



(19) INSTITUTO NACIONAL
DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL
PORTUGAL

(11) *Número de Publicação:* PT 93813 B

(51) *Classificação Internacional:* (Ed. 6)

A61K007/06 A

A61K007/48 B

A61K007/04 B

(12) *FASCÍCULO DE PATENTE DE INVENÇÃO*

(22) *Data de depósito:* 1990.04.19

(30) *Prioridade:* 1989.04.20 CH 1498/89
1989.12.09 DE 3940724

(43) *Data de publicação do pedido:*
1990.11.20

(45) *Data e BPI da concessão:*
06/96 1996.06.18

(73) *Titular(es):*

ERWIN STUCKLER
HASELBACHSTRASSE 18 D-7891 BANNHOLZ-AY
DE

(72) *Inventor(es):*

(74) *Mandatário(s):*

JORGE BARBOSA PEREIRA DA CRUZ
RUA DE VÍTOR CORDON 10-A 3/AND. 1200 LISBOA
PT

(54) *Epígrafe:* PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE UM PRODUTO PARA O TRATAMENTO DAS UNHAS, DA PELE E DOS CABELOS, CONTENDO TRIGONELINA E VITAMINA B6

(57) *Resumo:*

[Fig.]

DESCRIÇÃO
DA
PATENTE DE INVENÇÃO

N.º 93 813

REQUERENTE: ERWIN STUCKLER, alemão, industrial, com sede em Haselbachstrasse 18, D-7891 Bannholz-Ay, República Federal Alemã.

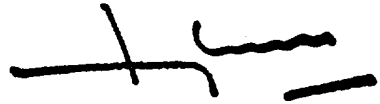
EPÍGRAFE: " PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE UM PRODUTO PARA O TRATAMENTO DAS UNHAS; DA PELE E DOS CABELOS, CONTENDO TRIGONELINA E VITAMINA B6 ".

INVENTORES:

Reivindicação do direito de prioridade ao abrigo do artigo 4.º da Convenção de Paris de 20 de Março de 1883.

Suiça, em 20 de Abril de 1989, sob o nº. 01 498/89-0 e na República Federal Alemã, em 09 de Dezembro de 1989, sob o nº. P 39 40 724.1.

93.813



ERWIN STUCKLER

"PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE UM PRODUTO PARA O TRATAMENTO DAS
UNHAS, DA PELE E DOS CABELOS, CONTENDO TRIGONELINA E VITAMINA B6"
=====

MEMORIA DESCRITIVA

Resumo

O presente invento diz respeito a um processo para a preparação de um produto para o tratamento das unhas, da pele e dos cabelos destinado ao combate à queda progressiva de cabelo e à estimulação do crescimento de novos cabelos nos seres humanos, que consiste em se incluir no referido produto como quantidade de administração diária, na forma a ser administrada diariamente, respectivamente, a) 80 a 500 mg de trigonelina e b) 1 a 5 mg de vitamina B6.

É também referido o processo para para o tratamento das unhas, da pele e dos cabelos utilizando o referido produto.

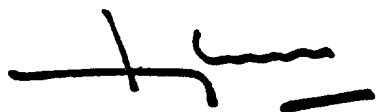
O presente invento diz respeito a um processo para a preparação de um produto para o tratamento das unhas, da pele e dos cabelos destinado ao combate à queda progressiva de cabelo e à estimulação do crescimento de novos cabelos nos seres humanos.

É conhecido através do pedido de patente europeu 0 289 639 um produto para a revigoração, a estimulação e o fortalecimento do crescimento do cabelo. O produto contém o alcalóide trigonelina ou ácido de trigonelina. Indica-se também que deve ser adicionada ao produto a vitamina B6. Através da patente europeia não se fica porém a saber que quantidade do ou dos produtos activos e em que sequência devem, por exemplo, ser administrados ao corpo humano para se atingirem os objectivos propostos.

Isto é desvantajoso na medida em que um reduzido adicionamento da trigonelina não origina os efeitos desejados e, a sua administração em doses demasiado elevadas, para além dos custos envolvidos, obriga a ter em conta efeitos secundários indesejáveis. Surpreendentemente, chegou-se agora à conclusão de que se pode obter um êxito regular com um novo produto contendo trigonelina. Concluiu-se ainda, com surpresa, que o referido meio também era valioso para o tratamento das unhas, pele e cabelo.

De acordo com o presente invento, isso é obtido com um produto contendo na forma de administração diária

- a) 100 a 500 mg de trigonelina e
- b) 1 a 5 mg de vitamina B6.



