

ITALIAN PATENT OFFICE

Document No.

102008901686465A1

Publication Date

20100612

Applicant

ZUCCARI SOCIETA' A RESPONSABILITA' LIMITATA IN BREVE "ZUCCARI S.R.L.

Title

COMPOSIZIONE COMPRENDENTE ISOFLAVONI

"COMPOSIZIONE COMPRENDENTE ISOFLAVONI"

D E S C R I Z I O N E

Il presente trovato ha come oggetto una composizione comprendente isoflavoni fitoestrogeni caratterizzata da un migliore assorbimento e biodisponibilità degli isoflavoni.

Attualmente sul mercato sono presenti numerosi prodotti caratterizzati dalla presenza di isoflavoni come ingredienti attivi. Gli isoflavoni sono una sottoclasse di composti ciclici polifenolici appartenente alla più ampia classe dei flavonoidi. Gli isoflavoni possono essere ottenuti sia da fonti naturali, sia per mezzo di sintesi chimica. Rispetto alla maggior parte dei flavonoidi, gli isoflavoni si distinguono per il fatto di essere incolori e per la loro distribuzione tassonomica piuttosto limitata, essendo presenti esclusivamente nelle *Leguminosae* e nelle *Iridaceae*.

Nelle piante gli isoflavoni svolgono diversi ruoli biochimici, agendo soprattutto come fitoestrogeni , ma anche come antiossidanti ed antibatterici. A livello medico, alcuni isoflavoni, quali ad esempio genisteina, daidzeina e cumestrololo hanno dimostrato di essere deboli agenti estrogenici. Inoltre, la genisteina, il maggior isoflavone presente nella soia, ha dimostrato di possedere proprietà chemopreventive nei confronti del cancro, sebbene al momento il meccanismo d'azione alla base di tale effetto non sia ancora stato delucidato.

L'assunzione di isoflavoni da parte di un soggetto è regolamentata dalla legge, che ne limita la quantità giornaliera a 80 mg. Questo limite rappresenta uno strumento di tutela, che può

tuttavia tradursi in una bassa o nulla efficacia di un prodotto il cui principio attivo sia un isoflavone. Infatti, poiché l'effettiva biodisponibilità degli isoflavoni è dipendente da innumerevoli variabili, essa può cambiare in maniera anche molto sensibile da soggetto a soggetto. Pertanto, la necessità di limitare l'assunzione di isoflavoni a 80 mg/die può essere uno svantaggio sostanziale laddove l'effettiva biodisponibilità degli isoflavoni apportati da un prodotto non sia sufficiente a raggiungere i livelli di isoflavoni necessari affinché tali sostanze siano in grado di esercitare un effetto benefico.

Esiste pertanto la necessità di sviluppare nuovi prodotti a base di isoflavoni la cui composizione sia studiata al fine di superare le problematiche sopra esposte, migliorando la biodisponibilità degli isoflavoni a parità di dosaggio.

Compito precipuo del presente trovato è quello di fornire una nuova composizione a base di isoflavoni la cui formulazione consenta un elevato assorbimento ed una migliore biodisponibilità di isoflavoni.

Nell'ambito di questo compito, uno scopo del trovato è quello di fornire una composizione che possa fornire un'alternativa naturale alla terapia ormonale sostitutiva.

Un altro scopo del trovato è quello di fornire una composizione a base di isoflavoni che possa essere impiegata per il trattamento di un disturbo selezionato dal gruppo costituito da menopausa e suoi sintomi, alcolismo, stress, insonnia, obesità e cellulite.

Non ultimo scopo del trovato è quello di fornire una composizione a base di isoflavoni che sia di elevata affidabilità, di relativamente facile realizzazione e a costi competitivi.

Questo compito, nonché questi ed altri scopi che meglio appariranno in seguito, sono raggiunti da una composizione comprendente almeno un isoflavone, floridzina ed uno o più probiotici.

I compiti e gli scopi dell'invenzione sono raggiunti anche da una composizione come qui descritta per uso interno come alternativa naturale alla terapia ormonale sostitutiva.

Inoltre, i compiti e gli scopi dell'invenzione sono raggiunti anche da una composizione come qui descritta per il trattamento di un disturbo selezionato dal gruppo costituito da menopausa e sintomi correlati, alcolismo, stress, insonnia, obesità e cellulite.

Altri scopi, caratteristiche e vantaggi dell'invenzione risulteranno maggiormente dalla seguente descrizione dettagliata.

