



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 311 588**

51 Int. Cl.:

A61K 31/555 (2006.01)	A61K 31/381 (2006.01)
A61K 31/202 (2006.01)	A61K 31/198 (2006.01)
A61K 31/375 (2006.01)	A61K 31/355 (2006.01)
A61K 31/51 (2006.01)	A61K 31/525 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01)	A61K 31/714 (2006.01)
A23L 1/29 (2006.01)	A61P 25/02 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **02425786 .7**

96 Fecha de presentación : **19.12.2002**

97 Número de publicación de la solicitud: **1325747**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **09.07.2003**

54 Título: **Suplemento dietético para pacientes neuropáticos.**

30 Prioridad: **20.12.2001 IT MI01A2732**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.02.2009

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.02.2009

73 Titular/es: **Health Pharma S.R.L**
Via della Vittoria 47
20025 Legnano, MI, IT

72 Inventor/es: **Lucchina, Franco y**
Terruzzi, Franco

74 Agente: **Isern Jara, Jorge**

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

Suplemento dietético para pacientes neuropáticos.

5 El presente invento se refiere a un suplemento dietético y particularmente a una composición de sustancias particularmente útiles para administrarse a sujetos afectados de neuropatías.

10 Se conoce que en muchos casos los suplementos dietéticos se formulan de modo que resulten útiles para la administración a personas susceptibles de situaciones de deficiencia particular o en condiciones de necesidad aumentada de nutrientes específicos.

15 El objeto del presente invento es proporcionar un suplemento dietético particularmente útil en la dieta de sujetos afectados por neuropatías. Este objeto se obtiene, de conformidad con el presente invento, con una composición de sustancias ya conocidas de por sí, pero combinadas en una nueva forma y oportunamente equilibrada para administrarse en la dieta de personas que tienen las necesidades antes citadas.

Las características del suplemento dietético se especifican en la reivindicación 1, especificándose otras características en las reivindicaciones dependientes.

20 La dieta suplementaria de conformidad con el presente invento además de ser fácilmente utilizable, tiene la ventaja básica de proporcionar al consumidor un agregado de sustancias cada una de las cuales tiene una actividad bien determinada y siendo dosificada mutuamente en una forma óptima. En efecto, comprende cantidades bien determinadas y oportunamente coordinadas de dos sustancias que tienen una actividad neuro-protectora, una sustancia que tiene actividad anti-inflamatoria y antioxidante, una sustancia que actúa sobre el sacaro- y lipometabolismo, así como
25 vitaminas con propiedades antioxidantes y un complejo vitamínico que actúa sobre el trofismo neuronal.

30 La primera sustancia que tiene actividad neuro-protectora, seleccionada oportunamente para el suplemento de la dieta de conformidad con el presente invento, es ácido lipoico o tióctico, una sustancia natural cuyas propiedades son ya conocidas y por tanto no requieren una descripción detallada. En la composición está presente en cantidades comprendidas entre 50 y 600 mg, de preferencia entre 100 y 300 mg, de conformidad con la dosis de toma y/o forma de administración.

35 La segunda sustancia que tienen una actividad neuro-protectora que se utiliza en la composición de conformidad con el presente invento es ácido γ -linolénico, un ácido graso poliinsaturado cuyas propiedades son ya conocidas y por tanto no es necesario una descripción detallada. En la composición está presente en cantidades comprendidas entre 50 y 600 mg, de preferencia entre 100 y 300 mg, dependiendo de la dosis de admisión y/o forma de administración.

40 Como una sustancia que tiene actividad anti-inflamatoria y antioxidante, se utiliza selenio, de preferencia como selenometionina que comprende 40,26% de selenio, en cantidades comprendidas entre 0,05 y 0,11 mg, de preferencia entre 0,06 mg y 0,1 mg dependiendo de la dosis de toma y/o forma de administración.

