



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 355 905**

51 Int. Cl.:

**A61P 25/32** (2006.01)      **A23L 1/29** (2006.01)  
**A23L 1/30** (2006.01)      **A61K 31/7004** (2006.01)  
**A61K 31/194** (2006.01)      **A61K 31/375** (2006.01)  
**A61K 31/195** (2006.01)      **A61K 31/198** (2006.01)  
**A61K 31/525** (2006.01)      **A61K 31/122** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05726408 .7**

96 Fecha de presentación : **17.02.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1720610**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **15.11.2006**

54

Título: **Composición de moderación del metabolismo del alcohol.**

30

Prioridad: **17.02.2004 EP 04003529**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**01.04.2011**

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**01.04.2011**

73

Titular/es: **Markus Graf v. Matuschka-Greifffenclau  
Waldparkstrasse 6  
9220 Bischofszell, CH**

72

Inventor/es:  
**Matuschka-Greifffenclau, Markus Graf von y  
Jander, Hans Peter**

74

Agente: **Carpintero López, Mario**

**ES 2 355 905 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**

La presente invención se refiere a una composición, en concreto una composición alimenticia o un complemento dietético, que es activa con respecto al soporte y/o a la moderación de un procedimiento de degradación del alcohol dentro del cuerpo humano.

5 Se han descrito composiciones con fines similares en, p.e., los documentos US 2002/006910; WO 03/006073 y FR 27 48935.

La presente invención trata concretamente el problema de la acumulación de acetaldehído después de la degradación rápida del alcohol, es decir, el metabolismo del alcohol ya que se puede producir en la mayoría de las personas de estructura genética no caucásica.

10 A este respecto, un objeto de la presente invención es lograr soluciones que proporcionen una reducción de los efectos tóxicos o del estrés psicológico en relación con el consumo de alcohol, en particular para personas con una predisposición hacia la degradación rápida del alcohol y la posterior acumulación de acetaldehído debido a un polimorfismo genético de la enzima acetaldehído-deshidrogenasa humana.

15 De acuerdo con la presente invención, este objeto se logra mediante una composición alimenticia o un complemento dietético que incluye las siguientes sustancias:

dextrosa, vitamina C, L-glutamina, cisteína, riboflavina, ácido succínico, ácido fumárico y coenzima Q 10, todas las sustancias en dosis fisiológicamente relevantes.

20 Con esta composición alimenticia o este complemento dietético concreto, es posible reducir la actividad o suprimir la producción de una enzima alcohol deshidrogenasa (ADH<sub>3</sub>) concreta y retrasar la producción de acetaldehído y el procedimiento de metabolismo del etanol. Además, se potenciará la actividad enzimática de la aldehído deshidrogenasa, ALDH<sub>2</sub>, de modo que se soportará la metabolización del acetaldehído.

Estos efectos concretos ayudan a reducir un síndrome de sofoco, reducir la probabilidad de dolores de cabeza y además ayudan a evitar o eliminar una resaca el día después.

25 Se considera que la composición alimenticia o el complemento dietético concreto es apropiado para reducir un pico de acetaldehído en exceso que entra en el torrente sanguíneo y tiene como objetivo disminuir el riesgo de daño de funciones y órganos vitales del cuerpo humano, y en este sentido también disminuye el riesgo de diversas formas de cáncer.

30 Preferiblemente se debe tomar esta composición o complementos aproximadamente 5 minutos antes del consumo de alcohol y, en caso de alto consumo de alcohol, de nuevo mientras se consume alcohol. La masa de la composición alimenticia tomada por el consumidor debería estar en el intervalo aproximadamente del 70 al 120% de la masa de alcohol incluido en las bebidas consumidas. Una dosis estándar puede incluir aproximadamente 10,0 g de dextrosa, 1,0 g de vitamina C, 1,5 g de L-glutamina, 500 mg de cisteína, 40 mg de riboflavina, 100 mg de ácido succínico, 100 mg de ácido fumárico y 60 mg de coenzima Q10.

35 La composición alimenticia o el complemento dietético concreto tiene como objeto prevenir el paso de demasiado acetaldehído a la matriz mitocondrial y suprimir el autobloqueo de la actividad enzimática de ALDH y por tanto facilitar la descomposición del acetaldehído.

