

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 713 693**

51 Int. Cl.:

A61K 8/35 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **30.06.2015** **PCT/EP2015/064779**

87 Fecha y número de publicación internacional: **07.01.2016** **WO16001189**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.06.2015** **E 15732693 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **12.12.2018** **EP 3160435**

54 Título: **Utilización de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)alquilcetona como agente calmante de la piel**

30 Prioridad:

30.06.2014 FR 1456176

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
23.05.2019

73 Titular/es:

L'ORÉAL (100.0%)
14, rue Royale
75008 Paris, FR

72 Inventor/es:

DALKO, MARIA

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 713 693 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

Utilización de 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)alquilcetona como agente calmante de la piel

5 La presente invención se refiere a la utilización cosmética no terapéutica de compuestos de tipo 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)alquilcetona, como agentes calmantes de la piel de la cara y del cuerpo.

La piel es la primera barrera de protección del organismo frente al medio ambiente. Sufre por lo tanto numerosas agresiones externas que pueden llevar a reacciones cutáneas molestas.

10 Las reacciones cutáneas molestas de la piel de la cara o del cuerpo pueden generarse, especialmente, por el contacto con productos químicos tales como limpiadores, permanentes, coloraciones del cabello o proceder de acciones mecánicas tales como el afeitado, la exfoliación, el peeling, la depilación, o proceder de la acción de la temperatura, del clima, o también de la polución atmosférica.

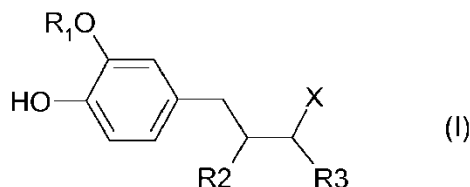
15 Existe por lo tanto la necesidad de nuevos agentes calmantes en el campo cosmético para la piel de la cara y del cuerpo.

20 Se describe en la solicitud WO2012/131274 que unos compuestos de tipo 4-(3-etoxi-4-hidroxifenil)alquilcetona permiten eliminar y/o reducir el número de levadura del género *Malassezia*, la cantidad de caspa, así como los picores y las rojeces sobre el cuero cabelludo.

25 Sin embargo, la piel de la cara o del cuerpo no sufre las mismas molestias del cuero cabelludo generadas por la presencia en cantidad importante de la levadura del género *Malassezia*. El documento US2012258058 se refiere a una formulación que tiene una acción de reducción de la irritación de la piel utilizando [6]-paradol en una composición cosmética.

30 De manera sorprendente, el inventor ha mostrado que los compuestos de fórmula (I) descritos a continuación presentan unas propiedades calmantes para la piel de la cara y/o del cuerpo.

La presente invención se refiere a la utilización cosmética no terapéutica como agente calmante para la piel de la cara y/o del cuerpo de un compuesto de fórmula (I) siguiente:



35 en la que:

- R1 representa un radical alquilo de C1-C4

40 - R2 representa un átomo de hidrógeno, o un radical hidrocarbonado, saturado o insaturado, lineal o ramificado, de C1-C6;

- R3 representa un radical hidrocarbonado, saturado o insaturado, lineal o ramificado, de C1-C4 eventualmente sustituido con un grupo hidroxilo;

45 - C-X representa C=O o CH-OH.

Preferentemente:

50 - R1 representa un radical alquilo etilo

- R2 representa un átomo de hidrógeno;

55 - R3 representa un radical hidrocarbonado, saturado o insaturado, lineal o ramificado, de C1-C4 eventualmente sustituido con un grupo hidroxilo;

