

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 613 888**

21 Número de solicitud: 201631111

51 Int. Cl.:

A61K 8/97 (2007.01)

A61K 31/506 (2006.01)

A61K 31/58 (2006.01)

A61P 17/14 (2006.01)

12

PATENTE DE INVENCION

B1

22 Fecha de presentación:

19.08.2016

43 Fecha de publicación de la solicitud:

26.05.2017

Fecha de concesión:

08.11.2017

45 Fecha de publicación de la concesión:

16.11.2017

73 Titular/es:

BLANXART SENA, Enrique (100.0%)
C/ MURCIA 1, 4º 3º
08026 BARCELONA (Barcelona) ES

72 Inventor/es:

BLANXART SENA, Enrique

74 Agente/Representante:

FORNELLS CARRERAS, Montserrat

54 Título: **COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA PARA EL TRATAMIENTO DE LA ALOPECIA**

57 Resumen:

El objeto de esta patente de invención es una composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia que comprende una solución curtiembre de taninos hididoalcohólica que incluye corteza de Tepezcohuite (Mimosa Teniuflora) y una mixtura de minoxidil y finasterida y cuyo uso consiste en un ciclo de seis días repetido de forma continuada con una aplicación alterna cada 12 horas de la solución curtiembre de taninos y de la mixtura de minoxidil y finasterida, sin fricción del cuero cabelludo, finalizando el ciclo con un lavado suave del cabello al séptimo día.

ES 2 613 888 B1

Aviso: Se puede realizar consulta prevista por el art. 37.3.8 LP 11/1986.

DESCRIPCIÓN

COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA PARA EL TRATAMIENTO DE LA ALOPECIA

5 Sector de la técnica

La presente invención se refiere a una composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia. Se incluye en el campo de la salud, en particular farmacéutico y/o cosmético para el tratamiento capilar.

10

Antecedentes de la invención

Una de las situaciones con que se enfrentan hombres y mujeres, aunque en grado distinto, es la caída del cabello, es decir, la alopecia, una afección de la cual se han determinado
15 diferentes grupos en base a su origen y/o manifestaciones. La más común es la alopecia androgénica que afecta mayormente a los hombres por la acción de las hormonas masculinas pero lo cierto es que la alopecia puede deberse a multitud de causas, desde genéticas y hereditarias hasta infecciones, traumatismos o enfermedades de la piel.

20 En general, la alopecia viene provocada por la degeneración de los folículos capilares que acusan una deficiencia en su comportamiento natural por causas diversas. Al margen de las ya citadas y relacionadas con enfermedades, diferentes estudios han determinado que el medio ambiente, el envejecimiento, el estrés o la mala alimentación con la consiguiente deficiencia nutricional son también factores que provocan una caída anormal del cabello.

25 También se relaciona la mala circulación de la sangre con la caída del cabello, considerando que en ese caso los folículos pilosos se debilitan por el escaso nivel de oxígeno y por tanto el cabello nace débil y con escaso grosor, lo que determina su pronta caída.

30 Para combatir la alopecia a nivel clínico y farmacológico se trabaja principalmente con dos principios activos, el minoxidil y la finasterida.

El minoxidil es un vasodilatador por lo que contribuye a agrandar los vasos sanguíneos, permitiendo un mejor paso de la sangre. Al margen de su eficacia en el tratamiento de
35 otras enfermedades, el minoxidil se emplea contra la alopecia, sea como tratamiento oral en forma de comprimidos, sea como solución tópica, en concentraciones del 5% o del 2%

en función si está destinada a hombres o a mujeres. Por sus propiedades vasodilatadoras, el minoxidil tiende a aumentar el volumen de los folículos pilosos, aportando un mayor volumen de oxígeno, provocando la caída de folículos pilosos envejecidos y favoreciendo la aparición y crecimiento de nuevos y fortalecidos folículos pilosos. También se ha observado que estimula la apertura de canales de potasio y frena el paso del calcio directamente a las células, con lo cual los folículos pilosos no reciben la señal que envía el calcio para que se detenga el crecimiento del pelo. La aplicación del minoxidil en forma tópica se presenta en formato ampolla o bien en dosificadores mediante espray o jeringa para su aplicación en la zona afectada siempre en tratamientos de uso prolongado en el tiempo puesto que si se cesa, provoca el retorno a la situación de alopecia original. El minoxidil debe aplicarse en dosis muy controladas puesto que tiene efectos secundarios relacionados con el músculo cardíaco, entre otros.

Por su parte la finasterida es un fármaco antiandrogénico derivado no hormonal de los esteroides que se utiliza en el tratamiento de la hiperplasia benigna de próstata (HBP) y del que se ha descubierto que también trabaja como un inhibidor de la dihidrotestosterona (DHT), la cual debilita los folículos pilosos hasta que finalmente mueren, lo que se traduce en la alopecia. Como efecto secundario, la finasterida, ingerida como comprimido por vía oral, puede ocasionar graves problemas de tipo sexual.

Existen, por supuesto, numerosos tratamientos alternativos y naturales para tratar la alopecia que insisten en la necesidad de estimular el riego sanguíneo en el cuero cabelludo para fortalecer las raíces de los folículos pilosos. Una de las técnicas más usadas es el masaje capilar, por ejemplo con aceites esenciales mezclados con aceite de coco, almendras, oliva, ricino o de romero.

También se ha recurrido a la elaboración de pastas o mascarillas que se aplican sobre el cuero cabelludo, por ejemplo con alholva o fenogreco, unas semillas que contienen estrógenos y otras sustancias similares a las hormonas sexuales femeninas que fortalecen los folículos pilosos, mejorando el crecimiento del cabello. O el jugo de cebolla, con propiedades antibacterianas y alto contenido en azufre. También se recomienda la remolacha, que contiene hidratos de carbono, proteínas, potasio, fósforo, calcio y vitaminas B y C, ya sea consumida en jugo o bien como pasta aplicada sobre el cuero cabelludo. Para una ingesta en formato de bebida, se recomienda la infusión de té verde, antioxidante, y la cerveza, que en formato levadura también se utiliza como ingrediente culinario.

Sin embargo, sea cual sea el tratamiento aplicado, farmacológico o natural, y en especial en lociones o pastas/mascarillas, el cuero cabelludo, aun siendo una zona receptiva a la absorción de soluciones tópicas, no consigue absorber una cantidad significativa del tratamiento, lo que significa que los resultados son difícilmente apreciables y/o duraderos.

5 Además, en su aplicación como loción, el minoxidil se presenta en formulaciones que añaden excipientes como etanol al 96%, propilenglicol y agua purificada y tiene efectos secundarios como picazón, sequedad, descamación, irritación o ardor del cuero cabelludo, similares a los que produce la solución alcohólica de finasterida.

10 El solicitante entiende que una solución para evitar tales efectos secundarios sería tratar el cuero cabelludo con una solución que incremente su resistencia al alcohol pero que no bloquee la absorción de las lociones capilares y lo mantenga receptivo a las mismas. Una solución viable y natural serían los taninos.

15 Los taninos son una sustancia orgánica que se encuentran en la corteza de algunos árboles como el roble, el castaño o el cortex mimosa tenuiflora, también conocido como Tepezcohuite, y en el interior de diversos frutos. Los taninos son solubles en el agua, insolubles en el alcohol y de un sabor amargo. Químicamente son metabolitos secundarios de las plantas, fenólicos, no nitrogenados. Por sus propiedades, los taninos reaccionan
20 con las proteínas del colágeno de la piel, uniéndolas entre si y aumentando la resistencia al roce y especialmente a los agentes químicos, a los disolventes, a la degradación natural y a los agentes patógenos, lo que los convierte en un elemento de curtido muy eficaz.

A nivel de propiedad industrial son muchas las patentes farmacéuticas que presentan
25 formulaciones y composiciones destinadas al tratamiento de la alopecia pero la presencia de taninos tiende a relacionarse con composiciones destinadas al tinte del cabello. Por ejemplo, la patente KR20090006422 que presenta una *“composición de tinte para el cabello oxidativo para minimizar el daño en el cabello y el cuero cabelludo debido a un material alcalino y un colorante y para mejorar la sensación de acondicionamiento del*
30 *cabello, la cual comprende un precursor de colorante de oxidación; un acoplador; la tinta de sepia o un componente de melanina extraído de la tinta de sepia; y el tanino de caqui.”* Por su parte la patente FR2666740 presenta una formulación que hace que sea posible producir *“un complejo biológico para combatir la caída del cabello que puede ser de sinergia con otros complejos de tanino vegetal. Se compone de la dosificación de las*
35 *proteínas, aminoácidos, glicosaminoglicanos y provitaminas del grupo B estabilizada con un poliéster de ácido graso en una solución que contiene 23% en volumen de alcohol*

etílico. La formulación de la invención está destinada especialmente para la preparación de usos múltiples tratamientos para el cabello cosmética. La patente FR2653996 se refiere a una *“composición regeneradora del cabello y una solución acuosa. La composición y la solución anterior comprenden, en particular, ácido bórico, resorcinol, ácido salicílico, tanino, lysol y fenol.”* Otras patentes, como las patentes europeas 97112736.0 y 97943935.3 desarrollan procedimientos para el curtido de pieles en los que se incluyen taninos.

El solicitante no tiene conocimiento de composición alguna que contemple un tratamiento del cuero cabelludo contra la alopecia que incluya la participación de taninos y de una mixtura de minoxidil y finasterida.

Objeto de la invención

La presente invención se refiere a una composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia, detallando la forma de uso y posología de la misma.

La composición farmacéutica comprende una solución de taninos y una mixtura de los principios activos de minoxidil y de finasterida.

El minoxidil aporta su capacidad como vasodilatador, contribuyendo al mejor riego sanguíneo de los folículos pilosos, al tiempo que bloquea el calcio en las células del cuero cabelludo, lo que implica que los folículos pilosos no ven alterado su desarrollo. Por su parte, la finasterida actúa con sus propiedades inhibitoras bloqueando la Dihidrotestosterona (DHT), con lo cual los folículos pilosos no se ven afectados y mantienen su vitalidad. Visto lo anterior, es obvio que la combinación de ambos principios activos mejora sensiblemente su eficacia al reforzar los folículos pilosos en diferentes aspectos. Por su parte, la aplicación de una solución de taninos actúa directamente sobre el cuero cabelludo, protegiéndolo de la potencial agresividad de las soluciones tópicas del minoxidil y/o de la finasterida en las cuales participa un componente alcohólico en un alto porcentaje y graduación que puede dañar el cuero cabelludo en tratamientos de larga duración como son los que actúan contra la alopecia.

La mixtura de minoxidil y finasterida se presenta en una solución alcohólica de etanol 96%, con la participación de minoxidil de entre el 1% y el 7% y de finasterida de entre el 0,2% y el 0,7% en peso.

La solución de taninos es hididoalcohólica y comprende un porcentaje de entre el 50% y el 80% en peso de extracto acuoso con una concentración de entre el 10% y el 25% de corteza de Tepezcohuite (*Mimosa Teniuflora*) y un porcentaje de entre el 20% y el 50% en peso de alcohol etílico (etanol) de 96%.

5

La dosis de la mezcla de minoxidil y finasterida es de entre 3 y 7 gotas, administradas mediante un aplicador que contiene un elemento absorbente, por ejemplo algodón.

10

La dosis de la solución de taninos es de entre 3 y 10 gotas, administradas igualmente mediante un aplicador que contiene un elemento absorbente, por ejemplo algodón.

Este aplicador permite aplicar directamente las dosis indicadas sobre el cuero cabelludo, separando el pelo para conseguir una mejor impregnación de la solución de taninos y una mejor absorción de la mezcla de minoxidil y finasterida.

15

Exceder de la dosis señalada de la mezcla de minoxidil y finasterida puede ocasionar que la evaporación del alcohol sea lenta y actúe demasiado tiempo sobre el cuero cabelludo, pudiendo provocar lesiones como escamaciones y llagas.

20

La posología preferente es de una aplicación alterna cada 12 horas de la solución de taninos y de la mezcla de minoxidil y finasterida sobre el cuero cabelludo.

El uso de esta composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia consiste en un ciclo de siete días con las siguientes fases:

25

a) Por la mañana, mediante una impregnación superficial sin fricción del cuero cabelludo, aplicar la solución curtiende de taninos, repitiendo diariamente durante seis días.

30

b) Por la noche, mediante una impregnación muy suave y sin frotar el cuero cabelludo, aplicar la solución alcohólica de la mezcla de minoxidil y finasterida en cantidad suficiente para mojar ligeramente el cuero cabelludo, repitiendo diariamente durante seis días.

35

c) Al séptimo día, proceder al lavado suave del cabello, sin aplicación de solución alguna.

d) Al octavo día, se inicia un nuevo ciclo.

Este ciclo se repite de forma continuada.

- 5 Si en un par de semanas no se nota mejoría en la caída de cabellos, se entiende que los folículos pilosos no responden al tratamiento de la forma esperada y es preferible no continuar.

- 10 El crecimiento de cabellos nuevos es rápido en los folículos con caída reciente y más largo en los de caída antigua, incluso es posible en los más antiguos que los folículos estén muertos y no sea posible regenerar el cabello.

- 15 Puesto que la composición que se reivindica contempla el uso de lociones de uso tópico sobre el cuero cabelludo, cualquier efecto secundario que pueda advertirse desaparece con el lavado con agua, aplicando un aclarado contundente del cuero cabelludo y del pelo.

- 20 No se considera necesario hacer más extensa esta descripción para que cualquier experto en la materia comprenda el alcance de la invención y las ventajas que de esta composición se derivan. Los términos en que se ha redactado esta memoria deberán ser tomados siempre en sentido amplio y no limitativo.

REIVINDICACIONES

- 1^a Composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia caracterizada esencialmente porque comprende una solución curtiente de taninos y una mixtura de minoxidil y finasterida.
- 2^a Composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia según la 1^a reivindicación caracterizado porque la solución curtiente de taninos es hididoalcohólica
- 3^a Composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia según la 2^a reivindicación caracterizado porque la solución hididoalcohólica de taninos comprende corteza de Tepezcohuite (Mimosa Teniuflora)
- 4^a Composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia según la 3^a reivindicación caracterizado porque la corteza de Tepezcohuite (Mimosa Teniuflora) se presenta en una concentración de entre el 10% y el 25% en un porcentaje de entre el 20% y 50% en peso de alcohol etílico (etanol) de 96% y un porcentaje de entre el 50% y el 80% en peso de extracto acuoso.
- 5^a Composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia según la 1^a reivindicación caracterizado porque la mixtura de minoxidil y finasterida se presenta en una solución alcohólica de etanol 96%, con la participación de minoxidil de entre el 1% y el 7% y de finasterida de entre el 0,2% y el 0,7% en peso.
- 6^a Uso de una composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia caracterizado porque consiste en un ciclo de seis días repetido de forma continuada con una aplicación alterna cada 12 horas de una solución curtiente de taninos y de una mixtura de minoxidil y finasterida, sin fricción del cuero cabelludo, finalizando el ciclo con un lavado suave del cabello al séptimo día.



OFICINA ESPAÑOLA
DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

②① N.º solicitud: 201631111

②② Fecha de presentación de la solicitud: 19.08.2016

③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TECNICA

⑤① Int. Cl.: Ver Hoja Adicional

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
X	CN 104887685 A (XIE BINGQUAN) 09/09/2015, (Resumen) World Patents Index [bases de datos en línea]. Derwent Publications, Ltd. [recuperado el 21/03/2017]. Recuperado de: EPOQUENET. DW201576, N° de acceso 2015-64955F.	1, 2, 5
Y	Resumen	3, 4, 6
Y	EP 0329834 A2 (IZUNDEGUI MACDONNELL, FRANCISCO) 30/08/1989, columna 1, líneas 5 - 8, líneas 21 - 35; ejemplo 1, reivindicación 2,	3, 4, 6
A	FR 2710533 A1 (NEMET, PIERRE ALAIN) 07/04/1995, Todo el documento.	1-6
A	US 2014114231 A1 (ROSTRO, BERTHA) 24/04/2014, Todo el documento.	1-6
A	MX 2015002300 A (BIOLAB SANUS FARMACEUTICA LTDA.) 10/02/2016, Todo el documento.	1-6
A	ROGERS, N.E. et al., 'Medical treatments for male and female pattern hair loss', JOURNAL OF THE AMERICAN ACADEMY OF DERMATOLOGY, 2008, Vol. 59, No. 4, Páginas 547-566, ISSN: 0190-9622 (print), ISSN: 1097-6787 (Electronic), doi: 10.1016/j.jaad.2008.07.001, Todo el documento.	1-6

Categoría de los documentos citados

X: de particular relevancia

Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la misma categoría

A: refleja el estado de la técnica

O: referido a divulgación no escrita

P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación de la solicitud

E: documento anterior, pero publicado después de la fecha de presentación de la solicitud

El presente informe ha sido realizado

☒ para todas las reivindicaciones

☐ para las reivindicaciones nº:

Fecha de realización del informe
27.03.2017

Examinador
J. L. Vizán Arroyo

Página
1/4

CLASIFICACIÓN OBJETO DE LA SOLICITUD

A61K8/97 (2017.01)

A61K31/506 (2006.01)

A61K31/58 (2006.01)

A61P17/14 (2006.01)

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación)

A61K, A61Q, A61P

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

INVENES, EPODOC, WPI, BIOSIS, MEDLINE, EMBASE, INTERNET

Fecha de Realización de la Opinión Escrita: 27.03.2017

Declaración

Novedad (Art. 6.1 LP 11/1986)	Reivindicaciones 3, 4, 6	SI
	Reivindicaciones 1, 2, 5	NO
Actividad inventiva (Art. 8.1 LP11/1986)	Reivindicaciones	SI
	Reivindicaciones 3, 4, 6	NO

Se considera que la solicitud cumple con el requisito de aplicación industrial. Este requisito fue evaluado durante la fase de examen formal y técnico de la solicitud (Artículo 31.2 Ley 11/1986).