- 3 -

Entende-se por trigonelina o composto hidróxido de 3-carboxi-1-metil-piridínio, também conhecido sob a designação corrente de cofearina.

As quantidades referidas dizem respeito à forma química pura dos compostos.

A trigonelina pode ser utilizada na forma sintetizada. Uma forma particularmente valiosa e, conseqüentemente, também preferida da trigonelina pode ser extraída das sementes de certa espécie de trevo (Bockshornklee). Os extractos desse tipo são, em si, de há muito conhecidos e constituem uma mistura de diversos componentes susceptíveis de serem extraídos de partes da planta, em particular das sementes da espécie Trigonella foenum graecum. A trigonelina pode, por exemplo, ser obtida através de um dos processos de extracção conhecidos, tais como a maceração ou a percolação.

A mistura atrás definida de piroxidina, piridoxal e piridoxamina engloba a vitamina B6. A vitamina B6 tem sido suficientemente descrita na literatura da especialidade, podendo ser obtida por via sintética, semi-sintética ou a partir de produtos naturais.

O produto preferido contém, tal como atrás se refere,

- a) 100 a 400 mg de trigonelina, e
- b) 2 a 4 mg de vitamina B6.

Fazem igualmente parte das composições preferidas as que contêm 10 a 50 mg de ácido nicotínico e/ou amida de ácido nicotínico.



- 4 -

Uma outra composição preferida pode conter de 1 a 4 mg de riboflavina.

Outras composições preferidas contêm 0,2 a 1 mg de ácido fólico.

Contam-se igualmente entre as composições preferidas as que contêm 5 a 25 mg de d-pantotenato de cálcio.

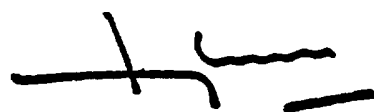
São particularmente preferidas as composições contendo pelo menos duas das substâncias seguintes: ácido nicotínico e/ou amida de ácido nicotínico, riboflavina, ácido fólico e/ou d-pantotenato de cálcio.

As substâncias referidas, bem como o d-pantotenato de cálcio, são conhecidos da cosmética capilar.

Descobriu-se agora que as substâncias preferidas atrás mencionadas, pertencentes ao grupo da vitamina B, conduzem, nas quantidades referidas, juntamente com as quantidades de trigonelina e de vitamina B6 de acordo com o invento, a composições vantajosamente eficazes.

As composições de acordo com o invento podem também conter os aminoácidos cisteína e/ou lisina. A cisteína e a lisina são compostos conhecidos, representando a lisina um aminoácido essencial e a cisteína um aminoácido não essencial. A cisteína propriamente dita encontrou aplicação na cosmética capilar como uma substância conhecida na formação da queratina.

São particularmente preferidas as substâncias que contêm, por exemplo, pólen de flores, que por sua vez contêm riboflavina, cisteína e rutina. A quantidade de pólen de flores

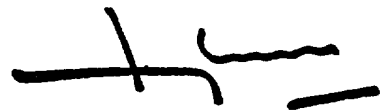


pode estar compreendida, por exemplo, entre 100 e 1500 mg, em particular entre 1000 e 1500 mg e, de preferência, entre 1000 e 1300 mg.

É também preferido um produto contendo um ou vários compostos do tipo do hidrogeno-fosfato de cálcio, extracto aquoso de raiz de urtigas e de folhas de urtigas, em particular de folhas novas, nitrato de tiamina (vitamina B1), vitamina B12, vitamina B8, metionina, uma mistura de histidina, lisina e arginina, de preferência na proporção de 1:4:12, óleo de alho e/ou extracto de alho ou, pelo menos, os compostos de aliina e/ou de aliicina neles contidos, um extracto de urtigas, tussilago, aquílea, alecrim, sálvia, equiseto, flor de trevo ou de bétula, um complexo de vitaminas A, E e/ou F, vitamina H ou aminoácidos contendo enxofre.

Tal como atrás se referiu, são também preferidos os produtos contendo uma ou várias das substâncias a seguir mencionadas, por exemplo, levedura de cerveja, podendo utilizar-se quantidades compreendidas entre, por exemplo, 10 e 1000 mg, vantajosamente 100 e 800 mg e, de preferência, 200 e 500 mg; óleo de gérmen de trigo, em quantidades situadas entre, por exemplo, 10 e 1000 mg, vantajosamente 100 e 800 mg e, de preferência, 200 e 500 mg; óleo de fígado de bacalhau, por exemplo em quantidades situadas entre 10 e 1000 mg, vantajosamente 100 e 800 mg e, de preferência, 200 e 500 mg.

