



(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 286 777**

(51) Int. Cl.:

A61Q 19/06 (2006.01)

A61K 8/49 (2006.01)

A61K 8/87 (2006.01)

A61K 8/898 (2006.01)

A61K 8/97 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(86) Número de solicitud europea: **05292099 .8**

(86) Fecha de presentación : **10.10.2005**

(87) Número de publicación de la solicitud: **1676606**

(87) Fecha de publicación de la solicitud: **05.07.2006**

(54) Título: **Composición adelgazante que comprende una base xántica y un copoliol dimeticona con un poliuretano en polvo.**

(30) Prioridad: **17.12.2004 FR 04 53051**

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

(45) Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.12.2007

(72) Inventor/es: **Fonolla Moreno, Angeles y**
Piot, Bertrand

(45) Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.12.2007

(74) Agente: **Ungría López, Javier**

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).

DESCRIPCIÓN

Composición adelgazante que comprende una base xántica y un copoliol dimeticona con un poliuretano en polvo.

5 La presente invención tiene por objeto una composición cosmética que contiene una dimeticona copoliol, una base xántica y un polvo de poliuretano. La invención tiene igualmente por objeto un procedimiento cosmético para luchar contra la celulitis y/o la piel de naranja y/o adelgazar la silueta, consistente en la aplicación tópica de la composición sobre la piel.

10 La adiposidad (o exceso de grasa en el tejido celular subcutáneo) puede tener numerosas causas más o menos complejas.

Ciertas células de la piel, llamadas adipocitos, contienen cantidades variables de grasas en forma de triglicéridos, siendo sintetizados estos triglicéridos *in vivo* por los propios adipocitos según reacciones de tipo enzimático (lipogé-
15 nesis), a partir de los ácidos grasos libres y de la glucosa (tras la degradación de esta última en glicerol) contenidos en el organismo y aportados a éste por medio de ciertos alimentos. Ahora bien, los triglicéridos así formados, y luego almacenados en las células adipocíticas pueden también descomponerse, siempre bajo la acción de enzimas específicas (lipólisis) contenidas en estas mismas células, liberando esta vez ácidos grasos por una parte y glicerol y/o mono-
20 y/o diésteres del glicerol por otra parte. Los ácidos grasos así liberados pueden entonces, o bien difundirse por el organismo para ser allí consumidos o transformados de diferentes formas, o bien ser recaptados (en seguida o un poco más tarde) por los adipocitos para generar de nuevo triglicéridos por lipogénesis.

Si, por diversas razones (nutrición más rica, inactividad, envejecimiento y otros), se instala un desequilibrio sub-
25 tancial en el organismo entre la lipogénesis y la lipólisis, es decir, con mayor precisión, si las cantidades de grasas formadas por lipogénesis se hacen notable y constantemente superiores a las que se eliminan por lipólisis, se produce entonces en los adipocitos una acumulación de triglicéridos que, si se vuelve excesiva, puede traducirse progresiva-
30 mente en la aparición de una piel espesa, con superficie frecuentemente irregular ("piel de naranja") y de consistencia más o menos flácida o gelatinosa, que da finalmente a la silueta un aspecto general desagradable que puede evolucionar entre la simple sobrecarga local (lipodismorfia) y la formación de celulitis, pasando por la gordura verdadera y finalmente la obesidad real.

Es así que, teniendo en cuenta especialmente la profunda incomodidad tanto física como estética, y a veces psico-
lógica, que ocasionan en los individuos afectados, en particular en las mujeres, la adiposidad y la celulitis constituyen
35 actualmente una afección cada vez menos soportada o aceptada.

Se propusieron, pues, soluciones en la técnica anterior para intervenir sobre el metabolismo de los ácidos grasos, que es, como se ha visto, uno de los objetivos privilegiados en el control de esta sobrecarga lipídica adipocitaria.

40 Éste puede ser modulado:

- o bien por bloqueo del transporte de glucosa al interior del adipocito que da lugar, como se ha visto, a una disminución de los ácidos grasos que entran en el adipocito;

- o bien por inhibición de la lipoproteína lipasa;

- o bien por activación de la triglicérido lipasa (o lipasa hormonosensible), generalmente estimulando el AMP cíclico, por ejemplo por activación de la adenil ciclasa, o provocando su acumulación por inhibición de la fosfodiesterasa.

