

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 921 485**

51 Int. Cl.:

C07D 213/20 (2006.01)

C07D 213/50 (2006.01)

A61Q 5/08 (2006.01)

A61K 8/22 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **21.12.2015** **PCT/EP2015/080850**

87 Fecha y número de publicación internacional: **23.06.2016** **WO16097413**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **21.12.2015** **E 15817323 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.06.2022** **EP 3233801**

54 Título: **Uso de sales de piridinio particulares para el tratamiento de sustancias queratínicas, composiciones y métodos de aplicación**

30 Prioridad:

19.12.2014 FR 1463028

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
26.08.2022

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

HERCOUET, LEÏLA y
SABELLE, STÉPHANE

74 Agente/Representante:

BERCIAL ARIAS, Cristina

ES 2 921 485 T3

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

DESCRIPCIÓN

Uso de sales de piridinio particulares para el tratamiento de sustancias queratínicas, composiciones y métodos de aplicación

- 5 La presente invención se refiere al uso de una o más sales de piridinio particulares para el tratamiento de sustancias queratínicas, particularmente fibras queratínicas humanas tal como el cabello. La invención también se refiere a un método para el tratamiento de sustancias queratínicas usando dichas sales y, opcionalmente, en presencia de uno o más agentes oxidantes químicos.

La invención también se refiere a una composición para aclarar las sustancias queratínicas, que comprende una o más sales de piridinio como se define a continuación y uno o más agentes oxidantes químicos.

- 10 La presente invención también se refiere a una o más sales de piridinio particulares, y también a las composiciones que las contienen, especialmente las composiciones que comprenden un medio fisiológicamente aceptable.

- 15 Cuando una persona desea cambiar el color del cabello, en particular cuando desea obtener un color más claro que su color original, a menudo es necesario proceder a un aclarado o decoloración del cabello. Para ello, se usan productos aclarantes o decolorantes. Esta etapa se combina opcionalmente con una etapa de coloración del cabello.

Es conocido aclarar o decolorar las sustancias queratínicas, en particular las fibras queratínicas, y especialmente las fibras queratínicas humanas, tales como el cabello, con composiciones aclarantes o decolorantes que contienen uno o más agentes oxidantes químicos.

- 20 Entre estos oxidantes químicos usados convencionalmente, se puede mencionar el peróxido de hidrógeno, los compuestos que pueden producir peróxido de hidrógeno por hidrólisis, tal como el peróxido de urea, o las persales, tales como perboratos, percarbonatos y persulfatos, siendo especialmente preferidos el peróxido de hidrógeno y los persulfatos.

- 25 El papel del agente oxidante químico es el de degradar la melanina del cabello, lo que, dependiendo de la naturaleza del agente oxidante y las condiciones de pH, conduce a un aclaramiento más o menos pronunciado de las fibras.

- 30 Las composiciones aclarantes o decolorantes se presentan en forma anhidra o acuosa y en diferentes formas de presentación: por ejemplo en forma de polvos, cremas, geles, espumas o pastas, que contienen compuestos alcalinos tales como aminas alcalinas o silicatos, y un reactivo peroxigenado tal como persulfatos, perboratos o percarbonatos de amonio o de metales alcalinos, que se diluyen en el momento de uso con una composición acuosa de peróxido de hidrógeno.

Las composiciones aclarantes o decolorantes también pueden resultar de mezclar, en el momento del uso, un polvo anhidro que contiene el reactivo peroxigenado con una composición acuosa que contiene los compuestos alcalinos y otra composición acuosa que contiene peróxido de hidrógeno.

- 35 En particular, la solicitud francesa FR 2 912 140 describe el uso de sales de piridinio para teñir fibras queratínicas.

Además, las sustancias queratínicas también se pueden decolorar usando un método convencional, que consiste en aplicar sobre dichas sustancias una composición acuosa que comprende al menos un agente oxidante.

- 40 Así, para aclaramientos relativamente suaves, el agente oxidante es generalmente peróxido de hidrógeno. Cuando se desea un mayor aclaramiento, se suelen usar sales peroxigenadas, por ejemplo persulfatos, en presencia de peróxido de hidrógeno.

Para obtener un producto aclarante o decolorante para sustancias queratínicas que sea más eficaz en cuanto a aclaramiento y/o velocidad, actualmente es necesario combinar peróxido de hidrógeno con un agente alcalino o sales de persulfato con un pH básico para lograr una adecuada formación de oxígeno activo.

- 45 Sin embargo, tal combinación comúnmente provoca la degradación de las sustancias queratínicas, en particular las fibras queratínicas, y posiblemente puede conducir a diversos grados de irritación de la piel.

En consecuencia, existe una necesidad real de usar compuestos que no presenten los inconvenientes mencionados anteriormente, es decir, que puedan producir, en condiciones más seguras que los persulfatos, un aclaramiento potente, especialmente de fibras queratínicas, al tiempo que minimizan su degradación.

- 50 Por lo tanto, la Solicitante ha descubierto, de manera sorprendente, que el uso de una o más sales de piridinio que tienen la fórmula (II), como se define a continuación, permite en particular mejorar el poder oxidante del

peróxido de hidrógeno, lo que proporciona un mayor aclaramiento de las sustancias queratínicas, especialmente fibras queratínicas, al tiempo que minimiza su degradación.

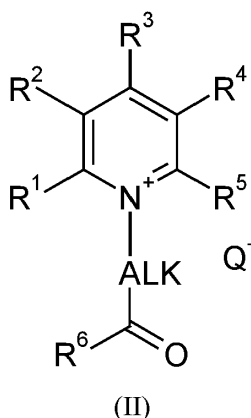
En otras palabras, implementar compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención mejora la actividad del peróxido de hidrógeno sin tener que aumentar su concentración ni tener que usar sales de persulfato a altas concentraciones, lo que minimiza los problemas de sensibilización de las sustancias queratínicas.

Por consiguiente, el uso de la o las sales de piridinio según el uso conduce a un mayor aclaramiento de las sustancias queratínicas sin tener que aumentar la fuerza del agente oxidante.

En otras palabras, el uso de la o las sales de piridinio según la invención potencia la actividad oxidante de los agentes oxidantes químicos, en particular el peróxido de hidrógeno, lo que conduce a un aclaramiento mejorado de las sustancias queratínicas en comparación con el uso del agente oxidante químico solo.

Además, las sales de piridinio que tienen la fórmula (II) en combinación, en particular con peróxido de hidrógeno, conducen a un aclaramiento más potente de las sustancias queratínicas que las sales de piridinio, usadas en las mismas condiciones, pero que son estructuralmente diferentes a las de la invención.