O produto pode conter, eventualmente, outros adjuvantes, tais como solventes, emulsionantes e/ou estabilizadores. Constituem exemplos de solventes o álcool etílico, o óleo de soja hidratado, o óleo de soja, o óleo de amendoim (oleum arachidis) e a água. São exemplos de emulsionantes a lecitina de soja e a lecitina pura de soja sob a forma de pó. São exemplos de



estabilizadores o nipastato e o di-alfa-nicoferol. Uma composição particularmente preferida deverá conter na sua forma de administração diária 80 a 500 mg de trigonelina ou de ácido de trigonelina, de preferência sob a forma de extracto das plantas da espécie Trigonella, 1 a 5 mg de vitamina B6, 10 a 50 mg de ácido nicotínico, 1 a 4 mg de riboflavina, 0,2 a 1 mg de ácido fólico, 5 a 25 mg de d-pantotenato de cálcio e 1000 a 1300 mg de pólen de flores.

A administração do produto pode efectuar-se de várias formas. Uma vez que cada uma das substâncias é solúvel na água e/ou no álcool etílico, pode preparar-se, por exemplo, uma composição aquosa tal como um xarope. As formas de administração aquosa têm o inconveniente de serem mais dificilmente doseáveis. É por isso vantajoso que o produto de acordo com o invento seja apresentado numa forma de administração sólida. Estas formas de administração sólida podem ser, por exemplo, comprimidos, drageias (comprimidos revestidos), cápsulas de amido ou cápsulas de gelatina. As substâncias activas utilizadas nas quantidades previstas no presente invento são misturadas, conforme o modo de administração pretendido, com amido de trigo, ou farinha de trigo, ou lactose, de forma a obter-se cápsulas de amido. Um outro modo de realização é o das cápsulas de gelatina, em que as substâncias activas são misturadas com um veículo, por exemplo um óleo gordo, um glicol, um álcool superior, um éster glicólico, que terão de ser, evidentemente, fisiologicamente aceitáveis, e processadas com emulsionantes do tipo, por exemplo, da lecitina, gelatinas ou caseína e, eventualmente, com uma quantidade apropriada de pelo menos um conservante tal como o éster-PHB, as substâncias fenólicas, o ácido sórbico ou os alcoóis aromáticos ou alifáticos e, se necessário, outros adjuvantes, de maneira a obter-se as referidas cápsulas. Como material para cápsulas é

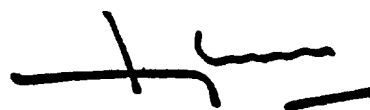
preferida a gelatina fortemente purificada, em particular, sem suplementos como, por exemplo, corantes.

O presente invento compreende também um processo cosmético para o tratamento das unhas, da pele e dos cabelos, destinado ao combate à queda de cabelo progressiva e à estimulação do crescimento de novos cabelos no ser humano, através da trigonelina como substância activa, caracterizado por se administrar ao corpo humano, por via oral, uma quantidade de 80 a 500 mg de trigonelina juntamente com 1 a 6 mg de vitamina B6. As formas de preparação do produto a seguir indicadas e consideradas preferidas conduzem, aquando da sua aplicação, a processos preferidos.

O produto de acordo com o presente invento destina-se a ser administrado especialmente em seres humanos e em particular, quando utilizado no combate à queda do cabelo, em seres humanos do sexo masculino, sendo contudo de esperar que produza um efeito adequado quando administrado em animais de sangue com uma pelagem pelo menos parcial.

Além de combater a queda do cabelo, o produto de acordo com o presente invento tem também uma acção vantajosa sobre a qualidade e o aspecto da pele e unhas.

Para que possa actuar eficientemente, o produto de acordo com o presente invento deverá ser administrado, na quantidade prevista de acordo com o presente invento, durante pelo menos 20 dias consecutivos. Só após esse período, correspondendo ao do crescimento natural do cabelo, poderão ser observados os primeiros resultados positivos. Não existe uma limite superior para o período de administração do produto de acordo com o



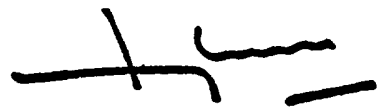
- 8 -

presente invento que pode ser prolongado até à obtenção do efeito desejado.