40 Por tanto, los riesgos fisiológicos en relación con el consumo de alcohol pueden reducirse significativamente mediante el uso de la composición alimenticia de acuerdo con la presente invención, ya que esta composición alimenticia o este complemento dietético facilita de manera sinérgica una disminución temprana del nivel de acetaldehído después de beber y proporciona simultáneamente un efecto protector con respecto a la supresión de la generación de radicales libres.

45 Dicha composición alimenticia o dicho complemento dietético se encuentra preferiblemente de forma, preferiblemente como ingredientes de un tipo de aperitivo, que permita el consumo de la composición alimenticia dentro de un restaurante o de un bar antes de consumir bebidas alcohólicas. Preferiblemente, una dosificación para una persona con un peso corporal de aproximadamente 80 kg incluye una fracción de dextrosa aproximadamente del 75%, en la que dicha dosificación puede tener un peso total aproximadamente de 10 a 15, preferiblemente de 13,3 g. Una dosificación de este tipo proporciona una moderación considerable en la degradación de aproximadamente 18 ml de alcohol.

50 La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo incluya una fracción de dextrosa aproximadamente del 75,2% en masa, es decir, una cantidad de dextrosa en el intervalo desde 7,2 hasta 12,8 g, preferiblemente de 10,0 g dentro de una dosis de 13,3 g.

La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo incluya una fracción de vitamina C aproximadamente del 7,5% en masa, es decir, una cantidad de vitamina C en el intervalo desde 0,78 hasta 1,18 g, preferiblemente de 1,0 g, dentro de una dosis de 13,3 g.

5 La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo incluya una fracción de L-glutamina aproximadamente del 11,27% en masa, es decir, una cantidad de dicha fracción de L-glutamina en el intervalo desde 1,23 hasta 1,7 g, preferiblemente de 1,5 g, dentro de una dosis de 13,3 g.

10 La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo incluya una fracción de cisteína aproximadamente del 3,76% en masa, es decir, una cantidad de dicha fracción de cisteína en el intervalo desde 460 hasta 540 mg, preferiblemente de 500 mg, dentro de una dosis de 13,3 g.

La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo incluya una fracción de riboflavina aproximadamente del 0,30% en masa, es decir, una cantidad de dicha riboflavina en el intervalo desde 32 hasta 48 mg, preferiblemente de 40 mg, dentro de una dosis de 13,3 g.

15 La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo incluya una fracción de ácido succínico (Bernsteinsäure) aproximadamente del 0,752% en masa, es decir, una cantidad de dicho ácido succínico en el intervalo desde 90 hasta 110 mg, preferiblemente de 100 mg, dentro de una dosis de 133 g.

20 La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo incluya una fracción de ácido fumárico (Fumarsäure) aproximadamente del 0,752% en masa, es decir, una cantidad de dicho ácido fumárico en el intervalo desde 90 hasta 110 mg, preferiblemente de 100 mg, dentro de una dosis de 13,3 g.

25 La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo incluya una fracción de coenzima aproximadamente del 0,451% en masa, es decir, una cantidad de dicha fracción de coenzima en el intervalo desde 50 hasta 70 mg, preferiblemente de 60 mg, dentro de una dosis de 13,3 g.

La composición alimenticia o el complemento dietético está constituido preferiblemente de manera que una dosificación del mismo se encuentra en forma de comprimidos. Preferiblemente, cada comprimido está conformado y dimensionado de modo que permita la disolución de dicho comprimido fácilmente.

30 Preferiblemente, dichos comprimidos se encuentran de forma que una dosificación incluya una pluralidad de estos comprimidos.

35 Los comprimidos se pueden acomodar dentro de un receptáculo de dosificación que incluye varios de estos comprimidos. Es posible que la composición alimenticia se encuentre en forma de bolas o comprimidos pequeños, y que se guarden los mismos en un tubo pequeño, aunque se puede determinar el volumen de la composición alimenticia tomada por el consumidor con respecto al volumen de alcohol que se espera consumir.

La composición alimenticia o el complemento dietético también se puede encontrar en forma similar a terrones de azúcar, o se puede encontrar en forma de polvo frío.

