



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 336 479**

51 Int. Cl.:

**A61K 9/107** (2006.01)

**A61K 47/20** (2006.01)

**A61K 47/24** (2006.01)

**A61P 19/00** (2006.01)

**A61P 35/04** (2006.01)

**A61P 39/06** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06722529 .2**

96 Fecha de presentación : **24.02.2006**

97 Número de publicación de la solicitud: **1850830**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **07.11.2007**

54

Título: **Supositorio para unir compuestos de oxígeno reactivo en el cuerpo de seres humanos y animales.**

30

Prioridad: **25.02.2005 DE 10 2005 009 515**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**13.04.2010**

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**13.04.2010**

73

Titular/es: **Heinrich Exner**  
**Birkenweg 29**  
**39291 Möckern, DE**

72

Inventor/es: **Exner, Heinrich**

74

Agente: **Carpintero López, Mario**

ES 2 336 479 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

Supositorio para unir compuestos de oxígeno reactivo en el cuerpo de seres humanos y animales.

5 **Campo de la invención**

Por el documento DE 103 13 196 se conoce una emulsión de aceite de silicona para la profilaxis y la terapia de enfermedades como consecuencia de la formación de radicales de oxígeno reactivo. Esta emulsión se administra como pomada o inyección. Presenta como constituyentes esenciales el 0,01-85% en peso de silicona, especialmente polidimetilsiloxanos, el 0,01-35% en peso de emulsionante hidrófobo con un valor de HLB de 1 a 7 y/o un emulsionante hidrófilo con un valor de HLB de 7 a 14 y/o el 0,01-35% en peso de una mezcla de emulsionante hidrófobo e hidrófilo con un valor de HLB de 1 a 14, el 0,1-99% en peso de solución salina biocompatible y el 0,01-40% en peso de dimetilsulfóxido. En la aplicación como inyección es desventajoso, especialmente en una inyección intravenosa, que ésta sólo puede realizarse exclusivamente por personal cualificado. Esto hace necesario para el paciente que para cada tratamiento tenga que ir al médico o a un hospital. La aplicación como pomada muestra una acción exclusivamente local y es menos adecuada para un tratamiento de cuerpo entero.

Los antecedentes subyacentes a la invención son los siguientes. Las infecciones con secuelas inflamatorias pueden conducir a un colapso del sistema inmunitario - parálisis inmunitaria - (SIRS, choque séptico) debido a la aglomeración de productos intermedios de oxígeno y sus productos de reacción. Mediante la utilización de la emulsión conocida en grandes dosis se realiza una neutralización de estos productos intermedios de oxígeno insaturados, la parálisis inmunitaria se resuelve y la fagocitosis de los patógenos puede continuar.

También se producen efectos similares en el tratamiento del dolor. El dolor causado por inflamaciones representa la representación sensible de la aglomeración de estos productos intermedios insaturados y sus productos de reacción. Mediante la aplicación de la emulsión conocida en dosis mayores el dolor se trata en sus orígenes amortiguándose las cargas negativas.

En relación con el tratamiento de enfermedades con la emulsión de aceite de silicona conocida se hicieron las siguientes observaciones que se basan en principios fisicoquímicos: los aceites de silicona son dieléctricos y dipolares. En la emulsión conocida, los aceites de silicona están emulsionados y presentan una superficie muy grande.

En la mayoría de los casos, un dieléctrico obtiene sus propiedades mediante polarización. Cuando un dieléctrico se coloca en un campo eléctrico, los dipolos contenidos en el dieléctrico se orientan según el campo. Por dipolo se entiende en general la disposición de dos cargas opuestas, por ejemplo, una molécula con un extremo eléctricamente positivo y uno eléctricamente negativo. Debido a esta polarización, el dieléctrico está cargado y almacena energía que puede emitirse de nuevo tan pronto como se quite el campo eléctrico.

Los disolventes dipolares presentes, además del aceite de silicona, en la emulsión conocida y los emulsionantes usados basados en polioxietileno elevan el carácter dipolar de la emulsión. Las interacciones electrostáticas se producen y resultan las llamadas fuerzas de Van-der-Waals que se producen entre dipolos permanentes e inducidos (D. Voet, Judith G. Voet, Charlotte W. Pratt, Biochemie, pág. 26 y siguientes, 2002 Wiley-VCH Verlag, Weinheim).

