



República Federativa do Brasil
Ministério da Economia
Instituto Nacional da Propriedade Industrial

(11) PI 0607967-9 B1



(22) Data do Depósito: 27/02/2006

(45) Data de Concessão: 19/07/2022

(54) Título: USO DE VISNADINA

(51) Int.Cl.: A61K 8/49; A61Q 5/00.

(30) Prioridade Unionista: 12/03/2005 EP 05251511.1.

(73) Titular(es): UNILEVER IP HOLDINGS B.V..

(72) Inventor(es): RANJIT BHOGAL; JASVEEN CHUGH; HELEN MELDRUM.

(86) Pedido PCT: PCT EP2006001824 de 27/02/2006

(87) Publicação PCT: WO 2006/097192 de 21/09/2006

(85) Data do Início da Fase Nacional: 11/09/2007

(57) Resumo: COMPOSIÇÕES PARA O CUIDADO DO CABELO E/OU DO COURO CABELUDO, MÉTODO PARA TRATAR E/OU PREVENIR AS AFECÇÕES INFLAMATÓRIAS DA PELE, USO DA VISNADINA E USO DE UMA COMPOSIÇÃO. A presente invenção propõe uma composição para o cuidado do cabelo e/ou do couro cabeludo, que compreende um tensoativo aniônico com propriedades de limpeza em uma quantidade de 5 a 30% em peso e visnadina. A presente invenção ainda propõe uma composição para o cuidado do cabelo e/ou do couro cabeludo, que compreende um tensoativo condicionador catiônico em uma quantidade de 0,01 a 10% em peso e visnadina. A presente invenção também refere-se a um método para tratar e/ou prevenir as afecções inflamatórias da pele tais como o prurido e a descamação do couro cabeludo associados com a caspa, em que o referido método compreende a aplicação tópica de uma composição de acordo com a presente invenção no cabelo e/ou na pele, de preferência no cabelo e/ou no couro cabeludo.

“USO DE VISNADINA”

CAMPO DA INVENÇÃO

[001] A presente invenção trata de composições para o cuidado dos cabelos e/ou do couro cabeludo que incorporam visnadina. A presente invenção também trata do uso da visnadina para o tratamento e/ou a prevenção de afecções inflamatórias da pele tais como o prurido e a descamação do couro cabeludo associados com a caspa.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

[002] Existe uma convicção generalizada de que as leveduras de *Malassezia*, tais como *Malassezia furfur*, são a principal causa da caspa. Entretanto, não está claro porque certas pessoas sofrem dessa afecção ao passo que outras não. O que se sabe é que o aumento do nível de *Malassezia* no couro cabeludo não leva automaticamente à caspa. Isso sugere que *Malassezia* é necessária, porém não suficiente para causar essa afecção.

[003] A principal, se não a única estratégia de intervenção utilizada atualmente no mercado para o tratamento da caspa é a aplicação tópica de antifúngicos tais como zinco piritiona (ZnPTO), octopirox e cetoconazol que são normalmente aplicados a partir de um xampu. Esses agentes antifúngicos removem (ou pelo menos reduzem o nível de) *Malassezia* do couro cabeludo, e conferem um tratamento eficaz para a caspa.

[004] Embora clinicamente provado que são eficazes no tratamento dos sintomas clínicos da caspa durante um período de duas a quatro semanas, persiste a necessidade de tratar os sintomas principais da caspa de modo mais eficaz e rápido. Os principais sintomas da caspa são escamas visíveis de pele no cabelo e nos ombros e prurido do couro cabeludo. O prurido do couro cabeludo é percebido como um problema particular em certas partes do mundo, por exemplo, ele é o principal sintoma da caspa na China, no Sudeste Asiático e na Índia.

[005] Portanto, além de tratar os sinais clínicos da caspa, persiste a necessidade de conferir um alívio rápido ao prurido do couro cabeludo para os indivíduos que sofrem de caspa.

[006] O documento WO 04/00085 descreve como os ativadores dos receptores canabinóides (CBR) podem ser úteis nas composições de tratamento capilar para o tratamento e/ou a prevenção de sintomas da caspa tais como o prurido e a descamação do couro cabeludo.

[007] Os presentes inventores revelam que a visnadina é capaz de atuar como ativadores de CBR, e podem, portanto, ser utilizados para o tratamento e/ou a prevenção de sintomas da caspa tais como prurido e descamação do couro cabeludo.

[008] Não existe qualquer sugestão no documento WO04/00085 de que a visnadina possa ter essa atividade. Ela é significativamente mais hidrofílica (com um $\text{ClogP} < 4,5$) que os compostos que foram geralmente descritos na literatura como capazes de ativação dos CBR.

[009] A visnadina foi descrita no documento EP 0 693 278 como uma substância com atividade vasocinética que pode ser utilizada juntamente com agentes antiandrogênicos e anti-seborréicos em uma loção ou gel hidroalcoólicos para evitar a queda de cabelos.

DESCRIÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

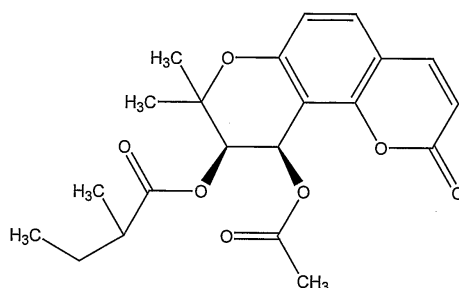
[010] A presente invenção propõe uma composição para o cuidado dos cabelos e/ou do couro cabeludo que é uma composição de xampu, que compreende um tensoativo aniônico com propriedades de limpeza em uma quantidade de 5 a 30% em peso e visnadina.

[011] A presente invenção propõe uma composição para o cuidado do cabelo e/ou do couro cabeludo que é uma composição de condicionador, que compreende um tensoativo condicionador catiônico em uma quantidade de 0,01 a 10% em peso e visnadina.

[012] A presente invenção também propõe um método para tratar e/ou prevenir as afecções inflamatórias da pele, tais como o prurido e a descamação do couro cabeludo associados com a caspa, método esse que compreende a aplicação tópica de uma composição de acordo com a presente invenção nos cabelos e/ou na pele, de preferência nos cabelos e/ou no couro cabeludo.

DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO E REALIZAÇÕES PREFERIDAS

A visnadina possui a fórmula estrutural (I):



(I)

[013] Um processo para a extração e a purificação da visnadina a partir de umbelas da planta *Amni visnaga* está descrito no documento GB 867.290.

[014] A quantidade de visnadina nas composições da presente invenção é escolhida de preferência na faixa de 0,05 a 20%, de preferência de 0,1 a 10%, mais preferencialmente ainda de 0,25 a 5% em peso em relação ao peso total.

AGENTE ANTICASPA

[015] De preferência, as composições de acordo com a presente invenção compreendem de 0,01% a 30% em peso, de preferência 0,1% a 10%, mais preferencialmente 0,5 a 2% em peso de um agente anticaspa. Por “agente anticaspa” entende-se um composto diferente da visnadina que é ativo contra a caspa e que são tipicamente agentes antimicrobianos, de preferência agentes antifúngicos.

[016] Os compostos anticaspa apropriados são compostos escolhidos entre o zinco piritiona, o climbazol, o cetoconazol, o octopirox e suas misturas.

[017] O agente antifúngico preferido é o zinco piritiona (ZnPTO) que, devido a sua relativa insolubilidade em sistemas aquosos, é geralmente usada em composições para o tratamento do cabelo como uma dispersão de partículas. O zinco piritiona pode ser utilizado em qualquer forma de partículas incluindo, por exemplo, formas cristalinas tais como plaquetas e agulhas e partículas amorfas, de forma regular ou irregular. Se o zinco piritiona estiver presente na composição, utiliza-se de preferência um agente de suspensão para evitar ou inibir a decantação das partículas fora da composição. O diâmetro médio das partículas de zinco piritiona (isto é, sua dimensão máxima) varia tipicamente de aproximadamente 0,2 a aproximadamente 50 μm , de preferência de aproximadamente 0,4 a aproximadamente 10 μm , mais preferência ainda de 0,4 a 1 μm .

[018] Os agentes antifúngicos apresentam tipicamente uma concentração inibidora mínima de aproximadamente 50 mg/ml ou menos contra *Malassezia*.

[019] Se o agente antifúngico for solúvel em um sistema aquoso, ele pode estar presente em solução em uma composição usada na presente invenção.

FORMAS DOS PRODUTOS

[020] As composições para o cuidado do cabelo e/ou do couro cabeludo da presente invenção podem ser produtos com ou sem enxágüe. Os produtos com enxágüe se destinam a ser substancialmente enxaguados do cabelo e/ou do couro cabeludo do usuário com água após o uso. Os produtos sem enxágüe não se destinam a ser enxaguados do cabelo e/ou do couro cabeludo do usuário imediatamente após o uso (isto é, pelo menos nas primeiras 2 horas, de preferência pelo menos quatro horas, após a aplicação

da composição). Os produtos sem enxágüe compreendem, por exemplo, condicionadores sem enxágüe para os cabelos destinados a uma aplicação tópica sobre o cabelo e/ou o couro cabeludo. As composições com enxágüe compreendem os xampus e condicionadores com enxágüe para o cabelo, bem como condicionadores para o cabelo que se destinam a ser deixados nos cabelos e/ou no couro cabeludo por um período de até 2 horas (por exemplo, 5 minutos a 2 horas) antes do enxágüe.

COMPOSIÇÕES DE XAMPU

[021] As composições de xampu de acordo com a presente invenção compreendem um tensoativo aniônico com propriedades de limpeza em uma quantidade de 5 a 30% em peso.