Por lo tanto, la presente invención se refiere en particular al uso para el tratamiento de sustancias queratínicas, preferiblemente fibras queratínicas, en particular fibras queratínicas humanas tales como el cabello, de uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) y sus sales de adición y solvatos:



Fórmula (II) en la que:

- R^1 y R^5 representan un átomo de hidrógeno;
- R^2 y R^4 , que pueden ser idénticos o diferentes, representan:
 - un átomo de hidrógeno,
 - un sustituyente alquílico de C_2-C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1-C_{10} y $-NR^7R^8$,
 - un sustituyente alcoxi de C_1-C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1-C_{10} y $-NR^7R^8$,
 - un sustituyente $-CO_2H$,
 - un sustituyente $-CO_2R^9$,
 - un sustituyente $-COR^{10}$,
- R^3 representa:
 - un átomo de hidrógeno;
 - un sustituyente alquílico de C_2-C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1-C_{10} y $-NR^7R^8$,
 - un sustituyente alcoxi de C_1-C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1-C_{10} , hidroxialquilo de C_1-C_4 y $-NR^7R^8$,
 - un sustituyente $-CO_2R^9$,

- un sustituyente -COR¹⁰,

• ALK representa un sustituyente metilénico,

• R⁶ representa un sustituyente metílico,

5 • R⁷ y R⁸, que pueden ser idénticos o diferentes, denotan un átomo de hidrógeno o un sustituyente alquílico de C₁-C₁₀ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo o alcoxi de C₁-C₁₀ y amino;

• R⁹ y R¹⁰, que pueden ser idénticos o diferentes, denotan un sustituyente alquílico de C₁-C₁₀ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo o alcoxi de C₁-C₁₀ y amino;

10 • Q⁻ representa un anión o una mezcla de aniones orgánicos o inorgánicos que aseguran la electroneutralidad en compuestos que tienen la fórmula (II).

El o los compuestos que tienen la fórmula (II) así definidos corresponden por lo tanto a sales de piridinio, y actúan como activadores de la oxidación.

15 El o los compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención se pueden usar en presencia de uno o más agentes oxidantes químicos para aclarar sustancias queratínicas, preferiblemente fibras queratínicas, en particular fibras queratínicas humanas tales como el cabello.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere en particular al tratamiento de sustancias queratínicas, preferiblemente fibras queratínicas, en particular fibras queratínicas humanas tales como el cabello, que consiste en aplicar a dichas sustancias uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) y sus sales de adición y solvatos.

20 Preferentemente, el método según la invención consiste en aplicar dichos compuestos de fórmula (II) y uno o más agentes oxidantes químicos.

Además, la invención se refiere a una composición para aclarar sustancias queratínicas, preferiblemente fibras queratínicas, en particular fibras queratínicas humanas tales como el cabello, que comprende uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) y sus sales de adición y solvatos, y uno o más agentes oxidantes químicos

25 Del mismo modo, la invención también se refiere al uso de dicha composición para aclarar sustancias queratínicas, preferiblemente fibras queratínicas, en particular fibras queratínicas humanas tales como el cabello.

Otros objetos, características, aspectos y ventajas de la invención surgirán aún más claramente al leer la descripción y los ejemplos que siguen.

En lo que sigue, y a menos que se indique lo contrario, los límites de un intervalo de valores se incluyen dentro de este intervalo, en particular en las expresiones “de entre” y “que oscila de... a...”.

30 Además, la expresión “al menos uno”, usada en la presente descripción, es equivalente a la expresión “uno o más”. Además, la expresión “al menos dos” es equivalente a la expresión “dos o más”.

La expresión “anión o mezcla de aniones que aseguran la electroneutralidad de los compuestos que tienen la fórmula (II)” significa un anión o un grupo aniónico derivado de una sal de ácido orgánico o inorgánico que contrarresta la carga catiónica del compuesto; más particularmente, el contraión aniónico se escoge de: i) haluros tales como cloruro o bromuro; ii) nitratos; iii) sulfonatos, incluyendo alquilsulfonatos de C₁-C₆: Alk-S(O)₂O⁻, tales como metanosulfonato o mesilato y etanosulfonato; iv) arilsulfonatos: Ar-S(O)₂O⁻, tales como bencenosulfonato y toluenosulfonato o tosilato; v) citrato; vi) succinato; vii) tartrato; viii) lactato; ix) alquilsulfatos: Alk-O-S(O)O⁻, tales como metilsulfato y etilsulfato; x) arilsulfatos: Ar-O-S(O)O⁻, tales como bencenosulfato y toluenosulfato; xi) alcoxisulfatos: Alk-O-S(O)₂O⁻, tales como metoxisulfato y etoxisulfato; xii) ariloxisulfatos: Ar-O-S(O)₂O⁻; xiii) fosfatos O=P(OH)₂O⁻, O=P(O⁻)₂OH, O=P(O⁻)₃, HO-[P(O)(O⁻)]_w-P(O)(O⁻)₂, siendo w un número entero; xiv) acetato; xv) triflato; y xvi) boratos, tal como tetrafluoroborato, xvii) disulfato (O=)S(O⁻)₂ o SO₄²⁻ y monosulfato HSO₄⁻; xviii) carbonato CO₃²⁻ o hidrogenocarbonato HCO₃⁻; el contraión aniónico, derivado de una sal de ácido orgánico o inorgánico, asegura la neutralidad eléctrica de la molécula; de este modo, se entiende que cuando el anión comprende varias cargas aniónicas, entonces el mismo anión puede servir para la neutralidad eléctrica de varios grupos catiónicos en una misma molécula, o también puede servir para la neutralidad eléctrica de varias moléculas.

Por sales de adición de compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención se entiende por lo tanto sales de adición con un ácido orgánico o inorgánico, y sales de adición con una base orgánica o inorgánica.

50 Las sales de adición de los compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención se escogen en particular de sales de adición con un ácido, tales como hidroccloruros, hidrobromuros, sulfatos, citratos, succinatos, tartratos,

lactatos, tosilatos, bencenosulfonatos, metanosulfonatos, fosfatos, y acetatos, y las sales de adición con una base, tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, amoníaco, aminas, o alcanolaminas.

- Además, los solvatos de los compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención representan más particularmente los hidratos de dichos compuestos y/o la combinación de dichos compuestos con un alcohol de C₁ a C₄ lineal o ramificado, tal como metanol, etanol, isopropanol o n-propanol. Preferiblemente, los solvatos son hidratos.

Uso de los compuestos que tienen la fórmula (II)

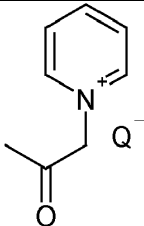
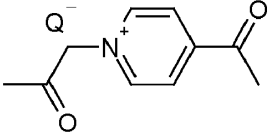
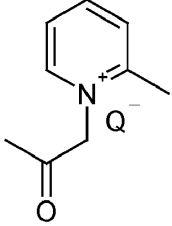
Preferiblemente, en la fórmula (II), R² y R⁴, que pueden ser idénticos o diferentes, representan un átomo de hidrógeno o un sustituyente alquílico de C₁-C₄ lineal, en particular un sustituyente metílico.

- 10 Preferentemente, en la fórmula (II), R³ representa un átomo de hidrógeno o un sustituyente -COR¹⁰, denotando R¹⁰ un sustituyente alquílico de C₁-C₁₀ lineal, particularmente un sustituyente alquílico de C₁-C₁₀ lineal.

