



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 318 866**

51 Int. Cl.:

A61K 8/64 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **98402327 .5**

96 Fecha de presentación : **22.09.1998**

97 Número de publicación de la solicitud: **0904777**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **31.03.1999**

54

Título: **Utilización de un inhibidor de aminoácidos excitatorio en una composición cosmética o dermatológica para pieles sensibles y composición obtenida.**

30

Prioridad: **25.09.1997 FR 97 11959**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.05.2009

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.05.2009

73

Titular/es: **L'ORÉAL**
14, rue Royale
75008 Paris, FR

72

Inventor/es: **Breton, Lionel y**
Nonotte, Isabelle

74

Agente: **Ungría López, Javier**

ES 2 318 866 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).

ES 2 318 866 T3

DESCRIPCIÓN

Utilización de un inhibidor de aminoácidos excitatorio en una composición cosmética o dermatológica para pieles sensibles y composición obtenida.

5 La presente invención se relaciona con la utilización de un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio, tal como el aspartato y el glutamato, para la preparación de una composición dermatológica, destinada a tratar las pieles sensibles, incluyendo el cuero cabelludo, los contornos de los ojos y las mucosas, de lo seres humanos. Se relaciona también con la composición dermatológica obtenida.

10 Es sabido que determinadas pieles son más sensibles que otras. Ahora bien, los síntomas de las pieles sensibles estaban hasta ahora mal caracterizados y el problema de estas pieles estaba, por ello, mal definido; nadie conocía exactamente el proceso que causaba la sensibilidad de la piel. Algunos pensaban que una piel sensible era una piel que reaccionaba a los productos cosméticos, otros que se trataba de una piel que reaccionaba a diversos factores exteriores, no forzosamente ligados a los productos cosméticos.

20 Se realizaron determinadas pruebas para intentar un acercamiento a las pieles sensibles, por ejemplo pruebas con ácido láctico y DMSO, que son conocidos por ser sustancias irritantes: véanse, por ejemplo, el artículo de K. Lam-mintausta y col., *Dermatosis*, 1988, 36, páginas 45-49; y el artículo de T. Agner y J. Serup, *Clinical and Experimental Dermatology*, 1989, 14, páginas 214-217. Pero estas pruebas no permitían caracterizar las pieles sensibles.

Por otra parte, se asimilaban las pieles sensibles a pieles alérgicas.

25 Debido a que se conocían mal las características de las pieles sensibles, era hasta ahora muy difícil tratarlas, y se trataban indirectamente, por ejemplo limitando en la composición cosmética el empleo de productos con carácter irritante, tales como los tensioactivos, los conservantes y los perfumes, así como ciertos principios activos.

30 La solicitante realizó numerosas pruebas clínicas y supo determinar los síntomas ligados a las pieles sensibles. Estos síntomas son, en particular, signos subjetivos, que son esencialmente sensaciones disestésicas. Se entiende por "sensaciones disestésicas" sensaciones más o menos dolorosas que se sienten en una zona cutánea, como picazón, hormigueo, comezón o prurito, quemazón, acaloramiento, incomodidad, tirantez, etc.

35 Por otra parte, la solicitante pudo mostrar que una piel sensible no era una piel alérgica. La característica esencial de la piel sensible es según la solicitante un mecanismo de respuesta a factores exteriores, que puede afectar a cualquier individuo, incluso si se dice que los individuos tienen piel sensible y reaccionan más deprisa que los otros. Este mecanismo no es inmunológico.

40 La solicitante ha visto ahora que las pieles sensibles podían dividirse en dos grandes formas clínicas, las pieles irritables y/o reactivas y las pieles intolerantes.

45 Una piel irritable y/o reactiva es una piel que reacciona con prurito, es decir, con comezones o con picazones, a diferentes factores, tales como el ambiente, las emociones, los alimentos, el viento, los frotos, la navaja de afeitar, el jabón, los tensioactivos, el agua dura con alta concentración calcárea, las variaciones de temperatura o la lana. En general, estos signos se asocian a una piel seca o a una piel que presenta un eritema.

Una piel intolerante es una piel que reacciona con sensaciones de acaloramiento, de tirantez, de hormigueo y/o de enrojecimiento a diferentes factores, tales como el ambiente, las emociones o los alimentos. En general, estos signos se asocian a una piel hiperseborreica o acneica y a un eritema.

