saber la vitamina B1 o tiamina; la vitamina B2 o riboflavina; la vitamina B3 (o vitamina PP) o niacina o niacinamida; la vitamina B5 o ácido pantoténico; la vitamina B6 o piridoxina; la vitamina B8 (o vitamina H) o biotina; la vitamina B9 o ácido fólico, y la vitamina B12 o cianocobalamina.

10 Como análogos o derivados de vitamina B, se pueden citar en particular las sales correspondientes, como el pantoneato de calcio, las provitaminas B como el pantenol, que es el alcohol análogo de la vitamina B5, también denominado provitamina B5; se pueden citar también los éteres y los ésteres correspondientes, como el pantenil etil éter, el pantenil etil éter acetato y el pantenil triacetato. Se puede utilizar por supuesto una mezcla de estos diferentes compuestos.

15 Preferiblemente, la vitamina B susceptible de emplearse en el ámbito de la invención se seleccionará entre la vitamina B3, la vitamina B5, la vitamina B6 y la vitamina B8, o uno de sus análogos o derivados, y en particular el pantotenato de calcio, el pantenol, el pantenil etil éter, el pantenil etil éter acetato y el pantenil triacetato; así como sus mezclas.

20 Preferentemente, la composición según la invención comprende la o las vitaminas B, análoga(s) y/o derivada(s) en una cantidad comprendida entre el 0,001 y el 5% en peso, en particular del 0,005 al 2% en peso, aún mejor entre el 0,01 y el 1% en peso, con respecto al peso total de la composición.

25 La composición según la invención puede también contener unos adyuvantes habituales en el campo cosmético, seleccionados por ejemplo de entre los gelificantes o espesantes hidrófilos o lipófilos, los aditivos hidrófilos o lipófilos, los conservantes, los antioxidantes (carotenoides), los perfumes, las cargas, los absorbentes de olores, los electrolitos, los neutralizantes, los agentes bloqueantes de UV como los filtros solares, los polímeros filmógenos, los activos cosméticos como las vitaminas; las materias colorantes, solubles o no en el medio. Las cantidades de estos diferentes adyuvantes son las clásicamente utilizadas en el campo cosmético, por ejemplo del 0,01 al 20%, mejor del 0,1 al 10% del peso total de la composición. Estos adyuvantes, según su naturaleza, se pueden introducir en la fase grasa, en la fase acuosa y/o en las vesículas lipídicas y en particular unos liposomas.

35 Como aceites o ceras susceptibles de emplearse, se pueden citar los aceites minerales (aceite de vaselina, isoparafina hidrogenada), los aceites vegetales (fracción líquida de la manteca de karité, aceite de girasol, de soja, de gérmenes de trigo), los aceites animales (perhidroescualeno), los aceites de síntesis (aceite de Purcellin, ésteres de ácido graso), los aceites o ceras siliconados (polidimetilsiloxanos lineales o cíclicos, ciclometicona, feniltrimeticona), los aceites fluorados (perfluoropolietéres), las ceras de abeja, de candellila, de arroz, de carnauba, de parafina o de polietileno. Se pueden citar también unos alcoholes grasos y unos ácidos grasos (ácido esteárico, linoleico, linoléico por ejemplo).

40 Como emulsionantes utilizables en la invención, se pueden citar por ejemplo los alcoholes grasos oxietilenados, el estearato o laurato de glicerol, el estearato u oleato de sorbitol polioxietilenado (por ejemplo el polisorbato 60 y la mezcla de PEG-6/PEG-32/estearato de glicol vendida bajo la denominación de Tefose[®] 63 por la compañía Gattefosse), los (alquil)dimeticonas copoliol.

