



MINISTERO DELLO SVILUPPO ECONOMICO
DIREZIONE GENERALE PER LA LOTTA ALLA CONTRAFFAZIONE
UFFICIO ITALIANO BREVETTI E MARCHI

DOMANDA DI INVENZIONE NUMERO	102009901700725
Data Deposito	05/02/2009
Data Pubblicazione	05/08/2010

Classifiche IPC

Titolo

**COMPOSIZIONE AD USO TOPICO PER IL TRATTAMENTO DELLE ADIPOSITA' LOCALIZZATE
E DEI RELATIVI INESTETISMI**

DESCRIZIONE DEL BREVETTO DI INVENZIONE INDUSTRIALE AVENTE COME

TITOLO :

MI 2009 A 000145

Composizioni ad uso topico per il trattamento delle
adiposità localizzate e dei relativi inestetismi .

A NOME : Vitrupharma S.r.l.

CON SEDE LEGALE IN MILANO

DESCRIZIONE

Parte 1 : introduzione

Per adiposità localizzate si intende un accumulo di grasso
(=cellule adipose), specialmente in alcune parti del corpo

Pagina 1 di 11

Silvafarm

come parete addominale, glutei e cosce, con danno estetico anche notevole.

Ciò avviene per effetto di abitudini alimentari errate (dieta ipercalorica, con conseguente tendenza all'obesità), sedentarietà e carenza di attività fisica, ma anche in seguito ad un intervento chirurgico, oppure ad una gravidanza.

La tendenza ad accumulare grasso aumenta, comunque, in funzione dell'età, di squilibri ormonali (iperandrogenismo nella donna), di alterazioni metaboliche (sindrome metabolica, iperinsulinismo, diabete di tipo 2).

Parte 2 : le tecniche precedenti

I trattamenti di più comune impiego per la rimozione delle adiposità localizzate sono :

- L'intervento chirurgico o liposuzione. Avviene in anestesia locale e consiste in una vera e propria aspirazione mediante cannula del grasso in eccesso.

- La mesoterapia. Somministrazione intradermica di principi attivi omeopatici e non, comunque in dosi molto basse, grazie all'uso di appositi aghi.

- L'intralipoterapia. Si tratta della somministrazione localizzata, per via iniettiva, di principi attivi lipolitici. Nello specifico : fosfatidilcolina e sodio desossicolato.

- L'uso di prodotti cosmetici a base di fosfatidilcolina o,

S. P. Fini

molto più spesso, di fosfatidilcolina idrogenata.

In questi casi è possibile ricorrere all' utilizzo di ultrasuoni, per facilitare l' assorbimento degli attivi attraverso la pelle. I massaggi risultano comunque un complemento spesso necessario al fine di ottenere un effetto soddisfacente.

Parte 3 :inconvenienti delle tecniche precedenti.

La liposuzione comporta tutti i rischi di un vero e proprio intervento chirurgico, anche se questi possono essere minimizzati ricorrendo a professionisti qualificati e a strutture idonee debitamente attrezzate. Le precauzioni da adottare e gli strumenti da impiegare rendono comunque il trattamento piuttosto costoso.

La mesoterapia può causare edemi e irritazioni locali.

Inoltre l' assorbimento di farmaci per via intradermica è lento, specie se i dosaggi sono bassi. Se il preparato utilizzato è infine di natura omeopatica, non esiste l' avallo della medicina ufficiale.

Anche l' intralipoteraia non è priva di effetti indesiderati : oltre a fenomeni transitori di gonfiore e arrossamento locale, alcuni autori rilevano vere e proprie alterazioni istologiche, riconducibili a fibrosi e necrosi sia del tessuto adiposo che di quello vascolare. In caso di trattamento a lungo termine si può anche determinare la formazione di cisti, con ovvie

Silvia F. n. b.

conseguenze di tipo estetico.

Schuller- Petrovic S e coll.

Tissue toxic effects of phosphatidylcholine/deoxycholate after subcutaneous injection for fat dissolution in rats and human volunteers.

Derm Surg. 2008 Apr; 34(4):529-42.

L'impiego di preparazioni cosmetiche è, grazie alle modalità applicative (=uso esterno), praticamente privo di effetti collaterali significativi.

Il frequente ricorso, tuttavia, alla sola fosfatidilcolina idrogenata, che risulta cosmetologicamente più accettabile perché protegge il mantello idrolipidico cutaneo, solleva dubbi sulla reale efficacia di questi prodotti. Solo la fosfatidilcolina NON idrogenata sembrerebbe in grado di penetrare attraverso la cute e di raggiungere così i depositi di grasso. Questa azione, d'altro canto, danneggerebbe lo strato superficiale dell'epidermide, aumentando la perdita di acqua per evaporazione.

Handbook of Cosmetic Science and Technology, p. 155-163

Edited by A.O. Borel, M. Paye and H.I. Maibach

CRC Press Taylor & Francis Group, Boca Raton 2006

Kosmetic International 1999(1), 104-106.

La fosfatidilcolina NON idrogenata oltretutto, se non

Serie Finzi

combinata col desossicolato, non garantirebbe neppure una sufficiente attività lipolitica, al fine di dissolvere le adiposità localizzate.

Salti G. e coll.

Phosphatidylcholine and Sodium Deoxycholate in the treatment of localized fat : a double-blind, randomized study.

Dermatol Surg 2008 Jan;34(1):60-66.