Preferiblemente, Q⁻ es un anión escogido de haluros, en particular cloruro, bromuro y yoduro, sulfatos, fosfatos; carbonato; hidrogenocarbonato; metanosulfonato; para-toluenosulfonato; canfosulfonato; tartrato; citrato; lactato; acetato.

- 15 Preferentemente, en la fórmula (II), Q⁻ es un anión escogido de para-toluenosulfonato y haluros, particularmente cloruro.

El o los compuestos que tienen la fórmula (II) se escogen preferentemente de los siguientes compuestos:

	Sal de 1-(2-oxopropil)piridinio, con Q⁻ como se definió anteriormente, preferiblemente: haluro, tal como Cl⁻ (compuesto 1), o arilsulfonato, tal como tolueno-4-sulfonato (compuesto 2)
	Sal de 4-acetil-1-(2-oxopropil)-piridinio, con Q⁻ como se definió anteriormente, preferiblemente: haluro, tal como Cl⁻ (compuesto 3)
	Sal de 2-metil-1-(2-oxopropil)-piridinio, con Q⁻ como se definió anteriormente, preferiblemente: haluro, tal como Cl⁻ (compuesto 4)

y mezclas de los mismos.

Preferentemente, el compuesto que tiene la fórmula (II) es cloruro de 1-(2-oxopropil)piridinio (compuesto 1).

- 20 Como se ha indicado anteriormente, el o los compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención, preferiblemente los compuestos 1 a 4, se pueden usar en presencia de uno o más agentes oxidantes químicos para aclarar sustancias queratínicas, preferiblemente fibras queratínicas, en particular fibras queratínicas humanas tales como el cabello.

Los agentes oxidantes son tales como los que se describen a continuación.

- 25 **Composición que contiene compuestos que tienen la fórmula (II)**

Por consiguiente, la invención se refiere a una composición que comprende el o los compuestos que tienen la fórmula (II) como se define anteriormente, y sus sales de adición y solvatos, y uno o más agentes oxidantes químicos.

Preferiblemente, la composición según la invención comprende uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) escogidos de la sal de 1-(2-oxo-propil)piridinio (compuestos 1 y 2), la sal de 4-acetil-1-(2-oxo-propil)-piridinio (compuesto 3), la sal de 2-metil-1-(2-oxopropil)-piridinio (compuesto 4).

5 Preferiblemente, la composición según la invención comprende al menos un compuesto escogido de sales de 1-(2-oxopropil)piridinio (compuestos 1 y 2), en particular cloruro de 1-(2-oxopropil)piridinio.

La composición según la invención aclara las sustancias queratínicas, en particular las fibras queratínicas, y preferiblemente las fibras queratínicas humanas tales como el cabello, usando menos agente oxidante químico.

10 Según una realización particular de la invención, la composición colorante comprende al menos un agente oxidante químico. La expresión "agente oxidante químico" significa un agente oxidante distinto del oxígeno atmosférico. La composición de la invención contiene preferentemente uno o más agentes oxidantes químicos.

El o los agentes oxidantes usados en la invención son, por ejemplo, peróxido de hidrógeno, peróxido de urea, bromatos de metales alcalinos, persales tales como perboratos y persulfatos, perácidos y enzimas oxidasas, entre las cuales se pueden mencionar peroxidases, oxidorreductasas de 2-electrones tales como uricasas, y oxigenasas de 4 electrones, por ejemplo lacasas. Se prefiere particularmente el peróxido de hidrógeno.

15 Más particularmente, el o los agentes oxidantes químicos se escogen de peróxido de hidrógeno, peróxido de urea, bromatos de metales alcalinos, sales peroxigenadas, por ejemplo persulfatos o perboratos, perácidos y sus precursores, y percarbonatos de metales alcalinos o alcalino-térreos. El o los agentes oxidantes químicos consisten ventajosamente en peróxido de hidrógeno.

20 El o los compuestos que tienen la fórmula (II), y sus sales de adición y solvatos, pueden estar presentes en la composición según la invención en un contenido que oscila de 0,01% a 10% en peso, preferiblemente en un contenido en peso que oscila de 0,5% a 2% en peso, con respecto al peso total de la composición.

Preferentemente, el agente oxidante químico es peróxido de hidrógeno.

25 Según una realización, la composición según la invención comprende uno o más compuestos que tienen la fórmula (II), y sus sales de adición y solvatos, y al menos un agente oxidante químico tal como peróxido de hidrógeno.

Según esta realización, la composición comprende preferiblemente de forma adicional uno o más persulfatos.

En otras palabras, la composición puede comprender preferentemente una mezcla de peróxido de hidrógeno y persulfatos.

30 Según una realización, la composición según la invención comprende uno o más compuestos que tienen la fórmula (II), y sus sales de adición y solvatos, y peróxido de hidrógeno como agente oxidante químico; estando dicha composición libre de persulfatos.

Según estas realizaciones, el compuesto que tiene la fórmula (II) es una sal de 1-(2-oxo-propil)piridinio, preferiblemente un haluro de 1-(2-oxo-propil)piridinio tal como cloruro de 1-(2-oxo-propil)piridinio (compuesto 1).

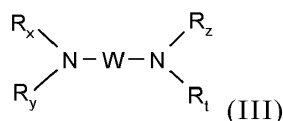
35 El o los agentes oxidantes químicos pueden estar presentes en la composición según la invención en un contenido que oscila de 0,5% a 9% en peso de la composición lista para uso, preferiblemente en un contenido en peso que oscila de 1,5% a 9% en peso, con respecto al peso total de la composición lista para uso.

Preferiblemente, la composición según la invención puede comprender uno o más agentes alcalinos, en particular agentes alcalinos orgánicos o inorgánicos.

40 El o los agentes alcalinos inorgánicos se escogen preferiblemente de amoniaco acuoso, haluros amónicos, y particularmente cloruro amónico, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos, tales como carbonatos de sodio o potasio y bicarbonatos de sodio o potasio, hidróxido de sodio o hidróxido de potasio, o mezclas de los mismos.

45 El o los agentes alcalinos orgánicos se escogen preferiblemente de aminas orgánicas con un pK_b a 25°C menor que 12, preferiblemente menor que 10, e incluso más ventajosamente menor que 6. Cabe señalar que se trata del pK_b correspondiente al grupo funcional que tiene la basicidad más alta. Además, las aminas orgánicas no comprenden ninguna cadena grasa de alquilo o alquenilo que comprenda más de diez átomos de carbono.

El o los agentes alcalinos orgánicos se escogen, por ejemplo, de alcanolaminas, etilendiaminas oxietilenadas y/u oxipropilenadas, aminoácidos, y los compuestos que tienen la fórmula (III) siguiente:



Fórmula (III) en la que W es un sustituyente alquilénico de C₁-C₆ divalente opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo o un sustituyente alquílico de C₁-C₆, y/u opcionalmente interrumpido con uno o más heteroátomos tales como O, o -NRu; Rx, Ry, Rz, Rt y Ru, que pueden ser idénticos o diferentes, representan un átomo de hidrógeno o un sustituyente alquílico de C₁-C₆, hidroxialquílico de C₁-C₆, o aminoalquílico de C₁-C₆.