Se han explorado otras vías biológicas para actuar sobre el mecanismo de la lipogénesis y/o de la lipólisis. Se
50 ha propuesto así utilizar antagonistas de los receptores del neuropéptido Y (NPY), que es un neuromediador que interviene en un cierto número de procesos fisiológicos y cuya implicación en la regularización de la lipólisis ha podido ser demostrada (P. Valet, *J. Clin. Invest.*, 1990, 85, 291-295). También se pueden utilizar antagonistas de los receptores α_2 o también agonistas de los receptores β_3 -adrenérgicos.

55 Las composiciones cosméticas propuestas hasta la fecha en vistas a tratar la adiposidad contienen, pues, compuestos llamados adelgazantes que actúan sobre uno o varios de los mecanismos mencionados anteriormente. Entre éstos, se pueden citar más en particular las bases xánticas (es decir, derivados de la xantina), tales como la teofilina, la cafeína y la teobromina.

60 Sin embargo, las bases xánticas como la cafeína tienen el inconveniente de conferir a las composiciones adelgazantes malas propiedades cosméticas experimentadas por la usuaria tras la aplicación de la composición sobre la piel. La piel tratada presenta un efecto pegajoso, una sensación de tirantez y una falta de suavidad; estas propiedades nefastas no satisfacen a la usuaria.

65 El fin de la presente invención es, pues, disponer de una composición cosmética con acción adelgazante que contiene una base xántica y que presenta buenas propiedades cosméticas tras la aplicación de la composición sobre la piel, especialmente buenas propiedades de no pegajosidad y de suavidad.

ES 2 286 777 T3

Los inventores han descubierto que se puede obtener una tal composición utilizando con la base xántica un polvo de poliuretano y una dimeticona copoliol no iónico.

La composición aplicada sobre la piel no presenta efecto pegajoso y confiere una sensación de suavidad agradable sobre la piel, sin efecto de tirantez. Además, la composición presenta una buena eficacia adelgazante.

De forma más precisa, la invención tiene por objeto una composición que contiene, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos una base xántica o un extracto vegetal que la contiene, al menos un polvo de poliuretano y al menos una dimeticona copoliol no iónico.

La invención tiene igualmente por objeto un procedimiento cosmético para luchar contra la celulitis y/o la piel de naranja y/o adelgazar la silueta, consistente en la aplicación sobre la piel de una composición tal como se ha definido anteriormente.

La composición según la invención está generalmente adaptada a una aplicación tópica sobre la piel e incluye, por lo tanto, en general, un medio fisiológicamente aceptable, es decir, compatible con la piel. Se trata preferiblemente de un medio cosméticamente aceptable, es decir, que presenta un color, un olor y un tacto agradables y que no genera incomodidades inaceptables (picazones, tirantezas, enrojecimientos), susceptibles de desanimar a la consumidora de la utilización de esta composición.

La composición según la invención incluye al menos una base xántica o un extracto vegetal que la contiene.

Entre las bases xánticas utilizables según la invención, se pueden citar: la cafeína, la teofilina, la teobromina, la acefilina, el nicotinato de xantanol, la dinipofilina, la diprofilina, la etamifilina y sus derivados, la etofilina, la proxifilina, la pentofilina, la propentofilina, la piridofilina y la bamifilina, sin que esta lista sea limitativa.

Se prefiere en particular utilizar la cafeína, la teofilina, la teobromina y la acefilina, y más particularmente la cafeína. Estas bases xánticas son conocidas como inhibidores de la fosfodiesterasa, que es la enzima responsable de la degradación del AMPc. Aumentando la proporción intracelular de AMPc, estas bases xánticas favorecen la actividad lipolítica y constituyen, pues, principios activos adelgazantes de primer orden.

Como ejemplos de extractos vegetales que contienen bases xánticas, se pueden citar especialmente los extractos de té, de café, de guaraná, de mate y de cola, sin que esta lista sea limitativa.

La base xántica puede estar presente en la composición según la invención en un contenido del 0,01% al 10% en peso con respecto al peso total de la composición, preferiblemente del 0,1% al 7% en peso y preferencialmente del 0,1% al 3% en peso, especialmente del 1% al 3% en peso.

La composición según la invención contiene un polvo de poliuretano. En particular, el polvo de poliuretano no es filmógeno, es decir, que no forma una película continua cuando se deposita sobre un soporte tal como la piel.

Ventajosamente, el polvo de poliuretano es un polvo de copolímero de diisocianato de hexametileno y de trimetilolhexilactona. Tal polvo de poliuretano está especialmente vendido bajo las denominaciones "PLASTIC POWDER D-400" y "PLASTIC POWDER D-800" por la sociedad TOSHIKI.