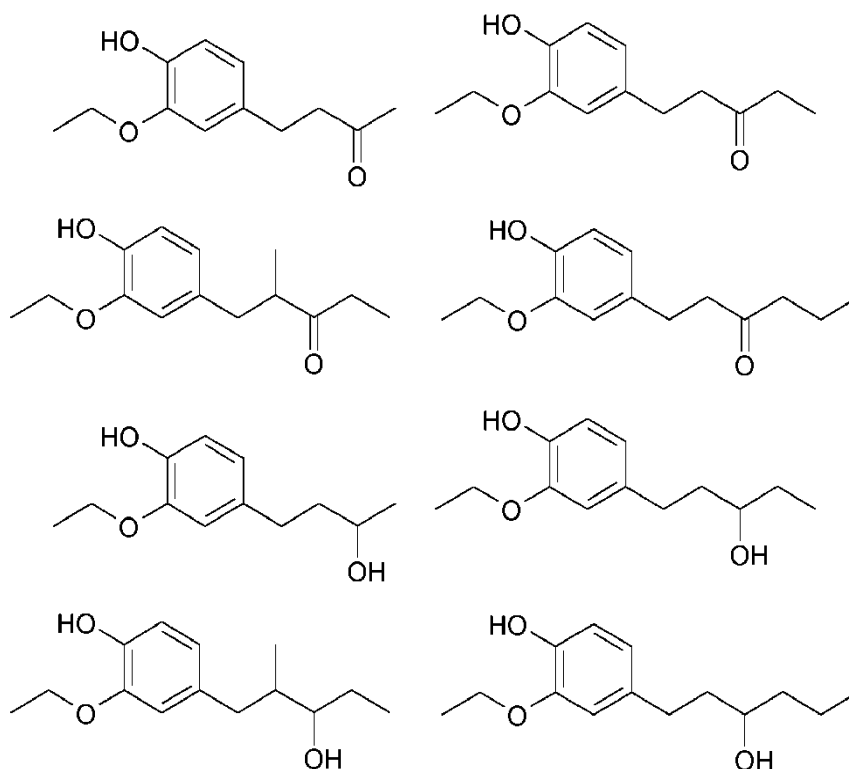
- C-X representa C=O o CH-OH y preferentemente C=O.

Preferiblemente:

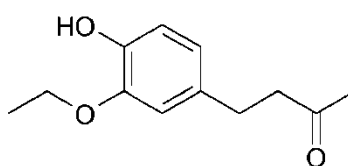
60

- R1 representa un radical alquilo etilo
- R2 representa un átomo de hidrógeno;
- 5 - R3 representa un radical hidrocarbonado, saturado, lineal de C1-C3;
- C-X representa C=O.

Como ejemplo de compuestos (I) se pueden citar:



Preferentemente, se utiliza el compuesto:



Los compuestos de fórmula (I) antes mencionados pueden por lo tanto utilizarse en composiciones cosméticas.

Se entiende por "composición cosmética" una sustancia o una preparación destinada a ponerse en contacto con las diversas partes superficiales del cuerpo humano, en particular la epidermis, las uñas, los labios, para, exclusiva o principalmente, limpiarlas, perfumarlas, modificar su aspecto, protegerlas, mantenerlas en buen estado o corregir los olores corporales. Una composición cosmética está destinada a una utilización no terapéutica.

La composición cosmética está destinada a aplicarse sobre la piel.

Por "piel" se entiende la piel de la cara y/o del cuerpo (cuello, manos, pies, piernas, busto).

La utilización cosmética de los compuestos de fórmula (I) antes mencionada según la invención puede destinarse a prevenir y/o tratar las reacciones antiestéticas y/o de molestia en la piel, siendo estas reacciones de origen no patológica y pudiendo ocasionarse, por ejemplo, por el afeitado o la depilación.

En particular, la utilización cosmética según la invención puede estar destinada a prevenir y/o tratar al menos una reacción cutánea de la piel, siendo esta reacción de origen no patológica, seleccionada del grupo constituido de las rojeces, de las sensaciones de picores o de tirantezas.

De manera general, las reacciones cutáneas no patológicas mencionadas anteriormente son más frecuentes en las zonas más expuestas del organismo, a saber las manos, los pies, las piernas, la cara y el cuello. Pueden ocurrir, especialmente, en zonas sometidas a algunos gestos de higiene diario, o frecuentemente reiterados, tales como el afeitado (barba, piernas), la depilación, el desbridamiento por productos de aseo o productos de limpieza, la aplicación de adhesivos como tiritas, parches o fijaciones de prótesis, o en el caso de gestos deportivos o profesionales, o simplemente relacionados con el modo de vida, con la utilización de ropa, de herramientas o de equipamientos que generan fricciones localizadas, o con la exposición a agentes irritantes o contaminantes o con las condiciones climáticas.

Las composiciones cosméticas que comprenden unos compuestos de fórmula (I), tales como se han definido anteriormente comprenden además un medio fisiológicamente aceptable. Un medio fisiológicamente aceptable es un medio no tóxico y susceptible de aplicarse sobre la piel y las faneras humanas y de aspecto, olor y tacto agradables.

El compuesto calmante de fórmula (I) tal como se ha definido anteriormente está preferentemente presente en las composiciones cosméticas en una cantidad del 0,01% al 10% en peso con respecto al peso total de la composición.

Preferiblemente, el compuesto calmante de fórmula (I) tal como se ha definido anteriormente está presente en una cantidad del 0,1% al 5% en peso con respecto al peso total de la composición.

El compuesto calmante de fórmula (I) tal como se ha definido anteriormente está aún más preferiblemente presente en una cantidad del 0,1% al 3% en peso con respecto al peso total de la composición.