Ejemplos de aminas que tienen la fórmula (III) que se pueden mencionar incluyen 1,3-diaminopropano, 1,3-diamino-2-propanol, espermina y espermidina.

El término "alcanolamina" significa una amina orgánica que comprende una función amina primaria, secundaria o terciaria, y uno o más grupos alquilo de C₁-C₈ lineales o ramificados que portan uno o más sustituyentes hidroxílicos.

Las aminas orgánicas escogidas de alcanolaminas tales como monoalcanolaminas, dialcanolaminas o trialcanolaminas que comprenden uno a tres sustituyentes hidroxialquílicos de C₁-C₄, idénticos o diferentes, son especialmente adecuadas para llevar a cabo la invención.

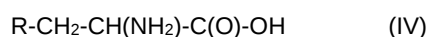
Entre los compuestos de este tipo, se pueden citar monoetanolamina (MEA), dietanolamina, trietanolamina, monoisopropanolamina, diisopropanolamina, N,N-dimetiletanolamina, 2-amino-2-metil-1-propanol, triisopropanolamina, 2-amino-2-metil-1,3-propanodiol, 3-amino-1,2-propanodiol, 3-dimetilamino-1,2-propanodiol, y tris(hidroximetil)aminometano.

Más particularmente, los aminoácidos que se pueden usar son de origen natural o sintético, en su forma L, D o racémica, y comprenden al menos una función ácida escogida más particularmente de las funciones ácido carboxílico, ácido sulfónico, ácido fosfónico, o ácido fosfórico. Los aminoácidos pueden estar en forma neutra o iónica.

Como aminoácidos que se pueden usar en la presente invención, se pueden mencionar en particular ácido aspártico, ácido glutámico, alanina, arginina, ornitina, citrulina, asparagina, carnitina, cisteína, glutamina, glicina, histidina, lisina, isoleucina, leucina, metionina, N-fenilalanina, prolina, serina, taurina, treonina, triptófano, tirosina y valina, y sus sales.

Ventajosamente, los aminoácidos son aminoácidos básicos que comprenden una función amina adicional opcionalmente incluida en un anillo o en una función ureido.

Tales aminoácidos básicos se escogen preferiblemente de los correspondientes a la fórmula (IV) a continuación, y también sus sales:



en la que R representa un grupo escogido de imidazolilo, preferiblemente imidazolil-4-ilo; aminopropilo; aminoetilo; -(CH₂)₂NH-C(O)-NH₂; y -(CH₂)₂-NH-C(NH)-NH₂.

La amina orgánica también se puede escoger de aminas orgánicas de tipo heterocíclico. Además de la histidina que ya se ha mencionado en los aminoácidos, se pueden mencionar en particular piridina, piperidina, imidazol, triazol, tetrazol, y bencimidazol.

La amina orgánica también se puede escoger de dipéptidos de aminoácidos. Como dipéptidos de aminoácidos que se pueden usar en la presente invención, se pueden mencionar especialmente carnosina, anserina, y balenina.

La amina orgánica también se puede escoger de compuestos que comprenden una función guanidina. Como aminas de este tipo que se pueden usar en la presente invención, además de la arginina, que ya ha sido mencionada como aminoácido, se pueden citar especialmente creatina, creatinina, 1,1-dimetilguanidina, 1,1-dietilguanidina, glicociamina, metformina, agmatina, N-amidinoalanina, ácido 3-guanidinopropiónico, ácido 4-guanidinobutírico, y ácido 2-([amino(imino)metil]amino)etano-1-sulfónico.

Los compuestos híbridos que se pueden mencionar incluyen las sales de las aminas mencionadas anteriormente con ácidos tales como ácido carbónico o ácido clorhídrico.

En particular, se puede usar carbonato de guanidina o hidrocloreuro de monoetanolamina.

Preferiblemente, el o los agentes alcalinos presentes en la composición según la invención se escogen de amoníaco acuoso, alcanolaminas, aminoácidos en forma neutra o iónica, en particular aminoácidos básicos, y preferiblemente correspondientes a los de fórmula (IV).

Más preferentemente, el o los agentes alcalinos presentes en la composición según la invención se escogen de amoníaco acuoso, alcanolaminas, y mezclas de los mismos.

Más preferentemente, el o los agentes alcalinos presentes en la composición según la invención se escogen de amoníaco acuoso y cloruro de amonio.

- 5 Según una realización particular de la invención, el o los agentes alcalinos son inorgánicos.

Según una realización particular de la invención, el o los agentes alcalinos son orgánicos, tales como alcanolaminas, en particular monoetanolamina.

La cantidad de agente o agentes alcalinos presentes en la composición según la invención puede oscilar de 0,01% y 30% en peso, y preferiblemente de 0,1% y 20% en peso con respecto al peso total de la composición.

- 10 La composición según la invención tiene un pH mayor o igual a 4. Preferiblemente, el pH de la composición según la invención varía de 7 a 11, más preferentemente de 8 a 10, y más preferentemente de 8,5 a 9,5.

Según una realización, la composición según la invención comprende uno o más compuestos de fórmula (II), y sus sales de adición y solvatos, uno o más agentes oxidantes químicos, y uno o más agentes alcalinos escogidos de amoníaco acuoso y haluros amónicos tal como cloruro amónico.

- 15 Según esta realización, el compuesto que tiene la fórmula (II) se escoge preferiblemente de haluros de 1-(2-oxopropil)piridinio, y más preferentemente cloruro de 1-(2-oxopropil)piridinio (compuesto 1).

Según esta realización, el agente oxidante químico es preferiblemente peróxido de hidrógeno.

- 20 La composición según la invención puede comprender opcionalmente uno o más aditivos, distintos de los compuestos de la invención, y entre los que se pueden citar en particular disolventes orgánicos, polímeros catiónicos, aniónicos, no iónicos, anfóteros, o mezclas de los mismos, agentes anticasca, agentes contra la seborrea, agentes para prevenir la caída del cabello y/o para promover el recrecimiento del cabello, vitaminas y provitaminas, incluyendo pantenol, protectores solares, pigmentos inorgánicos u orgánicos, secuestrantes, plastificantes, solubilizantes, agentes acidulantes, espesantes inorgánicos u orgánicos, especialmente espesantes poliméricos, opacificantes o agentes nacarantes, antioxidantes, hidroxiácidos, fragancias, conservantes, pigmentos, y ceramidas.

Huelga decir que un experto en la técnica se encargará de seleccionar este o estos compuestos adicionales opcionales de modo que las propiedades ventajosas asociadas intrínsecamente con la composición según la invención no se vean, o no se vean sustancialmente afectadas negativamente por la o las adiciones previstas.

- 30 Los adyuvantes anteriores generalmente pueden estar presentes en una cantidad, para cada uno de ellos, de entre 0 y 20% en peso con respecto al peso total de la composición.

La composición según la invención comprende preferentemente un medio fisiológicamente aceptable.