Como otro polvo de poliuretano, se puede utilizar el vendido bajo la denominación "PLASTIC POWDER CS-400" por la sociedad TOSHIKI.

El polvo de poliuretano puede estar presente en un contenido que va del 0,5% al 10% en peso con respecto al peso total de la composición, y preferiblemente que va del 0,5% al 6% en peso y preferencialmente que va del 0,5% al 3% en peso.

La composición según la invención incluye una dimeticona copoliol no iónico.

La dimeticona copoliol no iónico es un polidimetilmetilsiloxano oxipropilenado y/u oxietilenado que no contiene grupos iónicos (tales como grupos aniónicos, catiónicos o anfotéricos).

Se describen dimeticonas copolioles no iónicas especialmente en la patente US-A-4.268.499.

Una forma de dimeticona copoliol particularmente preferida es la vendida bajo la denominación DOW CORNING 5225C por la sociedad DOW CORNING.

La dimeticona copoliol no iónica puede estar presente en la composición según la invención en un contenido que va del 0,05% al 5% en peso con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,1% al 3% en peso y preferencialmente que va del 0,1% al 2% en peso.

La composición según la invención puede incluir ventajosamente una fase acuosa.

ES 2 286 777 T3

La composición puede incluir agua en un contenido del 30% al 80% en peso con respecto al peso total de la composición, preferiblemente del 40% al 70% y preferencialmente del 45% al 65% en peso.

5 El agua puede ser un agua floral, tal como el agua de aciano, y/o o un agua mineral, tal como el agua de VITTEL, el agua de LUCAS o el agua de LA ROCHE POSAY, y/o un agua termal.

10 La fase acuosa puede incluir al menos un monoalcohol de 2 a 6 átomos de carbono, tal como el etanol y el isopropanol, especialmente en un contenido que va del 1% al 30% en peso con respecto al peso total de la composición, y preferiblemente del 5% al 20% en peso.

15 La fase acuosa puede incluir además ácido salicílico o uno de sus derivados, como el ácido n-octanóico, especialmente presente en un contenido del 0,1% al 5% en peso con respecto al peso total de la composición, preferiblemente del 0,1% al 3% en peso y preferencialmente del 0,1% al 2% en peso.

20 La presencia de monoalcohol y de ácido salicílico en la fase acuosa permite favorecer una buena disolución de la base xántica en la fase acuosa y, por lo tanto, mejorar la eficacia adelgazante de la composición.

25 La composición según la invención puede presentarse en todas las formas galénicas normalmente utilizadas para una aplicación tópica sobre la piel, especialmente en forma de una emulsión de aceite-en-agua o de agua-en-aceite o múltiple, eventualmente gelificada, de una emulsión siliconada, de una microemulsión o nanoemulsión, de un producto anhidro líquido, pastoso o sólido, de una dispersión de aceite en una fase acuosa en presencia de esférulas, pudiendo estas esférulas ser nanopartículas poliméricas tales como las nanoesferas y las nanocápsulas, o mejor vesículas lipídicas de tipo iónico y/o no iónico. Ventajosamente, la composición está en forma de emulsión de aceite-en-agua.

30 Esta composición puede ser más o menos fluida y tener el aspecto de una crema blanca o coloreada, de una pomada, de una leche, de una loción, de un suero, de una pasta, de una espuma o de un gel. Puede eventualmente ser aplicada sobre la piel en forma de aerosol. Puede también presentarse en forma sólida, y por ejemplo en forma de barra.

35 De manera conocida, la composición de la invención puede contener también los adyuvantes habituales en los campos cosmético y dermatológico, tales como los gelificantes hidrófilos o lipófilos, los principios activos hidrófilos o lipófilos, los agentes hidratantes (tales como la glicerina, el propilenglicol, el butilenglicol, el pentilenglicol, el hexilenglicol, el dipropilenglicol y el dietilenglicol), los conservantes, los antioxidantes, los solventes, los perfumes, las cargas, los pigmentos, los filtros hidrófilos, los absorbentes de olor y las materias colorantes. Las cantidades de estos diferentes adyuvantes son las clásicamente utilizadas en los ámbitos considerados, y por ejemplo del 0,01 al 20% del peso total de la composición. Estos adyuvantes, según su naturaleza, pueden ser introducidos en la fase grasa, en la fase acuosa, en las vesículas lipídicas y/o en las nanopartículas.

40 Cuando la composición según la invención es una emulsión, la proporción de la fase grasa puede ir del 5 al 50% en peso y preferiblemente del 5 al 30% en peso con respecto al peso total de la composición.

