

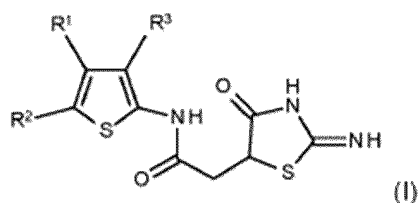
(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 51831 B1** (51) Cl. internationale : **A61K 31/4155; A61K 8/49; C07D 417/12; A61Q 7/00; C07D 277/54; A61P 17/14**
- (43) Date de publication : **27.09.2023**

-
- (21) N° Dépôt : **51831**
- (22) Date de Dépôt : **13.02.2019**
- (30) Données de Priorité : **13.02.2018 IT 201800002630**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2019/053591 13.02.2019**
- (71) Demandeur(s) : **Giuliani S.p.A., Via Palagi, 2 20129 Milano (IT)**
- (72) Inventeur(s) : **PAUS, Ralf ; BARONI, Sergio ; GIULIANI, Giammaria ; MARZANI, Barbara ; PINTO, Daniela ; HAWKSHAW, Nathan**
- (74) Mandataire : **SABA & CO., TMP**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation : EP 19708402.3
-
- (54) Titre : **COMPOSITION POUR LA PRÉVENTION ET LE TRAITEMENT DE TROUBLES DE LA POUSSE DES CHEVEUX**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne l'utilisation de dérivés d'iminoxothiazolidine pour la prévention ou le traitement de troubles de la pousse des cheveux. Les dérivés d'iminoxothiazolidine peuvent être formulés en tant que compositions appropriées pour l'administration systémique ou l'application locale sur le cuir chevelu.

REVENDEICATIONS

1. Utilisation cosmétique non thérapeutique d'un composé iminothiazolidine selon la formule (I)



où

R₁ est H, un alkyle en C₁-C₆ linéaire ou ramifié, un cycloalkyle, un phényle, un phényle en -CH₂-NH ;

R₂ est H, un alkyle en C₁-C₆ linéaire ou ramifié, un halogène, un phényle ;

R₃ est COO(C₁-C₆) alkyle, CONR₄R₅ où R₄ et R₅ sont individuellement H ou un alkyle en C₁-C₆, ou R₁ et R₂ forment ensemble un cycloalkyle en C₅-C₇ fusionné avec le noyau thiophène pour améliorer un aspect esthétique des cheveux.

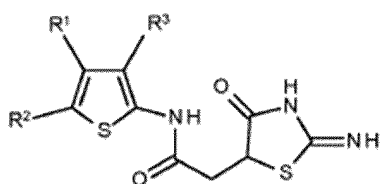
2. Utilisation cosmétique non thérapeutique selon la revendication 1 où R₁ est H ou un alkyle en C₁-C₃, de préférence un méthyle,

R₂ est H ou un halogène, de préférence Br, ou un alkyle en C₁-C₃, de préférence CH₃ et

R₃ est un COO(C₁-C₃) alkyle, de préférence un ester méthylique ou éthylique.

3. Utilisation cosmétique non thérapeutique selon la revendication 1 ou 2 dans laquelle les composés sont l'ester méthylique de l'acide 2-(2-(2-Imino-4-oxo-thiazolidin-5-yl)-acétylamino)-4,5-diméthyl-thiophène-3-carboxylique ou l'ester éthylique de l'acide 2-(2-(2-Imino-4-oxo-thiazolidin-5-yl)-acétylamino)-4,5-diméthyl-thiophène-3-carboxylique.

4. Utilisation cosmétique non thérapeutique d'une composition comprenant un composé iminothiazolidine selon la formule (I)



où

R₁ est H, un alkyle en C₁-C₆, un cycloalkyle, un phényle, un phényle en -CH₂-NH ;

R₂ est H, un alkyle en C₁-C₆, un halogène, un phényle ;

R₃ est COO(C₁-C₆) alkyle, CONR₄R₅ où R₄ et R₅ sont individuellement H ou un alkyle en C₁-C₆, ou R₁ et R₂ forment ensemble un cycloalkyle en C₅-C₇ fusionné avec le cycle thiophène et un support physiologiquement acceptable, pour améliorer un aspect esthétique des cheveux.

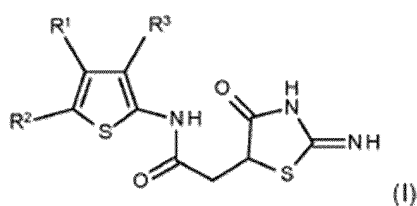
5. Utilisation cosmétique non thérapeutique selon la revendication 4 où R₁ est H ou un alkyle en C₁-C₃, de préférence un méthyle,

R₂ est H ou un halogène, de préférence Br, ou un alkyle en C₁-C₃, de préférence CH₃ et R₃ est un COO(C₁-C₃) alkyle, de préférence un ester méthylique ou éthylique.