- 35 Para los fines de la presente invención, la expresión “medio fisiológicamente aceptable” pretende denotar un medio que es adecuado para la administración tópica de una composición. Un medio fisiológicamente aceptable es preferentemente un medio cosmética o dermatológicamente aceptable, es decir, un medio que no tiene olor ni aspecto desagradables, y que es totalmente compatible con la vía de administración tópica. En el presente caso, cuando la composición está destinada a la administración tópica, es decir, a la administración por aplicación en la superficie del material queratínico considerado, dicho medio se considera en particular fisiológicamente aceptable cuando no provoca escozor, tirantez o enrojecimiento inaceptable para el usuario.

Método de tratamiento según la invención

- 40 El método de tratamiento de las sustancias queratínicas consiste en aplicar a dichas sustancias uno o más compuestos que tiene la fórmula (II) como se ha definido aquí anteriormente, opcionalmente en presencia de uno o más agentes oxidantes químicos.

Preferiblemente, el o los compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención se aplican en presencia de uno o más agentes oxidantes químicos, más preferentemente peróxido de hidrógeno.

- 45 Según una realización, el método de tratamiento consiste en aplicar la composición como se define previamente sobre las sustancias queratínicas.

Preferiblemente, el método de tratamiento consiste en aplicar la composición como se define previamente sobre las fibras queratínicas secas o húmedas. Se deja actuar sobre las fibras durante un período, generalmente de 1 minuto a 1 hora, preferiblemente de 5 minutos a 30 minutos.

La temperatura durante el método está convencionalmente entre la temperatura ambiente (entre 15 y 25°C) y 80°C, y preferiblemente entre la temperatura ambiente y 60°C.

Preferentemente, la composición se aplica a temperatura ambiente.

- 5 Después del tratamiento, las sustancias queratínicas se aclaran opcionalmente con agua, opcionalmente se lavan con un champú y después se aclaran con agua, antes de secarlas o dejarlas secar.

La composición según la invención se puede preparar mezclando al menos dos composiciones.

La composición según la invención se puede obtener especialmente mezclando dos composiciones:

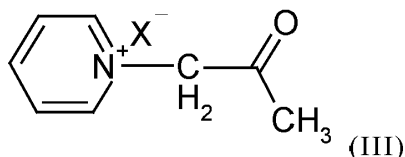
- una composición (A) que comprende uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención, y
- una composición (B) que comprende uno o más agentes oxidantes químicos.

10 **Compuestos que tienen fórmula (II) y composición correspondiente**

Como se indicó anteriormente, la presente invención también se refiere a compuestos que tienen la fórmula (II) como se define anteriormente, y sus sales de adición y solvatos, entendiéndose que la fórmula (II) no puede representar el compuesto que tiene la siguiente fórmula (III).

El compuesto que tiene la fórmula (II) es distinto de:

- 15 - el siguiente compuesto que tiene la fórmula (III):



representando X^- un anión escogido de ion cloruro (Cl^-), ion bromuro (Br^-), ion yoduro (I^-), ion perclorato (ClO_4^-), ion metosulfato ($MeSO_4^-$), ion hexafluorofosfato (PF_6^-), ion picrato ($C_6H_2N_3O_7^-$), ion mesilato ($CH_3SO_3^-$), e ion triflato ($CF_3SO_3^-$);

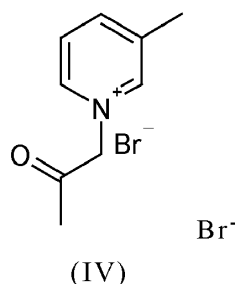
- 20 - los siguientes compuestos:

$C_8H_{10}NOCl.HgCl_2$ (sal doble de cloruro de mercurio de piridina monocloroacetona),

$(C_8H_{10}NOCl)_2.PtCl_4$ (sal doble de cloruro de platino de piridina monocloroacetona), y

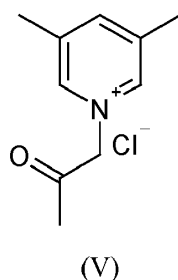
$C_8H_{10}NOCl.AuCl_3$ (sal doble de cloruro de oro de piridina monocloroacetona);

- el siguiente compuesto que tiene la fórmula (IV):

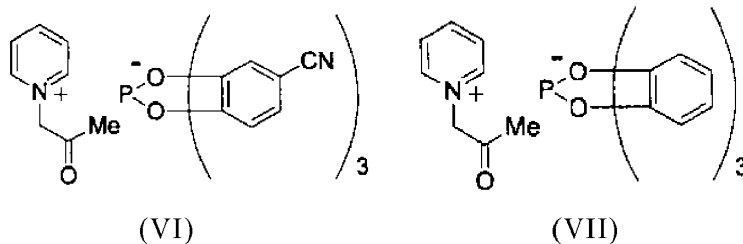


25

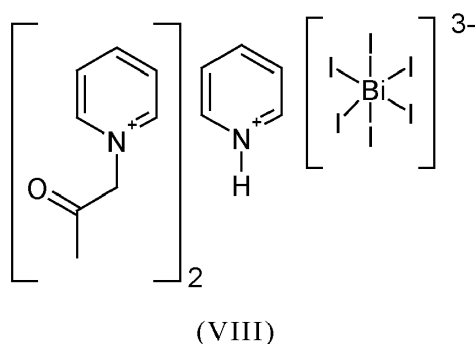
- el siguiente compuesto que tiene la fórmula (V):



- los compuestos que tienen las fórmulas (VI) y (VII):

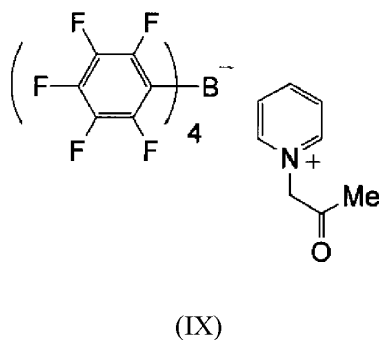


- el compuesto que tiene la fórmula (VIII):

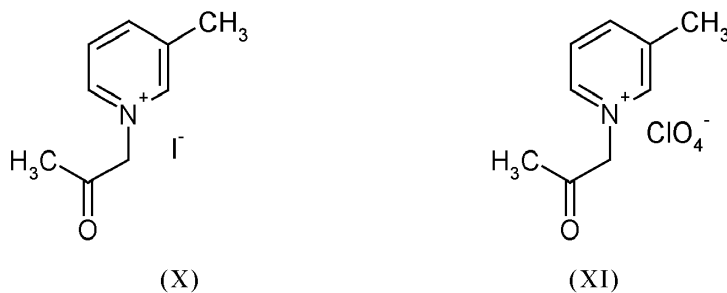


5

- el compuesto que tiene la fórmula (IX):



- los compuestos que tienen la fórmula (X) y (XI):



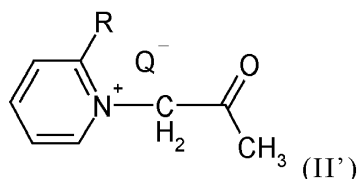
- 10 Preferentemente, en la fórmula (II), R^2 y R^4 , que pueden ser idénticos o diferentes, representan un átomo de hidrógeno o un sustituyente alquílico de C_1 - C_4 lineal, en particular un sustituyente metílico. Más preferentemente, R^2 y R^4 representan un átomo de hidrógeno.