50 Los cueros cabelludos "sensibles" tienen una semiología clínica más unívoca: las sensaciones de prurito y/o de picazón y/o de acaloramiento se desencadenan esencialmente por factores locales, tales como frotos, jabón, tensioactivos, agua dura de alta concentración calcárea, champúes o lociones y productos para dar forma permanente. Estas sensaciones se desencadenan también a veces por factores tales como el ambiente, las emociones y/o los alimentos. Frecuentemente, se asocian un eritema y una hiperseborrea del cuero cabelludo, así como un estado casposo, a los signos anteriores.

60 Por otra parte, en ciertas regiones anatómicas, como los grandes pliegues (regiones inguinales, genital, axilares, poplíteas, anal, submamarias, pliegues del codo) y los pies, la piel sensible se traduce en sensaciones pruriginosas y/o sensaciones disestésicas (acaloramiento, picazón), ligadas, en particular, al sudor, a los frotos, a la lana, a los tensioactivos, al agua dura de alta concentración calcárea y/o a las variaciones de temperatura.

65 Para determinar si una piel es sensible o no, la solicitante puso igualmente a punto una prueba. En efecto, tras haber efectuado un gran número de pruebas con el fin de definir una piel sensible, encontró sorprendentemente que existía un nexo entre las personas de piel sensible y las que reaccionaban a una aplicación tópica de capsaicina.

La prueba de la capsaicina consiste en aplicar sobre aproximadamente 4 cm² de piel 0,05 ml de una crema que contiene un 0,075% de capsaicina y en observar la aparición de signos subjetivos provocados por esta aplicación, tales como picazón, quemazón y prurito. En los sujetos de pieles sensibles, estos signos aparecen entre 3 y 20 minutos

ES 2 318 866 T3

después de la aplicación y van seguidos de la aparición de un eritema que comienza en la periferia de la zona de aplicación.

5 La capsaicina provoca especialmente una liberación de los neuropéptidos, y en particular de las taquikininas, que proceden de terminaciones nerviosas sensibles de la epidermis y de la dermis. La solicitante constató el esquema fisiopatológico común a todos los estados de las pieles sensibles estaba ligado a una gran aptitud para liberar taquikininas y más en particular sustancia P en la piel. Las manifestaciones disestésicas que se provocan por la liberación de neuropéptidos son llamadas “neurógenas”.

10 Esta sustancia P es un polipéptido elaborado y liberado por las terminaciones nerviosas sensitivas. Induce especialmente una desgranulación de las células cebadas que conlleva la liberación de serotonina, así como una cascada de sucesos bioquímicos que dan lugar a una reacción inflamatoria. La liberación de sustancia P por las terminaciones nerviosas sensitivas puede ser controlada por diferentes agentes, entre ellos los aminoácidos excitatorios, tales como el glutamato y/o el aspartato.

15 La solicitante ha descubierto ahora que fibras nerviosas presentes en la epidermis y/o la dermis contenían aminoácidos excitatorios, tales como el aspartato y/o el glutamato. Así, la liberación del aspartato y/o del glutamato en la proximidad de las terminaciones nerviosas sensitivas activa la liberación de sustancia P y, por lo tanto, la cascada de sucesos bioquímicos que genera reacciones nociceptivas más o menos importantes. Por consiguiente, la utilización de un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio permite obtener un efecto preventivo y/o curativo sobre las pieles sensibles. En efecto, disminuyendo la liberación y/o la síntesis de aminoácidos excitatorios por las fibras nerviosas y/o disminuyendo su fijación, disminuye la actividad observada de estos aminoácidos excitatorios.

20 Para tratar las pieles sensibles, la solicitante ha contemplado, pues, la utilización de un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio. Constató, en efecto, de manera sorprendente que la incorporación de un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio en una composición dermatológica permitía evitar la irritación y/o las sensaciones disestésicas y/o los pruritos de la piel.

30 La presente solicitud describe la utilización de al menos un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio para la preparación de una composición dermatológica que contiene un medio fisiológicamente aceptable para tratar las pieles sensibles.

35 La presente invención tiene por objeto la utilización de al menos un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio para la preparación de una composición dermatológica que contiene un medio fisiológicamente aceptable para prevenir y/o luchar contra las irritaciones cutáneas y/o los herpes y/o los eritemas y/o los pruritos de la piel.

