



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 331 881**

51 Int. Cl.:

A61K 8/67 (2006.01)

A61Q 19/08 (2006.01)

A61P 17/02 (2006.01)

A61K 31/455 (2006.01)

A61K 31/375 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **04292288 .0**

96 Fecha de presentación : **23.09.2004**

97 Número de publicación de la solicitud: **1529522**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **11.05.2005**

54

Título: **Composición exfoliante que comprende vitamina B3 y vitamina C.**

30

Prioridad: **29.10.2003 FR 03 50742**

73

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

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
19.01.2010

72

Inventor/es: **Sore, Gabrielle y**
Hansenne, Isabelle

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
19.01.2010

74

Agente: **Curell Suñol, Marcelino**

ES 2 331 881 T3

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 exfoliante que comprende vitamina B3 y vitamina C.

5 La presente invención se refiere a un procedimiento cosmético de exfoliación que comprende la aplicación tópica sobre la piel de una composición adaptada a una aplicación tópica sobre la piel y que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable: (a) de 10 a 70% en peso de por lo menos un compuesto seleccionado de entre: el ácido nicotínico, los ésteres de ácido nicotínico y la nicotinamida, y (b) de 10 a 70% en peso de por lo menos un compuesto seleccionado de entre: el ácido ascórbico y sus precursores seleccionados de entre el palmitato de ascorbilo, el estearato de ascorbilo, el ascorbil fosfato de magnesio, el ascorbil fosfato de sodio, el ascorbil sulfato disódico, el ácido sulfinil-L-ascórbico y el ácido glucopiranosil-L-ascórbico, con respecto al peso total de la composición.

10 Se refiere asimismo a la utilización de la composición citada anteriormente para fabricar una preparación dermatológica destinada a realizar una exfoliación química superficial por aplicación tópica sobre la piel, con objeto de atenuar las arrugas y patas de gallo y/o las manchas pigmentarias y/o las cicatrices tales como las marcas de acné o de varicela.

15 El ácido nicotínico y la nicotinamida son cofactores enzimáticos reagrupados bajo la denominación de “vitamina B3” o “vitamina PP”. Además de su interés nutricional, puesto a disposición en el campo alimentario, la vitamina B3 tiene principalmente propiedades vasodilatadoras, queratolíticas, anti-seborreicas, antiinflamatorias y de regulación de la diferenciación epidérmica y de la proliferación dérmica, así como unas propiedades despigmentadoras, que hacen de ellas un principio activo de calidad en el campo cosmético.

20 Por su parte, el ácido ascórbico, o vitamina C, posee numerosas virtudes que se pueden utilizar en cosmética, y principalmente unas propiedades anti-radicalarias, despigmentadoras, anti-edad, -mediante la estimulación de la biosíntesis de diferentes formas de colágeno, de la laminina, de los proteoglicanos y de las ceramidas epidérmicas y la inhibición de las metaloproteinasas matriciales-.

25 La vitamina C además ha sido descrita como posible constituyente, como agente blanqueador, de una composición exfoliante susceptible de incluir además la nicotinamida como inhibidor de la melanogénesis (US nº 5.874.463) y que incluye, como constituyente esencial, por lo menos un compuesto seleccionado de entre el ácido salicílico, el ácido retinoico, el ácido pirúvico, el resorcinol y el ácido glicólico. En este mismo documento, se utiliza como constituyente minoritario de una exfoliación superficial a base de ácido salicílico.

30 Las exfoliaciones químicas son un medio muy conocido para mejorar el aspecto de la superficie de la piel, en particular para atenuar los defectos de pigmentación tales como los lentigo actínicos o las marcas de acné o de varicela, o para alisar las irregularidades de la textura de la piel, en particular las arrugas y las patas de gallo, provocando una destrucción limitada de la epidermis y de las capas superficiales de la dermis.

35 El documento GB-A-2.210.789 describe una composición tópica para exfoliación que comprende ácido nicotínico como agente vasodilatador y un peróxido como agente queratolítico y descamante.

El documento WO 00/71094 describe una composición exfoliante a base de ácido ascórbico.

40 Las proporciones utilizadas en estos documentos son netamente inferiores a las proporciones en vitaminas C y B3 utilizadas en la presente solicitud.

45 Aunque las composiciones descritas en la patente US nº 5.874.463 hayan podido dar unos resultados satisfactorios, sin embargo no están desprovistas de efectos secundarios. De este modo, las exfoliaciones de ácido salicílico pueden dar lugar a casos de salicilismo en caso de sobredosis o de aplicación prolongada. Además, el ácido retinoico está asociado a riesgos de teratogénesis y aumenta la sensibilidad de la piel frente a los rayos UV.