In una sua forma di realizzazione, il presente trovato si riferisce ad una composizione comprendente isoflavoni in combinazione con ulteriori ingredienti attivi che, grazie alla loro sinergia, sono in grado di ottimizzare l'assimilazione e la biodisponibilità degli isoflavoni stessi quando la composizione viene assunta da un soggetto. In particolare, gli ulteriori ingredienti della presente composizione che si aggiungono agli isoflavoni sono la floridzina ed uno o più probiotici.

Preferibilmente, nella preparazione della composizione del

presente trovato l'almeno un isoflavone utilizzato come materia prima può avere un titolo da 1% a 100% p/p; la floridzina può avere un titolo da 1% a 100% p/p; e l'uno o più probiotici possono avere un titolo da 50×10^9 a 200×10^9 fermenti/g.

In una forma di realizzazione della composizione secondo il trovato, l'almeno un isoflavone può essere in una quantità da 0,001% a 99,998% in peso, la floridzina può essere in una quantità da 0,001% a 99,998% in peso e l'uno o più probiotici possono essere in una quantità da 0,001% a 99,998% in peso. In una forma di realizzazione preferita, l'almeno un isoflavone può essere in una quantità da 0,15% a 0,90% in peso. In un'altra forma di realizzazione preferita, la floridzina può essere in una quantità da 0,005% a 0,090% in peso. In un'ulteriore forma di realizzazione preferita, l'uno o più probiotici possono essere in una quantità da 0,004% a 0,11% in peso.

Come accennato in precedenza, gli isoflavoni sono sostanze di origine vegetale che nelle piante svolgono diverse funzioni biochimiche fra le quali quelle di antiossidanti, fitoestrogeni o antibatterici. La composizione del presente trovato comprende almeno un isoflavone, preferibilmente più isoflavoni anche diversi fra loro. Preferibilmente, ma non esclusivamente, gli isoflavoni sono selezionati dal gruppo costituito da puerarina, daidzina, daidzeina, genistina, genisteina e loro miscele.

In una forma di realizzazione, l'almeno un isoflavone facente parte della composizione qui descritta può essere estratto da una pianta selezionata dal gruppo costituito da *Pueraria lobata* (Kudzu),

Glycine max (Soia) e *Trifolium pratense* (Trifoglio Rosso).

Il secondo componente della composizione del trovato è rappresentato dalla floridzina (o florizina), un glicoside di origine naturale presente in diversi alberi da frutto, quali ad esempio il melo, e che può essere estratto da fonti quali corteccia, radici e buccia del frutto delle piante. Nella composizione del presente trovato, la floridzina aumenta l'assorbimento degli isoflavoni, consentendo così ad un soggetto cui la composizione sia somministrata di assimilare la maggior quantità possibile di isoflavoni.

La terza componente della composizione del presente trovato è rappresentata da uno o più probiotici. I probiotici sono supplementi dietetici contenenti microorganismi, quali ad esempio batteri o lieviti, la cui somministrazione in quantità adeguate conferisce effetti benefici al soggetto che riceve la somministrazione. Nella composizione del trovato, i probiotici vanno ad agire a livello intestinale, favorendo la biodisponibilità degli isoflavoni.

In una forma di realizzazione del presente trovato, l'uno o più probiotici sono preferibilmente, ma non esclusivamente, selezionati dal gruppo costituito da *Lactobacillus acidophilus*, *Lactobacillus casei*, *Lactobacillus helveticus*, *Streptococcus thermophilus*, *Streptococcus lactis*, *Lactobacillus bulgaricus*, *Bifidobacterium bifidum*, *Bifidobacterium breve*, *Bifidobacterium infantis*, *Bifidobacterium longum*, *Lactobacillus plantarum*, *Lactobacillus rhamnosus*, *Lactobacillus salivarius*, *Lactobacillus lactis* e loro miscele.

Preferibilmente, l'uno o più probiotici della composizione del presente trovato possono essere sia vivi, sia tindalizzati.

In un'altra forma di realizzazione del presente trovato, la composizione qui descritta può comprendere ulteriormente altre sostanze ad azione benefica. Tali sostanze possono essere selezionate dal gruppo costituito da minerali, vitamine, fitoestratti e prebiotici.

Preferibilmente, ma non esclusivamente, i prebiotici possono essere selezionati dal gruppo costituito da inulina, frutto-oligosaccaridi (FOS), galatto-oligosaccaridi (GOS) e loro miscele.