40 De forma más general, la invención se relaciona con la utilización de al menos un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio para la preparación de una composición dermatológica que contiene un medio fisiológicamente aceptable para tratar los síntomas cutáneos ligados a la liberación y/o la síntesis y/o la fijación de al menos un aminoácido excitatorio.

45 Un medio fisiológicamente aceptable es un medio cosmética o dermatológicamente aceptable, que es compatible con la piel, las mucosas, las uñas y el cabello. En particular, la composición que contiene un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio puede ser aplicada sobre la cara, el cuello, el cabello y las uñas, o cualquier otra zona cutánea del cuerpo.

50 Para que una sustancia sea reconocida como un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio, debe inhibir la liberación y/o la fijación y/o la síntesis de al menos un aminoácido excitatorio, tal como el glutamato y/o el aspartato, a nivel de la dermis y/o de la epidermis. Debe, más en particular, responder al menos a una de las características siguientes:

55 - tener una actividad farmacológica, medida especialmente por electroforesis, de tipo antagonista de receptores en uno de los receptores de al menos un aminoácido excitatorio, tal como especialmente los receptores de tipo AMPA (propionato de L- α -amino-3-hidroxi-5-metil-4-isoxazol), de tipo NMDA (N-metil-D-aspartato) o de tipo kainato (la farmacología y la localización permiten diferenciar estos receptores, que están los tres copulados a un canal iónico);

- disminuir la extravasación plasmática, medida especialmente por el método del Azul de Evans, observada tras estimulación antidrómica del nervio safeno o tras estimulación con capsaicina;

60 - disminuir la citotoxicidad celular inducida sobre líneas celulares neuronales tras incubación con concentraciones elevadas de glutamato.

65 Los signos clínicos de la piel sensible son esencialmente subjetivos, a saber: picazón, hormigueo, picor o prurito, tirantez o acaloramiento; se acompañan a veces de eritemas. Estos signos se deben a factores exteriores inespecíficos.

Según la invención, se pueden utilizar uno o más inhibidores de al menos un aminoácido excitatorio.

ES 2 318 866 T3

Se pueden utilizar así como inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio moléculas de síntesis química y también extractos de origen animal, vegetal o bacteriano.

Entre los inhibidores de al menos un aminoácido excitatorio, se pueden citar especialmente la ketamina, la me-
5 mantina, el ácido (\pm)-2-amino-3-fosfonopropiónico, el ácido (\pm)-2-amino-4-fosfonobutírico, el ácido (\pm)-2-amino-5-
fosfonopentanoico, el ácido D-8-glutamil-aminometanosulfónico, el clorhidrato de 1,2,3,6,7,8-hexahidro-3-(hidroxi-
imino)-N,N,7-trimetil-2-oxobenzo[2,1-b:-3,4-c']dipirrol-5-sulfonamida (llamado más comúnmente: NS 257, HCl), la
ciclotiazida, el aniracetam y el riluzol.

10 Preferiblemente, el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio es seleccionado entre el aniracetam y la
ketamina.

La cantidad de inhibidor de aminoácido excitatorio en una composición varía en gran medida, especialmente en
15 función del poder inhibidor del compuesto y del efecto buscado.

Para dar un orden de magnitud, en la composición según la invención el inhibidor de al menos un aminoácido
excitatorio es utilizado preferiblemente en una cantidad que va del 0,000001 al 5% del peso total de la composición, y
en particular en una cantidad que va del 0,0001 al 1%.

20 La composición según la invención puede presentarse en cualquier forma galénica normalmente utilizada para una
aplicación tópica sobre la piel, especialmente en forma de solución o dispersión del tipo loción o suero, de emulsión de
consistencia líquida o semilíquida del tipo leche, obtenida por dispersión de una fase grasa en una fase acuosa (Ac/Ag)
o a la inversa (Ag/Ac), o de suspensión o emulsión de consistencia blanda del tipo crema o gel acuoso o anhidro, de
25 microgránulos, de nanopartículas, de microemulsión, de nanocápsulas o de dispersiones de vesículas de tipo iónico
y/o no iónico. estas composiciones son preparadas según los métodos habituales.

También puede ser utilizada para el cabello en forma de solución acuosa, alcohólica o hidroalcohólica, de crema,
de gel, de emulsión o de espuma o también en forma de composiciones para aerosol que contienen un agente propulsor
bajo presión.

30 Las cantidades de los diferentes constituyentes de la composición según la invención son las clásicamente utilizadas
en los ámbitos considerados.