45 Como gelificantes hidrófilos utilizables en la invención, se pueden citar los polímeros carboxivinílicos (carbomer), los copolímeros acrílicos tales como los copolímeros de acrilatos/alquilacrilatos, las poliacrilamidas, los polisacáridos tales como la hidroxipropilcelulosa, las gomas naturales y las arcillas y, como gelificantes lipófilos, se pueden citar las arcillas modificadas como las bentonas, las sales metálicas de ácidos grasos como los estearatos de aluminio, la sílice tratada hidrófoba, la etilcelulosa y sus mezclas.

50 La composición puede comprender otros activos que pueden ser hidrófilos, como las proteínas o los hidrolizados de proteína, los aminoácidos, los polioles, la urea, la alantoina, los azúcares y los derivados de azúcar, las vitaminas hidrosolubles, los extractos vegetales, pudiendo estos extractos entonces contener o no unas isoflavonas; o que pueden ser lipófilos, como el retinol (vitamina A) y sus derivados, en particular éster (palmitato), el tocoferol (vitamina E) y sus derivados, en particular éster (acetato palmitato), los ácidos graso esenciales como los ácidos eicosatetraenoico y eicosatrienoico o sus ésteres y amidas, las ceramidas, los aceites esenciales, los ésteres de los hidroxí-ácidos, los fosfolípidos como la lecitina; o que pueden ser solubles en unos disolventes alcohólicos como las lactonas (kawaína); y sus mezclas.

55 Puede también comprender unos activos adicionales, en particular los que favorecen el recrecimiento de las fibras queratínicas humanas y/o que limitan su caída. Se pueden citar en particular, solo o en mezcla:

65 - los agentes antibacterianos; los antiparasitarios, los antifúngicos;

- los extractos de microorganismos, en particular los extractos bacterianos;
- los agentes que modulan la diferenciación y/o la proliferación cutánea tales como el ácido retinoico y sus isómeros, el retinol y sus ésteres, la vitamina D y sus derivados, los estrógenos tales como el estradiol;
- los agentes que modulan la adhesión bacteriana sobre la piel y/o las mucosas tales como la miel, en particular la miel de acacias y algunos derivados de azúcares;
- el ácido acetilsalicílico, el acetaminógeno o el ácido glicirretínico, el α -bisabolol;
- los agentes queratolíticos tales como los ácidos alfa- y beta-hidroxicarboxílicos o beta-cetocarboxílicos, sus sales, amidas o ésteres, las lactonas y sus sales correspondientes, y más particularmente los hidroxiácidos tales como el ácido glicólico, el ácido láctico, el ácido salicílico, el ácido cítrico y de manera general los ácidos de frutas, los derivados del ácido salicílico tales como los portadores de un radical alcanilo que tiene de 2 a 12 átomos de carbono en posición 5 del ciclo bencénico como el ácido n-octanoil-5-salicílico;
- los agentes anti-radicales libres tales como el alfa-tocoferol o sus ésteres, los superóxidos dismutasas, algunos quelantes de metales o el ácido ascórbico y sus ésteres;
- los anti-seborreicos;
- los anticaspas, como el octopirox o la piritiona de zinc;
- los agentes que disminuyen la caída del cabello, como el aminexil, la 6-O-[(9Z,12Z)-octadeca-9,12-dienoil]hexapiranososa; los derivados de pirimidina, como el 2,4-diamino 6-piperidinopirimidina 3-óxido o "minoxidil" descrito en las patentes US4139619 y US4596812.

La composición según la invención puede además comprender unas sustancias tales como los antagonistas de sustancia P, de CGRP o de bradikina y los inhibidores de NO-sintasa, compuestos descritos como siendo activos en el tratamiento de las pieles sensibles y como presentando unos efectos anti-irritantes, en particular frente a compuestos irritantes eventualmente presentes en las composiciones.

La composición según la invención, en particular cosmética, se puede aplicar sobre las zonas alopecicas del cuero cabelludo y del cabello, eventualmente dejada en contacto varias horas y/o eventualmente aclarada.

Se puede, por ejemplo, aplicar la composición según la invención por la tarde, guardar estar en contacto toda la noche y eventualmente efectuar un lavado con champú por la mañana. Estas aplicaciones se pueden renovar diariamente durante uno o varios meses según los individuos.