Preferentemente, en la fórmula (II), R^3 representa un átomo de hidrógeno o un sustituyente $-COR^{10}$, denotando R^{10} un sustituyente alquílico de C_1 - C_{10} lineal, particularmente un sustituyente alquílico de C_1 - C_4 lineal.

- 15 Más preferentemente, R^3 representa un sustituyente $-COR^{10}$, denotando R^{10} un sustituyente alquílico de C_1 - C_4 lineal, preferiblemente $-COCH_3$.

Preferentemente, en la fórmula (II), Q^- es un anión escogido de para-toluenosulfonato y haluros, particularmente cloruro.

Según una realización particular de la invención, el compuesto que tiene la fórmula (II) representa el siguiente compuesto:



5 Fórmula (II') en la que Q^- es un contraión aniónico como define anteriormente distinto de un ion cloruro (Cl^-), y R representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo,

Preferiblemente, el compuesto que tiene la fórmula (II) o (II') es tolueno-4-sulfonato de 1-(2-oxo-propil)-piridinio (compuesto 2) y cloruro de 4-acetil-1-(2-oxo-propil)-piridinio (compuesto 3).

La invención también se refiere a una composición que comprende uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) o (II') como se define anteriormente.

10 Preferiblemente, el compuesto comprende uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) o (II') escogidos de tolueno-4-sulfonato de 1-(2-oxo-propil)-piridinio (compuesto 2) y cloruro de 4-acetil-1-(2-oxo-propil)-piridinio (compuesto 3).

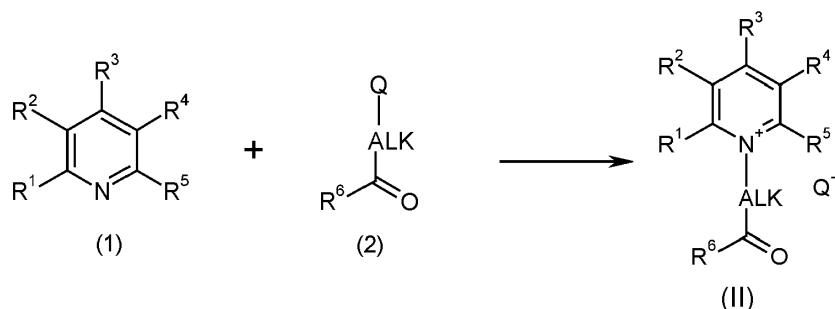
15 El o los compuestos que tienen la fórmula (II), y sus sales de adición y solvatos, pueden estar presentes en la composición según la invención en un contenido que oscila de 0,01% a 10% en peso, preferiblemente en un contenido que oscila de 0,5% a 2% en peso, con respecto al peso total de la composición.

La composición comprende preferentemente un medio fisiológicamente aceptable.

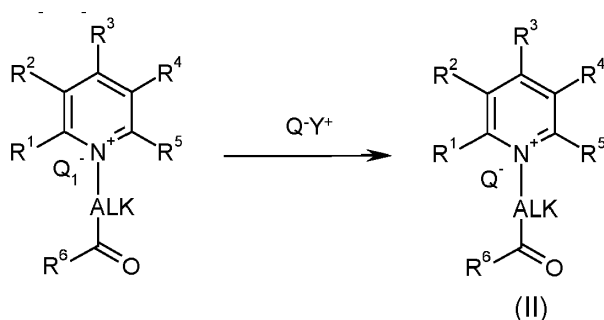
Método para preparar los compuestos que tienen la fórmula (II)

20 Los compuestos que tienen la fórmula (II) se pueden obtener por cuaternización de derivados de piridina (1) con derivados (2), representando Q un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, particularmente cloro, bromo y yodo, un alquilsulfonato o un arilsulfonato.

Tal reacción se lleva a cabo generalmente en presencia de un disolvente prótico polar, por ejemplo etanol, y se puede realizar a temperatura ambiente (27°C), y se acelera por calentamiento (a reflujo del disolvente).



25 Los compuestos que tienen la fórmula (II) también se pueden obtener simplemente intercambiando el contraanión:



Particularmente, estos métodos preparan tolueno-4-sulfonato de 1-(2-oxo-propil)-piridinio (compuesto 2) y cloruro de 4-acetil-1-(2-oxopropil)-piridinio (compuesto 3).

La presente invención también se refiere al uso de uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) como se define anteriormente como activador de la oxidación.

En particular, el o los compuestos de fórmula (II) según la invención se usan en presencia de uno o más agentes oxidantes químicos para mejorar el aclaramiento de sustancias queratínicas, preferentemente fibras queratínicas humanas tales como el cabello.

En otras palabras, el o los compuestos que tienen la fórmula (II) según la invención se usan para mejorar la actividad oxidante de uno o más agentes oxidantes químicos.

Preferiblemente, el agente oxidante químico es peróxido de hidrógeno.

Los ejemplos que siguen sirven para ilustrar la invención sin, sin embargo, ser de naturaleza limitativa.

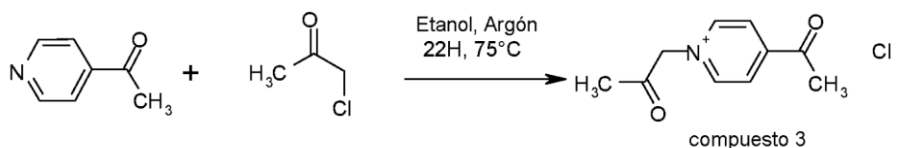
En estos ejemplos, el color de las trenzas se evaluó en el sistema CIE $L^* a^* b^*$, usando un colorímetro Minolta Spectrophotometer CM2600D.

En este sistema $L^* a^* b^*$, los tres parámetros denotan, respectivamente, la intensidad del color (L^*), el eje de color verde/rojo (a^*), y el eje de color azul/amarillo (b^*). Cuanto mayor sea el valor de L^* , más claro es el color. Cuanto mayor sea el valor de a^* , más rojo es el color, y cuanto mayor es el valor de b^* , más amarillo es el color.

15 EJEMPLOS

Ejemplo 1:

Síntesis de cloruro de 4-acetil-1-(2-oxo-propil)-piridinio (compuesto 3)



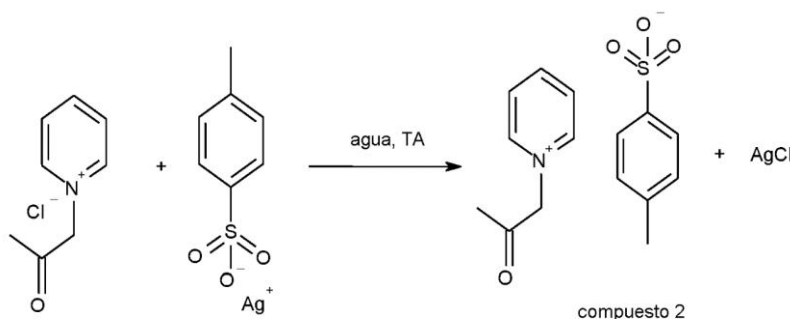
A una disolución de 0,5 g de 4-acetilpiridina (4,1 mmoles) en 2,5 g de etanol absoluto calentado a 70°C se añaden 0,40 g de cloroacetona (6,2 mmoles) según el procedimiento descrito en la patente WO 02/18311 A1. El conjunto se calienta a 75°C durante 22 horas. Después, el medio de reacción se evapora y se lava dos veces con 15 ml de acetato de etilo.