La composición de la invención constituye especialmente una crema de limpieza, de protección, de tratamiento
35 o de cuidado para la cara, para las manos, para los pies, para los grandes pliegues anatómicos o para el cuerpo (por
ejemplo, crema de día, crema de noche, crema desmaquilladora, crema de fondo de color, crema antisolar), un fondo
de color fluido, una leche desmaquilladora, una leche corporal de protección o de cuidado, una leche antisolar, una
loción, un gel o una espuma para el cuidado de la piel, como una loción de limpieza, una loción antisolar, una loción de
40 bronceado artificial, una composición para el baño, una composición desodorante que contiene un agente bactericida,
un gel o loción para después del afeitado, una crema depiladora, una composición contra las picaduras de insectos o
una composición antidolorosa.

La composición según la invención puede igualmente consistir en una preparación sólida que constituya un jabón
o un pan de limpieza.

45 El inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio puede ser también incorporado en cualquier tipo de composi-
ción para cuidados capilares, y especialmente en un champú, una loción de ondulación, una loción de tratamiento, una
crema o gel para el peinado, una composición de tinción (especialmente tinción de oxidación) eventualmente en forma
de champú colorante, una loción reestructurante para el cabello, una composición de permanente (especialmente una
50 composición para el primer tiempo de una permanente), una loción o gel anticaída, etc.

La composición de la invención puede también ser para uso bucodental, por ejemplo en forma de pasta dentífrica.
En este caso, la composición puede contener adyuvantes y aditivos habituales para una composición de uso bucal y
especialmente agentes tensioactivos, espesantes o humectantes, agentes pulimentadores tales como la sílice, o diversos
55 ingredientes activos, como los fluoruros, en particular el fluoruro de sodio, y eventualmente agentes edulcorantes, como
el sacarinato de sodio.

Cuando la composición de la invención es una emulsión, la proporción de la fase grasa puede ir del 5% al 80%
en peso y preferiblemente del 5% al 50% en peso con respecto al peso total de la composición. Los aceites, los
60 emulsores y los coemulsores empleados entonces son seleccionados entre los clásicamente utilizados en el campo
considerado. El emulsor y el coemulsor están presentes en la composición en una proporción del 0,3% al 30% en peso
y preferiblemente del 0,5 al 30% en peso con respecto al peso total de la composición. La emulsión puede además
contener vesículas lipídicas.

65 De forma conocida, la composición de la invención puede también contener adyuvantes habituales en el campo
considerado, tales como los gelificantes hidrófilos o lipófilos, los principios activos hidrófilos o lipófilos, los conser-
vantes, los antioxidantes, los solventes, los perfumes, las cargas, los filtros y las materias colorantes. Las cantidades
de estos diferentes adyuvantes son las clásicamente utilizadas en el campo considerado, y por ejemplo del 0,01% al

ES 2 318 866 T3

10% del peso total de la composición. Estos adyuvantes, según su naturaleza, pueden ser introducidos en la fase grasa, en la fase acuosa y/o en las esférulas lipídicas.

5 Como aceites utilizables en la invención, se pueden citar los aceites minerales (aceite de vaselina), los aceites vegetales (fracción líquida de la manteca de karité, aceite de girasol), los aceites animales (perhidroescualeno), los aceites de síntesis (aceite de Purcellin), los aceites siliconados (ciclometicona) y los aceites fluorados (perfluoropolíéters). Se pueden añadir a estos aceites alcoholes grasos y ácidos grasos (ácido esteárico).

10 Como emulsores utilizables en la invención, se pueden citar, por ejemplo, el estearato de glicerol, el polisorbato 60 y la mezcla de PEG-6/PEG-32/estearato de glicol vendida bajo la denominación de Tefose® 63 por la sociedad Gattefosse.

15 Como solventes utilizables en la invención, se pueden citar los alcoholes inferiores, especialmente el etanol y el isopropanol.

20 Como gelificantes hidrófilos, se pueden citar los polímeros carboxivinílicos (carbómero), 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 y la sílice hidrofóbica.

25 Como principios activos hidrófilos, se pueden utilizar las proteínas o los hidrolizados de proteína, los aminoácidos, los polioles, la urea, la alantoína, los azúcares y los derivados de azúcar, las vitaminas y los hidroxiácidos.