45 En algunas modalidades del suplemento de dieta de conformidad con el presente invento, como una sustancia que tiene actividad reguladora de sacaro- y lipometabolismo se utiliza picolinato de cromo que comprende 12,43% de Cr. También las propiedades de esta sustancia son ya conocidas y por tanto no es necesaria una descripción detallada. Esta presente en la composición en cantidades comprendidas entre 0,4 y 1,6 mg de preferencia entre 0,4 y 0,8 mg, dependiendo de la dosis de toma y/o forma de administración.

50 El picolinato de cromo puede eventualmente sustituirse por cantidades equivalentes de otro compuesto orgánico de cromo.

55 En calidad de vitaminas antioxidantes en la composición de conformidad con el presente invento se utilizan vitaminas C y E. La vitamina C se introduce en la composición de preferencia en forma de cristales puros en cantidades comprendidas entre 60 y 1580 mg, de preferencia entre 90 y 120 mg dependiendo de la dosis de toma y/o forma de administración.

La vitamina E está presente en la composición de preferencia en forma del polvo al 50% y en cantidades comprendidas entre 1,5 y 30 mg, de preferencia entre 10 y 30 mg dependiendo de la dosis de toma y/o forma de administración.

60 Además, como sustancia que actúa sobre el trofismo neuronal, está presente en la composición un complejo vitamínico del grupo "B", particularmente vitamina B1 en la dosis de 0,21 a 2,1 mg, de preferencia entre 1 y 2 mg; vitamina B2 en la dosis de 0,34 a 2,4 mg, de preferencia entre 1 y 2,2 mg, vitamina B6 en la dosis de 0,3 a 3 mg, de preferencia entre 1 y 3 mg, y vitamina B12 en la dosis de 0,00035 mg a 0,015 mg, de preferencia entre 0,00075 y 0,0015 mg.

65 Dependiendo de la dosis de toma y/o forma de administración, el suplemento dietético de conformidad con el presente invento puede comprender también excipientes, fragancias y otras sustancias que tengan una actividad conocida para el fin deseado. Estas sustancias son por ejemplo maltodextrina, celulosa microcristalina, estearato de magnesio,

ES 2 311 588 T3

sílize coloidal, etc. Aún en las cantidades óptimas de estas sustancias han de seleccionarse cada vez dependiendo de la dosis y de la forma de administración del suplemento dietético de conformidad con el presente invento.

5 Asimismo la técnica de preparación de la composición de conformidad con el presente invento se eligen en función de la forma de administración y de otras consideraciones prácticas. Esto será mas evidente para el experto en el arte a partir del ejemplo de realización que sigue del presente invento.

10 Para a realización de los ejemplos operativos que siguen se han utilizado sustancias que se encuentra en el comercio. Como ácido α -lipoico se ha utilizado un producto proporcionado por Labochim S.r.l. de Milan; en calidad de ácido γ -linolénico se ha utilizado un producto proporcionado por Giellep Chemicals de Milan, cuya sociedad ha proporcionado también sales minerales de cromo y selenio, mientras que las sustancias con actividad vitamínica se han proporcionado por el Istituto delle Vitamine Roche.

15 Ejemplo 1

Cápsulas de gelatina blanda

20 Para la preparación de un suplemento dietético de conformidad con el presente invento en forma de cápsulas de gelatina blanda se pesaron por separado los diferentes componentes necesarios para la producción de un lote industrial de alrededor de 150.000 cápsulas en donde el contenido en peso de la gelatina fue de alrededor del 35%.

25 En un recipiente de disolución de acero inoxidable proporcionad con agitador de alrededor de 200 litros de capacidad se introdujo primero ácido γ -linolénico, lecitina de soja, monodiglicéridos de ácidos grasos seguido de todos los demás componentes en polvo bajo lenta agitación.

Después de un periodo de unos 15 minutos se obtuvo una suspensión homogénea que se utilizó para llenar las cápsulas de gelatina blanda con una planta apropiada y específica que trabaja en ambiente aséptico.

30 La planta de producción de cápsulas de gelatina blanda operó sobre el principio de solidificación de gelatina animal en bandas de diferente ancho y espesor. La formación de cápsulas y el sellado correspondiente se simultaneó con el llenado de estas por medio de moldes apropiados. El tamaño de la cápsula fue un oval 12.

