

328087

P.- 32.278



328087

MEMORIA DESCRIPTIVA

para solicitar

P A T E N T E D E I N V E N C I O N

e n

E S P A Ñ A

por VEINTE años

a nombre de MEAD JOHNSON & COMPANY, entidad norteamericana, establecida en Evansville, Indiana, Estados Unidos de América, por:

"UN METODO DE HACER UNA COMPOSICION PARA ONDULAR EL CABELLO"

=====

Esta invención se refiere a procedimientos y composiciones para la deformación permanente del cabello humano, que tiene ventajas substanciales e inesperadas con respecto a los métodos comúnmente disponibles. Estos procedimientos y composiciones se refieren al así llamado ondulado permanente del cabello, así como a los procedimientos y composiciones de corolario de enderezamiento de cabello rizado naturalmente o artificialmente.

5

328037 28087

18 JUN 1954



Los procedimientos más comunes que se utilizan actualmente para el ondulado permanente del cabello mediante métodos químicos, comprende en un primer paso, en el cual el cabello es impregnado con una solución acuosa que contiene uno o más compuestos sulfhidrúlicos como un agente reductor para las ligaduras de disulfuro de la queratina, a fin de impartir plasticidad al cabello y permitir la reformación. El compuesto sulfhidrúlico ácido tioglicólico es el único miembro de la clase que ha logrado cierto grado substancial de aplicación práctica. Ha venido a quedar adelante debido a su bajo costo y debido a que las propiedades indeseables de los tioles como una clase son exhibidas en un grado mínimo por este compuesto.

Sin embargo, las composiciones de ondulado permanente comúnmente disponibles poseen desventajas substanciales. Lo más importante de notar es su olor pestilente y su carácter corrosivo para la piel y el cabello humanos. Se encuentran a menudo reacciones alérgicas. La carencia de aplicabilidad universal al cabello de todos los individuos debido a su sensibilidad variable al ácido tioglicólico, presenta también un problema no resuelto en el arte.

La naturaleza corrosiva de las soluciones de ondulado a base de tioglicolato, que da como resultado daño en el cabello, reflejado en pérdida en su resistencia a la tensión, es en un grado una característica inherente del ingrediente de tioglicolato. Además, dichas lociones son inestables por exposición al aire. Una de las razones de la inaplicabilidad de algunos otros compuestos de tiol

328087

18 Oct 19



que tienen la actividad inherente deseada, es que las mismas dejan depósitos indeseables sobre el cabello tratado, o de otro modo, el cabello adquiere una apariencia u olor indeseables.

5 La presente invención, por lo tanto, tiene entre sus objetos:

a. proveer procedimientos para la deformación permanente del cabello como en el ondulado permanente y en el tratamiento del cabello, que emplean composiciones inofensivas, no corrosivas, y no sensibilizadoras, substancialmente libres del olor indeseable asociado usualmente con los tioglicolatos.

b. proveer procedimientos tales que empleen composiciones que tengan una duración conveniente de estabilidad al almacenamiento.

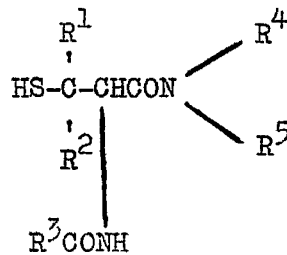
c. proveer procedimientos tales que tengan ciclos de tiempo de operación adaptados a la aplicación comercial o doméstica.

d. proveer procedimientos tales que empleen composiciones que tengan un amplio margen de seguridad y que sean aún efectivas para autoaplicación o empleo en el hogar por operadores inexpertos.

e. proveer composiciones para utilizarse en los procedimientos anteriores, que tengan una propensión disminuída a dañar el cabello cuando se utilizan en el mismo.