El producto final se obtiene como un líquido marrón viscoso (0,5 g, 57%).

Los resultados de espectrometría y espectroscopía concuerdan con la estructura del compuesto (3).

25 Ejemplo 2:

Síntesis de tolueno-4-sulfonato de 1-(2-oxo-propil)-piridinio (compuesto 2)



A una disolución de 7,38 g de cloruro de 1-(2-oxopropil)piridinio (4,3 milimoles) en 40 ml de agua se añaden 12 g de tosilato de plata (4,3 milimoles). Se filtra un precipitado blanco después de 1 h de agitación a temperatura ambiente, protegido de la luz. El filtrado se evapora hasta sequedad.

El producto final se obtiene como un aceite endurecedor de color marrón amarillento (11,4 g, 86%).

Los resultados de espectrometría y espectroscopía concuerdan con la estructura del compuesto 2.

Ejemplo 3:

En este ejemplo se estudia el efecto de mejora sobre el poder oxidante producido por las sales de piridinio según la invención.

I. Preparación de melanina sintética

- 5 La melanina sintética usada para la evaluación se obtiene polimerizando 5,6-dihidroxiindol con peróxido de hidrógeno según el siguiente procedimiento:

10 A 456 g de agua calentada hasta 80°C se añaden 100 g de 5,6 dihidroxiindol. Después de 10 minutos de agitación, se añade 1 ml de una disolución acuosa de amoníaco al 20%, y el medio se mantiene entonces durante 30 minutos a 80°C. A continuación, se añaden gota a gota 152 g de peróxido de hidrógeno al 30%, y la agitación se mantiene durante 2,5 horas a 80°C. Tras enfriar, la suspensión formada se filtra y se lava con agua.

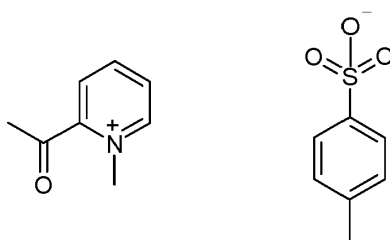
Esto produce 86 g de melanina sintética.

II. Composiciones ensayadas

Las composiciones usadas en este ejemplo se han obtenido a partir de los siguientes ingredientes (los porcentajes indicados son porcentajes en peso con respecto al peso total de la composición).

- 15 Las composiciones (B) y (C) son composiciones según la invención.

La composición comparativa D comprende la siguiente sal de piridinio:



	Composición A	Composición B	Composición C	Composición D
H ₂ O ₂	6%	6%	6%	6%
cloruro de 1-(2-oxopropil)piridinio (compuesto 1)	-	36 mg	15 mg	-
tolueno-4-sulfonato de 2-acetil-1-metilpiridinio	-	-	-	36 mg
Agua	c.s. 100	c.s. 100	c.s. 100	c.s. 100

III. Procedimiento

- 20 Para cada composición descrita en la tabla en la sección II se aplica el siguiente procedimiento.

A 1 mg de melanina sintética obtenida según la sección I se añade 1 ml de agua, 1 ml de amortiguador de amoníaco acuoso y cloruro de amonio a pH = 9,5, y 1 ml de la composición estudiada (composiciones A, B, C y D).

Se mide el aclaramiento (L*) obtenido después de cincuenta minutos de incubación.

- 25 **IV. Resultados**

	Composición A	Composición B	Composición C	Composición D
Nivel de aclaramiento (L*)	36	68	71	62

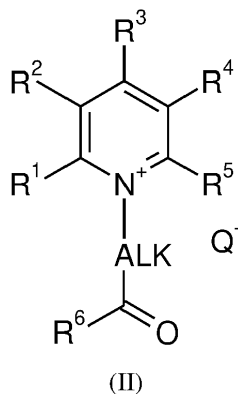
El aclaramiento obtenido que se observa es mayor para las composiciones B y C según la invención que para las composiciones A y D.

En particular, se observa que la presencia de sales de piridinio mejoran el poder oxidante del peróxido de hidrógeno, y por tanto potencian su actividad (comparación entre la composición A y las composiciones B y C).

- 5 Además, se observa que la presencia de sales de piridinio según la invención mejora el poder oxidante del peróxido de hidrógeno frente a una sal de piridinio que tiene una estructura diferente.

REIVINDICACIONES

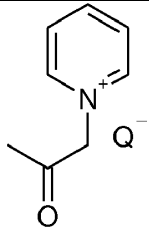
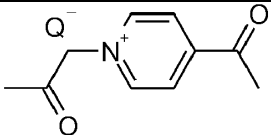
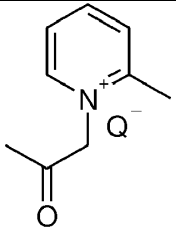
1. Uso para el tratamiento de sustancias queratínicas, en particular fibras queratínicas humanas tales como el cabello, de uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) y sus sales de adición y solvatos:



5 Fórmula (II) en la que:

- R^1 y R^5 representan un átomo de hidrógeno;
- R^2 y R^4 , que pueden ser idénticos o diferentes, representan:
 - un átomo de hidrógeno,
 - un sustituyente alquílico de C_1 - C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1 - C_{10} , y $-NR^7R^8$,
 - un sustituyente alcoxi de C_1 - C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1 - C_{10} y $-NR^7R^8$,
 - un sustituyente $-CO_2H$,
 - un sustituyente $-COR^{10}$,
- R^3 representa:
 - un átomo de hidrógeno;
 - un sustituyente alquílico de C_2 - C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1 - C_{10} y $-NR^7R^8$,
 - un sustituyente alcoxi de C_1 - C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1 - C_{10} , hidroxialquilo de C_1 - C_4 , y $-NR^7R^8$,
 - un sustituyente $-CO_2R^9$,
 - un sustituyente $-COR^{10}$,
- ALK representa un sustituyente metilénico,
- R^6 representa un sustituyente metílico,
- R^7 y R^8 , que pueden ser idénticos o diferentes, denotan un átomo de hidrógeno o un sustituyente alquílico de C_1 - C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1 - C_{10} y amino;
- R^9 y R^{10} , que pueden ser idénticos o diferentes, denotan un sustituyente alquílico de C_1 - C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1 - C_{10} y amino;
- Q^- representa un anión o una mezcla de aniones orgánicos o inorgánicos que aseguran la electroneutralidad en compuestos que tienen la fórmula (II).