6. Utilisation cosmétique non thérapeutique selon la revendication 4 ou 5 dans laquelle les composés sont l'ester méthylique de l'acide 2-(2-(2-Imino-4-oxo-thiazolidin-5-yl)-acétylamino)-4,5-diméthyl-thiophène-3-carboxylique ou l'ester éthylique de l'acide 2-(2-(2-Imino-4-oxo-thiazolidin-5-yl)-acétylamino)-4,5-diméthyl-thiophène-3-carboxylique.

7. Utilisation cosmétique non thérapeutique selon l'une quelconque des revendications 4 à 6 dans laquelle la composition est destinée à une application locale ou topique ou à une administration orale.

8. Composé iminooxothiazolidine selon la formule (I)



où

R₁ est H, un alkyle en C₁-C₆ linéaire ou ramifié, un cycloalkyle, un phényle, un phényle en -CH₂-NH ;

R₂ est H, un alkyle en C₁-C₆ linéaire ou ramifié, un halogène, un phényle ;

R₃ est COO(C₁-C₆) alkyle, CONR₄R₅ où R₄ et R₅ sont individuellement H ou un alkyle en C₁-C₆, ou R₁ et R₂ forment ensemble un cycloalkyle en C₅-C₇

fusionné avec le cycle thiophène pour une utilisation dans la prévention ou le traitement d'un trouble de la croissance des cheveux.

9. Composé iminooxothiazolidine selon la formule (I) pour une utilisation selon la revendication 8, où

R₁ est H ou un alkyle en C₁-C₃, de préférence un méthyle ;

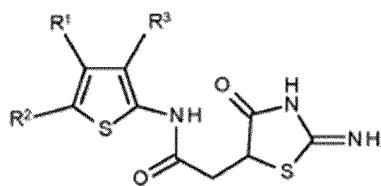
R₂ est H ou un halogène, de préférence Br, ou un alkyle en C₁-C₃ de préférence CH₃ et

R₃ est un COO(C₁-C₃) alkyle de préférence un ester méthylique ou éthylique.

10. Composé iminooxothiazolidine selon la formule (I) pour une utilisation selon la revendication 6 dans lequel les composés sont l'ester méthylique de l'acide 2-(2-(2-Imino-4-oxo-thiazolidin-5-yl)-acétylamino)-4,5-diméthyl-thiophène-3-carboxylique ou l'ester éthylique de l'acide 2-(2-(2-Imino-4-oxo-thiazolidin-5-yl)-4,5-diméthyl-thiophène-3-carboxylique.

11. Composé d'iminooxothiazolidine selon la formule (I) pour une utilisation selon l'une quelconque des revendications 8 à 10, dans lequel le trouble de la croissance est une alopécie, un effluvium télogène ou une alopécie androgénétique.

12. Composition pharmaceutique comprenant un composé iminooxothiazolidine selon formule (I)



où

R₁ est H, un alkyle en C₁-C₆ linéaire ou ramifié, un cycloalkyle, un phényle, un phényle en -CH₂-NH ;

R₂ est H, un alkyle en C₁-C₆ linéaire ou ramifié, un halogène, un phényle ;

R₃ est COO(C₁-C₆) alkyle, CONR₄R₅ où R₄ et R₅ sont individuellement H ou un alkyle en C₁-C₆, ou R₁ et R₂ forment ensemble un cycloalkyle en C₅-C₇ fusionné avec le cycle thiophène et un support pharmaceutiquement acceptable pour une utilisation dans la prévention ou le traitement d'un trouble de la

croissance des cheveux.

13. Composition pharmaceutique pour une utilisation selon la revendication 12, où

R₁ est H ou un alkyle en C₁-C₃, de préférence un méthyle ;

R₂ est H ou un halogène, de préférence Br, ou un alkyle en C₁-C₃ de préférence CH₃ et

R₃ est un COO(C₁-C₃) alkyle de préférence un ester méthylique ou éthylique.

14. Composition pharmaceutique pour une utilisation selon la revendication 12 ou 13, dans laquelle les composés sont l'ester méthylique de l'acide 2-(2-(2-Imino-4-oxo-thiazolidin-5-yl)-acétylamino)-4,5-diméthyl-thiophène-3-carboxylique ou l'ester éthylique de l'acide 2-(2-(2-Imino-4-oxo-thiazolidin-5-yl)-acétylamino)-4,5-diméthyl-thiophène-3-carboxylique.

15. Composition pharmaceutique pour une utilisation selon la revendication 10 dans laquelle la composition est destinée à une application locale/topique ou à une administration systémique.

16. Composition pharmaceutique pour une utilisation selon la revendication 10 ou 11 dans laquelle le trouble de la croissance est une alopécie, un effluvium télogène ou une alopécie androgénétique.