Estos y otros objetos se logran como un resultado de la presente invención, que involucra el tratamiento del cabello con compuestos que comprenden amidas de compuestos de cisteína N-acilada. Estas substancias tienen la siguiente fórmula:

328087



Fórmula I

5

En esta fórmula R^1 y R^2 son átomos de hidrógeno o grupos alquilo inferior que tienen hasta aproximadamente 4 átomos de carbono. Cuando R^1 y R^2 son, cada uno, átomos de hidrógeno, los productos son derivados del aminoácido cisteína. Cuando R^1 y R^2 son grupos metilo, los productos son derivados del aminoácido penicilamina.

10

R^3 representa un átomo de hidrógeno o el residuo orgánico del grupo N-acilo, en cuyo caso es un grupo alquilo o un grupo arilo, o un grupo aralquilo que tiene hasta 9 átomos de carbono.

15

R^4 y R^5 son átomos de hidrógeno en el caso de las amidas simples, que constituyen modalidades preferidas de la presente invención. En otras modalidades, representan los residuos orgánicos de amidas N-sustituídas. Más específicamente, R^4 es ya sea un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo, alqueniilo, cicloalquilo, o cicloalqueniilo hasta de 5 átomos de carbono. Para mencionar unos cuantos residuos representativos, pueden mencionarse los siguientes: metilo, etilo, propilo, alilo, pentilo, butilo, t-butilo, ciclopentilo, ciclopentenilo, etc. R^5 es un átomo de hidrógeno o bien un grupo alquilo inferior hasta de 4 átomos de carbono. R^4 y R^5 pueden estar sustituidos por uno o dos grupos hidroxilo. Alternativamente, R^4 y R^5 pueden conectarse para formar junto con el átomo de nitrógeno, un grupo heterocíclico tal como piperidino, pirroli

20

25

30

328087



dino, N'-R⁵-piperazino (en donde R⁵ tienen el significado mencionado anteriormente), morfolino, tiamorfolino, hexa-metilenimino, etc.

5 La elegancia cosmética de las preparaciones para el cabello, que contienen compuestos de la fórmula I, combinada con la naturaleza fisiológicamente aceptable y la capacidad de reducción de queratina mejorada de las mismas, a un pH neutro, las adapta particularmente para su empleo en procedimientos de tratamiento del cabello.

10 Los compuestos de la fórmula I tienen propensión notablemente pequeña a dañar el cabello o ha hacerlo reseco o quebradizo cuando se utilizan en procedimientos de ondulado permanente.

15 En una forma, la presente invención se refiere a un procedimiento que incluye poner en contacto el cabllo con una solución de un compuesto de la fórmula I, a fin de transformar el cabello a una configuración pre-determinada. En otra forma, la presente invención involucra poner en contacto el cabello humano limpio, mientras lo

20 confina en la configuración predeterminada deseada, con una solución acuosa de un compuesto de la fórmula I, que tiene un pH dentro de la escala de aproximadamente 7 a 9,5, y una concentración de la misma de aproximadamente 0,5% en peso hasta una solución saturada, o hasta aproxi

25 madamente 20% en peso. Se emplea un tiempo de contacto suficiente con la solución, para dar como resultado una deformación permanente del cabello. Este período varía de aproximadamente 10 minutos a aproximadamente 12 horas, dependiendo de las características del cabello que se es

30 tá tratando, de la temperatura, del pH de la solución, y



de la concentración y especie de compuesto de la fórmula I empleado. Queda dentro del alcance del operador experto determinar el período óptimo en cualquier situación dada.