40 La composición alimenticia o el complemento dietético se puede separar en subunidades separadas. Es posible proporcionar una unidad, por ejemplo una cápsula que incluya la fracción de vitamina C, cisteína, riboflavina, ácido succínico, ácido fumárico y coenzima Q10, mientras que la mayoría de la fracción de dextrosa se guarde en comprimidos, cápsulas, unidades separadas o similares.

Es posible añadir sustancias adicionales tales como extractos de zumo de frutas, cúrcuma, taninos, un polvo de Panax notoginseng y Vinca rosea en cantidades adecuadas. También se puede añadir té Oolong, aloe vera y algas de agua espirales.

45 La composición alimenticia o el complemento dietético también se puede encontrar en forma de líquido, en concreto un líquido de tipo jarabe. Es posible proporcionar la composición alimenticia con la apariencia de un refresco en un frasco pequeño.

Se considera que la composición alimenticia o el complemento dietético concreto proporciona los siguientes logros:

50 1. Reducción del metabolismo del etanol disminuyendo el procedimiento de oxidación de etanol en acetaldehído, para prevenir la acumulación de acetaldehído en primer lugar.

2. Estimulación de la actividad de ALDH y evitación de cualquier bloqueo de su actividad enzimática.

3. Incremento de la velocidad de la reacción de acetaldehído a ácido acético y de la descomposición adicional en el ciclo del citrato.

5 4. Mejora de los niveles de estos antioxidantes del consumidor de alcohol, que protegen especialmente frente a efectos tóxicos del acetaldehído.

El primer logro

10 Se cree que se alcanza mediante la toma de una gran dosis de azúcar dextrosa (glucosa). La glucosa se oxida rápidamente en el citosol de las células del hígado usando la misma reserva de  $\text{NAD}^+$  del citosol usada por el etanol para convertirse en acetaldehído. Ya que la cantidad de  $\text{NAD}^+$  citosólico es limitado y que sólo se puede reproducir de manera constante a partir de  $\text{NADH}+\text{H}^+$ , se acumula mucho menos acetaldehído.

El segundo logro

15 También se cree que se alcanza mediante la toma de una gran dosis de glucosa. La glucosa aumenta la actividad enzimática de ADH así como la de ALDH. Si se produce una gran carga de glucosa en el citosol de las células del hígado, entonces no existe la posibilidad de que el acetaldehído alcance niveles que puedan conducir a la inactivación de ALDH o a la destrucción mitocondrial.

El tercer logro

Se cree que se lleva a cabo

a) Acelerando la reoxidación de  $\text{NADH}+\text{H}^+$  a  $\text{NAD}^+$  incrementando la velocidad del transporte de electrones a través de la membrana mitocondrial interna

20 b) Acelerando el ciclo de Krebs

25 Se cree que se logra mediante la inclusión de coenzima  $\text{Q}_{10}$  y riboflavina. La riboflavina se transformará rápidamente en FMN, que junto con la coenzima  $\text{Q}_{10}$  es la sustancia determinante para incrementar la velocidad de la reoxidación de  $\text{NADH}+\text{H}^+$  a  $\text{NAD}^+$  en la matriz mitocondrial. El acetaldehído necesita  $\text{NAD}^+$  cuando se metaboliza en ácido acético. Dentro de esta reacción,  $\text{NAD}^+$  se transforma en  $\text{NADH}+\text{H}^+$ . Debido a que la disponibilidad de  $\text{NAD}^+$  es limitada en la matriz mitocondrial,  $\text{NADH}+\text{H}^+$  tiene que volverse a transformar en  $\text{NAD}^+$  para servir de nuevo para la descomposición de acetaldehído. Esta reacción sólo es posible porque el FMN y la coenzima  $\text{Q}_{10}$  absorben los electrones de  $\text{NADH}+\text{H}^+$  y los trasladan a través de la membrana mitocondrial. Cuanto más FMN y coenzima  $\text{Q}_{10}$  estén disponibles, más se incrementará la velocidad de este procedimiento y, debido a que está disponible más  $\text{NAD}^+$ , se acelera el metabolismo del acetaldehído.

30 También tiene sentido la inclusión de coenzima  $\text{Q}_{10}$  debido a que su nivel desciende en el cuerpo humano con el aumento de la edad.

