

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 732 455**

51 Int. Cl.:

A61K 36/23 (2006.01)

A61K 31/728 (2006.01)

A61P 17/00 (2006.01)

A61Q 19/06 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **08.07.2009 PCT/EP2009/004924**

87 Fecha y número de publicación internacional: **28.01.2010 WO10009809**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **08.07.2009 E 09777023 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.05.2019 EP 2318024**

54 Título: **Combinaciones de principios activos a partir de extracto de fruto de anís y ácido hialurónico**

30 Prioridad:

22.07.2008 DE 102008034265

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

22.11.2019

73 Titular/es:

**BEIERSDORF AG (100.0%)
Unnastrasse 48
20253 Hamburg, DE**

72 Inventor/es:

**ESPEL, ANJA;
SCHÄFER, JESSICA;
FEY, SVEN;
BREITENBACH, UTE;
KNOTT, ANJA;
MUMMERT, CHRISTOPER y
SCHERNER, CATHRIN**

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

Observaciones:

Véase nota informativa (Remarks, Remarques o Bemerkungen) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 732 455 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

Combinaciones de principios activos a partir de extracto de fruto de anís y ácido hialurónico

- 5 La presente invención se refiere a combinaciones de principios activos a partir de una cantidad eficaz de extracto de fruto de anís y ácido hialurónico, así como a preparados cosméticos que comprenden estas combinaciones de principios activos.
- 10 Con cosmética pueden resumirse todas las medidas que dan lugar por motivos estéticos a cambios en la piel y el cabello o se emplean para la limpieza del cuerpo. La cosmética también significa el cuidado de la parte externa del cuerpo, con el fin de mejorarlo y embellecerlo para que de forma visible, palpable y odorable sea del agrado de los demás y de uno mismo.
- 15 El objetivo del cuidado de la piel consiste además en equilibrar la pérdida de grasa y agua de la piel producida por el lavado diario. Esto es importante precisamente cuando la capacidad de regeneración natural no es suficiente. Los productos para el cuidado de la piel han de proteger además de ello contra influencias del entorno, en particular contra el sol y el viento y retrasar el envejecimiento de la piel.
- 20 El envejecimiento de la piel cronológico es producido, por ejemplo, por factores endógenos, genéticamente determinados. En la epidermis y dermis se producen debido al envejecimiento por ejemplo los siguientes trastornos estructurales y de tipo funcional, que se pueden englobar también bajo el concepto de "xerosis senil":
- a) sequedad, aspereza y formación de arrugas por sequedad,
 - b) prurito y
 - 25 c) reengrasado reducido por parte las glándulas sebáceas (por ejemplo, después del lavado).
- Los factores exógenos como la luz UV y las noxas químicas se pueden activar cuando se acumulan y acelerar, por ejemplo, los procesos endógenos de envejecimiento o bien completarlos. En la epidermis y la dermis se producen en particular debido a factores exógenos por ejemplo las siguientes alteraciones estructurales y de tipo funcional en la
- 30 piel, que exceden la medida y la calidad de los trastornos en el envejecimiento cronológico;
- d) dilatación visible de los vasos (teleangiectasias, cuperosis);
 - e) flacidez y formación de arrugas;
 - f) hiper-, hipopigmentaciones, faltas de pigmentación localizadas (por ejemplo, manchas por envejecimiento) y
 - 35 g) elevada propensión frente a estrés mecánico (por ejemplo, formación de grietas).
- La presente invención se refiere en particular a productos para el cuidado de la piel envejecida de forma natural, así como de los fenómenos indicados en a), e) y g).
- 40 Los productos para el cuidado de la piel laxa, en particular la piel envejecida son conocidos en sí. Contienen, por ejemplo, retinoides (ácido de vitamina A y/o sus derivados) o bien vitamina A y/o sus derivados. Su efecto sobre los trastornos estructurales está en general limitado en volumen. Además de ello, existen dificultades considerables en el desarrollo de los productos, para estabilizar los principios activos en suficiente medida contra la disgregación oxidativa. El uso de productos con contenido de ácido de vitamina A da lugar además de ello a menudo a irritaciones cutáneas eritematosas fuertes. Los retinoides pueden emplearse por lo tanto solo en pequeñas concentraciones.
- 45 Con frecuencia la piel laxa se relaciona también con un síntoma de sobrepeso y/o con la llamada celulitis ocasionada por el mismo.
- 50 En los últimos años ha crecido considerablemente la concienciación sobre el cuerpo de los consumidores. A este respecto, además de las aplicaciones para el lavado y cuidado se toman otras medidas para mejorar la silueta corporal. La celulitis, un fenómeno muy extendido, ocupa a este respecto un lugar central. La imagen visible de la celulitis se basa en un incremento de la acumulación de grasa en la hipodermis (tejido graso subcutáneo), en una debilidad del tejido conjuntivo, así como en una reducción de las condiciones circulatorias en las vías sanguíneas y
- 55 linfáticas. El motivo es por tanto una debilitación debida en parte a la predisposición, del tejido conjuntivo con aparición simultánea de cámaras de células grasas engrosadas como consecuencia del sobrepeso, de una alimentación no equilibrada, de la falta de movimiento. La formación de celulitis puede atribuirse además de ello a una elevada permeabilidad de las paredes de los vasos capilares, que permite la penetración de agua en el tejido conjuntivo.
- 60 Además de ello puede existir una carencia localizada de testosterona en las zonas cutáneas correspondientes. En cualquier caso la celulitis es un fenómeno que casi nunca se observa en los hombres.
- 65 Ha sido por tanto tarea de la presente invención hallar las vías para evitar las desventajas del estado de la técnica. Ha sido una tarea de la presente invención en particular poner a disposición preparados que puedan lograr un estiramiento ventajoso de la piel laxa.