30 Como principios activos lipófilos, se pueden utilizar el retinol (vitamina A) y sus derivados, el tocoferol (vitamina E) y sus derivados, los ácidos grasos esenciales, las ceramidas, los aceites esenciales y el ácido salicílico y sus derivados.

35 Se pueden asociar, entre otros, el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio a agentes activos destinados especialmente a la prevención y/o al tratamiento de las afecciones cutáneas.

40 Entre estos agentes activos, se pueden citar a modo de ejemplo:

45 - los agentes que modulan la diferenciación y/o la proliferación y/o la pigmentación 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, el ácido cójico o la hidroquinona;

50 - los antibacterianos, tales como el fosfato de clindamicina, la eritromicina o los antibióticos de la clase de las tetraciclinas;

55 - los antiparasitarios, en particular el metronidazol, el crotamitón o los piretrinoides;

60 - los antifúngicos, en particular los compuestos pertenecientes a la clase de los imidazoles, tales como el econazol, el ketoconazol o el miconazol o sus sales, los compuestos poliénicos, tales como la anfotericina B, y los compuestos de la familia de las alilaminas, tales como la terbinafina;

65 - los agentes antiinflamatorios esteroideos, tales como la hidrocortisona, el valerato de betametasona o el propionato de clobetasol, o los agentes antiinflamatorios no esteroideos, tales como el ibuprofeno y sus sales, el diclofenaco y sus sales, el ácido acetilsalicílico, el acetaminofeno o el ácido glicirretínico;

70 - los agentes anestésicos, tales como el clorhidrato de lidocaína y sus derivados;

75 - los agentes antipruriginosos, como la tenaldina o la trimeprazina;

80 - los agentes antivíricos, tales como el aciclovir;

85 - los agentes queratolíticos, tales como los ácidos alfa- y beta-hidroxicarboxílicos o beta-cetocarboxílicos, sus sales, amidas o ésteres, y más particularmente los hidroxiácidos, tales como el ácido glicólico, el ácido láctico, el ácido salicílico, el ácido cítrico y en general los ácidos de frutos, y los derivados alquilados C₂-C₂₂ del ácido salicílico, como el ácido n-octanoil-5-salicílico;

90 - los agentes antirradicales libres, tales como el alfa-tocoferol o sus ésteres, las superóxido dismutasas, ciertos quelantes de metales o el ácido ascórbico y sus ésteres;

95 - los antiseborreicos, tales como la progesterona;

100 - los anticaspa, como el octopirox o la piritiona de zinc;

105 - los antiacneicos, como el ácido retinoico o el peróxido de benzoílo.

ES 2 318 866 T3

La presente solicitud describe un procedimiento de tratamiento dermatológico, caracterizado por aplicar sobre la piel, el cabello y/o las mucosas, más particularmente de seres humanos, una composición tal como se ha descrito anteriormente que contiene al menos un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio en un medio dermatológicamente aceptable.

5 Más particularmente, la composición es aplicada sobre las pieles sensibles y/o los cueros cabelludos sensibles.

Se ha visto anteriormente en el texto lo que es una piel irritable. La irritación cutánea puede tener múltiples causas. Pueden ser causas intrínsecas, ligadas al desajuste de los mecanismos fisiológicos que conducen a una piel normal. 10 Pero pueden ser también causas extrínsecas, como compuestos irritantes que entrarían en contacto con la piel.

Así, el tratamiento está destinado a disminuir la irritación cutánea.

Este procedimiento de tratamiento puede ser llevado a la práctica especialmente aplicando la composición antes definida, según la técnica de utilización habitual de este tipo de composición. Por ejemplo: aplicación sobre la piel o 15 las mucosas de crema, de gel, de suero, de loción, de leche desmaquilladora o de composición antisolar, o sobre los cabellos secos o húmedos de champúes o de productos para después del champú, o también aplicación sobre las encías de dentífrico.

20 También, de forma ventajosa, el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio se asocia a principios activos que tienen un efecto secundario irritante, utilizados habitualmente en los campos considerados. La presencia de este inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio en una composición de la invención que contiene un principio activo con efecto irritante permite atenuar en gran medida, incluso suprimir, este efecto irritante.

25 También, la invención tiene aún por objeto una composición cosmética o dermatológica que contiene un medio fisiológicamente aceptable y al menos un principio activo con efecto secundario irritante, caracterizada por contener, además, al menos un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio.