La presente invención tiene también por objeto un procedimiento de tratamiento cosmético de las materias queratínicas humanas, en particular del cabello y/o de la piel, incluyendo el cuero cabelludo, en el que se aplica sobre dichas materias queratínicas una composición cosmética tal como se ha definido anteriormente, y eventualmente en aclarar dichas materias queratínicas.

Más especialmente, dicho procedimiento es un procedimiento de cuidado cosmético del cabello y/o del cuero cabelludo, para mejorar su estado y/o su aspecto.

Este procedimiento de tratamiento presenta bien las características de un procedimiento cosmético en la medida en la que permite mejorar la estética de las materias, en particular de las fibras queratínicas humanas dándoles un mayor vigor, un aspecto mejorado (aportación de acondicionamiento), una mayor facilidad de manipulación (extensión, distribución) y de peinado.

La invención se describe más en detalle en los ejemplos siguientes.

55 Ejemplo 1

Se prepara la composición siguiente (% en peso):

- dietiléster de ácido piridin-2,4-dicarboxílico (nombre INCI: DIETHYLLUTIDINATE)	5%
- etanol	56,5%
- éster de vitamina F y de glucosa (ejemplo 1 del documento EP1371658) protegido por el 0,5% de tocoferoles y el 0,1% de citrato trisódico (nombre INCI: Safflower glucoside)	0,1%
- ácido cítrico	c.s. pH = 5,5
- agua	c.s.p 100%

60 Esta loción es límpida y estable en el tiempo (al menos 2 meses, a 25°C o 45°C).

ES 2 656 618 T3

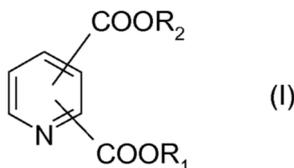
Aplicada raya por raya sobre el cuero cabelludo, esta loción presente buenas cualidades de uso favoreciendo la distribución y el reparto de los activos sobre el cuero cabelludo. Presenta también buenos rendimientos cosméticos. El cabello es sedoso y ligero, el cabello se domina y es fácil de peinar.

5

REIVINDICACIONES

1. Composición que comprende:

5 - (i) al menos un compuesto de fórmula general (I), o una de sus sales:



10 en la que R_1 y R_2 representan, independientemente el uno del otro, un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbonado alifático de C_1 - C_{18} , lineal o ramificado, saturado o insaturado; un radical arilo de C_6 - C_{18} ;

estando dichos radicales eventualmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados entre OH, NH_2 , -OR, -OCOR y -NHR, con R representando un grupo alquilo de C_1 - C_{18} ,

15 siendo al menos uno de los grupos R_1 y R_2 diferente de un átomo de hidrógeno; y

- (ii) al menos un éster de glucosa y de ácido(s) graso(s).

20 2. Composición según la reivindicación 1, en la que los sustituyentes $COOR_1$ y $COOR_2$ están respectivamente en posición 2 y 3, o 2 y 4 del núcleo piridina; preferiblemente en posición 2 y 4.

3. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que R_1 y R_2 son idénticos.

25 4. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que R_1 y R_2 representan, independientemente el uno del otro, un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbonado alifático saturado, en particular alquilo, lineal o ramificado, de C_1 - C_{18} , mejor de C_1 - C_{10} , incluso de C_1 - C_6 , eventualmente sustituido con un grupo alcoxi o aciloxi (OR o OCOR, con R designando un radical alquilo de C_1 - C_{18}), siendo uno al menos de los grupos R_1 y R_2 diferente de un átomo de hidrógeno.

30 5. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que R_1 y R_2 son idénticos y representan un radical alquilo saturado y lineal de C_1 - C_{18} , preferentemente de C_1 - C_{10} , y aún mejor de C_1 - C_6 ; y muy particularmente un radica etilo.