Otra tarea de la presente invención ha sido poner a disposición preparados para el cuidado cutáneo y preparados para el cuidado de la piel, debiendo dichos preparados cuidar y embellecer el aspecto externo del cuerpo. Los preparados deberían mejorar a este respecto en particular también la humedad de la piel.

5 Ha podido verse de manera sorprendente que un preparado cosmético caracterizado porque contiene una cantidad activa desde el punto de vista cosmético de extracto de fruto de anís y ácido hialurónico de acuerdo con la reivindicación 1, resuelve las desventajas del estado de la técnica.

10 El uso de preparados conforme a la invención con un contenido eficaz desde el punto de vista cosmético de extracto de fruto de anís y ácido hialurónico, por ejemplo en forma de los ejemplos mencionados, conduce sorprendentemente a una mejora considerable del aspecto de la piel, en particular utilizando preparados conforme a la invención

- se mantienen o bien recuperan las propiedades de barrera de la piel,
- 15 • se contrarresta mejor la sequedad de la piel, así como
- se protege mejor la piel de las influencias ambientales.

Mediante el uso de preparados conforme a la invención, se eleva además de ello la humedad de la piel y la humedad en profundidad de la piel, durando este efecto de cuidado de humectación de la piel y la protección contra la pérdida de humedad varias horas o incluso todo el día o más.

20 Responde también a la invención por lo tanto el uso de preparados cosméticos que contienen una cantidad eficaz desde el punto de vista cosmético de extracto de fruto de anís y de ácido hialurónico, para incrementar la humedad de la piel o bien para la humectación de la piel.

25 Los preparados conforme a la invención se adecuan de manera excelente además de ello para el cuidado de la piel sensible.

30 Ha resultado también sorprendente que mediante el uso de los preparados conforme a la invención mejora la elasticidad de la piel, del cabello y/o de las uñas y por lo tanto la celulitis o bien el aspecto de la llamada "piel de naranja".