TENSOATIVOS ANIÔNICOS COM PROPRIEDADES DE LIMPEZA

[022] Como tensoativos aniônicos com propriedade de limpeza apropriados pode-se citar os alquil sulfatos, alquil éter sulfatos, alcaril sulfonatos, alcanoil isetionatos, alquil succinatos, alquil sulfossuccinatos, N-alquil sarcosinatos, alquil fosfatos, alquil éter fosfatos, alquil éter carboxilatos, e alfa-olefina sulfonatos, em particular seus sais de sódio, magnésio, amônio e mono-, di- e trietanolamina. Os grupos alquila e acila contêm geralmente de 8 a 18 átomos de carbono e podem ser insaturados. Os alquil éter sulfatos, alquil éter fosfatos e alquil éter carboxilatos podem conter de 1 a 10 unidades de óxido de etileno ou óxido de propileno por molécula.

[023] Os tensoativos aniônicos com propriedades de limpeza típicos para uso nas composições de xampu da presente invenção compreendem oleil succinato de sódio, lauril sulfossuccinato de amônio, lauril sulfato de amônio, dodecilbenzeno sulfonato de sódio, dodecilbenzeno sulfonato de trietanolamina, cocoil isetionato de sódio, lauril isetionato de sódio e N-lauril sarcosinato de sódio. Os tensoativos aniônicos mais particularmente preferidos são lauril sulfato de sódio,

lauril éter sulfato de sódio (n) EO (em que n varia de 1 a 3), lauril sulfato de amônio e lauril éter sulfato de amônio (n) EO (em que n varia de 1 a 3).

[024] As misturas de qualquer um dos tensoativos aniônicos com propriedades de limpeza mencionados acima podem também ser apropriadas.

[025] A quantidade total de tensoativos aniônicos com propriedades de limpeza nas composições de xampu da presente invenção varia de preferência de 6 a 20, e mais preferencialmente ainda de 8 a 16% em peso da composição.

CO-TENSOATIVO

[026] As composições de xampu de acordo com a presente invenção podem eventualmente incluir co-tensoativos para ajudar a conferir propriedades estéticas, físicas ou de limpeza à composição.

[027] Como exemplo preferido, pode-se citar um tensoativo anfótero ou zwitteriônico, que pode ser incorporado em uma quantidade que varia de 0 a aproximadamente 8, de preferência de 1 a 4% em peso.

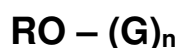
[028] Como exemplos de tensoativos anfóteros ou zwitteriônicos pode-se citar: óxidos de alquil amina, alquil betaínas, alquil amidopropil betaínas, alquil sulfobetaínas (sultaínas), alquil glicinatos, alquil carboxiglicinatos, alquil anfopropionatos, alquilanfoglicinatos, alquil amidopropil hidroxisultaínas, acil tauratos e acil glutamatos, em que os grupos alquila e acila possuem de 8 a 19 átomos de carbono. Os tensoativos anfóteros e zwitteriônicos típicos para uso nos xampus da presente invenção incluem óxido de lauril amina, cocodimetil sulfopropil betaína e de preferência lauril betaína, cocoamidopropil betaína e coconanfopropionato de sódio.

[029] Outro exemplo preferido é um tensoativo não-iônico, que pode ser incluído em uma quantidade que varia de 0 a 8, de preferência de 2 a 5% em peso da composição.

[030] A título de exemplo de tensoativos não-iônicos representativos que podem ser utilizados nas composições de xampu da presente invenção, pode-se citar os produtos da condensação de álcoois ou fenóis alifáticos primários ou secundários de cadeia linear ou ramificada (C₈-C₁₈) com óxidos de alquilenos, habitualmente óxido de etileno e que possui geralmente de 6 a 30 grupos óxido de etileno.

[031] Outros tensoativos não-iônicos representativos incluem as mono- ou di-alquil alcanolamidas. Pode-se citar como exemplos a coco mono- ou di-etanolamida e a coco mono-isopropanolamida.

[032] Outros tensoativos não-iônicos que podem ser incluídos na composição de xampu da presente invenção são os alquil poliglicosídeos (APGs). Tipicamente, o APG compreende um grupo alquila ligado (eventualmente por meio de um grupo de ligação) a um bloco de um ou mais grupos glicosila. Os APGs são definidos pela seguinte fórmula:



em que R é um grupo alquila de cadeia linear ou ramificada que pode ser saturado ou insaturado e G é um grupo sacarídeo.

[033] R pode representar uma cadeia alquila de comprimento médio de aproximadamente C₅ a aproximadamente C₂₀. De preferência, R representa uma cadeia alquila de comprimento médio de aproximadamente C₈ a aproximadamente C₁₂. Mais preferencialmente, o valor de R se situa entre aproximadamente 9,5 e aproximadamente 10,5. G pode ser escolhido entre os resíduos de monossacarídeos, e é de preferência um glicosídeo. G pode ser escolhido entre o grupo que compreende glicose, xilose, lactose, frutose, manose e seus derivados. De preferência, G é glicose.

