

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 755 103**

51 Int. Cl.:

A61K 8/44 (2006.01)

A61Q 7/02 (2006.01)

A61K 8/9789 (2007.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **16.09.2016 PCT/IB2016/001306**

87 Fecha y número de publicación internacional: **23.03.2017 WO17046644**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **16.09.2016 E 16794403 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **04.09.2019 EP 3349722**

54 Título: **Tratamiento tópico del hirsutismo**

30 Prioridad:

17.09.2015 IT UB20153691

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

21.04.2020

73 Titular/es:

**BMG PHARMA S.P.A. (100.0%)
Via Federico Confalonieri 29
20124 Milano, IT**

72 Inventor/es:

MASTRODONATO, MARCO LUCIO

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 755 103 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

Tratamiento tópico del hirsutismo

5 La presente invención se refiere a composiciones dermatológicas diseñadas para inhibir el crecimiento de vello no deseado; en particular, en los rostros de mujeres.

Técnica antecedente

10 El "hirsutismo" se define como el crecimiento de vello en partes del cuerpo femenino en las que normalmente está ausente. Dicha afección puede tener varias causas que, además de las predisposiciones genéticas, incluyen tumores endocrinos, síndrome de ovario poliquístico, hiperplasia suprarrenal congénita y el uso de medicamentos como corticosteroides, progestágenos, minoxidil, diazóxido y fenitoína.

15 Las mujeres que padecen este problema, que implica problemas estéticos y psicológicos obvios, utilizan principalmente procedimientos de depilación convencionales, tales como ceras depilatorias calientes o frías, cremas blanqueadoras, cremas depilatorias, remoción mecánica por afeitado o roscado, y tratamientos con láser. Dichos procedimientos obviamente se deben repetir a intervalos variables y no resuelven el problema de forma permanente.

20 Se han propuesto también remedios farmacológicos basados en inhibidores de 5-alfa-reductasa, ornitina descarboxilasa, S-adenosilmetionina descarboxilasa, gamma-glutamil transpeptidasa y transglutaminasa. Consulte, en particular, los documentos US 4.885.289, US 4.720.489, US 5.095.007, US 5.096.911 y US 5.132.293.

25 El documento US 5648394 divulga una formulación en crema de un inhibidor de la ornitina descarboxilasa, alfa-difluoroornitina o eflornitina, que se usa actualmente, bajo el nombre comercial Vaniqa®, para el tratamiento del hirsutismo.

30 Otras formulaciones de eflornitina se describen en los documentos US 2003/0523973 y WO 2007/031950.

Aunque es eficaz, la eflornitina presenta algunos inconvenientes asociados con su alto costo y las dificultades de formulación, que se ilustran, por ejemplo, en el documento US 2003/0523973.

35 También debe tenerse en cuenta que la eflornitina, propuesta previamente para el tratamiento de tumores cutáneos y queratosis actínica, es un medicamento bastante potente y puede requerir la prescripción de un médico.

40 Por consiguiente, existe la necesidad de formulaciones que inhiban el crecimiento superfluo del vello que contienen ingredientes activos baratos formulados fácilmente sin necesidad de usar excipientes especiales o promotores de absorción, y que sean seguros de usar, y que tengan poco o ningún riesgo de efectos secundarios.

Descripción de la invención

45 Se ha encontrado ahora que la capriloil glicina, un lipoaminoácido usado convencionalmente en diversas composiciones cosméticas por sus propiedades antimicrobianas y de regulación del pH, combate eficazmente el hirsutismo cuando se aplica tópicamente.

Por lo tanto, la presente invención se refiere a composiciones tópicas para el tratamiento del hirsutismo que comprenden capriloil glicina como ingrediente activo, mezclado con vehículos dermatológicamente aceptables.

50 La invención también se refiere al uso cosmético de capriloil glicina para inhibir el crecimiento de vello en el cuerpo, especialmente en la cara.

55 Las formulaciones de acuerdo con la invención pueden tomar cualquier forma adecuada para administración tópica, tal como gel, crema, espuma, pomada, loción, aerosol o líquido.