Cuanto mayor sea la superficie de las moléculas de silicona dipolares, mayor será también la captación de carga. En experimentos en patas de rata, la evacuación de los aceites de silicona de la emulsión ya pudo observarse a partir del primer día después de la aplicación de la emulsión. Después del 4º día, la evacuación por monocitos y granulocitos neutrófilos disminuyó considerablemente.

El carácter dipolar del aceite de silicona sin emulsionar no tiene importancia para la desintegración de compuestos de oxígeno patógenos debido a su baja superficie.

De esto resulta que sólo las emulsiones de aceite de silicona son adecuadas para la transferencia de electrones. La limitación terminal de la emulsión de aceite de silicona conocida debido a la desintegración o al metabolismo de los constituyentes es de gran importancia para sus efectos clínicos.

La emulsión de aceite de silicona conocida ya se ha descrito para la estimulación de la defensa no específica del sistema inmunitario en diversas enfermedades. La dosificación se encontró en este caso a 1 ml en promedio. Esta dosificación fue suficiente según los hallazgos entonces presentes para poder realizar un tratamiento específico y para poder estimular el sistema inmunitario no específico. Los primeros efectos clínicos en el tratamiento de las enfermedades no aparecieron hasta después de 1 a 3 semanas.

La determinación de las fuerzas de Van-der-Waals presentes en la emulsión de aceite de silicona conocida abrió un campo completamente nuevo para el uso de esta emulsión para el tratamiento de procesos de enfermedad. Los efectos patológicos que se producen por los productos intermedios de oxígeno insaturados y sus productos de reacción pueden amortiguarse electrostáticamente antes de tiempo y ofrecen al progreso de la enfermedad un progreso de pronóstico esencialmente más favorable. Las cargas negativas de los productos intermedios de oxígeno insaturados se amortiguan por la emulsión de aceite de silicona conocida. La neutralización de estas cargas la realiza el propio cuerpo.

## ES 2 336 479 T3

En el tipo de aplicación de este fármaco es desventajoso que las siliconas sean absorbidas por el cuerpo y allí puedan almacenarse en tejidos y órganos. No se realiza una desintegración de las siliconas. Esto es una desventaja esencial.

5 De la memoria de patente DE 44 99 552 se conoce un adyuvante para antígenos, así como un procedimiento para la preparación y el uso de un adyuvante para antígenos.

El documento WO 02/074283 describe otra emulsión de adyuvante. Este documento WO da a conocer una emulsión constituida por polidimetilsiloxanos, DMSO, un emulsionante hidrófobo o una mezcla de un emulsionante hidrófobo y uno hidrófilo, así como una solución salina biocompatible. La emulsión se utiliza para el tratamiento de, entre otras, SIRS, estados de agotamiento agudos y crónicos, enfermedades tumorales o estados de dolor agudos y crónicos. La administración se realiza subcutánea o intramuscular.

15 El documento WO 95/15768 describe un adyuvante incompleto para antígenos como virus, bacterias, parásitos, incluidos sus productos de metabolismo o partes de las estructuras de virus, bacterias y parásitos para la inmunización que está constituido por el 0,01%-30% de polidimetilsiloxanos, el 0,01%-15% de emulsionante de complejos con un valor de HLB de 9-16, el 45%-99% de solución salina biocompatible y el 0,01-10% de dimetilsulfóxido, el 0,0001-1% de formador de quelatos.

20 La memoria de patente US 6 288 026 describe el uso de una emulsión de aceite en agua como fármaco o para la preparación de un fármaco.

Otra emulsión de aceite en agua para uso como fármaco o para la preparación de un fármaco se da a conocer en el documento WO 00/50085. Éste describe una emulsión de aceite en agua que se prepara para la aplicación subcutánea o intramuscular y está constituida por polidimetilsiloxanos, un emulsionante hidrófilo, una solución salina biocompatible y dimetilsulfóxido. Con la emulsión dada a conocer se tratan enfermedades como SIRS, enfermedades virales como, por ejemplo, hepatitis C y SIDA, migrañas, artritis reumatoide, inflamaciones agudas y crónicas, estados de agotamiento agudos y crónicos, enfermedades tumorales o estados de dolor agudos y crónicos.

30 Por tanto, es objetivo de la invención poder realizar una medicación sin residuos para excluir posibles reacciones inflamatorias en el cuerpo.

35 Por el estado de la técnica también se conocen ahora supositorios que contienen sustancias y principios activos que funden a la temperatura corporal. Habitualmente toman la forma de conos, rodillos o torpedos y se usan en la aplicación rectal y/o vaginal de principios activos.

Tales principios activos pueden comprender según el documento EP 0 031 561 C1:

40 xantinas, agentes anticancerígenos, antibióticos, polipéptidos, antiarrítmicos, otros agentes cardiovasculares, antidiabéticos, agentes antiulcerosos, agentes antifúngicos, sedantes, diuréticos, agentes antihipertensivos y fármacos para el tratamiento de la enfermedad de Parkinson.

45 En el documento DE 37 09 861 A1 se describe una masa de base de supositorio sin silicona constituida por una masa grasa insoluble en agua y un producto de adición de 5 a 50 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino endurecido como emulsionante para la preparación de óvulos (supositorios) con un contenido de disoluciones acuosas de principio activo. Contienen preferiblemente del 0,2 al 10% en peso de emulsionante. Con la masa pueden prepararse óvulos sin silicona con hasta el 30% en peso de agua dispersa en su interior.

50 Así se hace posible la incorporación de principios activos que sólo están disponibles o pueden procesarse en solución acuosa. Tales principios activos pueden procesarse en cantidades tales con las masas de base de supositorio que los óvulos así obtenidos contengan hasta el 30% en peso de agua homogéneamente distribuida, es decir, homogéneamente dispersa.

55 La invención se basa en el problema técnico de especificar un procedimiento para la preparación de una emulsión de aceite de silicona para el tratamiento de infecciones (inflamaciones) causadas por la aglomeración de productos intermedios de oxígeno y sus productos de reacción sin carga e irritación adicionales del organismo y el sistema inmunitario debido al almacenamiento de siliconas.

60 Para solucionar este problema, la invención enseña un supositorio para aplicación rectal y vaginal que contiene una emulsión de aceite de silicona sólida, caracterizada porque el supositorio contiene el 0,01-85% en peso de aceite de silicona y el 0,01-45% en peso de dimetilsulfóxido. El supositorio destaca porque se disuelve después de la aplicación y libera la emulsión de aceite de silicona, resorbiéndose el dimetilsulfóxido (DMSO), así como la glicerina opcionalmente añadida y/o la solución salina fisiológica, y los constituyentes restantes del supositorio permanecen en el intestino o la vagina debido a su tamaño de molécula y a continuación se excretan por completo.

65 La invención se basa en el hallazgo sorprendente de que la emulsión de aceite de silicona que contiene DMSO permanece estable en el intestino o la vagina durante y después del proceso de disolución de la masa grasa insoluble en

## ES 2 336 479 T3

agua del supositorio y de esta manera conserva la gran superficie obligatoriamente necesaria para el amortiguamiento de los productos intermedios de oxígeno perjudiciales para el organismo. También es sorprendente que se conserve la acción analgésica y antiinflamatoria (sistémica) en todo el cuerpo de la emulsión de aceite de silicona que contiene DMSO aunque la silicona no sea absorbida por el cuerpo, sin embargo, el DMSO es resorbido por el cuerpo.

5 El mecanismo de acción según la invención del supositorio se basa en que el DMSO se libera continua y uniformemente en el intestino durante el proceso de disolución del supositorio. Allí es absorbido por el cuerpo mediante la mucosa intestinal y mediante la circulación de la sangre se transporta en pocos minutos a todos los sistemas de órganos. En zonas inflamadas de órganos o zonas con altas concentraciones de compuestos intermedios de oxígeno insaturados, el DMSO se une a los productos intermedios de oxígeno y/o los pasa a la emulsión estable del aceite de silicona en el intestino en el que, debido a su alto carácter dipolar formado en la emulsión, las cargas negativas de la silicona emulsionada se unen, se neutralizan y se excretan por los excrementos. Por tanto, la reducción del dolor se produce en el plazo de un tiempo muy corto, como máximo de 15 minutos. El DMSO no presenta efectos prolongados en el cuerpo ya que, además de la excreción por el intestino, también se excreta por la piel y los pulmones.

Bibliografía: (Pharmacology of DMSO, **Stanley W. Jacob** and **Robert Herschier**, Department of Surgery • Oregon Health Science University • Portland, Oregon 97201, 2001-2003).

20 Se ha comprobado que la acción según la invención del DMSO sólo se alcanza en combinación con la emulsión de aceite de silicona mencionada. Una administración de DMSO puro o en combinación con siliconas no emulsionadas no conduce a la alta acción analgésica y antiinflamatoria según la invención.