[034] O grau de polimerização, n, pode apresentar um valor de aproximadamente 1 a aproximadamente 10 ou mais. De preferência, o valor de n se situa na faixa de aproximadamente 1,1 a aproximadamente 2. Mais

preferencialmente, o valor de n se situa na faixa de aproximadamente 1,3 a aproximadamente 1,5.

[035] Os alquil poliglicosídeos apropriados para uso na presente invenção estão comercialmente disponíveis e incluem, por exemplo, as substâncias identificadas como: Oramix NS10 da Seppic; Plantaren 1200 e Plantaren 2000 da Henkel.

[036] Outros tensoativos não-iônicos derivados do açúcar que podem ser utilizados na composição de xampu da presente invenção incluem as amidas de ácidos graxos N-alkil (C_{10} - C_{18}) poliidroxi (C_1 - C_6), tais como as N-metil glucamidas com C_{12} - C_{18} , tais como descritas por exemplo nos documentos WO 92 06154 e US 5 194 639, e as amidas de ácidos graxos N-alcóxi poliidroxi tais como a N-(3-metoxipropil) glucamida com C_{10} - C_{18} .

[037] Uma mistura preferida de tensoativos para limpeza é uma combinação de lauril éter sulfato de amônio, lauril sulfato de amônio, a cocamida PEG 5 e a cocamida MEA (denominações CTFA).

[038] A composição de xampu pode também incluir eventualmente um ou mais co-tensoativos catiônicos incluídos em uma quantidade que varia de 0,01 a 10, mais preferencialmente de 0,05 a 5, mais preferencialmente ainda de 0,05 a 2% em peso da composição. Os tensoativos catiônicos úteis estão descritos a seguir em relação às composições de condicionador.

[039] A quantidade total de tensoativo (incluindo qualquer co-tensoativo e/ou qualquer emulsificante) nas composições de xampu da presente invenção situa-se geralmente de 5 a 50, de preferência de 5 a 30, e mais preferencialmente ainda de 10 a 25% em peso da composição.

POLÍMERO CATIÔNICO

[040] Um polímero catiônico é um ingrediente preferido nas composições de xampu de acordo com a presente invenção para melhorar o desempenho do xampu em termos de condicionamento.

[041] O polímero catiônico pode ser um homopolímero ou ser formado a partir de dois ou mais tipos de monômeros. O peso molecular do polímero estará geralmente situado entre 5.000 e 10.000.000, tipicamente pelo menos 10.000 e mais preferencialmente ainda na faixa de 100 000 a aproximadamente 2.000.000. Os polímeros terão nitrogênios catiônicos que contêm grupos tais como amônio quaternário ou grupos amino protonados, ou sua mistura.

[042] O grupo que contém nitrogênio catiônico estará geralmente presente como substituinte em uma fração das unidades totais de monômero do polímero catiônico. Assim, quando o polímero não for um homopolímero, ele pode conter unidades espaçadoras de monômeros não-catiônicos. Esses polímeros estão descritos no Cosmetic Ingredient Directory da CTFA, 3a edição. A razão entre as unidades de monômeros catiônicos e não-catiônicos é escolhida para dar um polímero que possui uma densidade de carga catiônica na faixa requerida.

[043] Os polímeros condicionadores catiônicos apropriados incluem, por exemplo, copolímeros de monômeros vinílicos que possuem funcionalidades amina catiônica ou amônio quaternário com espaçadores de monômeros hidrossolúveis tais como (met)acrilamida, alquil e dialquil(met)acrilamidas, alquil (met)acrilato, vinil caprolactona e vinil pirrolidina. Os monômeros substituídos alquila e dialquila possuem de preferência grupos alquila com C₁-C₇, mais preferencialmente ainda grupos alquila com C₁-C₃. Outros espaçadores apropriados incluem os ésteres vinílicos, o álcool vinílico, o propileno glicol e o etileno glicol.

[044] As aminas catiônicas podem ser aminas primárias, secundárias ou terciárias, dependendo do caso particular e do pH da composição. Em geral, as aminas secundárias e terciárias, em particular terciárias, são preferidas.

[045] Os monômeros vinílicos substituídos com amina e as aminas podem ser polimerizados na forma amina e convertidos a seguir em amônio por quaternização.

[046] Os polímeros condicionadores catiônicos podem compreender misturas de unidades de monômeros derivadas de monômeros substituídos por grupos amônio quaternário e/ou amina e/ou monômeros espaçadoras compatíveis.