50 Por lo tanto, existe la necesidad de disponer de composiciones de exfoliación que sean eficaces siendo al mismo tiempo bien toleradas.

55 Actualmente el solicitante ha constatado que las vitaminas B3 y C, o sus precursores, asociadas a fuertes concentraciones en una composición tópica, pueden permitir la realización de exfoliaciones químicas eficaces y bien toleradas, sin que sea necesario añadir otros principios activos exfoliantes.

60 Se han descrito ya en la patente US nº 6.071.888 unas composiciones, susceptibles de ser utilizadas por vía tópica, que comprenden de 1 a 20% en peso de ácido nicotínico (o sus precursores) y de 10 a 30% en peso de ácido ascórbico. Estas composiciones están destinadas al tratamiento de melanomas mediante la estimulación de la respuesta inmunitaria. No se ha previsto que estas composiciones se apliquen sobre pieles que presentan imperfecciones cutáneas visibles o táctiles, y después aclaradas para realizar una exfoliación destinada a atenuar estas imperfecciones.

65 La presente invención tiene por lo tanto por objeto un procedimiento cosmético de exfoliación que comprende la aplicación tópica sobre la piel de una composición adaptada a una aplicación tópica sobre la piel y que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable: (a) de 10 a 70% en peso de por lo menos un compuesto seleccionado de entre:

ES 2 331 881 T3

ácido nicotínico, ésteres de ácido nicotínico y nicotinamida, y (b) de 10 a 70% en peso de por lo menos un compuesto seleccionado de entre: ácido ascórbico y sus precursores, con relación al peso total de la composición.

5 Se refiere asimismo a la utilización de esta composición para fabricar una preparación dermatológica destinada a realizar una exfoliación química superficial mediante aplicación tópica sobre la piel, con objeto de atenuar las arrugas y patas de gallo y/o las manchas pigmentarias y/o las cicatrices tales como las marcas de acné o de varicela.

10 El primer constituyente de la composición según la invención se selecciona de entre el ácido nicotínico, sus ésteres y la nicotinamida. Como ésteres de ácido nicotínico que se pueden utilizar en la presente invención, se pueden citar los ésteres alquílicos de ácido nicotínico y de un alcohol en C₁-C₂₀, seleccionado por ejemplo de entre los alcoholes metílico, etílico, butílico, hexílico, octílico, decílico, dodecílico y miristílico. Se prefiere sin embargo la nicotinamida para una utilización en la presente invención.

15 El segundo constituyente de esta composición se selecciona de entre el ácido ascórbico y sus precursores. Los precursores del ácido ascórbico, se seleccionan de entre el palmitato de ascorbilo, el estearato de ascorbilo, el ascorbil fosfato de magnesio, el ascorbil fosfato de sodio, el ascorbil sulfato disódico, el ácido sulfínico-L-ascórbico y el ácido glucopiranosil-L-ascórbico. Se prefiere el ácido ascórbico para una utilización en la presente invención.

20 La cantidad de cada uno de los compuestos (a) y (b) según la invención representa de 10 a 70% en peso de la composición. Preferentemente, la cantidad de compuesto (a) está comprendida entre 10 y 50% del peso de la composición y, mejor, entre 10 y 40% del peso de la composición. La cantidad de compuesto (b) está comprendida preferentemente entre 10 y 50% del peso de la composición y, mejor, entre 10 y 40% del peso de la composición. El experto en la materia sabrá ajustar estas cantidades en función de la profundidad de la exfoliación que debe realizarse, es decir, de las capas de epidermis o de dermis que deben ser retiradas.

25 La composición según la invención está adaptada a una aplicación tópica sobre la piel y comprende por lo tanto generalmente un medio fisiológicamente aceptable, es decir compatible con la piel y opcionalmente con sus faneros.

30 Puede presentarse bajo todas las formas galénicas utilizadas habitualmente para una aplicación tópica, siempre que se elimine fácilmente por aclarado, y principalmente en forma de gel acuoso, de solución acuosa o hidroalcohólica. Asimismo puede, con la ayuda de una fase grasa u oleosa, presentarse en forma de dispersión o del tipo loción o de emulsión de consistencia líquida o semilíquida, obtenida preferentemente por dispersión de una fase grasa en una fase acuosa (H/E). Estas composiciones se preparan según los métodos habituales.

35 Según una forma de realización preferida de la invención, la composición contiene una fase acuosa continua.

40 Cuando la composición está en forma de emulsión, la proporción de la fase oleosa de la emulsión puede estar comprendida por ejemplo entre 1 y 30% en peso, y preferentemente entre 5 y 20% en peso en relación al peso total de la composición. Los aceites, los emulsionantes y los coemulsionantes utilizados en la composición en forma de emulsión se seleccionan de entre los utilizados habitualmente en el campo cosmético o dermatológico. El emulsionante y el coemulsionante están generalmente presentes en la composición, en una proporción comprendida entre 0,3 y 30% en peso, y preferentemente entre 0,5 y 20% en peso con relación al peso de la composición. La emulsión puede, además, contener unas vesículas lipídicas.

45 Como materias grasas que se pueden utilizar en la invención, se pueden utilizar los aceites y principalmente los aceites minerales (aceite de vaselina), los aceites de origen vegetal (aceite de aguacate, aceite de soja), los aceites de síntesis (perhidroescualeno), los aceites siliconados (ciclometicona) y los aceites fluorados (perfluoropolíéters).

50 Como emulsionantes y coemulsionantes que se pueden utilizar en la invención se pueden citar por ejemplo los ésteres de ácido graso y de polietilenglicol tales como el estearato de PEG-100, estearato de PEG-50, y el estearato de PEG-40; los ésteres de ácido graso y de poliol tales como el estearato de glicerilo, el triestearato de sorbitano y los estearatos de sorbitano oxietilenados disponibles bajo las denominaciones comerciales Tween[®] 20 o Tween[®] 60, por ejemplo; y sus mezclas.

55 La composición según la invención puede contener asimismo los adyuvantes habituales en los campos cosmético y dermatológico, tales como espesantes, principios activos, conservantes, disolventes y cargas. Las cantidades de estos diferentes adyuvantes son las utilizadas habitualmente en los campos considerados, y por ejemplo de 0,01 a 20% del peso total de la composición. Estos adyuvantes, según su naturaleza, pueden ser introducidos en la fase grasa o en la fase acuosa. Los adyuvantes, así como sus concentraciones, deben ser tales que no perjudiquen a las propiedades de los compuestos según la invención.

60 Como espesantes, se pueden citar en particular: la goma de xantano, un homo- o copolímero de ácido acrílico opcionalmente reticulado, una poli(acrilamida), un homo- o copolímero de ácido acrilamido metilpropanosulfónico, y los derivados de celulosa tales como la hidroxipropilcelulosa.

65 La composición contiene ventajosamente por lo menos un compuesto seleccionado de entre los alcoholes y los polioles que comprenden de 1 a 3 átomos de carbono. Como ejemplos de dichos compuestos, se pueden citar el etanol, el isopropanol, el glicerol y el propilenglicol.

ES 2 331 881 T3

Además, según una forma de realización preferida de la invención, la composición no contiene ácido retinoico ni ácido glicólico, ni resorcinol, ni ácido pirúvico, ni ácido salicílico, ni quitosán.

5 Como se ha indicado anteriormente, esta composición está destinada a ser utilizada para realizar una exfoliación química superficial con objeto de atenuar las arrugas y patas de gallo y/o las manchas pigmentarias y/o las cicatrices. La composición se utiliza preferentemente en personas que presentan acné y/o arrugas y/o cicatrices y/o defectos de pigmentación tales como melasmas y lentigos seniles o actínicos. Puede aplicarse sobre la cara y/o el cuello y/o el escote y/o las manos y/o la espalda.

10 El procedimiento según la invención comprende preferentemente las etapas que consisten en:

(a) aplicar por vía tópica sobre una zona de piel humana una composición tal como la definida en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6,

15 (b) dejar la composición en contacto con la piel durante un periodo comprendido entre 5 minutos y 6 horas, y

(c) eliminar la composición mediante aclarado.

20 Preferentemente, la composición se deja en contacto con la piel, en la etapa (b), durante un periodo comprendido entre 5 y 30 minutos.

25 La composición utilizada según la invención puede aplicarse por cualquier medio que permita un reparto uniforme y principalmente con la ayuda de un algodón, de una varilla, de un pincel, de una gasa, de una espátula o de un tampón, o incluso por pulverización, y puede eliminarse mediante aclarado con agua o con la ayuda de un detergente suave después de permanecer en contacto con la piel.

30 Para optimizar sus efectos, el procedimiento de exfoliación comprende preferentemente unas etapas adicionales de preparación de la piel para la exfoliación (para mejorar la eficacia y la homogeneidad de la exfoliación) y/o de cuidado de la piel después de la exfoliación con ayuda de composiciones que contienen cantidades más pequeñas de vitamina B3 y/o de vitamina C que la composición descrita anteriormente.

35 Las composiciones utilizadas en estas etapas preliminar y suplementaria se pueden aplicar por la mañana y por la tarde, por ejemplo, opcionalmente junto con una composición destinada a proteger la piel contra los efectos de los rayos UV. La composición de pretratamiento se puede aplicar durante una a cuatro semanas y la composición después del tratamiento durante un día a ocho semanas, por ejemplo.