25 Mediante el supositorio según la invención que contiene una emulsión de aceite de silicona sólida que contiene DMSO también se garantiza que se realice una emisión de DMSO lenta y uniforme del supositorio. Por una parte, esto se justifica por la forma de la emulsión por sí misma, por otra parte por la composición del supositorio. La emulsión de aceite de silicona que contiene DMSO se libera lenta y continuamente en el intestino o la vagina durante la disolución de la proporción de masa grasa insoluble en agua del supositorio, es decir, el supositorio según la invención presenta, además del carácter prolongado de la emulsión de aceite de silicona, un carácter prolongado adicional. Mediante la elección del tipo y las proporciones de los constituyentes del supositorio puede determinarse la velocidad de las liberaciones de la emulsión de aceite de silicona que contiene DMSO. Esto puede conseguirse, entre otras cosas, por el tipo de las masas grasas insolubles en agua elegidas (longitud de cadena, comportamiento de fusión, carácter de unión). A causa de esto, la dosificación de la emulsión de aceite de silicona que contiene DMSO se adapta al cuadro de enfermedad que va a tratarse.

35 Debido a éste pueden aplicarse cantidades de DMSO claramente más pequeñas con la misma intensidad de acción. En preparaciones convencionales para el tratamiento de enfermedades crónicas en seres humanos, el DMSO puede administrarse en una dosis de hasta 1 g/kg de peso corporal. Sólo se produce una acción tóxica en seres humanos con un aporte de más de 1 g/kg de DMSO (N. M. Luerry y col., Drug. Intell. Clin Pharm. 18, 591 [1984]). Debido a la emulsión de aceite de silicona según la invención, la misma acción se consigue en seres humanos con una dosis de aplicación de DMSO de 1 mg/kg de peso corporal. Por tanto, con la emulsión de aceite de silicona según la invención se reduce la cantidad de DMSO que va a aplicarse a 1/1000 de la cantidad de aplicación hasta ahora habitual.

45 En la administración rectal es ventajoso que el paso hepático primario se evita en gran parte ya que las proporciones de la emulsión resorbidas en los dos tercios inferiores del recto llegan directamente a la vena cava inferior y no a la vena portal. La acción de la emulsión de aceite de silicona según la invención se produce en el plazo de pocos minutos, preferiblemente después de 5 a 15 min, en promedio después de 10 min, y se mantiene duraderamente durante todo el periodo de resorción de 2 a 6 horas, en promedio de 4 horas.

50 Preferiblemente se usan masas grasas insolubles en agua que se usan como masa de base del supositorio según la invención, seleccionadas preferiblemente del grupo “mantequilla de cacao, grasas vegetales endurecidas, mezclas de mono, di y triglicéridos de ácidos grasos saturados, ceras”.

55 Los emulsionantes según la invención pueden seleccionarse del grupo “emulsionantes con un valor de HLB de 1 a 14”. Preferiblemente se usan emulsionantes basados en polioxietileno. Éstos elevan el carácter dipolar de la emulsión.

60 Como otros coadyuvantes, al supositorio según la invención pueden añadirse, además de alcohol cetilestearílico, cera de abeja, monoestearato de glicerina, estearato de aluminio, bentonita, celulosa, triglicéridos líquidos, parafinas, ácido silícico altamente disperso o tierra de infusorios, carbonato cálcico, óxido de magnesio, antioxidantes.

65 Preferiblemente, el supositorio está constituido por el 0,01-85% en peso de aceites de silicona, especialmente polidimetilsiloxanos, el 0,01-35% en peso de emulsionante hidrófobo con un valor de HLB de 1 a 7 y/o un emulsionante hidrófilo con un valor de HLB de 7 a 14 y/o el 0,01-35% en peso de una mezcla de emulsionante hidrófobo e hidrófilo con un valor de HLB de 1 a 14, el 0,1-99% en peso de solución salina biocompatible, el 0,01-40% en peso de dimetilsulfóxido (DMSO), el 0,01-35% en peso de glicerina, el 0,01-45% en peso de alcohol cetilestearílico, el 0,01-80% en peso de masa grasa insoluble en agua, disolviéndose el supositorio después de la aplicación y liberando la emulsión, resorbiéndose el dimetilsulfóxido (DMSO), la glicerina, así como la solución salina fisiológica, y permaneciendo los

## ES 2 336 479 T3

constituyentes restantes del supositorio en el intestino o la vagina debido a su tamaño de molécula y a continuación excretándose por completo.