35 Se cree que la activación del ciclo de Krebs (citrato) se logra mediante la inclusión de ácido succínico y de ácido fumárico. Ambas sustancias activan la segunda mitad del ciclo del citrato y, por tanto, activan el procedimiento de oxidación aeróbica en la mitocondria. La L-glutamina ayuda a incrementar la velocidad de la lanzadera de Malabo-aspartato citosólico-mitocondrial, que juega un papel principal en el transcurso de la intoxicación por acetaldehído. También incrementa la velocidad del procedimiento de oxidación de succinato previniendo la inhibición de acético y oxálico de la succinato deshidrogenasa.

El cuarto logro,

40 La elevación de niveles antioxidantes, se cree que se logra mediante la inclusión de cisteína, ácido ascórbico y también de L-glutamina. La cisteína debería proporcionar un fuerte efecto antioxidante, así como el ácido ascórbico. El cuerpo humano transforma la cisteína en glutatión, que protege especialmente frente a los efectos tóxicos del acetaldehído. Para alcanzar un nivel óptimo de glutatión y para evitar que la cisteína se transforme en cistina, es importante combinar la cisteína con glutamato y proporcionar el doble de ácido ascórbico y de cisteína.

45 Se espera que, tomando las sustancias mencionadas, se reducirá notablemente el nivel de acetaldehído después de beber alcohol y al menos disminuirán los síntomas de los sofocos. También deberían desaparecer los otros efectos secundarios conocidos del acetaldehído, tales como los dolores de cabeza y las resacas.

## REIVINDICACIONES

1. Composición alimenticia o complemento dietético para moderar un procedimiento de degradación del alcohol con respecto al metabolismo del etanol dentro del cuerpo humano, incluyendo las sustancias siguientes en cantidad fisiológicamente relevante:
  - 5 dextrosa,
  - vitamina C,
  - L-glutamina,
  - cisteína,
  - riboflavina,
  - 10 ácido succínico y/o ácido fumárico,
  - coenzima Q10.
2. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con la reivindicación 1, en el que una dosis del mismo tiene un peso de aproximadamente 13,3 g, configurándose dicha dosis de modo que permita su consumo dentro de un restaurante o de un bar antes del consumo de alcohol.
- 15 3. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, en el que una dosis del mismo incluye una fracción de dextrosa aproximadamente del 75,2% en masa.
4. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que una dosis del mismo incluye una fracción de vitamina C aproximadamente del 7,5% en masa.
- 20 5. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que una dosis del mismo incluye una fracción de L-glutamina aproximadamente del 11,28% en masa.
6. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que una dosis del mismo incluye una fracción de cisteína aproximadamente del 3,76% en masa.
7. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que una dosis del mismo incluye una fracción de riboflavina aproximadamente del 0,3% en masa.
- 25 8. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el que una dosis del mismo incluye una fracción de ácido succínico aproximadamente del 0,752% en masa.
9. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en el que una dosis del mismo incluye una fracción de ácido fumárico aproximadamente del 0,752% en masa.
- 30 10. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en el que una dosis del mismo incluye una fracción de coenzima aproximadamente del 0,451% en masa.
11. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que el mismo se encuentra en forma de comprimidos.
12. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que una dosis del mismo incluye una pluralidad de cápsulas o comprimidos pequeños.
- 35 13. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que dichas cápsulas o comprimidos están contenidos en un receptáculo de dosificación.
14. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que dicha composición se encuentra en forma de un tipo de terrón de azúcar.
- 40 15. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que el mismo se encuentra en forma de criopolvo.
16. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que el mismo se encuentra en forma de una pequeña unidad de bebida.
17. Composición alimenticia o complemento dietético de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que el mismo se encuentra en forma de jarabe.

18. Composición alimenticia o complemento dietético para afectar el procedimiento de degradación de alcohol con respecto al metabolismo del etanol dentro del cuerpo humano, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17, para proporcionar los efectos siguientes dentro del cuerpo humano:

5

- Reducir el metabolismo de etanol disminuyendo el procedimiento de oxidación de etanol en acetaldehído, para prevenir la acumulación de acetaldehído en primer lugar;
- Estimular la actividad de ALDH y evitar cualquier bloqueo de su actividad enzimática;
- Acelerar la reacción de acetaldehído a ácido acético y la descomposición adicional en el ciclo del citrato;
- Mejorar los niveles de estos antioxidantes del consumidor de alcohol, que protegen especialmente frente a efectos tóxicos del acetaldehído.