35 Los preparados cosméticos o dermatológicos contienen preferentemente conforme a la invención de 0,001 a 30 % en peso, preferentemente de 0,1 a 15 % en peso, de manera particularmente preferente de 0,5 a 5 % en peso de extracto de fruto de anís y ácido hialurónico, referido correspondientemente al peso total del preparado.

40 Conforme a la invención es ventajoso en particular un extracto de fruto de anís acuoso (INCI: Pimpinella anis fruit extract), que es rico en minerales inorgánicos como iones de sodio y de magnesio, en particular en iones de potasio y se conserva con butilenglicol 0,36 % y parabenos 0,14 % y puede obtenerse mediante hidrólisis enzimática de frutos de anís solubilizados en agua, de manera que la proporción de material en bruto con respecto a extracto es de aproximadamente 1 : 2 y puede obtenerse con los nombres comerciales de Bioxilift® de la empresa SILAB, (Brive Cedex, Francia).

45 En el caso del extracto de fruto de anís (Bioxilift®, empresa SILAB) se trata de un extracto de fruto de anís acuoso.

El extracto presenta un color tipo ámbar y tiene un olor característico a anís. Es rico en minerales inorgánicos como iones de sodio y de magnesio, pero en particular en iones de potasio.

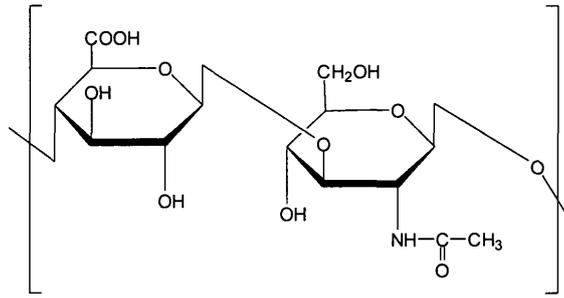
La composición específica es:

50	Masa en seco:	40 - 60 g/l
	Cenizas minerales:	11 - 18 g/l
	Proteínas totales:	12 - 20 g/l
55	pH	4,5 - 5,5

El extracto puede producirse o almacenarse en forma no conservada o también conservada. Su preparación se describe en el documento de solicitud de patente internacional WO 02/102347.

60 Una posible conservación es por ejemplo con butilenglicol 0,36 % y parabenos 0,14 % y es soluble en etanol hasta una proporción de 40/60 etanol/agua (v/v). En la preparación se solubilizan los frutos de anís en agua y se hidrolizan enzimáticamente. La proporción de material en bruto con respecto a extracto es de 1 : 2. Se separan las fases solubles y no solubles y a continuación se filtran o bien se filtran en condiciones estériles tras ello.

65 El ácido hialurónico es un derivado de polisacárido, el cual se caracteriza por el siguiente elemento estructural:



El ácido hialurónico es un glicosaminoglicano, que aparece en el tejido conjuntivo, en el humor vítreo, en el cordón umbilical y en el líquido sinovial de las articulaciones. El ácido hialurónico está presente en una medida particularmente alta en etapas embrionarias tempranas y participa aquí de migraciones celulares, en cuanto que protege unas de otras debido a su estructura suelta y un alto contenido de agua, las células que lo exprimen en su superficie y de esta manera permite su movimiento libre. El ácido hialurónico participa de la sanación de heridas.

El ácido hialurónico es un compuesto de alto peso molecular con pesos moleculares de entre 40000 y varios millones. El ácido hialurónico de cadena corta se usa con un máximo de masa molar media de entre 40.000 y 60.000 g/mol, en particular de por ejemplo 52.000 g/mol, es decir, 52 KDa. De acuerdo con la invención es igualmente ventajoso cuando el ácido hialurónico se presenta en forma protonada, como sal, como sal protonada parcialmente, disociado en solución o disociado parcialmente.

De acuerdo con la invención la concentración de ácido hialurónico con respecto al peso total del preparado es ventajosamente de 0,001 a 10 % en peso, preferentemente de 0,05 a 5 % en peso y de manera muy particularmente preferente de 0,01 a 2 % en peso, referido correspondientemente al peso total del preparado.