[047] Os polímeros condicionadores catiônicos incluem, por exemplo:

- copolímeros de 1-vinil-2-pirrolidina e sal de 1-vinil-3-metil-imidazólio (por exemplo, sal de cloreto), designado na indústria pela "Cosmetic, Toiletry, and Fragrance Association" (CTFA) como Poliquaternium-16. Essa substância é vendida comercialmente pela BASF Wyandotte Corp. (Parsipanny, N.J. USA) sob o nome de marca Luviquat (por exemplo, Luviquat FC 370);

- copolímeros de 1-vinil-2-pirrolidina e metacrilato de dimetilaminoetila, designados na indústria (CTFA) como Poliquaternium-11. Essa substância é vendida comercialmente pela Gaf Corporation (Wayne, NJ, USA) sob o nome de marca Gafquat (por exemplo, Gafquat 755N);

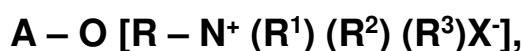
- polímeros catiônicos que contêm grupos dialil amônio quaternário que incluem, por exemplo, o homopolímero de cloreto de dimetildialilamônio e copolímeros de acrilamida e cloreto de dimetildialilamônio, designados na indústria (CTFA) como Poliquaternium 6 e Poliquaternium 7, respectivamente;

- sais de ácido mineral de amino-alquil ésteres de homo- e copolímero de ácidos carboxílicos insaturados que possuem de 3 a 5 átomos de carbono (tais como descritos na Patente U.S. 4.009.256);

- poli-acrilamidas catiônicas (tais como descritas em WO 95/22311).

[048] Outros polímeros condicionadores catiônicos que podem ser utilizados incluem os polímeros de polissacarídeos catiônicos, tais como os derivados catiônicos de celulose, os derivados catiônicos de gomas, e os derivados catiônicos de goma de guar. De modo apropriado, esses polímeros de sacarídeos catiônicos possuem uma densidade de carga na faixa de 0,1 a 4 meq/g.

[049] Os polímeros de polissacarídeos catiônicos apropriados para uso nas composições da presente invenção incluem os de fórmula:



em que: A é um grupo residual anidroglicose, tal como um resíduo anidroglicose de amido ou celulose. R é um grupo alquilenos, oxialquilenos, polioxialquilenos, ou hidroxialquilenos, ou uma combinação desses grupos. R¹, R² e R³ independentemente representam grupos alquila, arila, alquilarila, arilalquila, alcoxialquila, ou alcoxiarila, e cada grupo contém aproximadamente 18 átomos de carbono. O número total de átomos de carbono para cada fração catiônica (isto é, a soma dos átomos de carbono em R¹, R² e R³) é de preferência de aproximadamente 20 ou menos, e X é um contraíon aniônico.

[050] A celulose catiônica pode ser obtida junto a Amerchol Corp. (Edison, NJ, USA) em suas série de polímeros Polímero JR (marca comercial) e LR (marca comercial), como sais de hidroxietilcelulose que reagiram um epóxido substituído por um grupo trimetilamônio, designado na indústria (CTFA) como Poliquaternium 10. Outro tipo de celulose catiônica inclui os sais de amônio quaternário poliméricos de hidroxietil celulose que reagiram com grupo epóxido substituído por lauril dimetil amônio, designado na indústria (CTFA) como Poliquaternium 24. Essas substâncias podem ser obtidas junto a Amerchol Corp. (Edison, NJ, USA) sob a marca comercial Polymer LM-200.

[051] Outros polímeros de polissacarídeos catiônicos apropriados incluem éteres de celulose que contêm nitrogênio quaternário (por exemplo, tal como descreve a Patente US 3.962.418), e copolímeros de celulose e amido eterificados (por exemplo, tal como descreve a Patente US 3.958.581).

[052] Um tipo particularmente apropriado de polímero de polissacarídeos catiônicos que pode ser utilizado é um derivado de goma guar catiônica (comercialmente disponível junto a Rhône-Poulenc em suas séries da marca Jaguar).

[053] Pode-se citar como exemplos Jaguar C13S, que possui um nível baixo de substituição dos grupos catiônicos e viscosidade elevada, Jaguar C15, que possui um grau moderado de substituição e baixa viscosidade, Jaguar C17 (grau elevado de substituição, viscosidade elevada), Jaguar C16, que é um derivado de guar catiônico hidroxipropilado que contém um nível baixo de grupos substituintes bem como grupos amônio quaternário catiônicos, e Jaguar 162 com um guar de transparência elevada, viscosidade média com um grau baixo de substituição.

[054] De preferência, o polímero condicionador catiônico é escolhido entre a celulose catiônica e os derivados de guar catiônico. Polímeros catiônicos particularmente preferidos são Jaguar C13S, Jaguar C15, Jaguar C17 e Jaguar C16 e Jaguar C162.

[055] O polímero condicionador catiônico estará geralmente presente nas composições da presente invenção em níveis de 0,01 a 5, de preferência de 0,05 a 1, e mais preferencialmente ainda de 0,08 a 0,5% em peso da composição.

[056] Quando o polímero condicionador catiônico estiver presente em uma composição de xampu de acordo com a presente invenção, prefere-se que o copolímero esteja presente como partículas em emulsão com

um diâmetro médio de partículas ($D_{3,2}$, tal como medido por espalhamento da luz com um medidor de partículas Malvern) de 2 micrômetros ou menos.

COMPOSIÇÕES CONDICIONADORAS DO CABELO

[057] As composições condicionadoras do cabelo de acordo com a presente invenção compreendem um tensoativo condicionador catiônico em uma quantidade de 0,01 a 10% em peso.