35 6. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, que comprende como compuesto de fórmula (I), uno de los compuestos siguientes:

- el piridin-2,4-dicarboxilato de dimetilo,

40 - el piridin-2,3-dicarboxilato de dimetilo,

- el piridin-2,4-dicarboxilato de dietilo,

- el piridin-2,3-dicarboxilato de dietilo,

45 - el piridin-2,5-dicarboxilato de dietilo,

- el piridin-2,5-dicarboxilato de dimetilo,

50 - el piridin-2,4-dicarboxilato de diisopropilo,

- el piridin-2,4-dicarboxilato de di(acetiloximetilo) (derivado de fórmula (I) tal que R_1 y R_2 representan $-CH_2-O-COCH_3$).

55 7. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que el o los compuestos de fórmula (I) están presentes en una cantidad comprendida entre el 0,001 y el 10% en peso, en particular del 0,01 al 5% en peso, con respecto al peso total de la composición.

8. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que el éster de glucosa y de ácido(s) graso(s) responde a la fórmula (II) siguiente: $(RCOO)_n$ -Glu (II) en la que:

60

- Glu representa el radical glucosa;

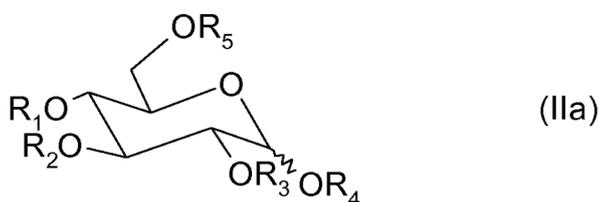
- R representa un radical alquilo o alquenilo de C8-C40 eventualmente hidroxilado;

5 - n representa un número entero que tiene de 1 a 5.

9. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que, en la fórmula (II), los grupos RCOO proceden de los ácidos grasos saturados o insaturados de C8-C32, más preferiblemente seleccionados entre los ácidos láurico, mirístico, palmítico, cetílico, esteárico, oleico, linoleico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico, linolénico, y sus mezclas.

10. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que el éster de glucosa y de ácido(s) graso(s) es un éster de glucosa y de vitamina F.

15 11. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que el éster de glucosa y de ácido(s) graso(s) comprende una mezcla de compuestos de fórmula (IIa):



20 en la que R1, R2, R3, R4 y R5, independientemente los unos de los otros, representan el átomo de hidrógeno o un radical -COR', con R' representando una cadena hidrocarbonada alifática, saturada o insaturada (preferentemente alquilo), lineal y que comprende de 11 a 21 átomos de carbono, con la condición de que al menos uno de los radicales R1 a R5 sea diferente del hidrógeno.

25 12. Composición según una de las reivindicaciones 10 a 11, en la que el éster de vitamina F y de glucosa comprende, todas posiciones combinadas:

- del 40 al 80% en peso, preferentemente del 60 al 75% en peso, preferiblemente del 68 al 72% en peso, de éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido linoleico,

30 - del 10 al 20% en peso, preferentemente del 12 al 17% en peso, preferiblemente del 14 al 15% en peso, de éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido oleico,

35 - del 5 al 20% en peso, preferentemente del 7 al 15% en peso, preferiblemente del 9 al 12% en peso, de éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido palmítico,

- del 0,5 al 7% en peso, preferentemente del 1 al 5% en peso, preferiblemente del 2 al 4% en peso, de éster, en particular monoéster, de glucosa y de ácido estearico,

40 - del 0 al 10% en peso, en particular del 0,10 al 4% en peso, incluso del 0,15 al 2% en peso, de uno o varios monoésteres de glucosa y de ácido láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico y/o linolénico,

45 - del 0 al 10% en peso, en particular del 0,10 al 4% en peso, incluso del 0,15 al 2% en peso, de diésteres de glucosa y de uno o varios ácidos seleccionados entre los ácidos láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico, linoleico, oleico, palmítico, esteárico y/o linolénico.

13. Composición según una de las reivindicaciones 10 a 12, en la que el éster de vitamina F y de glucosa comprende:

50 - del 40 al 80% en peso, preferentemente del 60 al 75% en peso, preferiblemente del 68 al 72% en peso, de éster de glucosa y de ácido linoleico de los cuales principalmente la 6-O-octadeca-9,12-dienoil-D-glucopiranos, la 1-O-octadeca-9,12-dienoil-D-glucopiranos, la 2-O-octadeca-9,12-dienoil-D-glucopiranos y/o la 3-O-octadeca-9,12-dienoil-D-glucopiranos,

55 - del 10 al 20% en peso, preferentemente del 12 al 17% en peso, preferiblemente del 14 al 15% en peso, de éster de glucosa y de ácido oleico, de los cuales principalmente la 6-O-octadeca-9-enoil-D-glucopiranos, la 3-O-octadeca-9-enoil-D-glucopiranos, la 1-O-octadeca-9-enoil-D-glucopiranos y/o la 2-O-octadeca-9-enoil-D-glucopiranos,

- del 5 al 20% en peso, preferentemente del 7 al 15% en peso, preferiblemente del 9 al 12% en peso, de éster de glucosa y de ácido palmítico, de los cuales principalmente la 6-O-hexadecanoil-D-glucopiranososa, la 3-O-hexadecanoil-D-glucopiranososa, la 1-O-hexadecanoil-D-glucopiranososa y/o la 2-O-hexadecanoil-D-glucopiranososa;
- 5 - del 0,5 al 7% en peso, preferentemente del 1 al 5% en peso, preferiblemente del 2 al 4% en peso, de éster de glucosa y de ácido esteárico, de los cuales principalmente la 6-O-octadecanoil-D-glucopiranososa, la 3-O-octadecanoil-D-glucopiranososa, la 1-O-octadecanoil-D-glucopiranososa y/o la 2-O-octadecanoil-D-glucopiranososa,
- 10 - del 0 al 10% en peso, en particular del 0,10 al 4% en peso, incluso del 0,15 al 2% en peso, de uno o varios monoésteres de glucosa y de ácido láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico y/o linolénico,
- del 0 al 10% en peso, en particular del 0,10 al 4% en peso, incluso del 0,15 al 2% en peso, de diésteres de glucosa y de uno o varios ácidos seleccionados entre los ácidos láurico, mirístico, araquídico, behénico, lauroleico, miristoleico, palmitoleico, linoleico, oleico, palmítico, esteárico y/o linolénico.
- 15
14. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, en la que el o los ésteres de ácido(s) graso(s) y de glucosa están presentes en una cantidad comprendida entre el 0,01 y el 20% en peso, en particular del 0,05 al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición.
- 20
15. Composición según una de las reivindicaciones anteriores, que se presenta en forma de una composición cosmética capilar, tal como una loción de cuidado capilar, de un champú o de un acondicionador capilar, de un jabón líquido o sólido de limpieza del cuero cabelludo, de un producto de moldeado del cabello, de una mascarilla de tratamiento, de una crema o de un gel espumante de limpieza del cabello.
- 25
16. Procedimiento de tratamiento cosmético (no terapéutico) de las materias queratínicas humanas, en particular del cabello y/o del cuero cabelludo, en el que se aplica sobre dichas materias queratínicas una composición cosmética tal como se define en una de las reivindicaciones 1 a 15, y eventualmente en aclarar dichas materias queratínicas.
- 30
17. Procedimiento según la reivindicación 16, siendo dicho procedimiento un procedimiento de cuidado cosmético del cabello y/o del cuero cabelludo, para mejorar su estado y/o su aspecto.
- 35
18. Utilización no terapéutica de una composición tal como se define en una de las reivindicaciones 1 a 15 para inducir y/o estimular el crecimiento de las fibras queratínicas humanas y/o frenar su caída y/o aumentar su densidad.