De manera ventajosa se seleccionan porcentajes en peso de extracto de fruto de anís y de ácido hialurónico de entre los intervalos de 1 : 10 a 10 : 1, preferentemente de 1 : 5 a 5 : 1, de manera particularmente preferente de 1 : 3,33 a 3,3 : 1.

Las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención pueden anexionarse sin problemas a preparados cosméticos y/o dermatológicos habituales, como preparados de protección solar, preparados para el cuidado de la piel, preparados para combatir las arrugas, pero también otros preparados, por ejemplo preparados farmacéuticos.

Los preparados cosméticos o dermatológicos pueden estar compuestos de acuerdo con la invención tal como es habitual y servir para el tratamiento, el cuidado y la limpieza de la piel y/o del cabello y como producto para maquillaje en la cosmética decorativa.

Es posible también y ventajoso en el sentido de la presente invención incorporar las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención en sistemas acuosos o preparados tensioactivos para la limpieza de la piel y del cabello.

Los preparados cosméticos y dermatológicos de acuerdo con la invención pueden comprender agentes auxiliares cosméticos como se usan habitualmente en este tipo de preparados, por ejemplo, agentes conservantes, bactericidas, perfumes, sustancias para evitar la formación de espuma, colorantes, pigmentos, los cuales tienen un efecto de coloración, agentes espesantes, sustancias con actividad en superficie, emulsionantes, sustancias plastificantes, humectantes y/o de retención de la humedad, grasas, aceites, ceras u otros constituyentes habituales de una formulación cosmética o dermatológica, tales como alcoholes, polioles, polímeros, estabilizantes de espuma, electrolitos, agentes disolventes orgánicos o derivados de silicona.

La cantidad de agentes antioxidantes (uno o varios compuestos) en los preparados es preferentemente de 0,001 a 30 % en peso, de manera particularmente preferente de 0,05 – 20 % en peso, en particular de 1 – 10 % en peso, referido al peso total del preparado.

La fase lipídica se puede seleccionar ventajosamente del siguiente grupo de sustancias:

- aceites minerales, ceras minerales
- aceites, tales como triglicéridos del ácido caprílico o caprílico, además de ello aceites naturales tales como, por ejemplo, aceite de ricino;
- grasas, ceras y otros cuerpos grasos naturales y sintéticos, preferentemente ésteres de ácidos grasos con alcoholes de bajo número de C, por ejemplo, con isopropanol, propilenglicol o glicerina, o ésteres de alcoholes grasos con ácidos alcanóicos de bajo número de C o con ácidos grasos;
- benzoatos de alquilo;

- aceites de silicona tales como dimetilpolisiloxanos, dietilpolisiloxanos, difenilpolisiloxanos, así como formas mixtas de los mismos.

5 La fase oleosa de las emulsiones, oleogeles o bien hidrodispersiones o dispersiones lipídicas en el sentido de la presente invención se selecciona ventajosamente del grupo de los ésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados y/o insaturados, ramificados y/o no ramificados con una longitud de cadena de 3 a 30 átomos de C y alcoholes saturados y/o insaturados, ramificados y/o no ramificados con una longitud de cadena de 3 a 30 átomos de C, del grupo de los ésteres de ácidos carboxílicos aromáticos y alcoholes saturados y/o insaturados, ramificados y/o no ramificados con una longitud de cadena de 3 a 30 átomos de C. Este tipo de aceites de éster se pueden seleccionar entonces ventajosamente del grupo isopropilmiristato, isopropilpalmitato, isopropilestearato, isopropiloleato, n-butilestearato, n-hexilaurato, n-decileato, isoctilestearato, isononilestearato, isononilisononanoato, 2-
10 etilhexilpalmitato, 2-etilhexilaurato, 2-hexildecilestearato, 2-octildodecilpalmitato, oleiloleato, oleilerucato, eruciloleato, erucilerucato, así como mezclas sintéticas, semisintéticas y naturales de estos ésteres, por ejemplo, aceite de jojoba.