TENSOATIVO CONDICIONADOR CATIÔNICO

[058] Pode-se citar como exemplos de tensoativos condicionadores catiônicos os que correspondem à fórmula geral:



Em que R_1 , R_2 , R_3 e R_4 são escolhidos independentemente entre (a) um grupo alifático com 1 a 22 átomos de carbono, ou (b) um grupo aromático alcóxi, polioxialquileno, alquilamido, hidroxialquila, arila ou alquilarila com até 22 átomos de carbono; e X é um ânion formador de sal tais como os que são escolhidos entre os radicais halogênio (por exemplo, cloreto, brometo), acetato, citrato, lactato, glicolato, fosfato, nitrato, sulfato, e alquilsulfato.

[059] Os grupos alifáticos podem conter, além dos átomos de carbono e de hidrogênio, ligações éter, e outros grupos tais como grupos amino. Os grupos alifáticos de cadeias mais longas, por exemplo, os que possuem aproximadamente 12 carbonos, ou mais, podem ser saturados ou insaturados.

[060] Os tensoativos condicionadores catiônicos preferidos são os compostos de monoalquil amônio quaternário nos quais o comprimento da cadeia alquila é C_{16} a C_{22} .

[061] Outros tensoativos condicionadores catiônicos preferidos são os chamados compostos de dialquil amônio quaternário nos quais R_1 e R_2 independentemente possuem comprimento de cadeia alquila de C_{16} a C_{22} , e R_3 e R_4 possuem 2 ou menos átomos de carbono.

[062] Entre os tensoativos catiônicos apropriados pode-se citar: cloreto de trimetilamônio, cloreto de beeniltrimetilamônio, cloreto de cetilpiridínio, cloreto de tetrametilamônio, cloreto de tetraetilamônio, cloreto de octiltrimetilamônio, cloreto de dodeciltrimetilamônio, cloreto de hexadeciltrimetilamônio, cloreto de octildimetilbenzilamônio, cloreto de decildimetilbenzilamônio, cloreto de estearildimetilbenzilamônio, cloreto de didodecildimetilamônio, cloreto de dioctadecildimetilamônio, cloreto de sebotrimetilamônio, cloreto de cocotrimetilamônio, cloreto de oleilamônio de PEG-2 e seus sais quando o cloreto for substituído por halogênio (por exemplo, brometo), acetato, citrato, lactato, glicolato, fosfato, nitrato, sulfato, ou alquilsulfato. Outros tensoativos catiônicos apropriados incluem as substâncias que possuem as denominações CTFA Quaternium-5, Quaternium-31 e Quaternium-18. As misturas de qualquer uma das substâncias citadas acima podem também ser apropriadas. Um tensoativo condicionador catiônico particularmente útil é o cloreto de cetiltrimetilamônio, disponível comercialmente, for exemplo como Genamin CTAC, junto a Hoechst Celanese.

[063] Os sais de aminas graxas primárias, secundárias, e terciárias são também tensoativos condicionadores apropriados. Os grupos alquila dessas aminas possuem de preferência de aproximadamente 12 a aproximadamente 22 átomos de carbono, e podem ser substituídas ou não substituídas.

[064] São particularmente são as amidas graxas terciárias substituídas por grupos amino. Essas aminas, úteis na presente invenção, incluem estearamidopropildietilamina, estearamidoetildietilamina, estearamidoetildimetilamina, palmitamidopropildimetilamina, palmitamidopropildietilamina, palmitamidoetildietilamina, palmitamidoetildimetilamina, beenamidopropildimetilamina,

beenamidopropildietilamina, beenamidoetildietilamina,
beenamidoetildimetilamina, araquidamidopropildimetilamino,
araquidamidopropildietilamina, araquidamidoetildietilamina,
araquidamidoetildimetilamina, dietilaminoetilestearamida.

[065] São também úteis dimetilestearamina, dimetilsojamina, sojamina, miristilamina, tridecilamina, etilestearilamina, N-propano sebo diamina, etoxilados (com 5 mols de óxido de etileno), estearilamina, diidroxietilestearilamina, e araquidil beenilamina. Essas aminas são usadas tipicamente em combinação com um ácido para fornecer espécies catiônicas.

[066] Como ácidos preferidos úteis na presente invenção pode-se citar ácido-L-glutâmico, ácido láctico, ácido hidrolórico, ácido málico, ácido succínico, ácido acético, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido cítrico, cloridrato-L-glutâmico, e suas misturas; mais preferencialmente o ácido L-glutâmico, o ácido láctico, o ácido cítrico. Entre os tensoativos de aminas catiônicas úteis na presente invenção pode-se citar as que estão descritas na Patente U.S. 4.275.055 conferida a Nachtigal. et al., publicada em 23 de junho de 1981.

[067] A razão molar de aminas protonáveis para H⁺ do ácido varia de preferência de aproximadamente 1:0,3 a 1:1,2, e mais preferencialmente de aproximadamente 1:0,5 a aproximadamente 1:1,1.

