



Ministero delle Imprese e del Made in Italy
DIREZIONE GENERALE PER LA TUTELA DELLA PROPRIETÀ INDUSTRIALE
UFFICIO ITALIANO BREVETTI E MARCHE

UIBM

| | |
|-------------------------------------|------------------------|
| DOMANDA DI INVENZIONE NUMERO | 102023000007461 |
| Data Deposito | 18/04/2023 |
| Data Pubblicazione | 18/10/2024 |

Classifiche IPC

| Sezione | Classe | Sottoclasse | Gruppo | Sottogruppo |
|---------|--------|-------------|--------|-------------|
| A | 61 | K | 36 | 185 |

| Sezione | Classe | Sottoclasse | Gruppo | Sottogruppo |
|---------|--------|-------------|--------|-------------|
| A | 61 | K | 36 | 73 |

| Sezione | Classe | Sottoclasse | Gruppo | Sottogruppo |
|---------|--------|-------------|--------|-------------|
| A | 61 | K | 36 | 752 |

Titolo

ESTRATTI DI FRUTTI CON ELEVATO CONTENUTO DI POLIFENOLI, PROCESSO PER LA LORO PREPARAZIONE E COMPOSIZIONI CHE LO CONTENGONO

12194M Descrizione del brevetto per invenzione industriale avente per titolo:

FM/mc **“ESTRATTI DI FRUTTI CON ELEVATO CONTENUTO DI POLIFENOLI, PROCESSO PER LA LORO PREPARAZIONE E COMPOSIZIONI CHE LO CONTENGONO”**

a nome : **AKHYNEX s.r.l.**

con sede in: Via Ronchi, 2 - 89024 Polistena (Reggio Calabria)

* * *

L'invenzione ha per oggetto estratti di frutti, in particolare di bergamotto, mela e melograno, con elevato contenuto di polifenoli e composizioni farmaceutiche o nutraceutiche che li contengono.

Stato della tecnica

I polifenoli sono sostanze naturali presenti in molti vegetali, in particolare bergamotto, mela e melograno. Sono noti per le loro proprietà antiossidanti, anti-infiammatorie e cardio-protettive. Il bergamotto, ad esempio, è una fonte ricca di polifenoli noti come flavonoidi, tra cui la naringina e la neohesperidina. Studi hanno dimostrato che questi composti possono avere un effetto benefico sulle malattie cardiache, abbassando il colesterolo e la pressione sanguigna.

La mela è un'altra fonte di polifenoli, tra cui i flavonoidi, le procianidine, gli acidi idrossicinnamici, i triterpeni pentaciclici ed alcoli a lunga catena e loro esteri.

I polifenoli della mela insieme alle pectine sono stati associati a una diminuzione del rischio di malattie croniche, come il diabete, l'obesità e le malattie cardiache.

Anche il melograno è noto per la sua alta concentrazione di polifenoli, tra cui le punicalagine, ellagitannini e antociani. Questi composti hanno dimostrato proprietà antinfiammatorie, antiossidanti, antimicrobiche ed antivirali.

Estratti di bergamotto sono stati descritti in WO 2020 021425, WO2010 05549 e

US 8,741,362. I componenti principali di tali estratti sono neoeriocitrina, naringina e neoesperidina, in quantità fino al 40% - 50% in peso dell'estratto.

Gli estratti sono ottenuti con processi che prevedono una sequenza di numerosi passaggi quali macinatura, congelamento/scongelamento della biomassa, pressatura, trattamenti enzimatici per la degradazione della pectina, inattivazione degli enzimi, ultrafiltrazione, cromatografie.

Estratti di mela sono noti da KR100331578, CN102210471, KR20100112226 ed EP657169, che descrivono processi di estrazione per mezzo di tecniche diverse (pressatura, enzimolisi, estrazione, cromatografia e simili).

Descrizione dell'invenzione

Si è ora trovato che estratti ricchi in polifenoli e in altri componenti bioattivi possono essere ottenuti dai residui solidi di torchiatura di frutti quali bergamotto, mela e melograno sottoposti ad essiccazione prima dell'estrazione con etanolo acquoso al 70-90% ed essiccazione finale dell'estratto etanologico. Si è trovato che l'immediato essiccamento delle biomasse dopo la loro spremitura per l'ottenimento dei succhi è critico ai fini dell'invenzione. L'essiccamento, oltre a diminuire i costi di processo, consente l'eliminazione di una grande quantità di acqua, di zuccheri semplici e di acidi organici. L'essiccamento immediato in forni rotativi ad alta efficienza consente di evitare degradazioni dei principi attivi e di disporre di un solido stabile che può essere estratto con estrattori adeguati. I residui dopo spremitura vengono quindi essiccati stabilizzando i principi attivi presenti anche come complessi molecolari con i veicoli fisiologici che regolano l'assorbimento e l'attività degli stessi.

L'invenzione ha pertanto per oggetto estratti di bergamotto, mela o melograno ottenuti da un processo che comprende nell'ordine:

- a) Torchiatura/spremitura dei frutti interi;

- b) Essiccamento del residuo solido di torchiatura (pastazzo);
- c) Estrazione del residuo essiccato con etanolo acquoso al 70-90% in peso, preferibilmente con etanolo all'80% in peso;
- d) Essiccazione della soluzione etanolica.

Gli estratti così ottenuti possono essere utilizzati tal quali come ingredienti di composizioni farmaceutiche, nutraceutiche, alimentari, utili nel trattamento di diverse condizioni patologiche o pre-patologiche, che costituiscono un ulteriore oggetto dell'invenzione.