Preferibilmente, ma non esclusivamente, i fitoestratti possono essere fitoestratti di piante selezionate dal gruppo costituito da *Crataegus monogyna*, *Melissa officinalis*, *Passiflora sp.*, *Humulus lupulus*, *Hypericum perforatum*, *Panax ginseng*, *Salvia miltiorrhiza*, *Cimicifuga racemosa*, *Cassia angustifolia*, *Cassia nomame*, *Coffea arabica*, *Griffonia simplicifolia*, *Equisetum arvense*, *Taraxacum dens leonis*, *Sambucus nigra*, *Rheum officinalis*, *Rhamnus purshiana*, *Carica papaya* e loro miscele.

La composizione del presente trovato può assumere diverse forme nella quali essere somministrata ad un soggetto. Ad esempio, la composizione potrà essere in forma liquida o solida.

Le forme di somministrazione solida possono includere capsule, tavolette, pillole, polveri o granuli. In queste forme solide, la composizione del trovato può ulteriormente comprendere uno o più eccipienti idonei normalmente impiegati nel campo farmaceutico ed

alimentare.

Le forme di somministrazione liquida possono invece includere emulsioni, soluzioni, sospensioni, sciroppi o elisir. In queste forme liquide, la composizione del trovato può ulteriormente comprendere uno o più eccipienti idonei, quali ad esempio diluenti, umettanti, emulsionanti o agenti sospensivanti, normalmente impiegati nel campo farmaceutico ed alimentare.

In un altro aspetto, il presente trovato si riferisce all'uso della composizione qui descritta in qualità di prodotto farmaceutico e non-farmaceutico destinato ad

Il presente trovato si riferisce pertanto anche ad una composizione come qui descritta per uso come alternativa naturale alla terapia ormonale sostitutiva, sfruttando quindi prodotti di origine vegetale, quali isoflavoni e floridzina, in sostituzione degli estrogeni.

Ulteriormente, il presente trovato si riferisce anche ad una composizione come qui descritta per il trattamento di un disturbo selezionato dal gruppo costituito da menopausa e sintomi correlati, alcolismo, stress, insonnia, obesità e cellulite.

In una forma di realizzazione preferita, la composizione del trovato per il trattamento della menopausa e dei suoi sintomi può essere caratterizzata dal fatto di comprendere, in aggiunta ai tre ingredienti attivi principali, minerali, vitamine ed uno o più fitoestratti di piante selezionate dal gruppo costituito da *Crataegus monogyna*, *Melissa officinalis*, *Passiflora sp.*, *Humulus lupulus* e *Cimicifuga racemosa*.

In un'altra forma di realizzazione preferita, la composizione del trovato per il trattamento dell'alcolismo può essere caratterizzata dal fatto di comprendere, in aggiunta ai tre ingredienti attivi principali, uno o più fitoestratti di piante selezionate dal gruppo costituito da *Humulus lupulus*, *Hypericum perforatum*, *Panax ginseng* e *Salvia miltiorrhiza*.

In un'ulteriore forma di realizzazione preferita, la composizione del trovato per il trattamento dell'obesità può essere caratterizzata dal fatto di comprendere, in aggiunta ai tre

ingredienti attivi principali, uno o più fitoestratti con proprietà drenanti e detossificanti e utili nel mantenimento del tono e dell'elasticità dei tessuti, uno o più minerali, quali ad esempio rame, selenio e ferro, e uno o più principi attivi addizionali, come ad esempio teanina e collagene. In particolare, i fitoestratti drenanti e detossificanti possono essere uno o più fitoestratti di piante selezionate dal gruppo costituito da *Cassia angustifolia*, *Cassia nomame*, *Coffea arabica*, *Griffonia simplicifolia*, *Equisetum arvense*, *Taraxacum dens leonis*, *Sambucus nigra*, *Rheum officinalis*, *Rhamnus purshiana* e *Carica papaya*.

Inoltre, in un altro aspetto la presente invenzione si riferisce anche ad una composizione come qui descritta che possa essere impiegata per favorire la ridistribuzione della massa grassa o per il miglioramento del tono del seno.

In una forma di realizzazione preferita, la composizione del trovato per favorire la ridistribuzione della massa grassa può essere caratterizzata dal fatto di comprendere, in aggiunta ai tre ingredienti attivi principali, uno o più dei fitoestratti drenanti e detossificanti, dei minerali e dei principi attivi addizionali impiegati nella composizione per il trattamento dell'obesità qui descritta.