45 Como materias grasas utilizables en la invención, se pueden utilizar los aceites minerales, los aceites de origen animal, los aceites de síntesis, los aceites siliconados y los aceites fluorados. Se pueden utilizar también como materias grasas ácidos grasos, ceras y gomas, y en particular las gomas de silicona.

50 Los emulsores y los coemulsores eventualmente utilizados en la composición en forma de emulsión son seleccionados entre los clásicamente utilizados en el campo considerado. Estos emulsores y coemulsores están preferiblemente presentes en la composición en una proporción que va del 0,3 al 20% en peso y preferiblemente del 0,5 al 5% en peso con respecto al peso total de la composición. Como emulsores y coemulsores utilizables en la invención, es particularmente ventajoso utilizar los ésteres de ácido graso y de poliol tales como el estearato de PEG-100, el estearato de PEG-50 y el estearato de PEG-40; el triestearato de sorbitán, los estearatos de sorbitán oxietilenados disponibles bajo las denominaciones comerciales Tween® 20 o Tween® 60, por ejemplo; y sus mezclas.

55 Como gelificantes hidrófilos, se pueden citar, en particular, los polímeros carboxivinílicos (carbómeros), los copolímeros acrílicos tales como los copolímeros de acrilatos/alquilacrilatos, las poliacrilamidas, los polisacáridos, 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 y la sílice hidrofóbica.

60 Como principios activos que van a completar la acción de los principios activos según la invención, se pueden utilizar especialmente:

- los principios activos que actúan sobre la microcirculación (vasoprotectores o vasodilatadores), tales como los flavonoides, los extractos de *Ginkgo biloba*, las ruscogeninas, esculosidos, la escina extraída de castaño de Indias, los nicotinatos, la hesperidina metilchalcona, el ruscus o pequeño acebo y los aceites esenciales de lavanda o de romero;

65 - los principios activos reafirmantes y/o antiglicantes (que impiden la fijación del azúcar sobre las fibras de colágeno), tales como los extractos de *Centella asiatica* y de *Siegesbeckia*, que estimulan la síntesis de colágeno, el silicio, la amadorina, la vitamina C y sus derivados y el retinol y sus derivados;

- y sus mezclas.

Bien entendido, el experto en la técnica velará por seleccionar el o los compuestos eventuales que se van a añadir a las composiciones según la invención, así como su concentración, de tal manera que las propiedades ventajosas intrínsecamente ligadas a las composiciones según la invención no resulten alteradas, o no lo sean substancialmente, por la adición contemplada.

La composición antes definida puede ser utilizada para prevenir o luchar contra la celulitis y/o para afinar la silueta o los contornos de la cara.

La invención será ahora ilustrada con ayuda de los siguientes ejemplos no limitativos:

Ejemplos 1 a 4

Se realizaron 3 composiciones adelgazantes según la invención (ejemplos 2 a 4) que contenían una dimeticona copoliol no iónica y un polvo de poliuretano y una composición fuera de la invención (ejemplo 1) que contenía una dimeticona copoliol aniónica y un polvo de sílice.

Se aplicó la composición sobre la piel y se observaron las propiedades cosméticas obtenidas.

Los contenidos están expresados en gramos.

COMPOSICIÓN	Ejemplo 1*	Ejemplo 2	Ejemplo 3	Ejemplo 4
FASE I				
Agua	csp	csp	csp	csp
Gelificante acrílico (1)	0,5	0,5		0,2
Goma de xantano	0,1	0,08		
AMPS (2)		0,1	1	0,6
Glicerina	4	4	5	4
Propilenglicol	3	3	3	3
Cafeína	2,5	2,5	3	4
Ácido salicílico	0,4	0,4	0,5	0,6
FASE II				
Dimeticona copoliol (3)	0	2	3	5
Aceites de siliconas volátiles	9	9	7	5
Pecosil PS-100 (4)	1	-	-	-
Gomas de silicona	0,5	0,5	1	2
Perfume	0,4	0,4	0,5	0,5
FASE III				
Etanol	12	12	16	18

FASE IV				
Polvo de poliuretano (5)		1	0,8	2
Sílice	1			
Propiedades cosméticas	Sin efecto suave. La piel se pega y está tirante. Sensación pegajosa.	Efecto suave y desli- zante, no pega- joso.	Piel muy suave, sin efecto pegajo- so.	Piel muy suave, sin efecto pegajo- so.

*: ejemplo fuera de la invención.

(1) Polímero carboxivinílico vendido bajo la denominación "CARBOPOL 980" por la sociedad NOVEON.

