



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 367 523**

51 Int. Cl.:

A61K 8/92 (2006.01)

A61K 8/97 (2006.01)

A61K 8/02 (2006.01)

A61Q 19/08 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **99939502 .3**

96 Fecha de presentación : **26.08.1999**

97 Número de publicación de la solicitud: **1176946**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **06.02.2002**

54

Título: **Composición cosmética que contiene aceites de *Cynara Cardunculus* o de *Silybum Marianum*.**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
04.11.2011

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
04.11.2011

73

Titular/es: **Jean Julia**
128 route Nationale
66550 Corneilla la Rivière, FR

72

Inventor/es: **Julia, Jean**

74

Agente: **De Justo Bailey, Mario**

ES 2 367 523 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 cosmética que contiene aceites de *Cynara cardunculus* o de *Silybum marianum*

5 La presente invención se refiere a una composición para uso cosmético e higiene corporal basada en aceite de *Cynara cardunculus* o de *Silybum marianum*. Se refiere igualmente a un procedimiento de extracción de aceite adaptado a la fabricación de una composición para uso cosmético e higiene corporal.

10 Ciertos sujetos de la familia de los cardos son conocidos por su eficacia con respecto a ciertas afecciones. Es así que el *Cnicus benedictus* ejerce sus efectos sobre la digestión y la fiebre, la cardencha (*Dipsacus silvestris*) sobre el eczema y el acné, el *Cynara cardunculus* y el *Silybum marianum* sobre el hígado, las varices y las hemorroides. Igualmente, son conocidas por la patente JP5345705 composiciones cosméticas que contienen extractos de *Cynara scolymus* y *Silybum marianum*, así como el empleo de extractos de frutas de *Silybum marianum* en composiciones cosméticas como la mencionada en la solicitud de patente EP 0.236.218.

15 Se ha evidenciado, así como se describe en la patente francesa 2.716.371, que el uso en productos cosméticos de aceite producido mediante compresión en frío a alta presión de granos de *Cynara cardunculus* daba lugar a buenos resultados en los campos cutáneos y capilares.

20 En la prolongación del trabajo emprendido sobre el aceite de *Cynara Cardunculus*, un estudio sistemático de este aceite ha mostrado que había la posibilidad de mejorar de manera sorprendente sus aplicaciones asociándolo con otras sustancias cuyos compuestos actúan sinérgicamente con los del aceite de *Cynara Cardunculus*. Otro estudio ha mostrado que podían obtenerse resultados similares con un aceite obtenido mediante compresión en frío a alta presión de granos de *Silybum marianum*.

25 Según la presente invención, se propone una composición para uso cosmético e higiene corporal que contiene el aceite producido mediante mezclado y compresión en frío a alta presión de granos de *Cynara cardunculus* o de *Silybum marianum* no descascarillados, conteniendo dicho aceite silimarina que favorece la absorción cutánea de la invención y, por otra parte, un extracto de hojas de *Cynara cardunculus*, planta de la familia de los cardos, cuyo extracto contiene cinarina y ácido clorogénico.

30 El aceite producido mediante mezclado y compresión en frío a alta presión de granos de *Cynara cardunculus* o de *Silybum marianum* contiene silimarina directamente biodisponible a una dosis alta y constante (276 mg por litro, o sea 300 mg por kilogramo de aceite de *Cynara cardunculus*). Contiene igualmente una cantidad alta de ácido linoleico y ácido oleico, aminoácidos, especialmente prolina y glicina, fitoesteroles contenidos en las fracciones insaponificables, vitamina E y betacarotenos biodisponibles.

35 Un extracto de plantas de la familia de los cardos que comprende especialmente *Cynara cardunculus*, *Silybum marianum*, *Dipsacus silvestris*, *Cnicus benedictus* y *Cynara scolymus*, contiene polifenoles, especialmente derivados cafeicos, especialmente cinarina y ácido clorogénico, y flavonoides.

40 La silimarina favorece la absorción cutánea de la composición. Además, al actuar la silimarina sinérgicamente con la cinarina tiene un efecto antirradical alto, El efecto antioxidante y de trampa de radicales libres está reforzado por la presencia en la composición de otros antioxidantes tales como vitamina E y betacaroteno. Estos constituyentes permiten además a aminoácidos tales como prolina y glicina regenerar el colágeno, del que son los componentes principales. Ahora bien, el colágeno es con la elastina uno de los elementos principales que permiten una buena firmeza de los tejidos epidérmicos.

45 Además, el ácido clorogénico es un venotónico que va a estimular la circulación en los capilares de superficie, lo que va a favorecer la eliminación de toxinas. Esta acción va a cooperar con la acción de los flavonoides conocidos por su acción que conlleva la mejora de los mecanismos de eliminación de lípidos. La silimarina, debido a su afinidad por membrana, reduce el paso de membrana y conlleva la bajada de la penetración de productos tóxicos.

50 Según otro aspecto de la presente invención, la composición se presenta en forma de leche, gel, crema, pomada, bálsamo, emulsión, champú o máscara. Contiene entre 0,5% y 98% de aceite, según el efecto buscado. Contiene ventajosamente entre 5 y 25% de aceite, especialmente para las leches y cremas. Según un modo de realización actualmente preferido para una crema o leche, contiene aproximadamente un 10% de aceite.

55 El contenido en silimarina de la composición depende directamente de la cantidad de aceite presente en la composición, vista la estabilidad del contenido en silimarina del aceite producido por mezclado y compresión en frío a alta presión de granos de *Cynara cardunculus* o de *Silybum marianum*.

60 Según la presente invención, el extracto en cuestión es un extracto de hojas de *Cynara cardunculus*, planta de la familia de los cardos.

65 Las hojas son efectivamente ideales para la extracción de los principios activos, especialmente cinarina y

flavonoides. La hoja de *Cynara cardunculus* contiene estos principios activos en gran cantidad.

Según otro aspecto de la presente invención, la composición contiene entre 0,1 y 50% de extracto de hojas de *Cynara cardunculus* en función de la composición de este extracto. Contiene ventajosamente entre 0,1 y 50% de dicho extracto en función del contenido en polifenoles del extracto, tales como derivados cafeicos y flavonoides. Ventajosamente, especialmente cuando la composición contiene aproximadamente un 10% de aceite, contiene entre 0,1 y 10% de extracto.

El contenido en principios activos del extracto de planta de la familia de los cardos depende efectivamente del periodo de recolección de la planta, así como de la técnica de extracción. Un estudio ha mostrado que las concentraciones de derivados cafeicos totales y de flavonoides totales son respectivamente 1,65 y 3,5 veces más altos en la primavera que en el otoño en los extractos de alcachofas obtenidos según el mismo protocolo. Asimismo, un estudio ha mostrado que una técnica de extracción en medio acuoso en caliente es la mejor adaptada cuando se desea obtener un extracto rico en ácido clorogénico. En contraposición, el tratamiento de hojas de *Cynara Cardunculus* mediante una solución hidroalcohólica a 45/55% vol/vol parece convenir mejor para la extracción de cinarina.

Se describen a continuación los modos de realización preferidos de la presente invención.

20 1. Obtención de aceite de granos de *Cynara cardunculus*

Se cultivan *Cynara cardunculus*. Se cultiva la planta como el girasol, estando totalmente mecanizado el cultivo. Se hace la recolección con cosechadora trilladora clásica axial para no dañar los granos. Los rendimientos de granos oleaginosos son del orden de 1,5 a 2 toneladas por hectárea en cultivo realizado normalmente. Estos granos tienen un contenido de aceite de 16 a 18% para el primer ciclo de cultivo y de 22 a 26% para los siguientes. Esto da lugar, en el caso de una extracción por compresión en frío, a un porcentaje de 12 a 14% de aceite virgen en el primer ciclo y de 15 a 18% para los siguientes.

La extracción de aceite se hace exclusivamente por primera compresión sin calentamiento de los granos no descascarillados. La temperatura no supera la debida al frotamiento de piezas metálicas, cuyo máximo es del orden de 40 a 50°C. Los protocolos de trituración de granos y de extracción de aceite son los descritos en las especificaciones de agricultura biológica.

El aceite así obtenido contiene especialmente los elementos siguientes.

35 Ácidos grasos

Ácido mirístico	0,12%
Ácido palmítico	11,12%
Ácido esteárico	2,75%
Ácido oleico	21,15%
Ácido linoleico	63,10%
Ácido araquídico	0,30%
Ácido γ -linolénico	0,05%
Ácido α -linolénico	0,33%

40 Fracciones de ésteres

β -Sistoesterol	43,1 %
δ -7-Estigmaesterol	26,7%
Estigmaesterol	13,1 %

Aminoácidos

45 Aminoácidos por 100 g

Ácido aspártico	1800 mg
Treonina	790 mg

Serina	880 mg
Ácido glutámico	2380 mg
Prolina	3370 mg
Glicina	6610 mg
Alanina	2760 mg
Cistina total	190 mg
Valina	760 mg
Metionina	180 mg
Isoleucina	400 mg
Leucina	850 mg
Tirosina	150 mg
Fenilalanina	510 mg
Lisina	910 mg
Histidina	170 mg
Arginina	1980 mg
Triptófano	50 mg

Otros componentes

Silimarina	276 mg/l
β-Caroteno	4 mg/l
Vitamina E	270 mg/l

5 En lo referente a los ácidos grasos esenciales, el aceite contiene una gran cantidad de ácidos linoleico y oleico. Contiene un 65% de ácidos grasos poliinsaturados y un 22% de ácidos grasos monoinsaturados. Se dosifica idealmente por tener un efecto importante con un papel de precursor de prostaglandinas.

10 Los ácidos grasos esenciales contenidos en el aceite intervienen igualmente al nivel de la estructura de las membranas celulares.

15 En lo referente a los aminoácidos, todos los aminoácidos esenciales están presentes en el aceite de *Cynara cardunculus*. Tienen especialmente un papel de vectores o transmisores. Intervienen igualmente en el campo hormonal, al nivel de la célula, al nivel inmunitario y son detoxificantes.

20 En lo referente a los ésteres contenidos en las fracciones insaponificables, los fitoesteroles contenidos en el aceite de *Cynara cardunculus* se dosifican correctamente y se reparten dentro de las fracciones insaponificables. Se sabe especialmente que contribuyen a la lucha contra la deposición de colesterol, en particular en el sistema cardiovascular. Algunas investigaciones han mostrado que la absorción de fitoesteroles reducía de manera notable la tasa de colesterol sanguíneo. Causan igualmente una protección aumentada de la célula. Además, estas sustancias tienen un efecto importante como sustitutos de los estrógenos naturales en las mujeres menopáusicas o premenopáusicas.

25 En lo referente a la vitamina E, está contenida en gran cantidad en el aceite de *Cynara cardunculus* en forma de RRR-D-α-tocoferol natural. Esta forma natural posee una biodisponibilidad dos veces superior a la de la forma sintética de la vitamina E. La vitamina E se comporta como un antioxidante, protegiendo de la oxidación a los lípidos en circulación y a los lípidos de las membranas celulares.

30 El aceite contiene igualmente betacaroteno, que es especialmente el precursor de la vitamina E en el organismo.

En lo referente a la silimarina contenida en el aceite de *Cynara cardunculus*, está directamente biodisponible, lo que no es el caso de, por ejemplo, la silimarina extraída químicamente de bala de aqueno de cardo mariano.

35 Según estudios realizados sobre la silimarina, esta última tiene compatibilidad de membrana con la célula. Su acción se traduce especialmente por una acción protectora frente a lesiones producidas por productos tóxicos debido a que la afinidad de membrana reduce la permeabilidad de la membrana, y por una acción regeneradora debido al

aumento de la multiplicación de células que conlleva. Favorece el aumento de la síntesis proteica de las mitocondrias epiteliales al inducir una regeneración acelerada de los tejidos epiteliales.

2. Obtención de un extracto de hojas de *Cynara cardunculus*

5 Se obtiene el extracto a partir de hojas enteras congeladas de *Cynara cardunculus*. Un lote de hojas se ha recogido en primavera, otro en otoño. Se han usado tres procedimientos de extracción.

Extracto 1

10 Se obtuvo un extracto acuoso a partir de 4,8 kg de hojas de otoño congeladas cortadas y 7,2 kg de agua. Se llevó a ebullición el conjunto durante 2 horas limitando la evaporación. Se recupera a continuación la parte sólida con la ayuda de un tamiz grueso y se reserva la parte líquida o "jugo". Se comprime la parte sólida con la ayuda de una prensa de husillo, se añade el líquido obtenido al "jugo" reservado y se enfría todo a 4°C durante 24 horas. Se filtra todo a continuación después de la adición de conservante.

Extracto 2

20 Se obtuvo un extracto glicólico mediante maceración a partir de 20 g de hojas de otoño congeladas cortadas, 95 g de propilenglicol, 50 g de agua y 2 g de conservante. Se realiza la maceración a temperatura ambiente en un vaso de precipitados de vidrio protegido de la luz. Se agita la planta cada 3 o 4 días con la ayuda de una varilla de teflón. La maceración dura 3 semanas, después de lo cual se recoge la solución mediante tamizado y después compresión en un lienzo y luego filtración por papel filtrante. Después de estimar el contenido de propilenglicol por refractometría, se añade propilenglicol con el fin de obtener una solución que contiene tanto agua como propilenglicol.

Extracto 3

30 Se obtiene un extracto acuoso en las mismas condiciones que para el extracto 1, pero a partir de hojas recogidas en primavera, justo antes de la floración (aparición de la yema).

Una valoración efectuada en los tres extractos dio los siguientes resultados.

Extracto analizado	Derivados cafeicos (g/l)	Flavonoides (g/l)
<u>Extracto 1</u>	2,59	0,147
<u>Extracto 2</u>	0,654	0,102
<u>Extracto 3</u>	4,29	0,510

35 Ha de observarse que, visto el procedimiento de dosificación usado en este estudio, las concentraciones de derivados cafeicos pueden estar sobrevaloradas. Estas concentraciones permiten no obstante constatar bien las variaciones en función del periodo de recolección de las plantas y del procedimiento de extracción.

40 En lo referente al contenido más particular de ácido clorogénico y cinarina, una valoración dio los resultados siguientes.

Extracto analizado	Ácido clorogénico (g/l)	Cinarina (g/l)
<u>Extracto 1</u>	0,353	0,172
<u>Extracto 2</u>	0,061	0,126
<u>Extracto 3</u>	0,557	0,868

3. Obtención de una composición para uso cosmético e higiene corporal

45 Se dan aquí varios ejemplos de composiciones cosméticas y de higiene corporal que usan una mezcla de granos de *Cynara cardunculus* tal como se obtiene de la manera descrita en (1) y un extracto acuoso de hojas recolectadas en primavera de *Cynara cardunculus* (extracto 3) tal como se obtiene de la manera descrita en (2).

1. Crema de día

50 Esta composición contiene:

- 10% de aceite;

- 2% de extracto de hojas;

- filtro solar;

5

- ceramidas vegetales;

- factor hidratante.

10 Su aplicación permite hidratar y nutrir en profundidad la piel. Se estimula la circulación en los capilares de superficie. Se forma una película protectora en la superficie, que alisa y suaviza la epidermis. En profundidad, la composición activa la regeneración de la piel y la reparación de los trastornos intracelulares, facilitando la circulación y por tanto la eliminación de toxinas.

15 2. Cuidado de noche

Esta composición contiene:

- 10% de aceite;

20

- 2% de extracto de hojas;

- ceramidas vegetales;

25

- textura nutritiva.

3. Cuidado antienvjecimiento

Esta composición contiene:

30

- 10% de aceite;

- 5% de extracto de hojas;

35

- factor ARL;

- extracto de ginseng;

- alantoína;

40

- ceramidas vegetales.

La asociación de flavonoides del aceite (silimarina), los contenidos en el complejo ARL y los contenidos en el extracto de hojas produce una acción regeneradora intensa.

45

El extracto de ginseng refuerza la tonificación, las ceramidas vegetales refuerzan la protección de las capas superficiales de la epidermis, la alantoína calma las irritaciones cutáneas y favorece la multiplicación celular.

4. Máscara de crema

50

Esta composición contiene:

- 5% de aceite;

55

- 5% de extracto de hojas;

- extracto de hipérico.

Combina a la vez las funciones regenerativa, desincrustante, venotónica, tranquilizante y alisante.

60

5. Leche corporal

Esta composición contiene:

65

- 18% de aceite;

- 5% de extracto de hojas;

- agentes hidratantes;

5 - ceramidas vegetales.

10 Se trata de una leche corporal particularmente hidratante. Su alto contenido en silimarina (10 mg por matraz de 200 mg) permite una absorción cutánea máxima. Va a permitir a la piel luchar contra los radicales libres y las toxinas procedentes de agresiones externas. El extracto de hojas refuerza el poder antioxidante, especialmente debido a la presencia de cinarina, y aporta un efecto tonificante y venotónico con el ácido clorogénico. Los flavonoides absorbidos tienen un efecto detoxificante que permite luchar eficazmente contra los trastornos intracelulares.

6. Leche desmaquilladora

15 Esta composición contiene:

- 10% de aceite;

- 2% de extracto de hojas;

20 - agentes hidratantes;

- ceramidas vegetales.

25 Todos los componentes de las composiciones que se acaban de describir tienen en común los campos de acción sobre el organismo humano. Sus acciones actúan sinérgicamente y sus efectos se encuentran aumentados con relación a lo que serían individualmente.

REIVINDICACIONES

- 5 1. Composición para uso cosmético e higiene corporal, caracterizada porque contiene, por una parte, aceite producido mediante mezclado y compresión en frío, a alta presión, de granos de *Cynara cardunculus* o de *Silybum marianum* no descascarillados, conteniendo dicho aceite silimarina que favorece la absorción cutánea de la composición, y, por otra parte, un extracto de hojas de *Cynara cardunculus*, planta de la familia de los cardos, conteniendo dicho extracto cinarina y ácido clorogénico.
- 10 2. Composición para uso cosmético e higiene corporal según la reivindicación 1, caracterizada porque, presentándose en forma de leche, gel, crema, pomada, bálsamo, emulsión, champú o máscara, contiene entre 0,1 y 98% de dicho aceite.
- 15 3. Composición para uso cosmético e higiene corporal según la reivindicación 1, caracterizada porque contiene entre 5 y 25% de dicho aceite.
4. Composición para uso cosmético e higiene corporal según la reivindicación 1, caracterizada porque contiene aproximadamente un 10% de dicho aceite.
- 20 5. Composición para uso cosmético e higiene corporal según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizada porque contiene entre 0,1 y 50% de dicho extracto de hojas.