La composición cosmética puede comprender además, como excipiente, al menos un gelificante hidrófilo o lipófilo, un aditivo hidrófilo o lipófilo, un agente emulsionante, un agente estabilizante, un conservante, una carga, un perfume, un absorbente de olores, un aceite, una cera, un disolvente o una materia colorante.

Las cantidades de estos diferentes excipientes son las clásicamente utilizadas en el campo cosmético, y por ejemplo varían de aproximadamente el 0,01 al 15% del peso total de la composición.

Según un modo particular de la presente invención, la composición cosmética está destinada a una administración tópica.

Para una aplicación tópica sobre la piel, la composición puede tener la forma en particular de soluciones acuosas u oleosas o de dispersiones de tipo loción o suero, de emulsiones de consistencia líquida o semi-líquida de tipo leche, obtenidas por dispersión de una fase grasa en una fase acuosa (H/E) o inversamente (E/H), o de suspensiones o emulsiones de consistencia blanda de tipo crema o gel acuoso o anhidras, o también de microcápsulas o micropartículas, o de dispersiones vesiculares de tipo iónico y/o no iónico o de espumas, preferentemente en forma de emulsión. Estas composiciones se preparan según los métodos habituales.

Estas composiciones cosméticas o dermatológicas pueden, por ejemplo, constituir unas cremas de limpieza, de protección, de tratamiento o de cuidado para la cara, para las manos, para los pies, para los grandes pliegues anatómicos o para el cuerpo (por ejemplo cremas de día, cremas de noche, cremas desmaquilladoras, cremas de base de maquillaje, cremas antisolares), bases de maquillajes fluidas, leches desmaquilladoras, leches corporales de protección o de cuidado, leches antisolares, lociones, geles o espumas para el cuidado de la piel, como lociones de limpieza, lociones antisolares, lociones de bronceado artificial, composiciones para el baño, composiciones desodorizantes que comprenden un agente bactericida, geles o lociones para después del afeitado y cremas depilatorias.

Las composiciones pueden también consistir en preparaciones sólidas que constituyen unos jabones o unas pastillas de limpieza.

Las composiciones pueden también envasarse en forma de composición para aerosol que comprende también un agente propulsor bajo presión.

La composición puede formularse en forma de emulsión, de crema, de pomada, de bálsamo, de leche, de loción, de gel, de espuma o de solución.

La composición cosmética se puede seleccionar, en particular, entre los productos de afeitado, los productos para después del sol, los desodorantes, las cremas calmantes, o los productos específicamente destinados a los labios, a los ojos o a las piernas.

En particular, la composición cosmética se puede seleccionar entre los bálsamos para después del afeitado, los desodorantes o las cremas calmantes.

La invención tiene también por objeto un procedimiento cosmético para el cuidado no terapéutico para calmar la piel de la cara y/o del cuerpo, caracterizado por que comprende la aplicación sobre la piel de la cara y/o del cuerpo, de una composición cosmética tal como se ha descrito anteriormente. El procedimiento se utiliza sobre la piel de la cara y/o del cuerpo, a excepción del cuero cabelludo.

El procedimiento cosmético según la invención está destinado a calmar la piel, en particular para prevenir y/o reducir las reacciones de molestia de la piel de la cara y/o del cuerpo.

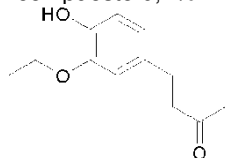
Más particularmente, el procedimiento cosmético según la invención está destinado a prevenir y/o tratar al menos una reacción cutánea seleccionada del grupo constituido de las rojezes, de las sensaciones de picores o de tirantezas. Se trata en particular de sensaciones de picores o de tirantezas que se deben a la sequedad de la piel.

Las propiedades de los compuestos calmantes de fórmula (I) tales como se han definido anteriormente se han puesto en evidencia gracias, en particular, al ejemplo siguiente.

Ejemplo 1:

Se prepara un gel cosmético que tiene la composición siguiente:

- compuesto 0,1%



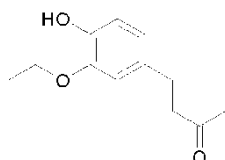
- ácido acrílico reticulado (CARBOPOL 941) 0,3%

- agua csp 100%

El gel aplicado sobre una piel de la cara previamente afeitada o sobre las piernas previamente depiladas permite calmar la piel tras el afeitado o la depilación.