5 Incluyen compuestos preferidos para utilizarse de conformidad con la presente invención, la 2-acetamido-3-mercaptopropionamida, 2-acetamido-3-mercapto-N-metilpropionamida, y 2-propionamido-3-mercaptopropionamida. La L-2-acetamido-3-mercaptopropionamida ha demostrado ser
10 también una sustancia no tóxica en grado elevado. En ratones, el valor de DL_{50} es de 2820 mg/kg (administración intravenosa). En conejos, después de instalación de una solución al 20% de la misma en el ojo, no es evidente reacción ocular empleando el método de Draize (Food, Drugs &
15 Cosmetics 49-51 (1959)) para determinar la toxicidad para la mucosa de los ojos. Además, no se hace evidente ningún efecto anestésico local, según se estima por el método de Herschfelder y Bieter, *Physiol. Rev.* 12, 190 (1932). La sensibilización en cobayos tratados con el compuesto mediante inyección intradérmica no pudo inducirse (Draize,
20 Food, Drug & Cosmetic Law Journal 10 (10), 722-726, Oct. 1955).

Tal como es convencional en el arte de ondulación del cabello, cuando el contacto del cabello con la
25 solución acuosa de un compuesto de la fórmula I, ha logrado plastificación suficiente para dejarlo asumir la configuración deseada, el cabello se expone a condiciones de oxidación para el propósito de regenerar las ligaduras de disulfuro de cistina de la queratina. Este paso ha sido
30 denominado en el arte variadamente como fijación o neutra

328087



lización. El primer término se considera más apropiado en la presente descripción, ya que el término neutralización implica también ajuste de pH. Cuando se emplea el término "medios de fijación" para describir la presente
5 invención, se pretende hacer referencia al paso de exponer el cabello que ha sido plastificado por medio del contacto con una solución de un compuesto de la fórmula I, a condiciones de oxidación, permitiendo la regeneración de las ligaduras de disulfuro de cistina de la queratina.

10 Los medios de fijación convencionales conocidos en el arte de ondulación de cabellos son aplicables al procedimiento de la presente. Estos involucran ya sea expsición al aire durante un período prolongado, o contacto breve con una solución de un agente oxidante inorgánico.
15 Los agentes oxidantes que han sido empleados y que son adecuados en el procedimiento de la presente, incluyen peróxido de hidrógeno, los bromatos y yodatos de metal alcalino, los perboratos de metal alcalino, etc.

El ajuste del pH dentro de la escala especifica
20 da para la acción de ondulación del cabello, puede lograr se, cuando es necesario, por neutralización con una base adecuada. Las bases empleadas para el ajuste del pH deben ser cosméticamente aceptables. El hidróxido de sodio, el amoníaco o el hidróxido de amonio satisfacen ambas nor-
25 mas. Otros materiales que son aplicables incluyen las sa-les de sodio, potasio y amonio de ácidos débiles, cosméti-camente aceptables. Las aminas orgánicas cosméticamente aceptables, que tienen alcalinidades comparables a o mayo-res que las del amoníaco, son adecuadas y de hecho son
30 las que se prefieren. Los valores de pKb de tales aminas,

328087



son menores que 5.

La lista siguiente incluye una muestra de bases adecuadas para ajuste del pH de las soluciones de ondulación empleadas en el procedimiento de la presente: hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, amoníaco, metilamina, 5 etilamina, propilamina, butilamina, dimetilamina, dietilamina, monoetanolamina, etilendiamina, piperazina, tetraetilendiamina, y sales de sodio, potasio o amonio de los ácidos siguientes: ácido láctico, ácido acético, ácido 10 carbónico, ácido cítrico, etc. La base preferida para el ajuste del pH es la monoetanolamina. La escala de pH preferida es de 8 a 9,5. Se observará que la mayor parte de las bases indicadas anteriormente son materiales solubles en agua, que indican la preferencia de la presente por 15 bases de este tipo.

El término "cosméticamente aceptables" según se aplica a ingredientes de la composición presente, se pretende que haga referencia a ciertas características funcionales de los mismos. Por ejemplo, las aminas y sales 20 cosméticamente aceptables son materiales que no son corrosivos en las concentraciones empleadas, que tienen bajas toxicidades, y que carecen de propensión de irritación o sensibilización. Además, dichos ingredientes no tienen efecto de ablandamiento indebido o irreversible sobre el 25 cabello. No deben reaccionar con el grupo sulfhídrido de los compuestos de la fórmula I bajo las condiciones de almacenamiento y empleo, en una forma irreversible o destructiva, por ejemplo por oxidación, condensación, o precipitación. Además, no deben evocar las reacciones de color indeseables que dañan la apariencia de la composición 30

328087 10 JUN



como un total o del cabello tratado con la misma.