(2) Ácido poliacrilamidopropanosulfónico neutralizado parcialmente con amoníaco y entrecruzado, vendido bajo la denominación "HOSTACERIN AMPS" por la sociedad CLARIANT.

(3) Mezcla de dimeticona copoliol/ciclopentadimetilsiloxano/agua (10/88/2) vendida bajo la denominación "DOW CORNING 5225C FORMULATION AID" por la sociedad DOW CORNING.

(4) Polidimetilsiloxano oxietilenado con grupo fosfato vendido bajo la denominación "PECOSIL PS-100" por la sociedad PHOENIX CHEMICAL.

(5) Polvo de poliuretano vendido bajo la denominación "PLASTIC POWDER D-400" por la sociedad TOSHIKI.

Se constató que las composiciones de los ejemplos 2 a 4 según la invención, tras aplicación sobre la piel, presentan una buena suavidad y no son pegajosas al tacto, mientras que la composición del ejemplo 1 fuera de la invención confiere una tirantez a la piel (sin suavidad) y presenta un aspecto pegajoso.

REIVINDICACIONES

1. Composición que contiene, en un medio fisiológicamente aceptable, al menos una base xántica o un extracto vegetal que la contiene, al menos un polvo de poliuretano y al menos una dimeticona copoliol no iónica.
2. Composición según la reivindicación anterior, **caracterizada** por seleccionar la base xántica entre: la cafeína, la teofilina, la teobromina, la acefilina, el nicotinato de xantanol, la diniprofilina, la diprofilina, la etamifilina y sus derivados, la etofilina, la proxifilina, la pentofilina, la propentofilina, la piridofilina y la bamifilina.
3. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por seleccionar la base xántica entre la cafeína, la teofilina, la teobromina y la acefilina.
4. Composición según la reivindicación anterior, **caracterizada** por seleccionar dicho extracto vegetal entre los extractos de té, de café, de guaraná, de mate y de cola.
5. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por estar presente la base xántica en un contenido del 0,01% al 10% en peso con respecto al peso total de la composición, preferiblemente del 0,1% al 7% en peso y preferencialmente del 0,1% al 3% en peso.
6. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por el hecho de que el polvo de poliuretano no es filmógeno.
7. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por ser el polvo de poliuretano un polvo de copolímero de diisocianato de hexametileno y de trimetilolhexillactona.
8. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por contener un polvo de poliuretano en un contenido del 0,5% al 10% en peso con respecto al peso total de la composición y preferiblemente del 0,5 al 6% en peso y preferencialmente del 0,5% al 3% en peso.
9. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por ser la dimeticona copoliol no iónica un polidimetilmetilsiloxano oxipropileno y/o oxietileno que no contiene grupo iónico.
10. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por estar presente la dimeticona copoliol no iónica en un contenido que va del 0,05% al 5% en peso con respecto al peso total de la composición, preferiblemente que va del 0,1% al 3% en peso y preferencialmente que va del 0,1% al 2% en peso.
11. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por incluir una fase acuosa.
12. Composición según la reivindicación anterior, **caracterizada** por incluir agua en un contenido del 30% al 80% en peso con respecto al peso total de la composición, preferiblemente del 40% al 70% en peso y preferencialmente del 45% al 65% en peso.
13. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 11 ó 12, **caracterizada** por incluir un monoalcohol de 2 a 6 átomos de carbono.
14. Composición según la reivindicación anterior, **caracterizada** por seleccionar el monoalcohol entre el etanol y el isopropanol.
15. Composición según la reivindicación 13 ó 14, **caracterizada** por estar presente el monoalcohol en un contenido del 1% al 30% en peso con respecto al peso total de la composición y preferiblemente del 5% al 20% en peso.
16. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones 12 a 15, **caracterizada** por incluir ácido salicílico o uno de sus derivados.
17. Composición según la reivindicación anterior, **caracterizada** por estar presente el ácido salicílico o sus derivados en un contenido del 0,1% al 5% en peso con respecto al peso total de la composición, preferiblemente del 0,1% al 3% en peso y preferencialmente del 0,1% al 2% en peso.
18. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por presentarse en forma de emulsión de aceite-en-agua.
19. Composición según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, **caracterizada** por incluir un principio activo seleccionado entre los principios activos que actúan sobre la microcirculación, los principios activos reafirmantes y/o antiglicantes y sus mezclas.
20. Procedimiento cosmético para luchar contra la celulitis y/o la piel de naranja y/o adelgazar la silueta, consistente en la aplicación tópica sobre la piel de una composición según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores.