

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 925 732**

21 Número de solicitud: 202100093

51 Int. Cl.:

A61K 31/4178 (2006.01)

A61K 31/196 (2006.01)

A61K 31/5383 (2006.01)

A61K 9/08 (2006.01)

A61P 27/10 (2006.01)

12

SOLICITUD DE PATENTE

A1

22 Fecha de presentación:

06.04.2021

43 Fecha de publicación de la solicitud:

19.10.2022

71 Solicitantes:

PRESBYCARROD DROPS S.L. (100.0%)

C/ Concepción Arenal, 20 - Portal 4

35006 Las Palmas de Gran Canaria (Las Palmas) ES

72 Inventor/es:

RODRÍGUEZ HERNÁNDEZ, José Vicente y

CARRERAS DÍAZ, Humberto

74 Agente/Representante:

ZERPA MARRERO, Jorge Juan

54 Título: **Composición oftálmica**

57 Resumen:

Composición oftálmica, en particular una composición oftálmica para la corrección de la presbicia consistente en un colirio basado en una concentración de pilocarpina entre 1-1,5% + bromfenaco 1.8 mgrs en una solución salina balanceada (BSS) que, además, incluye pirenoxina sódica. Concretamente, consiste en un colirio de 8 o 9 ml, para conseguir una concentración de pilocarpina final entre 1-1,5%, bromfenaco 1.8 mgrs, y pirenoxina sódica 0.05mg/ml, todo ello en una solución salina balanceada (BSS).

ES 2 925 732 A1

DESCRIPCIÓN

Composición oftálmica

5 Objeto de la invención

La invención, tal como expresa el enunciado de la presente memoria descriptiva, se refiere a una composición oftálmica.

10 Más en particular, el objeto de la invención se centra en una mejorada composición para el tratamiento farmacológico de la presbicia que, estando basada en un colirio ya conocido con una fórmula que comprende una concentración de pilocarpina al 1-1,5% y bromfenaco, 1.8 mgrs en solución salina balanceada estéril (BSS), se distingue por incluir además, en dicha
15 fórmula, pirenoxina sódica en una proporción de 0,05mg/ml que, como agente anti-cataratas, supone una mejora de la fórmula citada haciendo que la eficacia del colirio sea mucho más prolongada en el tiempo, mejorando y alargando la independencia de las gafas de cerca en pacientes Prébistas a los que está destinado, mejorando notablemente la calidad de vida de los mismos.

20 Campo de aplicación de la invención

El campo de aplicación de la presente invención se enmarca dentro del sector de la industria farmacéutica, centrándose particularmente en el ámbito de los fármacos oftalmológicos.

25 Antecedentes de la invención

Como es sabido, la Presbicia, también denominada vista cansada, es un defecto ocular asociado a la edad que aparece generalmente entre los 40-45 años y ocasiona dificultad para ver de cerca. Se debe a la reducción del poder de acomodación del cristalino que provoca
30 disminución de la capacidad para enfocar objetos cercanos.

La acomodación es la capacidad que permite a las personas ver con nitidez objetos cercanos a expensas de la función del músculo ciliar que cambia la forma del cristalino y aumenta el poder óptico del ojo. La función del músculo ciliar depende del grado de estimulación parasimpática
35 de los receptores muscarínicos, además a través de la modulación de la pupila, contrayendo la pupila para crear un "efecto de estenopeico" y aumentar la profundidad de campo, mejorando aún más, la visión de cerca. Disminuir el tamaño de la pupila: aumenta tanto la profundidad de campo como la profundidad de enfoque.

40 Los síntomas aparecen entre los 40-45 años y progresan hasta los 60 aproximadamente. Consisten en una dificultad creciente para la visión nítida de objetos cercanos.

"La necesidad de corrección de la Presbicia es un punto importante de insatisfacción visual para los pacientes Emétropes sanos mayores de 40 años" y tener opciones no quirúrgicas para
45 eliminar la necesidad de gafas o lentes de contacto en Prébistas jóvenes, sería una estrategia bienvenida a nuestro armamentarium de corrección de la Presbicia.

Actualmente no existe en el mercado farmacéutico, ningún tratamiento tópico, seguro, eficaz y bien tolerado que pueda ser utilizado, para compensar la Presbicia. La etiología de la Presbicia
50 aún no está bien definida, pero los cambios que se producen en el Cristalino, en la Zónula y en

el Músculo Ciliar, contribuyen probablemente a la pérdida progresiva de la capacidad de Acomodación.

Si existe, sin embargo, un tratamiento farmacológico, consiste en la estimulación de los receptores muscarínicos, mediante la instilación de un colirio, divulgado en el documento de patente n° ES253855B1, y cuyo titular es el propio solicitante de la presente invención, consistente en una composición para la activación de la función del músculo ciliar y del esfínter de la Pupila. La estimulación farmacológica de la función ciliar con dicho colirio logra mejorar la Acomodación, que unido a la mejoría en la profundidad de foco ocasionada por el efecto estenopeico provocado por la miosis obtenida, permite que los pacientes vuelvan a enfocar en todas las distancias, hasta que aparecen los primeros síntomas de "esclerosis del cristalino" y por supuesto de la pérdida de elasticidad del mismo.

Es por ello, que sería deseable poder alargar la efectividad de dicho fármaco.

Por otra parte, es también conocido que la Pirenoxina Sódica 0,05 mg/ml, es un estabilizador de membrana de células del Cristalino, normalizando su metabolismo e impidiendo la fijación de sustancias opacificantes a las proteínas del mismo. La Pirenoxina es, pues, un agente anti-cataratas.

El objetivo de la presente invención, es pues, el desarrollo de un colirio para la corrección de la presbicia mejorado mediante la combinación del mismo con un agente anti-cataratas como la Pirenoxina Sódica para poder ampliar y alargar su efectividad.

Explicación de la invención

La composición oftálmica que la invención propone se configura, pues, como una solución óptima al objetivo anteriormente señalado, estando los elementos caracterizadores que la distinguen convenientemente recogidos en las reivindicaciones finales que acompañan a la presente descripción.

Más concretamente, como se ha apuntado en apartados anteriores, la invención se refiere a una composición oftálmica para el tratamiento farmacológico de la presbicia mejorada, la cual, estando basada en un colirio ya conocido y divulgado en la patente n° ES253855B1 del propio solicitante, con una fórmula que comprende una concentración de pilocarpina al 1-1,5% y bromfenaco, 1.8 mgrs en solución salina balanceada estéril (BSS), se distingue por el hecho de que además, en dicha fórmula, se incluye un agente anti-cataratas, concretamente pirenoxina sódica en una proporción de 0,05mg/ml, lo cual supone una mejora de la fórmula citada.

Dicho fármaco puede desempeñar un papel importante en la prevención y retraso de la aparición de Cataratas. El efecto anti-cataratas de la Pirenoxina resulta de la inhibición de la combinación sulfhidrilo de sustancias quinoides con proteínas del Cristalino y la inhibición conduce al mantenimiento de la transparencia del Cristalino, así como a la conservación durante años de su elasticidad, todo ello hace que la eficacia del nuevo colirio sea mucho más prolongada en el tiempo, mejorando y alargando en el tiempo, la independencia de las gafas de cerca en pacientes Présbitas, mejorando notablemente la calidad de vida de nuestros pacientes.

Más específicamente, la composición oftálmica objeto de la invención consiste en un colirio de 8 o 9 ml, para conseguir una concentración de pilocarpina final entre 1-1,5%, bromfenaco 1.8 mgrs, y pirenoxina sódica 0.05mg/ml, todo ello en una solución salina balanceada (BSS).

Descrita suficientemente la naturaleza de la presente invención, así como la manera de ponerla en práctica, no se considera necesario hacer más extensa su explicación para que cualquier experto en la materia comprenda su alcance y las ventajas que de ella se derivan, haciéndose constar que podrá ser llevada a la práctica en otras formas de realización que difieran en detalle siempre que no se modifique lo fundamental.

5

REIVINDICACIONES

- 5 1. COMPOSICIÓN OFTÁLMICA, en particular una composición oftálmica para la corrección de la presbicia consistente en un colirio basado en una concentración de pilocarpina entre 1-1,5% + bromfenaco 1.8 mgrs en una solución salina balanceada (BSS), está **caracterizada** porque, además, incluye pirenoxina sódica.
- 10 2. COMPOSICIÓN OFTÁLMICA, según la reivindicación 1, **caracterizada** porque consiste en un colirio de 8 o 9 ml, para conseguir una concentración de pilocarpina final entre 1-1,5%, bromfenaco 1.8 mgrs, y pirenoxina sódica 0.05mg/ml, todo ello en una solución salina balanceada (BSS).



②① N.º solicitud: 202100093

②② Fecha de presentación de la solicitud: 06.04.2021

③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TÉCNICA

⑤① Int. Cl.: Ver Hoja Adicional

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
Y	ES 2538551 A2 (EUROCANARIAS OFTALMOLOGICA SL) 22/06/2015; todo el documento.	1-2
Y	TSUNEYOSHI YUKARI <i>et al.</i> ; Author Correction: Suppression of presbyopia progression with pirenexine eye drops: experiments on rats and non-blinded, randomized clinical trial of efficacy.. Scientific reports England, 16/04/2020, Vol. 10, Páginas 6757, ISSN 2045-2322 (Electronic), <DOI: doi:10.1038/s41598-020-62436-7 pubmed:32296100>	1-2
A	EP 0885612 A1 (PHARMACONSULT S A S) 23/12/1998; ejemplo.	1-2

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
14.02.2022

Examinador
N. Vera Gutierrez

Página
1/2

CLASIFICACIÓN OBJETO DE LA SOLICITUD

A61K31/4178 (2006.01)

A61K31/196 (2006.01)

A61K31/5383 (2006.01)

A61K9/08 (2006.01)

A61P27/10 (2006.01)

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

A61K, 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, REGISTRY, CAS, WPI, EMBASE, MEDLINE, BIOSIS, NPL, XPESP, PATENW