En la práctica de la presente invención se prefiere emplear soluciones en relación a las cuales el derivado de cisteína descrito tiene una concentración en la
5 escala de aproximadamente 3% a aproximadamente 10% cuando el tratamiento se realiza a temperatura ambiente, v. gr. ondulación en frío. Sin embargo, pueden emplearse soluciones de una concentración hasta de 20%. Cuando se emplean
10 temperaturas elevadas en el tratamiento del cabello de conformidad con esta invención, puede ser deseable utilizar concentraciones de las mismas de menos de 3%.

Los materiales auxiliares del tipo empleado en el arte de ondulación del cabello son también adecuados para utilizarse en los procedimientos de la presente. Es-
15 tos incluyen opacadores y espesadores para impartir una consistencia lechosa o cremosa similar a una loción, a la solución de otro modo transparente, del derivado de cisteína descrito. Para este propósito, pueden emplearse ingredientes tales como carboximetil celulosa, poliacrilatos,
20 látex de poliestireno, aceites emulsificados, hidrocarburos clorados, pectinas, gomas, etc. Además, pueden utilizarse perfumes o colorantes cosméticamente aceptables, si se desea permitir elegancia.

Los aditivos de naturaleza funcional pueden incluirse también, y en este aspecto se ha encontrado que
25 los agentes humectantes y los agentes hinchadores pueden incorporarse con ventaja en las composiciones empleadas en el procedimiento de la presente. Los agentes humectantes adecuados incluyen los agentes humectantes sintéticos,
30 iónicos y no iónicos y particularmente detergentes tales



como las sales de sodio y potasio de ácidos alquilsulfúri
co, alquilsulfónico, y aralquilsulfónico, que tienen por
los menos 12 átomos de carbono, polioxi-etilenos, polioxi-
propilenos, y los éteres y ésteres de los mismos. Los
5 agentes humectantes se emplean en concentraciones de apro-
ximadamente 0,1% a 1% en peso.

Como materiales que se sabe que hinchan la cu-
bierta o vaina del cabello por contacto con la misma en
agua, pueden mencionarse urea, tiourea, metilurea, etilu-
10 rea, y las sales ácidas minerales de guanidina. Tales ma-
teriales pueden incluirse en las composiciones en una can-
tidad de aproximadamente 1% a aproximadamente 15% en peso
de la solución de ondulación según sea dictado por las
propiedades que afectan tanto a la función como la elega-
15 ncia del producto final.

Otros auxiliares que pueden emplearse incluyen
agentes para evitar el sobre-procesado del cabello. Los
materiales que se conocen en el arte como aplicables para
este propósito incluyen cloruro de amonio, sulfato de amo-
20 nio, fosfato de amonio, y otras varias sales de bases dé-
biles y ácidos fuertes.

A fin de ilustrar más claramente la forma de
practicar la presente invención, en seguida se dan varios
ejemplos específicos.

25

EJEMPLO 1

Se prepara una solución para la ondulación del
cabello a partir de los ingredientes siguientes, preparan-
do soluciones separadas de los ingredientes mostrados en
30 las listas A y B. La lista A contiene los ingredientes so-

328087

18 JUN



lubles en aceite, y la lista B los ingredientes solubles en agua. Las dos soluciones se calientan a 70°C. antes de combinarse. Después de que se combinan, se añade a las mismas un agente antiespumante de silicón, en una cantidad de 0,01 g, la solución se agita a un pH de 9,3 con monoetanolamina y hidróxido de amonio, y se diluye a 100 ml con agua.