35 La composición porcentual en peso de cada cápsula fue finalmente como sigue:

	Gelatina	34,3
	Ácido γ -linolénico	25
40	Ácido α -lipoico R/S	30
	Vitamina C	4,50
45	Monodiglicéridos	2,80
	Vitamina E 50%	1,50
	Lecitina de soja	1
50	Selenometionina	0,01
	Ácido pantoténico	0,45
55	Vitamina B2	0,15
	Vitamina B1	0,12
	Vitamina B6	0,11
60	Vitamina B12	0,00015

65 Las cápsulas de gelatina blanda así obtenidas, después de un periodo de maduración apropiado, se envasaron en blisters de PVC-ALU o en botellas de vidrio.

ES 2 311 588 T3

Ejemplo 2

Cápsulas de gelatina blanda

5 Para hacer que el suplemento dietético sea mas apropiado para ser tomado por sujetos que sufran de trastornos de sacarometabolismo, se preparó actuando como en el ejemplo 1, pero con el suministro de cromo en forma de picolinato de cromo.

10 En un aparato de disolución de acero inoxidable proporcionando con agitador con capacidad de unos 200 litros, se introdujo primero ácido γ -linolénico, lecitina de soja, monodiglicéridos de ácidos grasos y le siguieron todos los otros componentes en polvo bajo lenta agitación.

15 Después de un periodo de unos 15 minutos se obtuvo una suspensión homogénea que se utilizó para llenar las cápsulas de gelatina blanda con una planta apropiada y específica que trabaja en ambiente aséptico.

La planta de producción de cápsulas de gelatina blanda operó sobre el principio de solidificación de gelatina animal en bandas de diferente ancho y espesor. La formación de cápsulas y el sellado correspondiente se simultaneó con el llenado de estas por medio de moldes apropiados. El tamaño de la cápsula fue un oval 12.

20 La composición porcentual en peso de cada cápsula fue finalmente como sigue:

	Gelatina	34,3
25	Ácido γ -linolénico	25
	Ácido α -lipoico R/S	30
	Vitamina C	4,50
30	Monodiglicéridos	2,80
	Vitamina E 50%	1,50
35	Lecitina de soja	1
	Selenometionina	0,01
	Acido pantoténico	0,45
40	Vitamina B2	0,15
	Vitamina B1	0,12
45	Vitamina B6	0,11
	Vitamina B12	0,00015
50	Picolinato de cromo	0,08

Las cápsulas de gelatina blanda así obtenidas, después de un periodo de maduración apropiado, se envasaron en blisters de PVC-ALU o en botellas de vidrio.

55 Ejemplo 3 de referencia

Comprimidos tragables revestidos

60 Para la preparación de un suplemento dietético en forma de comprimidos tragables revestidos se pesaron por separado los diferentes componentes necesarios para la producción de un lote industrial de alrededor de 200.000 cápsulas.

65 En una mezcladora tipo Viani se mezclaron a fondo durante unos 10 minutos todos los componentes de conformidad con el presente invento. La mezcla así obtenida se comprimió con máquina Ronchi R23 equipada con un dispositivo electrónico para el control del peso unitario y provista con punzones ovales o circulares.

ES 2 311 588 T3

Los comprimidos así obtenidos, con un peso de alrededor de 600 mg, se dejaron durante unas 48 horas sobre enrejados apropiados en una estancia deshumidificada.

5 El recubrimiento del comprimido se llevó a cabo en una cubeta giratoria que, para evitar la fusión y consiguiente polimerización del ácido α -lipoico, se calentó a temperaturas no superiores a 40°C.

El recubrimiento se llevó a cabo a través de una suspensión de hidroxipropilmetilcelulosa, colorantes, dióxido de titanio y excipientes apropiados. El peso final del comprimido fue de 630 mg $\pm$ 20 mg.