Vantaggiosamente, la composizione secondo il presente trovato può quindi essere addizionata in tutte le formulazioni idonee a favorire il miglioramento dei problemi femminili legati allo squilibrio ormonale, così da promuovere il dimagrimento della donna

(in particolare al di sopra dei 30 anni), il miglioramento del tono del seno ed il miglioramento degli inestetismi cutanei, in particolare della cellulite.

Esempi non limitativi della composizione secondo il trovato possono essere:

una composizione per il trattamento dell'insonnia comprendente isoflavoni di *Pueraria lobata* (Kudzu), floridzina, *Lactobacillus acidophilus*, *Lactobacillus casei*, *Lactobacillus thermophilus*, fitoestratto di *Melissa officinalis* e fitoestratto di *Passiflora*;

una composizione per il trattamento dello stress comprendente isoflavoni da *Glycine max*, floridzina, *Lactobacillus acidophilus*, *Lactobacillus casei*, *Lactobacillus thermophilus*, fitoestratto di *Hypericum perforatum* e fitoestratto di *Panax ginseng*;

una composizione per il trattamento dei sintomi della menopausa comprendente isoflavoni da *Pueraria lobata* (Kudzu), floridzina, *Lactobacillus acidophilus*, *Lactobacillus casei*, *Lactobacillus thermophilus* e fitoestratto di *Crataegus monogyna*;

una composizione per il trattamento dell'alcolismo comprendente isoflavoni da *Trifolium pratense* (Trifoglio rosso), floridzina, *Lactobacillus acidophilus*, *Lactobacillus casei*, *Lactobacillus thermophilus*, fitoestratto di *Salvia miltiorrhiza* e fitoestratto di *Humulus lupulus*;

una composizione per il trattamento dell'obesità o per favorire la ridistribuzione della massa grassa comprendente isoflavoni da *Pueraria lobata* (Kudzu), floridzina, *Lactobacillus acidophilus*,

Lactobacillus casei e fitoestratti di *Cassia angustifolia*, *Coffea arabica*, *Sambucus nigra* e *Griffonia simplicifolia*.

Si è in pratica constatato come la composizione secondo il trovato assolva pienamente il compito prefissato, in quanto la combinazione sinergica di isoflavoni, floridzina e probiotici consente di aumentare l'assorbimento degli isoflavoni e porta ad una migliore biodisponibilità di tale principio attivo.

Inoltre, si è riscontrato come la composizione secondo il trovato, grazie al maggior assorbimento ed alla migliore biodisponibilità di isoflavoni possa essere utilizzata come terapia ormonale sostitutiva.

Si è constatato anche come la composizione secondo il trovato sia idonea alla preparazione di formulazioni, opzionalmente combinate con svariati fitoestratti, utile come alternativa naturale alla terapia ormonale sostitutiva e per il trattamento della menopausa e dei suoi sintomi, dell'alcolismo, dello stress, dell'insonnia, dell'obesità e della cellulite.

La composizione, così concepita, è suscettibile di numerose modifiche e varianti, tutte rientranti nell'ambito del concetto inventivo; inoltre, tutti i dettagli potranno essere sostituiti da altri elementi tecnicamente equivalenti.

R I V E N D I C A Z I O N I

1. Composizione comprendente almeno un isoflavone, floridzina ed uno o più probiotici.

2. Composizione secondo la rivendicazione 1, in cui l'almeno un isoflavone è in una quantità da 0,001% a 99,998% in peso, la floridzina è in una quantità da 0,001% a 99,998% in peso e l'uno o più probiotici sono in una quantità da 0,001% a 99,998% in peso.

3. Composizione secondo la rivendicazione 1 o 2, in cui l'almeno un isoflavone è selezionato dal gruppo costituito da puerarina, daidzina, daidzeina, genistina, genisteina e loro miscele.

4. Composizione secondo la rivendicazione 1 o 2, in cui l'almeno un isoflavone è estratto da una pianta selezionata dal gruppo costituito da *Pueraria lobata* (Kudzu), *Glycine max* (Soia) e *Trifolium pratense* (Trifoglio Rosso).

5. Composizione secondo una o più delle rivendicazioni 1-4, in cui l'uno o più probiotici sono selezionati dal gruppo costituito da *Lactobacillus acidophilus*, *Lactobacillus casei*, *Lactobacillus helveticus*, *Streptococcus thermophilus*, *Streptococcus lactis*, *Lactobacillus bulgaricus*, *Bifidobacterium bifidum*, *Bifidobacterium breve*, *Bifidobacterium infantis*, *Bifidobacterium longum*, *Lactobacillus plantarum*, *Lactobacillus rhamnosus*, *Lactobacillus salivarius*, *Lactobacillus lactis* e loro miscele.