30 En particular, los principios activos con efecto secundario irritante son seleccionados entre los α -hidroxiácidos (ácido de frutos), los β -hidroxiácidos, como el ácido salicílico y sus derivados alquilados, los α -cetoácidos, los β -cetoácidos, los retinoides, las antralinas, los antranoides, los peróxidos, las sales de litio, los antimetabolitos y la vitamina D y sus derivados.

35 Los ejemplos siguientes son dados a título ilustrativo. En estos ejemplos, las proporciones son dadas en porcentajes en peso.

Ejemplo 1

Loción desmaquilladora para la cara

40	Aniracetam	0,0001	
	Antioxidante	0,05	
45	Isopropanol	40,00	
	Conservante	0,30	
	Agua	csp	100%

50 Ejemplo 2

Gel para el cuidado de la cara

55	Aniracetam	0,05	
	Hidroxipropilcelulosa (Klucel H, vendida por la sociedad Hercules)	1,00	
60	Antioxidante	0,05	
	Isopropanol	30,00	
	Conservante	0,30	
65	Agua	csp	100%

ES 2 318 866 T3

Ejemplo 3

Crema de cuidado dermatológico de la cara (emulsión de aceite en agua)

5	Ketamina		0,002
	Estearato de glicerol		2,00
10	Polisorbato 60 (Tween 60, vendido por la sociedad ICI)		1,00
	Ácido esteárico		1,40
15	Trietanolamina		0,70
	Carbómero		0,40
	Fracción líquida de la manteca de karité		12,00
20	Perhidroescualeno		12,00
	Antioxidante		0,05
	Perfume		0,5
25	Conservante		0,30
	Agua	csp	100%

30

Ejemplo 4

Crema de cuidado antiarrugas para la cara (emulsión de aceite en agua)

35	Aniracetam		0,15
	Estearato de glicerol		2,00
40	Polisorbato 60 (Tween 60, vendido por la sociedad ICI)		1,00
	Ácido esteárico		1,40
45	Ácido n-octanoil-5-salicílico		0,50
	Trietanolamina		0,70
	Carbómero		0,40
50	Fracción líquida de la manteca de karité		12,00
	Perhidroescualeno		12,00
55	Antioxidante		0,05
	Perfume		0,5
	Conservante		0,30
60	Agua	csp	100%

65

ES 2 318 866 T3

Ejemplo 5

Champú

5	Aniracetam		0,0001
10	Lauril éter sulfato de sodio y magnesio con 4 moles de óxido de etileno, vendido bajo la denominación de TEXAPON ASV por HENKEL (tensioactivo aniónico)		6,5 g
15	Hidroxipropilcelulosa (Klucel H, vendida por la sociedad Hercules)		1,00
20	Perfume		0,50
	Conservante		0,30
	Agua	csp	100%

25

Ejemplo 6

Gel emulsionado de cuidado contra las picaduras de insectos (emulsión de aceite en agua)

30	Memantina		0,01
35	Aceite de Purcellin (vendido por la Sociedad Dragocco)		7,00
40	PEG-6/PEG-32/estearato de glicol (Tefose ^R 63 de Gattefosse)		0,30
	Sumatriptán		0,02
	Conservante		0,30
45	Perfume		0,40
	Carbómero		0,60
	Crotamitón		5,00
50	Ácido glicirretínico		2,00
	Alcohol etílico		5,00
	Trietanolamina		0,20
55	Agua	csp	100%

60

65

ES 2 318 866 T3

Ejemplo 7

Crema de cuidado dermatológico de la rosácea para la cara (emulsión de aceite en agua)

5	Ketamina	0,025
	Estearato de glicerol	2,00
10	Polisorbato 60 (Tween 60, vendido por la sociedad ICI)	1,00
	Ácido esteárico	1,40
15	Metronidazol	1,00
	Trietanolamina	0,70
	Carbómero	0,40
20	Fracción líquida de la manteca de karité	12,00
	Aceite de vaselina	12,00
25	Antioxidante	0,05
	Perfume	0,5
	Conservante	0,30
30	Agua	csp
		100%

Ejemplo 8

Crema de cuidado de las pieles sensibles contra el eritema solar (emulsión de aceite en agua)

	Aniracetam	0,025
40	Estearato de glicerol	2,00
	Polisorbato 60 (Tween 60, vendido por la sociedad ICI)	1,00
45	Ácido esteárico	1,40
	Ácido glicirretínico	2,00
	Trietanolamina	0,70
50	Carbómero	0,40
	Fracción líquida de la manteca de karité	12,00
	Aceite de girasol	10,00
55	Antioxidante	0,05
	Perfume	0,5
60	Conservante	0,30
	Agua	csp
		100%

65

REIVINDICACIONES

5 1. Utilización de al menos un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio para la preparación de una composición dermatológica que contiene un medio fisiológicamente aceptable, destinada a prevenir y/o luchar contra las irritaciones cutáneas y/o los herpes y/o los eritemas y/o los pruritos de la piel.