	LISTA A		LISTA B
10	Aceite mineral	3,0 g	L-2-acetamido-3-mercapto-propionamida
	Lanolina líquida	0,75g	Acido disodio-etilendiaminotetraacético
	Eter estearílico de polioxietileno(2)	0,5 g	Agua destilada, aproximadamente
15	Eter estearílico de polioxietileno(20)	0,5 g	10,0 g 0,05 g 70 ml

Esta solución se emplea de conformidad con la técnica usual para aplicar un permanente doméstico, incluyendo los pasos de tratamiento del cabello con champú, saturación del cabello con la solución de ondulación, enrolamiento del cabello sobre rizadores, restauración de los esfuerzos en el estado enrollado con la loción de ondulación, manutención durante un período suficiente, al juicio del operador, para que se desarrolle la plasticidad, y neutralización con una solución de peróxido de hidrógeno al 1,5%. Después se enjuaga, se deja secar y se separan los rizadores.

EJEMPLO 2 y 3

Se preparan composiciones de ondulación del ca-



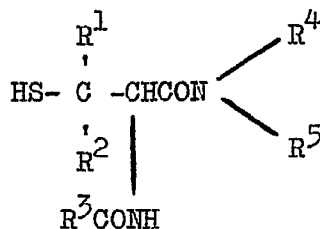
bello y se utilizan según se describió en el Ejemplo 1, substituyendo la cantidad de L-2-acetamido-3-mercaptopropionamida especificada en el Ejemplo 1, por 5 g de L-2-acetamido-3-mercaptopropionamida (Ejemplo 2) o 10 g de L-2-propionamido-3-mercaptopropionamida (ejemplo 3).

La presente solicitud que corresponde a la presentada en los Estados Unidos de América, el 28 de Junio de 1.965, bajo el número 467.673, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

N O T A

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

- 1.- Un método de hacer una composición para ondular el cabello que comprende mezclar una solución acuosa cosméticamente aceptable que tiene un pH de entre aproximadamente 7 y 9,5 y desde aproximadamente 0,5% hasta aproximadamente 20% en peso de un compuesto que tiene la siguiente fórmula:





en la cual R^1 y R^2 son hidrógeno o alcohol de hasta 4 átomos de carbono; R^3 es hidrógeno alcohol, aralcohol, o arilo, cada uno de ellos hasta con 9 átomos de carbono;

5 R^4
 \swarrow
 N es piperidino, pirrolidino, $N'-R^5$ -piperazino, mor-
 \swarrow
 R^5

folino, tiamorfolino, hexametilenimino, o amino en la cual R^4 es hidrógeno, alcohol, alqueno, cicloalcohol, o cicloalqueno cada uno de ellos con hasta 5 átomos de
 10 carbono y está insustituído o sustituido por hasta dos grupos hidroxilo; R^5 es hidrógeno o alcohol inferior de hasta 4 átomos de carbono y está sin sustituir o sustituido por hasta dos grupos hidroxilo.

2.- El método de la reivindicación 1, en el
 15 cual dicho compuesto está seleccionado de 2-acetamido-3-mercaptopropionamida, 2-acetamido-3-mercapto-N-metilpropionamida o 2-propionamido-3-mercaptopropionamida.

3.- El método de la reivindicación 1 ó 2, en el
 20 cual la concentración de dicho compuesto es de aproximadamente 3% hasta aproximadamente 10% en peso.

4.- El método de la reivindicación 1, 2 ó 3, en el cual el pH está dentro del margen de 8 a 9,5.

5.- Un método de hacer una composición para ondular el cabello.

25 Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y para los fines que se han especificado.

328087



Esta Memoria consta de catorce hojas escritas
a máquina por una sola cara.

Madrid, 15 MAR 1967
P.A.

[Handwritten signature]
AGENCI...
P.A.

AVS.
9.3.67