Ejemplo 2:

Se han evaluado las propiedades calmantes del compuesto:



con el protocolo siguiente:

Se ha preparado la composición siguiente (Composición A):

Compuesto	1,6 g
Homopolímero AMPS	0,19 g
Ciclohexasiloxano	5 g
Dimeticona 10 cst	3,75 g
Poliisobutileno hidrogenado (Parleam de Nof Corporation)	4 g
Hidróxido de sodio	0,12 g
Propano 1-3 diol	5 g
Polímero carboxivinílico (Carbopol 980 polymer de Lubrizol)	0,3 g
Copolímero reticulado ácido acrílico/metacrilato de alquilo de C ₁₀ -C ₃₀ (PEMULEN TR-2 POLYMER de Lubrizol)	0,11 g
Ácido poliacrilamidometilpropano sulfónico neutralizado parcialmente con amoníaco y altamente reticulado (Hostacerin AMPS® de Clariant)	0,2

Ácido cítrico	0,08 g
Agua	csp 100 g

Se ha preparado también una composición placebo (composición P) sin el compuesto cetónico sustituyendo su cantidad por agua.

5 Se ha efectuado un ensayo panel con 10 hombres para evaluar la composición A y con 9 hombres para evaluar la composición P. Los hombres del panel tienen una piel blanca.

10 Cada sujeto ha aplicado la composición después del afeitado por la mañana y también por la noche antes de acostarse, durante 5 días.

Una primera evaluación o medición se ha efectuado el primer día 20 minutos después del afeitado, después se ha realizado una segunda evaluación o medición el 5º día 20 minutos después del afeitado, como se describe a continuación.

15 Medición de la rojez de la piel:

Se ha medida la rojez de la piel con un cromámetro (Konica Minolta CR-400, D65 Daylight mode) sobre la zona de la cara tratada con la composición y la zona no tratada. El color se ha medido utilizando el sistema CIE Lab y el valor se ha anotado (3 mediciones efectuadas).

20 Con la composición A se ha obtenido una reducción de la rojez del 4,1% mientras que con la composición placebo la reducción de la rojez es del 1,4%.

Evaluación de la sensación de tirantez de sequedad de la piel:

25 Se ha pedido también al panel evaluar la sensación de tirantez de sequedad de la piel en el primer día y en el quinto día de tratamiento, según las anotaciones siguientes:

0 = ninguna

30 1 = baja

2 = moderada

35 3 = severa

Se ha calculado después la media de la nota atribuida por el conjunto del panel en el primer y en el quinto día de tratamiento y después se ha determinado la diferencia en porcentaje entre la

40 Se han obtenido los resultados siguientes:

Composición A:

Media primer día = 0,90

45 Media quinto día = 0,30

Es decir una diferencia de $0,3/0,9 \times 100 = 33,3\%$

50 Composición P:

Media primer día = 0,78

Media quinto día = 0,44

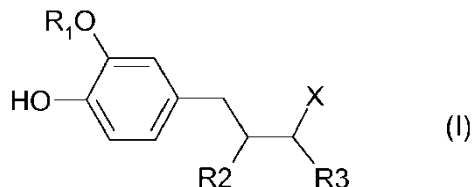
55 Es decir una diferencia de $0,44/0,78 \times 100 = 57,1\%$

El panel tratado con la composición A percibe una sensación de tirantez de sequedad de la piel más baja que la percibida por el panel tratado con la composición P.

60 Los resultados obtenidos muestran que el compuesto cetónico ensayado permite disminuir la rojez de la piel así como la sensación de tirantez de sequedad de la piel ocasionada por el afeitado. El compuesto cetónico tiene por lo tanto una acción calmante de la piel después del afeitado.

REIVINDICACIONES

1. Utilización cosmética no terapéutica de un compuesto de fórmula (I) siguiente:



en la que:

10 - R1 representa un radical alquilo de C1-C4

- R2 representa un átomo de hidrógeno, o un radical hidrocarbonado, saturado o insaturado, lineal o ramificado, de C1-C6;

15 - R3 representa un radical hidrocarbonado, saturado o insaturado, lineal o ramificado, de C1-C4 eventualmente sustituido con un grupo hidroxilo;

- C-X representa C=O o CH-OH;

20 como agente calmante de la piel de la cara o del cuerpo.

2. Utilización cosmética según la reivindicación 1, en la que para el compuesto de fórmula (I):

25 - R1 representa un radical alquilo etilo

- R2 representa un átomo de hidrógeno;

- R3 representa un radical hidrocarbonado, saturado o insaturado, lineal o ramificado, de C1-C4 eventualmente sustituido con un grupo hidroxilo;

30 - C-X representa C=O o CH-OH.