L'invenzione ha inoltre per oggetto il processo di preparazione degli estratti, come sopra definito.

Il contenuto di polifenoli e flavonoidi degli estratti dell'invenzione dipenderà ovviamente dal frutto utilizzato nel processo. In linea di massima, nel caso del bergamotto il contenuto di polifenoli e flavonoidi varia da 20 a 35% sul peso dell'estratto; nel caso della mela, il residuo secco dopo dell'estratto varia da un peso medio del 25% con un contenuto di polifenoli e flavonoidi compreso tra 12 a 18% sul peso dell'estratto; nel caso del melograno il contenuto di polifenoli e flavonoidi varia da 32 a 40% sul peso dell'estratto.

La torchiatura dei frutti può essere effettuata con metodi convenzionali. I frutti nel caso del bergamotto possono essere preventivamente lavati in acqua e sbucciati prima di essere torchiati. Il succo ottenuto può essere destinato ad impieghi in campo alimentare.

La polpa deprivata del succo, definita anche pastazzo, contiene pectine, polifenoli, flavonoidi e fibre. Queste ultime sono eliminate nel successivo passaggio di estrazione con etanolo acquoso. Nel caso delle mele e del melograno le bucce ed ogni residuo non solubile deve essere essiccato insieme alle polpe perché i principi attivi sono legati alle matrici vegetali della parte esterna del frutto. L'essiccazione del pastazzo viene effettuata con metodi convenzionali, ad esempio in essiccatori rotanti, fino ad un contenuto di acque

residuo dal 3 al 7% in peso.

L'estrazione del pastazzo essiccato può essere effettuata a temperature comprese tra 20 e 60°C, preferibilmente a temperatura ambiente (20-25°C), con rapporti pastazzo : solvente compresi tra 1:2 e 1:10. L'estrazione può essere ripetuta più volte. L'estratto etanologico viene quindi evaporato a dare un residuo solido che può essere utilizzato per la formulazione in adatte forme di somministrazione. Si utilizzano preferibilmente essiccatori rotanti.

Gli estratti ottenuti si distinguono da quelli noti per un maggiore contenuto di principi attivi legati ai loro veicoli naturali quali pectine, proteine acidi nucleici . Il processo per la loro preparazione è vantaggioso in quanto non utilizza stadi di trattamento enzimatico, congelamento, cromatografie e gli estratti ottenuti sono pertanto economici rispetto a quelli noti e presentano un profilo ottimale di contenuto di componenti bioattivi. Gli estratti, se desiderato, possono essere macinati o micronizzati con tecniche convenzionali.

Un secondo aspetto dell'invenzione riguarda composizioni farmaceutiche, nutraceutiche o alimentari comprendenti come ingrediente attivo l'estratto dell'invenzione in miscela con veicoli od eccipienti.

Le composizioni dell'invenzione sono preparate utilizzando tecniche ed eccipienti convenzionali per la somministrazione orale come descritto, per esempio, in "Remington's Pharmaceutical Handbook", Mack Publishing Co., N.Y., USA. In particolare, le composizioni dell'invenzione sono formulate secondo tecniche convenzionali di formulazione di ingredienti vegetali. Esempi di formulazioni orali sono compresse, confetti, capsule di gelatina o di cellulosa, granulati, sospensioni, barrette, bevande, succhi, alimenti funzionali. Le composizioni possono anche contenere altri ingredienti attivi scelti ad esempio fra vitamine, estratti fitoterapici, probiotici, carnosina, carnitina o altri ingredienti

ad attività complementare o comunque utile. Le composizioni dell'invenzione possono essere utilizzate per il trattamento e la prevenzione di condizioni dismetaboliche, sindrome metabolica, diabete, deficit cognitivi. Il dosaggio dell'estratto dell'invenzione è generalmente compreso fra 50 e 1000 mg al giorno, in una o più somministrazioni.

RIVENDICAZIONI

1. Estratti ricchi in polifenoli e in altri componenti bioattivi ottenuti dai residui solidi di torchiatura essiccati di frutti di bergamotto, mela o melograno per estrazione con etanolo acquoso al 70-90% ed essiccazione dell'estratto etanolo.
2. Estratti secondo la rivendicazione 1 in cui il frutto è bergamotto.
3. Estratti secondo la rivendicazione 1 in cui il frutto è mela.
4. Estratti secondo la rivendicazione 1 in cui il frutto è melograno.
5. Estratti secondo una delle rivendicazioni da 1 a 4 caratterizzato da un contenuto di polifenoli compreso fra 20 e 35% sul peso dell'estratto di bergamotto; fra 12 e 18% sul peso dell'estratto di mela; fra 32 e 40% sul peso dell'estratto di melograno.
6. Processo per la preparazione degli estratti delle rivendicazioni 1-5 che comprende:
 - a) Torchiatura/spremitura dei frutti interi;
 - b) Essiccamento del residuo solido di torchiatura;
 - c) Estrazione del residuo solido essiccato con etanolo acquoso al 70-90% in peso, preferibilmente con etanolo all'80% in peso;
 - d) Essiccazione della soluzione etanolica.
7. Composizioni farmaceutiche, nutraceutiche o alimentari comprendenti come ingrediente attivo un estratto delle rivendicazioni 1-5 in miscela con veicoli od eccipienti.
8. Estratto delle rivendicazioni 1-5 per uso nel trattamento di condizioni dismetaboliche, sindrome metabolica, diabete, deficit cognitivi.

Milano, 18 aprile 2023