15 La fase acuosa de los preparados de acuerdo con la invención contiene dado el caso ventajosamente alcoholes, dioles o polioles de bajo número de C, así como sus éteres, preferentemente etanol, isopropanol, propilenglicol, glicerina, etilenglicol, etilenglicolmonoetil- o monobutiléter, propilenglicolmonometil-, -monoetil- o -monobutiléter, dietilenglicolmonometil- o -monoetiléter y productos análogos, además de ello alcoholes de bajo número de C, por ejemplo, etanol, isopropanol, 1,2-propandiol, glicerina, así como en particular uno o varios agentes espesantes, el cual o los cuales pueden seleccionarse ventajosamente del grupo dióxido de silicio, silicato de aluminio, polisacáridos o sus derivados, por ejemplo goma xantana, hidroxipropilmetilcelulosa, de manera particularmente ventajosa del grupo de los poliácridatos, preferentemente un poliácridato del grupo de los llamados carbopoles, por ejemplo carbopoles de los tipos 980, 981, 1382, 2984, 5984, respectivamente solo o en combinación.

20 En particular se usan mezclas de los agentes disolventes mencionados anteriormente. En el caso de los agentes disolventes alcohólicos el agua puede ser un componente adicional.

30 Las emulsiones de acuerdo con la invención son ventajosas y comprenden por ejemplo las grasas, aceites, ceras y otros cuerpos grasos mencionados, así como agua y un emulsionante, como se usa habitualmente para un tipo de formulación de estas características.

35 Los geles de acuerdo con la invención comprenden habitualmente geles de bajo número de C, por ejemplo etanol, isopropanol, 1,2-propandiol, glicerina y agua o bien un aceite mencionado anteriormente en presencia de un agente espesante, que en caso de geles oleosos-alcohólicos es preferentemente dióxido de silicio o un silicato de aluminio, en geles acuosos-alcohólicos o alcohólicos preferentemente un poliácridato.

40 Como agente expansor para preparados de acuerdo con la invención que pueden ser pulverizados desde recipientes de aerosol son adecuados los agentes expansores licuados volátiles habitualmente conocidos, por ejemplo hidrocarburos (propano, butano, isobutano), los cuales pueden usarse individualmente o mezclados entre sí. También puede usarse de manera ventajosa aire comprimido.

45 Los preparados de acuerdo con la invención pueden comprender ventajosamente también sustancias, las cuales absorben radiación UV en el rango UVB, siendo la cantidad total de las sustancias filtro por ejemplo de 0,1 % en peso a 30 % en peso, preferentemente de 0,5 a 10 % en peso en particular de 1,0 a 6,0 % en peso, referido al peso total de los preparados, para poner a disposición preparados cosméticos, los cuales protegen el cabello o la piel contra la totalidad del rango de la radiación ultravioleta. Pueden servir también como agente de protección solar para el cabello o la piel.

50 Los siguientes ejemplos han de aclarar la siguiente invención sin limitar la misma. Todas las indicaciones sobre cantidades, proporciones y proporciones porcentuales son, siempre y cuando no se indique lo contrario, porcentajes en peso, referidos al peso y a la cantidad total o bien al peso total de los preparados.

Ejemplo 1	
I	% en peso
1,2-hexanodiol	1,00
Alcohol de behenilo	2,00
Triglicérido de ácido caprílico/ácido caprínico	6,00
Carbómero	0,30
Alcohol cetílico	3,00
Dicaprililéter	5,00
Etilhexilglicerina	0,00

(continuación)

Ejemplo 1	
I	% en peso
Glicerina	0,50
Citrato de estearato de glicerilo	1,50
Metilpropanodiol	4,00
Fenoxietanol	0,50
Polimetilsilsesquioxano	2,00
Hialuronato sódico	0,10
Alcohol estearílico	4,00
Dióxido de titanio + trimetoxicaprilsilano	2,00
Agua + Pimpinella Anisum (extracto de fruto de anís)	3,50
Hidróxido de sodio	0,60
Agua	Hasta 100,00