Base de la Opinión.-

La presente opinión se ha realizado sobre la base de la solicitud de patente tal y como se publica.

1. Documentos considerados.-

A continuación se relacionan los documentos pertenecientes al estado de la técnica tomados en consideración para la realización de esta opinión.

Documento	Número Publicación o Identificación	Fecha Publicación
D01	CN 104887685 A (XIE BINGQUAN)	09.09.2015
D02	EP 0329834 A2 (IZUNDEGUI MACDONNELL, FRANCISCO)	30.08.1989
D03	FR 2710533 A1 (NEMET, PIERRE ALAIN)	07.04.1995
D04	US 2014114231 A1 (ROSTRO, BERTHA)	24.04.2014
D05	MX 2015002300 A (BIOLAB SANUS FARMACEUTICA LTDA.)	10.02.2016
D06	Rogers, N.E. et al., <i>J. Am. Acad. Dermatol.</i> , (2008), 59(4): 547-66.	2008

En D01, D05 y D06 se describen composiciones farmacéuticas para el tratamiento de la alopecia que contienen minoxidil y finasterida.

En D02-D04 se describe la obtención y uso de composiciones farmacéuticas que contienen un extracto hidroalcohólico de la corteza de Tepezcohuete (*Mimosa tenuiflora*).

2. Declaración motivada según los artículos 29.6 y 29.7 del Reglamento de ejecución de la Ley 11/1986, de 20 de marzo, de Patentes sobre la novedad y la actividad inventiva; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

Se considera que los documentos D01 y D02 constituyen el estado de la técnica más próximo al objeto definido en las reivindicaciones de la solicitud. Estos documentos afectan a la patentabilidad de dicho objeto en la manera que se expone a continuación:

1. NOVEDAD (Art. 4.1. y Art. 6.1. de la Ley de Patentes).**1.1. La reivindicación 1 y las reivindicaciones dependientes 2 y 5 comprenden características técnicas que no cumplen el requisito de novedad con respecto al estado de la técnica anterior, representado por el documento D01.**

En D01 se divulga una composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia que comprende minoxidil a una concentración del 1 al 6% en peso y finasterida a una concentración en peso del 0,01 al 0,8 % en peso (cf. D01: Resumen). Además dicha composición farmacéutica comprende extracto de semilla de uva (2-6% en peso) que contiene compuestos polifenólicos (taninos).

Por consiguiente, la composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia divulgada en D01 y la definida en las reivindicaciones 1, 2 y 5 de la solicitud comparten las mismas características técnicas.

Por todo ello, se considera que el objeto de las reivindicaciones 1, 2 y 5 no es nuevo (Art. 4.1., Art. 6.1. Ley de Patentes).

2. ACTIVIDAD INVENTIVA (Art. 4.1. y Art. 8.1. de la Ley de Patentes).**2.1. Las reivindicaciones 3, 4 y 6 comprenden características técnicas que no cumplen el requisito de actividad inventiva con respecto al estado de la técnica anterior, representado por los documentos D01 y D02.**

En D01 se divulga una composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia de comprende unos principios activos (minoxidil y finasterida) y un extracto de semilla de uva (cf. D01: Resumen).

La diferencia técnica entre composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia de la reivindicación 3 y la divulgada en D01 radica en el origen vegetal de la solución hidroalcohólica de taninos.

En D02 se describe una composición para el crecimiento y regeneración del cabello que contiene un extracto hidroalcohólico de corteza, ramas y hojas de *Mimosa tenuiflora* (Tepezcohuete) (cf. D02: Columna 1, líneas 5 - 8, líneas 21 -35; Ejemplo 1; Reivindicación 2).

Por consiguiente, se considera que el experto en la materia, a la vista de los documentos D01-D02 y motivado por la necesidad de conseguir una composición farmacéutica para el tratamiento de la alopecia hubiera llegado a la solución propuesta en la reivindicación 3 o a una equivalente.

Por lo tanto, se estima que el objeto de las reivindicaciones 3, 4 y 6 no tiene actividad inventiva (Art. 4.1. y Art. 8.1. Ley de Patentes).