10 2. Utilización según la reivindicación anterior, **caracterizada** por seleccionar un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio entre la ketamina, la memantina, el ácido (\pm)-2-amino-3-fosfonopropiónico, el ácido (\pm)-2-amino-4-fosfonobutírico, el ácido (\pm)-2-amino-5-fosfonopentanoico, el ácido D-8-glutamilaminometano-sulfónico, el clorhidrato de 1,2,3,6,7,8-hexahidro-3-(hidroxiimino)-N,N,7-trimetil-2-oxobenzo[2,1-b:3,4-c']dipirrol-5-sulfonamida (llamado más comúnmente: NS 257, HCl), la ciclotiazida, el aniracetam y el riluzol.

15 3. Utilización según la reivindicación 2, **caracterizada** por seleccionar el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio entre el aniracetam y la ketamina.

4. Utilización según una de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por utilizar el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio en una cantidad que va del 0,000001 al 5% en peso con respecto al peso total de la composición.

20 5. Utilización según una de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por utilizar el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio en una cantidad que va del 0,0001 al 1% en peso con respecto al peso total de la composición.

25 6. Utilización según una de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por ser el medio una solución acuosa o hidroalcohólica, una emulsión de agua-en-aceite, una emulsión de aceite-en-agua, una microemulsión, un gel acuoso, un gel anhidro, un suero o una dispersión de vesículas.

30 7. Utilización según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por contener la composición al menos un agente seleccionado entre los agentes antibacterianos, antiparasitarios, antifúngicos, antiinflamatorios, antipruriginosos, anestésicos, antivíricos, queratolíticos, antirradicales libres, antiseborreicos, anticasca y antiacneicos y/o los agentes moduladores de la diferenciación y/o la proliferación y/o la pigmentación cutánea.

8. Composición cosmética o dermatológica que contiene un medio fisiológicamente aceptable y al menos un principio activo con efecto secundario irritante, **caracterizada** por contener además al menos un inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio.

35 9. Composición según la reivindicación 8, **caracterizada** por seleccionar el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio entre la ketamina, la memantina, el ácido (\pm)-2-amino-3-fosfonopropiónico, el ácido (\pm)-2-amino-4-fosfonobutírico, el ácido (\pm)-2-amino-5-fosfonopentanoico, el ácido D-8-glutamilaminometanosulfónico, el clorhidrato de 1,2,3,6,7,8-hexahidro-3-(hidroxiimino)-N,N,7-trimetil-2-oxobenzo[2,1-b:3,4-c']dipirrol-5-sulfonamida (llamado más comúnmente: NS 257, HCl), la ciclotiazida, el aniracetam y el riluzol.

40 10. Composición según una de las reivindicaciones 8 ó 9, **caracterizada** por utilizar el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio en una cantidad que va del 0,000001 al 5% del peso total de la composición.

45 11. Composición según una de las reivindicaciones 8 a 10, **caracterizada** por utilizar el inhibidor de al menos un aminoácido excitatorio en una cantidad que va del 0,0001 al 1% del peso total de la composición.

50 12. Composición según una de las reivindicaciones 8 a 11, **caracterizada** por seleccionar el principio activo con efecto secundario irritante entre los α -hidroxiácidos, los β -hidroxiácidos, los α -cetoácidos, los β -cetoácidos, los retinoides, los antralinas, los antranoïdes, los peróxidos, las sales de litio, los antimetabolitos y la vitamina D y sus derivados.

55 13. Composición según una de las reivindicaciones 8 a 12, **caracterizada** por contener además al menos un agente seleccionado entre los agentes antibacterianos, antiparasitarios, antifúngicos, antiinflamatorios, antipruriginosos, anestésicos, antivíricos, queratolíticos, antirradicales libres, antiseborreicos, anticasca, antiacneicos y/o los agentes moduladores de la diferenciación y/o la proliferación y/o la pigmentación cutánea.

60

65