6. Composizione secondo una o più delle rivendicazioni 1-5, caratterizzata dal fatto di comprendere ulteriormente una o più sostanze selezionate dal gruppo costituito da minerali, vitamine,

fitoestratti e prebiotici.

7. Composizione secondo la rivendicazione 6, in cui i prebiotici sono selezionati dal gruppo costituito da inulina, frutto-oligosaccaridi (FOS), galatto-oligosaccaridi (GOS) e loro miscele.

8. Composizione secondo la rivendicazione 6, in cui i fitoestratti sono fitoestratti di piante selezionate dal gruppo costituito da *Crataegus monogyna*, *Melissa officinalis*, *Passiflora* sp., *Humulus lupulus*, *Hypericum perforatum*, *Panax ginseng*, *Salvia miltiorrhiza*, *Cimicifuga racemosa*, *Cassia angustifolia*, *Cassia nomame*, *Coffea arabica*, *Griffonia simplicifolia*, *Equisetum arvense*, *Taraxacum dens leonis*, *Sambucus nigra*, *Rheum officinalis*, *Rhamnus purshiana*, *Carica papaya* e loro miscele.

9. Composizione secondo una o più delle rivendicazioni 1-8 caratterizzata dal fatto di essere in forma liquida o solida.

10. Composizione secondo una o più delle rivendicazioni 1-9 per uso come alternativa naturale alla terapia ormonale sostitutiva.

11. Composizione secondo una o più delle rivendicazioni 1-9 per il trattamento di un disturbo selezionato dal gruppo costituito da menopausa e sintomi correlati, alcolismo, stress, insonnia, obesità e cellulite.

CLAIMS

1. A composition comprising at least one isoflavone, phloridzine and one or more probiotics.

2. The composition according to claim 1, wherein the at least one isoflavone is in a quantity from 0.001% to 99.998% by weight, the phloridzine is in a quantity from 0.001% to 99.998% by weight, and the one or more probiotics are in a quantity from 0.001% to 99.998% by weight.

3. The composition according to claim 1 or 2, wherein the at least one isoflavone is selected from the group consisting of puerarin, daidzin, daidzein, genistin, genistein and mixtures thereof.

4. The composition according to claim 1 or 2, wherein the at least one isoflavone is extracted from a plant selected from the group consisting of Pueraria lobata (Kudzu), Glycine max (Soybean) and Trifolium pratense (Red clover).

5. The composition according to one or more of



claims 1-4, wherein the one or more probiotics are selected from the group consisting of Lactobacillus acidophilus, Lactobacillus casei, Lactobacillus helveticus, Streptococcus thermophilus, Streptococcus lactis, Lactobacillus bulgaricus, Bifidobacterium bifidum, Bifidobacterium breve, Bifidobacterium infantis, Bifidobacterium longum, Lactobacillus plantarum, Lactobacillus rhamnosus, Lactobacillus salivarius, Lactobacillus lactis and mixtures thereof.

6. The composition according to one or more of claims 1-5, characterized in that it further comprises one or more substances selected from the group consisting of minerals, vitamins, phytoextracts and prebiotics.

7. The composition according to claim 6, wherein the prebiotics are selected from the group consisting of inulin, fructooligosaccharides (FOS), galactooligosaccharides (GOS) and mixtures thereof.

8. The composition according to claim 6,
wherein the phytoextracts are phytoextracts of



plants selected from the group consisting of Crataegus monogyna, Melissa officinalis, Passiflora sp., Humulus lupulus, Hypericum perforatum, Panax ginseng, Salvia miltiorrhiza, Cimicifuga racemosa, Cassia angustifolia, Cassia nomame, Coffea arabica, Griffonia simplicifolia, Equisetum arvense, Taraxacum dens leonis, Sambucus nigra, Rheum officinalis, Rhamnus purshiana, Carica papaya and mixtures thereof.

9. The composition according to one or more of claims 1-8, characterized in that it is in liquid or solid form.

10. The composition according to one or more of claims 1-9 for use as a natural alternative to hormone replacement therapy.

11. The composition according to one or more of claims 1-9 for the treatment of a disorder selected from the group consisting of menopause and correlated symptoms, alcoholism, stress, insomnia, obesity and cellulitis.



Isaac
Dr. Isaac Isaacson
- 113 43 -