[068] Nos condicionadores da presente invenção, o nível de tensoativos condicionadores catiônicos varia de preferência de 0,05 a 5, e mais preferencialmente ainda de 0,1 a 2% em peso da composição total.

SUBSTÂNCIAS GRAXAS

[069] As composições condicionadoras do cabelo de acordo com a presente invenção compreendem, de preferência, também substâncias graxas.

[070] Por “substância graxa”, entende-se um álcool graxo, um álcool graxo alcoxilado, um ácido graxo ou suas misturas.

[071] Preferencialmente, a cadeia alquila da substância graxa é totalmente saturada.

[072] As substâncias graxas representativas compreendem de 8 a 22 átomos de carbono, mais preferencialmente 16 a 22. As substâncias graxas preferidas incluem álcool cetílico, álcool estearílico e suas misturas.

[073] Os álcoois graxos alcoxilados (ou seja, etoxilados ou propoxilados) que possuem de aproximadamente 12 a aproximadamente 18 átomos de carbono na cadeia alquila podem ser utilizados no lugar dos próprios álcoois graxos, ou em adição a eles. Como exemplos apropriados pode-se citar éter cetílico de etileno glicol, éter estearílico de polioxietileno (2), éter cetílico de polioxietileno (4), e suas misturas.

[074] O nível de substâncias graxas nos condicionadores da presente invenção situa-se de modo apropriado entre 0,01 e 15, de preferência de 0,1 a 10, e mais preferencialmente ainda de 0,1 a 5 por cento em peso da composição. A razão de peso do tensoativo catiônico para a substância graxa é modo apropriado de 10:1 a 1:10, de preferência de 4:1 a 1:8, otimamente de 1:1 a 1:7, por exemplo 1:3.

[075] As composições condicionadoras do cabelo da presente invenção podem também conter um polímero catiônico. Os polímeros catiônicos apropriados estão descritos acima em relação às composições de xampu.

OUTROS INGREDIENTES OPCIONAIS

[076] As composições da presente invenção podem conter qualquer outro ingrediente habitualmente utilizado nas formulações para o tratamento dos cabelos.

AGENTES DE SUSPENSÃO

[077] As composições para o tratamento do cabelo de acordo com a presente invenção tais como xampus compreendem de modo apropriado de 0,1 a 5% em peso de um agente de suspensão. Os agentes de suspensão apropriados são escolhidos entre os ácidos poliacrílicos, os polímeros reticulados de ácido acrílico, os copolímeros de ácido acrílico com um monômero hidrófobo, os copolímeros de ácido carboxílico que contêm monômeros e ésteres acrílicos, copolímeros reticulados de ácido acrílico e ésteres de acrilato, gomas de heteropolissacarídeos e derivados cristalinos de acila de cadeia longa. O derivado de acila de cadeia longa é vantajosamente selecionado entre o estearato de etileno glicol, as alcanolaminas de ácidos graxos que possuem de 16 a 22 átomos de carbono e suas misturas. O diestearato de etileno glicol e o distearato 3 de polietileno glicol são os derivados acila de cadeia longa preferidos. O ácido poliacrílico pode ser obtido comercialmente com o nome de Carbopol 420, Carbopol 488 ou Carbopol 493. Pode-se também utilizar polímeros de ácido acrílico reticulados com um agente polifuncional, que estão disponíveis comercialmente com o nome de Carbopol 910, Carbopol 934, Carbopol 940, Carbopol 941 e Carbopol 980. Como exemplo de um copolímero apropriado de um ácido carboxílico que contém um monômero e ésteres de ácido acrílico é o Carbopol 1342. Todas as substâncias conhecidas com o nome de Carbopol (marca comercial) podem ser obtidas junto a Goodrich.

[078] Os polímeros reticulados apropriados de ácido acrílico e ésteres de acrilato são Pemulen TR1 ou Pemulen TR2. Pode-se citar como goma de heteropolissacarídeo apropriada a goma xantana, por exemplo a que está disponível com o nome de Kelzan mu.

AGENTES CONDICIONADORES ADICIONAIS

[079] As composições para o tratamento do cabelo de acordo com a presente invenção contêm de modo apropriado agentes condicionadores

adicionais tais como agentes condicionadores siliconados e agentes condicionadores oleosos não-siliconados.

[080] Os agentes condicionadores siliconados apropriados incluem os polidiorganossiloxanos, em particular os polidimetilsiloxanos que possuem a designação CTFA de dimeticona. São também apropriados para uso nas composições da presente invenção (particularmente xampus e condicionadores) os polidimetil siloxanos que possuem grupos terminais hidroxila, que possuem a designação CTFA de dimeticonol. São também apropriadas para uso nas composições da presente invenção as gomas de silicone que possuem um ligeiro grau de reticulação, tais como descritas, por exemplo, no documento WO 96/31188. Essas substâncias podem conferir corpo, volume e facilidade para modelagem ao cabelo, bem como bom condicionamento para cabelos úmidos e secos. São também apropriados os silicones funcionais, particularmente os silicones amino-funcionais.