2. Uso según la reivindicación anterior, caracterizado por que el o los compuestos que tienen la fórmula (II) se escogen de los siguientes compuestos:

	Sal de 1-(2-oxo-propil)piridinio
	Sal de 4-acetil-1-(2-oxo-propil)-piridinio
	Sal de 2-metil-1-(2-oxo-propil)-piridinio

y mezclas de los mismos,

siendo Q^- como se define según la reivindicación 1.

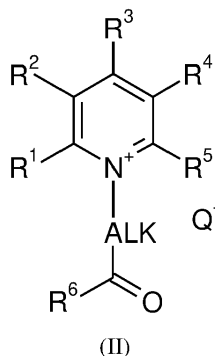
3. Uso de uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) como se define según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, para mejorar la actividad oxidante de uno o más agentes oxidantes químicos.

5 4. Composición que comprende uno o más agentes oxidantes químicos y uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) como se define según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2.

5. Composición según la reivindicación 4, caracterizada por que el agente oxidante químico es peróxido de hidrógeno.

10 6. Método de tratamiento de sustancias queratínicas, en particular de fibras queratínicas, preferiblemente fibras queratínicas humanas tal como el cabello, que consiste en aplicar a dichas sustancias queratínicas uno o más compuestos que tienen la fórmula (II), opcionalmente en presencia de uno o más agentes oxidantes químicos como se define según la reivindicación 4 o 5.

7. Compuestos que tiene la fórmula (II) y sales de adición y solvatos de los mismos:



15 Fórmula (II) en la que:

- R^1 y R^5 representan un átomo de hidrógeno;

- R^2 y R^4 , que pueden ser idénticos o diferentes, representan:

- un átomo de hidrógeno,

- un sustituyente alquílico de C_1 - C_{10} lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C_1 - C_{10} , y $-NR^7R^8$,

- un sustituyente alcoxi de C₁-C₁₀ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀, y -NR⁷R⁸,

- un sustituyente -CO₂H,

- un sustituyente -COR¹⁰,

5 • R³ representa:

- un átomo de hidrógeno;

- un sustituyente alquílico de C₂-C₁₀ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀, y -NR⁷R⁸,

10 - un sustituyente alcoxi de C₁-C₁₀ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀, hidroxialquilo de C₁-C₄, y -NR⁷R⁸;

- un sustituyente -CO₂R⁹,

- un sustituyente -COR¹⁰,

• ALK representa un sustituyente metilénico,

• R⁶ representa un sustituyente metílico,

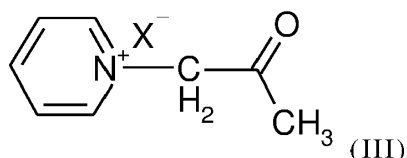
15 • R⁷ y R⁸, que pueden ser idénticos o diferentes, denotan un átomo de hidrógeno o un sustituyente alquílico de C₁-C₁₀ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀ y amino;

• R⁹ y R¹⁰, que pueden ser idénticos o diferentes, denotan un sustituyente alquílico de C₁-C₁₀ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con uno o más grupos hidroxilo, alcoxi de C₁-C₁₀ y amino;

20 • Q⁻ representa un anión o una mezcla de aniones orgánicos o inorgánicos que aseguran la electroneutralidad en compuestos que tienen la fórmula (II).

• entendiéndose que la fórmula (II) no puede representar:

- el siguiente compuesto que tiene la fórmula (III):



25 representando X⁻ un anión escogido de ion cloruro (Cl⁻), ion bromuro (Br⁻), ion yoduro (I⁻), ion perclorato (ClO₄⁻), ion metosulfato (MeSO₄⁻), ion hexafluorofosfato (PF₆⁻), ion picrato (C₆H₂N₃O₇⁻), ion mesilato (CH₃SO₃⁻), e ion triflato (CF₃SO₃⁻);

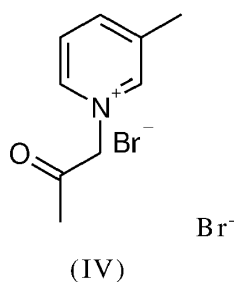
- los siguientes compuestos:

C₈H₁₀NOCl.HgCl₂ (sal doble de cloruro de mercurio de piridina monocloroacetona),

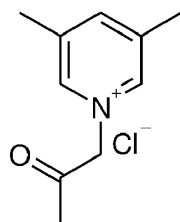
30 (C₈H₁₀NOCl)₂.PtCl₄ (sal doble de cloruro de platino de piridina monocloroacetona), y

C₈H₁₀NOCl.AuCl₃ (sal doble de cloruro de oro de piridina monocloroacetona);

- el siguiente compuesto que tiene la fórmula (IV):

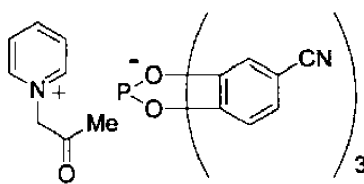


- el siguiente compuesto que tiene la fórmula (V):

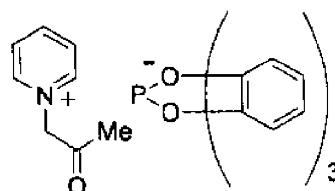


(V)

- los compuestos que tienen las fórmulas (VI) y (VII):



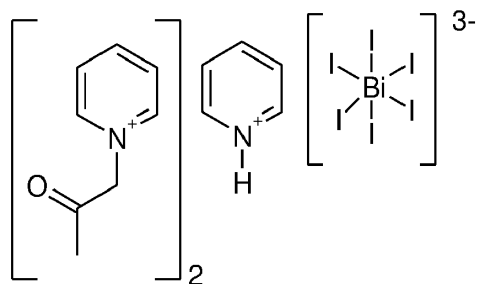
(VI)



(VII)

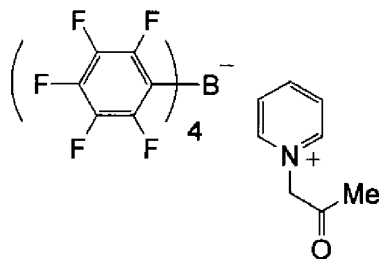
5

- el compuesto que tiene la fórmula (VIII):



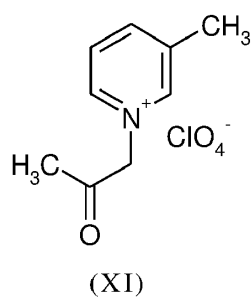
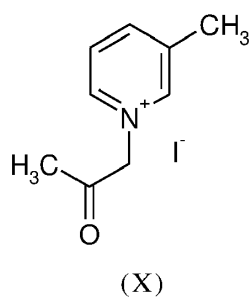
(VIII)

- el compuesto que tiene la fórmula (IX):



(IX)

- los compuestos que tienen la fórmula (X) y (XI):



8. Compuestos que tienen la fórmula (II) según la reivindicación 7, escogidos de tolueno-4-sulfonato de 1-(2-oxo-propil)-piridinio y cloruro de 4-acetil-1-(2-oxo-propil)-piridinio.

5 9. Composición que comprende uno o más compuestos que tienen la fórmula (II) como se define según la reivindicación 7 u 8.