La capriloil glicina está usualmente presente en las formulaciones de acuerdo con la invención en concentraciones que varían del 1 al 20% en peso, y preferentemente del 2,5 al 15% en peso.

60 La eficacia de las formulaciones puede incrementarse adicionalmente agregando otros ingredientes activos, preferentemente seleccionados de extractos de *Curcuma longa*, extractos de soja en general y extractos de *Gymnema sylvestre*.

65 Las concentraciones de dichos extractos pueden variar del 0,1 al 5% en peso para *Curcuma longa*, del 1 al 20% en peso para extractos de soja y del 1 al 10% en peso para extractos de *Gymnema sylvestre*. Las formulaciones contendrán preferentemente extractos de soja en porcentajes que varían de 5 a 15% en peso.

Los vehículos dermatológicos adecuados incluyen emulsiones de aceite en agua o de agua en aceite, agentes espesantes, agentes antiespumantes, emulsionantes, tensioactivos, perfumes, éteres de polietilenglicol de alcoholes alquílicos y copolímeros de óxido de etileno/óxido de propileno.

Si se desea, también se pueden agregar otros inhibidores de la ornitina descarboxilasa, inhibidores de la S-adenosilmetionina descarboxilasa, inhibidores de la gamma-glutamyl transpeptidasa o inhibidores de la transglutaminasa a las formulaciones. Por ejemplo, las formulaciones pueden incluir eflornitina, opcionalmente en concentraciones más bajas que las utilizadas hasta la fecha y actualmente comercializadas. Sin embargo, la presencia de eflornitina no es necesaria para producir los efectos contra el hirsutismo debido a la capriloil glicina, que ha demostrado ser completamente eficaz incluso cuando no se combina con otros ingredientes activos.

Dichos efectos se deben probablemente a propiedades que implican la inhibición de la enzima ornitina descarboxilasa. Sin embargo, la utilidad de la invención no depende en modo alguno de la verificación de dicho mecanismo de acción hipotético.

La invención se ilustra con mayor detalle en los ejemplos a continuación.

Ejemplo 1

agua purificada 49,7%
lipacida 5% (capriloil glicina)
propilenglicol 33%
sepigel 3%
ciclopentasiloxano 4%
propil parabeno 0,1%
metil parabeno 0,1%
hidrato de sodio a pH de 5/5,5
extractos de soja titulados 5%

Ejemplo 2

lipacida 10% (capriloil glicina)
propilenglicol 30%
sepigel 3%
ciclopentasiloxano 4%
propil parabeno 0,1%
metil parabeno 0,1%
hidrato de sodio a pH de 5/5,5
extractos de soja titulados 5%
agua c.s.

Ejemplo 3

Lipacida C8G (capriloil glicina) 4%
Palmatina soportada en microperlas de nylon de 5 micrómetros y suspendida en un vehículo aceitoso (Depiline®) 2%
Isoflavonas de soja 1,5%
Vitamina PP 1,5%

Ejemplo 4

La capacidad de la capriloil glicina para inhibir el crecimiento de vello superfluo se evaluó mediante el procedimiento Trichoscan® (<http://trichoscan.com/pages/english/professional-info/reference-values.php>). Una crema de capriloil glicina al 10% mostró tener una eficacia comparable a la de eflornitina, como se reporta en Eur. J Dermatol 2008; 18(1):65-70.

REIVINDICACIONES

- 5 1. Capriloil glicina para su uso en la inhibición del crecimiento de vello en el cuerpo en el tratamiento del hirsutismo.
2. Capriloil glicina para su uso de acuerdo con la reivindicación 1 para inhibir el crecimiento de vello en la cara.
- 10 3. Capriloil glicina para su uso de acuerdo con la reivindicación 1 o 2 en combinación con uno o más ingredientes activos seleccionados de extractos de *Curcuma longa*, soja, *Gymnema sylvestre*, eflornitina.
4. Capriloil glicina para su uso de acuerdo con la reivindicación 3 en combinación con extractos de soja.
- 15 5. Capriloil glicina para uso de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-4 administrada tópicamente en concentraciones de 1 a 20% en peso.