40 El procedimiento de exfoliación anterior, incluidas las etapas preliminar y suplementaria opcionales, se puede efectuar una sola vez o renovarse hasta cinco veces, si fuera necesario, espaciándose con preferencia las sesiones de exfoliación de una a ocho semanas.

La invención se ilustrará a continuación mediante los ejemplos siguientes no limitativos. En estos ejemplos, las cantidades están indicadas en porcentajes en peso.

45 Ejemplos

Ejemplo 1

50 *Composición de exfoliación antiarrugas*

Se prepara la siguiente composición de manera clásica para el experto en la materia:

55 Niacinamida	10%
Ácido ascórbico	10%
Glicerina	10%
60 Agua purificada	c.s.p. 100%

Esta composición se puede aplicar en forma de exfoliación para atenuar las arrugas y las patas de gallo faciales.

65

ES 2 331 881 T3

Ejemplo 2

Composición de exfoliación blanqueadora

5 Se prepara la siguiente composición de manera clásica para el experto en la materia:

	Niacinamida	15%
	Ácido ascórbico	15%
10	Panteteína-sulfonato cálcico	5%
	Propilenglicol	30%
15	Agua purificada	c.s.p. 100%

Esta composición se puede aplicar en forma de exfoliación para atenuar las discromías (lentigos actínicos o seniles, melasmas).

20

Ejemplo 3

Composición de exfoliación anti-acné

25 Se prepara la siguiente composición de manera clásica para el experto en la materia:

	Niacinamida	12%
	Ácido ascórbico	12%
30	Hidroxipropilcelulosa	2%
	Etanol	30%
35	Agua purificada	c.s.p. 100%

Esta composición se puede aplicar en forma de exfoliación para atenuar las marcas de acné.

40

45

50

55

60

65

REIVINDICACIONES

5 1. Procedimiento cosmético de exfoliación que comprende la aplicación tópica sobre la piel de una composición adaptada a una aplicación tópica sobre la piel y que comprende, en un medio fisiológicamente aceptable: (a) de 10 a 70% en peso de por lo menos un compuesto seleccionado de entre: el ácido nicotínico, los ésteres de ácido nicotínico y la nicotinamida, y (b) de 10 a 70% en peso de por lo menos un compuesto seleccionado de entre: el ácido ascórbico y sus precursores, siendo dichos precursores seleccionados de entre el palmitato de ascorbilo, el estearato de ascorbilo, el ascorbil fosfato de magnesio, el ascorbil fosfato de sodio, el ascorbil sulfato disódico, el ácido sulfinil-L-ascórbico y el ácido glucopiranosil-L-ascórbico, con respecto al peso total de la composición.

10 2. Procedimiento según la reivindicación 1, **caracterizado** porque los ésteres de ácido nicotínico se seleccionan de entre: los ésteres alquílicos de ácido nicotínico y de un alcohol C₁-C₂₀.

15 3. Procedimiento según la reivindicación 2, **caracterizado** porque los ésteres de ácido nicotínico se seleccionan de entre: los alcoholes metílico, etílico, butílico, hexílico, octílico, decílico, dodecílico y miristílico.

20 4. Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, **caracterizado** porque la cantidad de compuesto (a) representa de 10 a 50% del peso total de la composición.

25 5. Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, **caracterizado** porque la cantidad de compuesto (b) representa de 10 a 50% del peso total de la composición.

30 6. Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, **caracterizado** porque la composición no contiene ácido retinoico ni ácido glicólico, ni resorcinol, ni ácido pirúvico, ni ácido salicílico ni quitosán.

35 7. Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, **caracterizado** porque comprende las etapas que consisten en: (a) aplicar por vía tópica sobre una zona de piel humana una composición tal como la definida en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, (b) dejar la composición en contacto con la piel durante un periodo comprendido entre 5 minutos y 6 horas, y (c) eliminar la composición mediante aclarado.

40 8. Procedimiento según la reivindicación 7, **caracterizado** porque la composición se deja en contacto con la piel, en la etapa (b), durante un periodo comprendido entre 5 min. y 30 min.

45 9. Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, **caracterizado** porque la composición se aplica sobre la cara y/o el cuello y/o el escote y/o las manos y/o la espalda.

50 10. Utilización de una composición tal como la definida en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 para fabricar una preparación dermatológica destinada a realizar una exfoliación química superficial por aplicación tópica sobre la piel, con objeto de atenuar las arrugas y patas de gallo y/o las manchas pigmentarias y/o las cicatrices.

55 11. Utilización según la reivindicación 10, **caracterizada** porque las cicatrices son marcas de acné o de varicela.

60 12. Utilización según la reivindicación 10, **caracterizada** porque la composición se aplica en personas que presentan acné y/o arrugas y/o cicatrices y/o defectos de pigmentación.

50

55

60

65