3. Utilización cosmética según la reivindicación 1 o 2, en la que para el compuesto de fórmula (I):

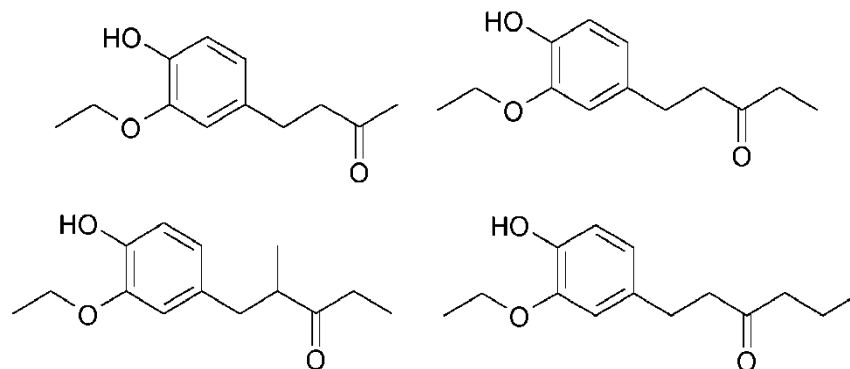
35 - R1 representa un radical alquilo etilo

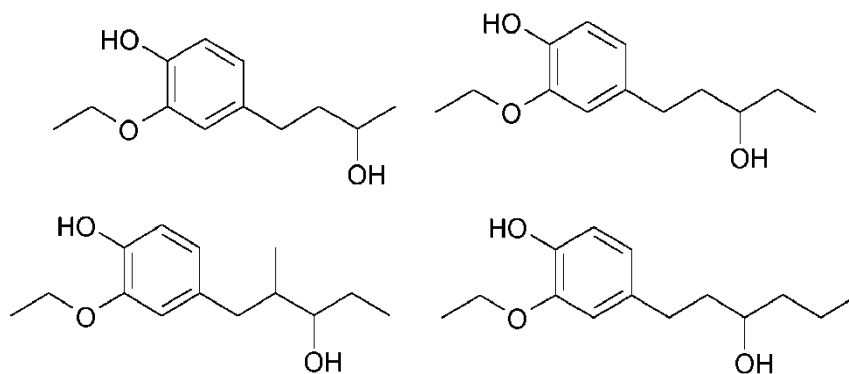
- R2 representa un átomo de hidrógeno;

40 - R3 representa un radical hidrocarbonado, saturado, lineal de C1-C3;

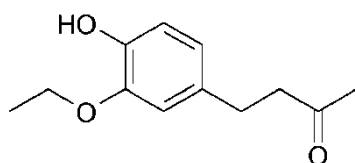
- C-X representa C=O.

4. Utilización cosmética según la reivindicación 1, en la que el compuesto de fórmula (I) se selecciona entre:





- 5 5. Utilización cosmética según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que el compuesto (I) es:



- 10 6. Utilización cosmética según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, para prevenir y/o tratar las reacciones de origen no patológicas antiestéticas y/o de molestia de la piel.
7. Utilización cosmética según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, para prevenir y/o tratar al menos una reacción cutánea no patológica seleccionada del grupo constituido por las rojeces, las sensaciones de picores o tirantece.
- 15 8. Utilización cosmética según la reivindicación anterior, en la que las sensaciones de picores o de tirantece se deben a la sequedad de la piel.
- 20 9. Utilización cosmética según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en la que el compuesto de fórmula (I) está comprendido en una composición cosmética.
- 25 10. Utilización cosmética, en la que el compuesto calmante de fórmula (I) tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 está presente en una composición cosmética en una cantidad que va del 0,01% al 10% en peso con respecto al peso total de la composición, preferentemente que va del 0,1% al 5 % en peso.
- 30 11. Procedimiento cosmético no terapéutico para calmar la piel de la cara y/o del cuerpo, caracterizado por que comprende la aplicación sobre la piel de la cara y/o del cuerpo, de una composición cosmética que comprende un compuesto (I) definido según una de las reivindicaciones 1 a 5.
- 35 12. Procedimiento según la reivindicación anterior, para prevenir y/o tratar las reacciones de origen no patológico antiestéticas y/o de molestia de la piel.
13. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 11 o 12, para prevenir y/o tratar al menos una reacción cutánea no patológica seleccionada del grupo constituido de las rojeces, de las sensaciones de picores o de tirantece.
- 40 14. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 11 a 13, en el que el compuesto de fórmula (I) está comprendido en una composición cosmética.
15. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 11 a 13, en el que el compuesto de fórmula (I) está presente en una composición cosmética en una cantidad que va del 0,01% al 10% en peso, con respecto al peso total de la composición, preferentemente que va del 0,1% al 5% en peso.