O efeito do produto de acordo com o presente invento pode ser maximizado mediante a aplicação externa de outras formas de execução do presente processo, por exemplo loções, tónicos, champôs, cremes ou unguentos, sobre as zonas afectadas, por exemplo o couro cabeludo, a pele em geral e/ou as unhas dos dedos e dos pés, que também estão abrangidas pelo âmbito do presente invento.

As loções, os tónicos, os champôs, os cremes e os unguentos contendo trigonelina e vitamina B6 de acordo com o presente invento também podem ser aplicados isoladamente.

Um exemplo de uma forma de execução preferida do presente processo, para aplicação externa no tratamento de unhas, pele e cabelo e destinada a combater a queda progressiva de cabelo e a estimular o crescimento de cabelo novo no ser humano é uma loção ou tónico contendo, por exemplo, água, álcool etílico e/ou propileno glicol como suporte, 300 a 400 mg, de preferência 500 mg, de trigonelina ou ácido de trigonelina, 5 a 15 mg, de preferência 10 mg, de vitamina B6, 30 a 50 mg, de preferência 40 mg, de ácido nicotínico e/ou amida do ácido nicotínico e 60 a 100 mg, de preferência 80 mg, de d-pantotenato de cálcio, referidos, em todos os casos, a 100 ml de loção. Outras substâncias valiosas que podem ser adicionadas, isoladamente ou em conjunto, à referida loção são: extracto de líquenes, extracto de castanha-da-índia, complexo vitamínico constituído pelas vitaminas A, E, F e H, enxofre coloidal, extracto de alho, fosfolípidos, oleato de polioxietileno-sorbitano, nicotinato de etilo, uma mistura de histidina, lisina e arginina na proporção de 1:4:12, um extracto de urtigas, tussilago, aquílea, alecrim, sálvia, equiseto, flor



de trevo e bétula, um extracto aquoso de raízas de urtigas e rebentos de urtigas, 3-óxido de 2,4-pirimidin-di-amin-6-(1-piperidinilo), em particular em quantidades situadas entre 1000 e 3000 mg, de preferência 2000 mg, por 100 ml de loção e aminoácidos contendo enxofre. O extracto de alho contém, por exemplo, as substâncias activas aliina e aliicina e trissulfureto de metil-alilo, isoladamente ou sob a forma de mistura. O extracto de alho é usado de preferência sob a forma de uma solução alcoólica contendo 4 g de extracto por cada 100 ml de álcool.

Uma forma de execução, de aplicação externa, do produto de acordo com o presente invento, por exemplo uma loção, pode conter ainda outras substâncias valiosas tais como óleo de rícino, Aloe Vera ou óleo de jujuba.

A loção pode conter eventualmente agentes tensioactivos, tais como oleato de polioxietileno-sorbitano, lecitina e aromas vegetais. Um champô destinado ao tratamento e combate à queda progressiva de cabelo e ainda à estimulação do crescimento de cabelo novo no ser humano contém quantidades compreendidas entre 300 e 700 mg, de preferência 500 mg, de trigonelina ou ácido de trigonelina, entre 5 e 15 mg, de preferência 10 mg, de vitamina B6, entre 30 e 50 mg, de preferência 40 mg, de ácido nicotínico e/ou amida de ácido nicotínico e entre 60 e 100 mg, de preferência 80 mg, de d-pantotenato de cálcio por cada 100 ml de champô. Outras substâncias valiosas que podem ser incluídas neste champô são: extracto de líquenes, extracto de castanha-da-índia, complexo vitamínico constituído pelas vitaminas A, E, F e H, fosfolípidos, oleato de polioxietileno-sorbitano, nicotinato de etilo, uma mistura de histidina, lisina e arginina na proporção de 1:4:12, um extracto de urtigas, tussílag, aquílea, alecrim, sálvia, equiseto, flor de trevo e bétula, um extracto aquoso de raízas de urtiga e de rebentos de urtiga e lecitina.

As componentes e as substâncias activas atrás mencionadas, são utilizadas sob formas obtidas por processos químicos ou bioquímicos ou, no caso de se tratar de substâncias de origem vegetal, no seu estado natural. Preferem-se os produtos baseados em substâncias naturais ou obtidos a partir destas.

As unhas dos dedos das mãos e dos pés também podem ser tratadas com composições cosméticas do tipo do verniz para as unhas contendo o produto de acordo com o presente invento.