10

La composición final de cada cápsula expresado como un por ciento en peso fue como sigue:

	Celulosa microcristalina	36,32
15	Ácido α -lipoico racémico	47,37
	Selenometionina	0,01
	Ácido pantoténico	0,71
20	Vitamina B2	0,24
	Vitamina B1	0,19
25	Vitamina B6	0,17
	Vitamina C	7,11
	Vitamina E 50	2,37
30	Hidroxipropilmetilcelulosa	3,16
	Estearato de magnesio	0,79
35	Dióxido de titanio	1,58

Ejemplo 4 de referencia

40 *Comprimidos tragables revestidos*

Se siguió el mismo procedimiento que en el ejemplo 3, pero con suministro de cromo en forma de picolinato de cromo con el fin de hacer que el suplemento dietético sea mas apropiado para ser tomado por sujetos que sufran de trastornos de sacarometabolismo.

45

La composición final de la cápsula en % de su peso fue como sigue:

	Celulosa microcristalina	36,32
50	Ácido α -lipoico racémico	47,37
	Selenometionina	0,01
55	Ácido pantoténico	0,71
	Vitamina B2	0,24
	Vitamina B1	0,19
60	Vitamina B6	0,17
	Vitamina C	7,10
65	Vitamina E 50	2,37
	Picolinato de cromo	0,13

ES 2 311 588 T3

	Hidroxipropilmetilcelulosa	3,15
	Estearato de magnesio	0,79
5	Dióxido de titanio	1,58

Ejemplo 4 de referencia

- 10 Se siguió el mismo procedimiento que en el ejemplo 2 con la diferencia de que el 25% de ácido γ -linolénico se sustituyó por fosfolípidos de lecitina de soja en la cantidad del 10% con respecto al peso de la cápsula.

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

REIVINDICACIONES

1. Un suplemento dietético para pacientes neuropáticos que comprende ácido α -lipoico, ácido γ -linolénico, selenio, así como vitaminas que tienen actividad antioxidante y vitaminas de complejo B que tienen actividad neurotrópica, en donde el ácido α -lipoico está constituido por cantidades entre 50 y 600 mg y el ácido γ -linolénico está comprendido en cantidades entre 50 y 600 mg.

2. Un suplemento dietético de conformidad con la reivindicación 1, **caracterizado** porque la vitamina C y la vitamina E están contenidas como vitaminas antioxidantes.

3. Un suplemento dietético de conformidad con la reivindicación 2, **caracterizado** porque la vitamina C adopta forma de cristales puros en cantidades entre 60 y 180 mg y la vitamina E está en forma de polvo al 50% y en cantidades entre 1,5 y 30 mg.

4. Un suplemento dietético de conformidad con la reivindicación 3, **caracterizado** porque la vitamina C está comprendida en cantidades entre 90 y 120 mg y la vitamina E está comprendida en cantidades entre 10 y 30 mg.

5. Un suplemento dietético de conformidad con la reivindicación 4, **caracterizado** porque comprende vitamina B1 en cantidades entre 0,21 y 2,1 mg, vitamina B2 en cantidades entre 0,34 y 2,4 mg, vitamina B6 en cantidades entre 0,3 y 3 mg, y vitamina B12 en cantidades entre 0,00035 y 0,015 mg.

6. Un suplemento dietético de conformidad con la reivindicación 5, **caracterizado** porque la vitamina B1 está comprendida en cantidades entre 1 y 2 mg, la vitamina B2 está comprendida en cantidades entre 1 y 2,2 mg, la vitamina B6 está comprendida en cantidades entre 1 y 3 mg, y la vitamina B12 está comprendida en cantidades entre 0,00075 y 0,015 mg.

7. El uso de ácido α -lipoico, ácido γ -linolénico, selenio, así como vitaminas que tienen actividad antioxidante y vitaminas de complejo B que tienen actividad neurotrópica, en donde el ácido α -lipoico está constituido por cantidades entre 50 y 600 mg, y el ácido γ -linolénico está comprendido en cantidades entre 50 y 600 mg, para la preparación de un suplemento dietético para el tratamiento de neuropatías.