[081] Os agentes condicionadores oleosos não siliconados apropriados são escolhidos entre os óleos hidrocarbonados, os ésteres graxos e suas misturas.

[082] O agente condicionador adicional está presente de modo apropriado nas composições para xampu ou condicionador em um nível de aproximadamente 0,05 a 10, de preferência de 0,2 a 5, e mais preferencialmente ainda de aproximadamente 0,5 a 3% do peso total de agente condicionador adicional em relação ao peso total da composição.

[083] As composições para o tratamento dos cabelos de acordo com a presente invenção podem conter outros ingredientes opcionais para melhorar o desempenho e/ou a aceitabilidade do consumidor, tais como perfumes, corantes e pigmentos, agentes de ajuste do pH, agentes perolizantes ou opacificantes, modificadores de viscosidade, conservantes, e

nutrientes naturais do cabelo tais como ingredientes vegetais, extratos de frutas, derivados de açúcar e aminoácidos.

[084] A presente invenção será ilustrada mais detalhadamente em relação aos exemplos não limitativos apresentados a seguir, nos quais todas as porcentagens estão expressas em peso em relação ao peso total salvo especificação contrária.

EXEMPLOS

EXEMPLO 1

[085] A visnadina foi avaliada em relação à sua aptidão para ativar o Receptor Canabinóide 1 (CB1R) e o Receptor Canabinóide 2 (CB2R).

[086] Para a realização dos experimentos com CB1R foram utilizadas membranas de células HEK293 que sobre-expressam CB₁ recombinante humano, tal como descrito pelo fabricante (Perkin-Elmer), e [3H]CP-55,490 foi usado como radio-ligante.

[087] Para a realização dos experimentos com CB2R foram utilizadas membranas de células HEK293 que sobre-expressam CB₂ recombinante humano, tal como descrito pelo fabricante (Perkin-Elmer), e [3H]CP-55,495 foi usado como radioligante.

[088] Os dados dos compostos ativos estão expressos em K_i (mM) e são média ± SEM [erro padrão da média] de n=3 determinações.

[089] Os valores que estão indicados para cada um dos compostos é um valor EC₅₀. Isso é definido como a concentração molar de um agonista que produz 50% da resposta máxima possível para esse agonista. Os valores documentados estão expressos em unidades micromolares.

[090] A ausência de um valor na tabela indica que uma concentração maior que 25 micromolar foi necessária para uma ligação de 50% do ligante com o receptor.

[091] Além disso, os valores ClogP dos compostos foram calculados com Sybyl v6.8 (Tripos Inc., Missouri).

[092] Os resultados são apresentados na Tabela a seguir:

Exemplo	Composto	Atividade do CB1R	Atividade do CB2R	ClogP
1	visnadina	-	14,10	3,95

EXEMPLO 2

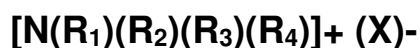
[093] A composição a seguir é um exemplo de uma composição para xampu de acordo com a presente invenção:

Ingrediente	Exemplo 2
Nome Químico	porcentagem em peso de ingrediente ativo
SLES 2EO	14
Cocoamidopropilbetaína	2
Cloreto de guar hidroxipropiltrimônio	0,1
Dimeticonol	1
Ácido poliacrílico reticulado	0,4
Zinco piritiona	0,5
Visnadina	0,6
Mica + dióxido de titânio	0,2
Benzoato de sódio	0,5
Água	q.s.p. 100

REIVINDICAÇÕES

1. USO DE VISNADINA, caracterizado por ser para a fabricação de uma composição para o tratamento de uma condição inflamatória da pele como o prurido do couro cabeludo, associado com caspa.

2. USO, de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pela composição para o tratamento de uma condição inflamatória da pele, compreendendo visnadina, ser uma composição condicionadora, compreendendo um tensoativo condicionador catiônico em uma quantidade de 0,01 a 10% em peso de visnadina, em que o tensoativo catiônico corresponde a fórmula geral:



em que R₁, R₂, R₃ e R₄ são independentemente selecionados de (a) um grupo alifático de 1 a 22 átomos de carbonos, ou (b) um grupo aromático, alcoxi, polioxialquileno, alquilamido, hidróxialquila, arila ou alquilarila com até 22 átomos de carbono; e X é um ânion formador de sal, tais como halogênios (por exemplo cloreto, brometo), acetato, citrato, lactato, glicolato, fosfato, nitrato, sulfato e radicais alquilsulfatos.

3. USO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 2, caracterizado pela composição de visnadina compreender de 0,01 a 30% em peso de um agente anticaspa, que é um composto ativo contra a caspa e é um composto diferente de visnadina.

4. USO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo agente anticaspa compreender um composto escolhido entre zinco piritiona, climbazol, cetoconazol, octopirox e suas misturas.

5. USO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 4, caracterizado pela quantidade de visnadina variar de 0,05 a 20% em peso e de preferência de 0,1 a 10% em peso.