Reivindicações

1ª - Processo para a preparação de um produto para o tratamento das unhas, da pele e do cabelo para o combate à queda progressiva de cabelo e para a estimulação do crescimento de novo cabelo humano, em que o referido produto é utilizado, nomeadamente, como aditivo em champôs e loções capilares ou no tratamento das unhas e da pele, caracterizado por se incluir no referido produto, na sua forma de administração diária:

a) 80 a 500 mg de trigonelina e

b) 1 a 5 mg de vitamina B6.

2ª - Processo de acordo com a Reivindicação 1, caracterizado por se incluir no referido produto:

a) 100 a 400 mg de trigonelina e

b) 2 a 4 mg de vitamina B6.

3ª - Processo de acordo com a Reivindicação 1, caracterizado por se incluir no referido produto 10 a 50 mg de ácido nicotínico e/ou amida de ácido nicotínico.

4ª - Processo de acordo com a Reivindicação 1, caracterizado por se incluir no referido produto 1 a 4 mg de riboflavina.

5ª - Processo de acordo com a Reivindicação 1, caracterizado por se incluir no referido produto 0,2 a 1 mg de ácido fólico.

6a - Processo de acordo com a Reivindicação 1, caracterizado por se incluir no referido produto 5 a 25 mg de d-pantotenato de cálcio.

7a - Process de acordo com a Reivindicação 1, caracterizado por se incluir no referido produto os aminoácidos cisteína e lisina.

8a - Processo cosmético para o combate à queda de cabelo progressiva e para a estimulação do crescimento de novo cabelo em seres humanos, caracterizado por se administrar diariamente ao corpo humano, por via oral, uma quantidade de 80 a 500 mg de trigonelina juntamente com 1 a 5 mg de vitamina B6.

9a - Processo cosmético para o tratamento das unhas e da pele, caracterizado por se administrar diariamente ao corpo humano, por via oral, uma quantidade de 80 a 500 mg de trigonelina juntamente com 1 a 5 mg de vitamina B6.

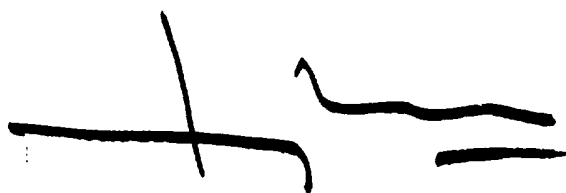
10a - Processo de acordo com a Reivindicação 1, caracterizado por se incluir no referido produto na sua forma de administração diária 80 a 500 mg de trigonelina ou de ácido de trigonelina, de preferência sob a forma do extracto das plantas do género Trigonella, 1 a 5 mg de vitamina B6, 10 a 50 mg de ácido nicotínico ou de amida de ácido nicotínico, 1 a 4 mg de riboflavina, 0,2 a 1 mg de ácido fólico, 5 a 25 mg de d-pantotenato de Ca e 1000 a 1300 mg de pólen de flores.

11a - Processo para a preparação de uma loção ou tónico para o tratamento das unhas, da pele e dos cabelos, destinados ao combate à queda de cabelo progressiva e à estimulação do crescimento de novo cabelo em seres humanos, caracterizados por se incluir na referida loção ou tónico água, álcool etílico ou

propilenoglicol como veículos e 300 a 700 mg, de preferência 500 mg de trigonelina ou de ácido de trigonelina, 5 a 15 mg, de preferência 10 mg de vitamina B6, 30 a 50 mg, de preferência 40 mg de ácido nicotínico e/ou amida de ácido nicotínico e 60 a 100 mg, de preferência 80 mg de d-pantotenato de Ca, relativos, respectivamente, a 100 ml de loção.

12ª - Processo para a preparação de um champô para o tratamento do cabelo, destinado ao combate à queda progressiva de cabelo e à estimulação do crescimento de novo cabelo em seres humanos, caracterizado por se incluir no referido champô água, álcool etílico ou propilenoglicol como veículos e 300 a 700 mg, de preferência 500 mg de trigonelina ou de ácido de trigonelina, 5 a 15 mg, de preferência 10 mg de vitamina B6, 30 a 50 mg, de preferência 40 mg de ácido nicotínico e/ou amida de ácido nicotínico e 60 a 100 mg, de preferência 80 mg de d-pantotenato de Ca, relativos, respectivamente, a 100 ml de champô.

Lisboa, 19 de Abril de 1990



J. PEREIRA DA CRUZ
Agente Oficial da Propriedade Industrial
RUA VICTOR CORDON, 10-A, 1.º
1200 LISBOA