Ejemplo 2	
I	% en peso
Polímero cruzado de acrilato/acrilato de alquilo C10-C30	0,10
Dicaprilato/dicaprato de butilenglicol	3,50
Butyrospermum Parkii (manteca de karité)	6,00
Alquilbenzoato C12-15	1,50
Triglicérido de ácido caprílico/ácido caprínico	1,00
Alcohol de cetilestearilo	3,00
Alcohol cetílico	4,00
Chondrus Crispus (carragenano)	0,50
Dietilamino hidroxibenzoil hexil benzoato	3,00
Dimeticona	0,50
Salicilato de etilhexilo	4,00
Glicerina de etilhexilo	0,50
Glicerina	10,00
Estearato de glicerilo SE	2,00
Metilparabeno	0,10
Metilpropanodiol	2,00
Cera microcristalina + aceite mineral	1,50
Fenoxietanol	0,30
Ácido fenilbenzimidazol sulfónico	1,50
R rojo 40	0,10
Hialuronato sódico	0,10
TiO ₂ + hidróxido de Al + copolímero de dimeticona/meticona	1,00
Acetato de tocoferilo	0,50
Na ₃ HEDTA	1,00
Agua + Pimpinella Anisum (extracto de fruto de anís)	4,00
Agua + NaOH	0,70
Agua	Hasta 100,00

Ejemplo 3	
I	% en peso
Polímero cruzado de acrilato/acrilato de alquilo C10-C30	0,15
Dicaprilato/dicaprato de butilenglicol	8,00
Butyrospermum Parkii (manteca de karité)	3,00
Alquilbenzoato C12-15	1,00
Triglicérido de ácido caprílico/ácido caprínico	6,00
Caprililglicol	0,25
Alcohol de cetilestearilo	5,00
Chondrus Crispus (carragenano)	0,25
Dimeticona	1,00
Glicerina de etilhexilo	0,50
Glicerina	10,00
Estearato de glicerilo	2,00
Metilparabeno	0,20
Pantenol	1,50
Fenoxietanol	0,50
Rojo 40	0,03
Hialuronato sódico	0,20
Glutamato estearoil de sodio	0,30
Amarillo crepúsculo	1,00
Acetato de tocoferilo	0,50
EDTA trisódico	1,00
Agua + Pimpinella Anisum (extracto de fruto de anís)	5,00
Hidróxido de sodio	0,08
Agua	Hasta 100,00

REIVINDICACIONES

- 5 1. Combinaciones de principios activos a partir de una cantidad eficaz de un extracto de fruto de anís acuoso y ácido hialurónico, **caracterizadas por que** el ácido hialurónico se selecciona del grupo de los ácidos hialurónicos con pesos moleculares de 40.000 a 60.000 g/mol, en particular de aproximadamente 52.000 g/mol.
2. Preparados cosméticos, que contienen combinaciones de principios activos según la reivindicación 1.
- 10 3. Preparado según la reivindicación 2, **caracterizado por que** la concentración de extracto de fruto de anís se selecciona del 0,0001 al 30 % en peso
4. Preparado según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado por que** la concentración de extracto de fruto de anís se selecciona del 0,5 al 10 % en peso.
- 15 5. Preparado según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizado por que** la concentración de ácido hialurónico se selecciona del 0,5 al 10 % en peso.
- 20 6. Combinaciones de principios activos o preparados según una de las reivindicaciones anteriores, **caracterizadas por que** las proporciones de peso de extracto de fruto de anís y ácido hialurónico se seleccionan de los intervalos 1 : 10 a 10 : 1, preferentemente de 1 : 5 a 5 : 1, de manera particularmente preferente de 1 : 3,33 a 3,3 : 1.