Secono recenti studi americani, addirittura, l' effetto lipolitico comunemente attribuito alla fosfatidilcolina, sarebbe in realtà imputabile, prevalentemente, all' azione detergente del sodio desossicolato.

Rotunda Adam M. e coll.

Detergent effects of Sodium Deoxycholate are a major feature of an injectable Phosphatidylcholine formulation used for localized fat dissolution.

Dermatol Surg 2007 Jul;30(7):1001-1008.

In conclusione : mentre le tecniche invasive (chirurgiche ed iniettive) pongono più che altro problemi di reazioni avverse, quelle non invasive (cosmetiche) rischiano di non garantire una sufficiente efficacia.

Parte 4 : vantaggi dell' invenzione

Scopo della presente invenzione è quello di mettere a disposizione delle utilizzatrici e degli utilizzatori un

S. F. Finzi

trattamento non invasivo per le adiposità localizzate ed i relativi inestetismi. Tale trattamento è basato su preparazioni dermatologiche per uso topico, che abbinino in maniera ottimale la scontata tollerabilità, legata solo alla tipologia di impiego, con una reale efficacia, paragonabile a quella che si riscontra con le preparazioni iniettabili.

Parte 5 : il concetto inventivo

Si è trovato che l' associazione di acido desossicolico e/o suoi sali con forskolina (diterpene prodotto dalla pianta indiana *Coleus forskohlii*) e caffeina è risultata sorprendentemente efficace nel trattamento topico delle adiposità localizzate e degli inestetismi ad esse riconducibili.

Le composizioni oggetto della presente invenzione mostrano risultati non spiegabili con la semplice sommatoria degli effetti registrati con la somministrazione separata dei singoli componenti. Questo sembra apparentemente dovuto alla sinergia che si instaura tra i tre principi attivi, che determinano un effetto lipolitico grazie a tre meccanismi diversi.

Il desossicolato ha, infatti, come già abbiamo visto, un effetto puramente chimico-fisico (=detergente).

La forskolina invece stimola l' enzima adenilciclasa, che



determina la produzione di AMP ciclico. Tale composto attiva a sua volta la proteinchinasi A, che innesca la lipolisi negli adipociti.

Wu Yin e coll.

Role of AMP-activated Protein Kinase A in cyclic AMP-dependent lipolysis in 3T3-L1 adipocytes.

Jour Biol Chem Oct 2003;278(44):43074-43080.

Hiromichi Okuda e coll.

Relationship between cyclic AMP production and lipolysis induced by forskolin in rat fat cells.

Jour Lip Res 1992;33:225-231.

La caffeina infine, attraverso la paraxantina che è il suo principale metabolita, attiva direttamente la scissione enzimatica dei trigliceridi in glicerolo ed acidi grassi.

Mello D. e coll.

The caffeine and its ergogenic effect.

Rev Bras Nutr Espor Mar-Apr 2007;1(2):ISSN 1981-9987.

La migliore sinergia sembra ottenersi quando :

- Il desossicolato ha una concentrazione tra lo 0.5 ed il 5%, preferibilmente del 2.5%
- la forskolina una concentrazione tra lo 0.1 e lo 0.8%, preferibilmente dello 0.4%
- la caffeina ha una concentrazione non inferiore allo 0.2%, preferibilmente dello 0.8%.

Silvia Finti

Parte 6 : il dettaglio dell' invenzione

Le composizioni della presente invenzione saranno formulate in modo da essere adatte ad una applicazione topica sulla cute.

Si presenteranno in forma di gel creme, soluzioni o sospensioni, utilizzando tecniche ed eccipienti convenzionali e comunque compatibili con l' uso.

Si riporta qui di seguito un esempio di formulazione secondo l' invenzione.

ESEMPIO

Formulazione in crema

INGREDIENTE	QUANTITA' % IN PESO
Sodio desossicolato	2.5
Forskolina	0.4
Caffeina	0.8
Eccipienti cosmetici	q.b
Acqua	q.b. a 100

Parte 7 : il funzionamento dell' invenzione

Applicare sulla pelle e massaggiare energicamente fino a totale assorbimento, preferibilmente al mattino, prima di iniziare la giornata, e la sera, immediatamente prima di coricarsi.

Silvia Finzi

Il trattamento va continuato fino al raggiungimento di un risultato soddisfacente.

Parte 8 : chiusura

Il trovato così concepito è suscettibile di modifiche e varianti, purchè rientranti nell' ambiti del concetto inventivo. Tutti i dettagli sono infine sostituibili con altri tecnicamente equivalenti.

S. F. m. a.

RIVENDICAZIONI (parte 9) :

MI 2009 A 000145

- 1) Composizioni farmaceutiche, medicali, cosmeceutiche e cosmetiche, ad uso topico, per il trattamento delle adiposità localizzate e dei relativi inestetismi, contenenti acido desossicolico e/o suoi sali, forskolina e caffeina
- 2) Composizioni secondo la rivendicazione 1) contenenti tra lo 0.5 ed il 5% di desossicolato in peso, preferibilmente il 2.5%
- 3) Composizioni secondo le rivendicazioni 1) e 2) contenenti tra lo 0.1 e lo 0.8% di forskolina in peso, preferibilmente lo 0.4%
- 4) Composizioni secondo le rivendicazioni 1), 2) e 3), con un contenuto di caffeina superiore allo 0.2% in peso, preferibilmente lo 0.8%
- 5) Composizioni secondo le rivendicazioni 1), 2), 3) e 4), in forma di gel, creme, soluzioni o sospensioni.

Silvia Finzi