5 En una forma de realización especial, el supositorio está constituido por el 8,3% en peso de dimeticona, el 3,2% en peso de polisorbato 80, el 11,5% en peso de alcohol cetilestearílico, el 8,3% en peso de dimetilsulfóxido, el 9,8% en peso de solución salina fisiológica, el 9,8% en peso de glicerina, el 49,1% en peso de manteca de cacao.

10 Preferiblemente, el supositorio que contiene una emulsión de aceite de silicona sólida se utiliza para el tratamiento de estados de dolor. Especialmente se tratan estados de dolor que aparecen en enfermedades tales como en enfermedades autoinmunitarias o neoplasias.

Además, el supositorio según la invención se utilizó satisfactoriamente en el tratamiento de bloqueos en el área espinal.

15 El supositorio según la invención puede aplicarse fácilmente y sin dolor por lo que mejora claramente la aceptación del supositorio, especialmente en niños y pacientes con dolor. Debido a la forma como supositorio se hace posible un tratamiento de todo el cuerpo del paciente en casa dado que el paciente puede administrarse por sí mismo el supositorio o, por ejemplo, puede dejar que se lo administre un miembro de la familia. Con terapias a largo plazo también se cuenta con menos estados de irritación que con repetidas, especialmente con inyecciones intramusculares, ya que los aceites de silicona se excretan del cuerpo después de su disolución en el intestino como emulsión.

En el caso de la emulsión de aceite de silicona puede tratarse de una emulsión de aceite en agua, de agua en aceite, como también de una emulsión doble.

25 En el intestino grueso, hasta el 90% del transporte de sustancias no pasa por los enterocitos, sino por la ruta paracelular. Las zonas de oclusión en el colon y el recto pueden ser libremente pasadas por moléculas de hasta un diámetro de como máximo 0,2-0,25 nm, sin embargo es menos permeable o impermeable para sustancias de alto peso molecular. Una medida indirecta para determinar el tamaño de molécula en el aceite de silicona es la determinación de la viscosidad cinemática. Se comprobó que la viscosidad cinemática del aceite de silicona según la Farmacopea Europea debe ascender a al menos  $50 \text{ mm}^2 \cdot \text{s}^{-1}$  para excluir una resorción. En una forma de realización especial, el supositorio según la invención puede combinarse con principios activos solubles en agua y/o solubles en grasas. Preferiblemente, el supositorio según la invención contiene uno o varios principios activos solubles en agua del grupo “antibióticos, peróxido de hidrógeno, analgésicos y vitaminas soluble en agua”.

35 Igualmente, el supositorio según la invención hace posible la aplicación de principios activos solubles en grasas. Los principios activos solubles en grasas pueden ser vitaminas solubles en grasas.

Un aspecto especial de la invención especial es la combinación de uno o varios principios activos solubles en agua y uno o varios solubles en grasas en un supositorio.

40 En una forma de realización especial, el supositorio puede usarse para el tratamiento de enfermedades genitales, pudiendo contener el supositorio adicionalmente a los principios activos mencionados o como único principio activo una solución acuosa de peróxido de hidrógeno. La concentración de la solución de peróxido de hidrógeno asciende en este caso a del 1% en peso al 4,5% en peso, preferiblemente al 2,5% en peso. Por esto es posible el tratamiento de enfermedades de la mucosa vaginal como “candidiasis, infecciones virales, infecciones bacterianas”. La invención enseña además un procedimiento para la preparación de un supositorio según la invención que presenta al menos las etapas de procedimiento: calentamiento de toda la formulación en el baño caliente hasta 60-99°C, preferiblemente 85°C, homogeneización de la masa de supositorio con 12000 a 14000 rpm, preferiblemente con 13.000 rpm y llenado de la masa de supositorio.

50 En una forma de realización preferida, el supositorio según la invención se prepara según el siguiente procedimiento:

55 Todos los constituyentes del supositorio según la invención se funden en el baño de agua y se calientan hasta más de 80°C. Después se realiza la homogeneización con un aparato de agitación con 12000 rpm. La masa se vuelve de esta manera pastosa y a continuación puede llenarse inmediatamente en los moldes de colada. El endurecimiento se realiza en el frigorífico o a temperatura ambiente en el plazo de 12 horas.

60 Un efecto positivo inesperado de este procedimiento de preparación es que el supositorio sólido puede prepararse en una etapa. La emulsión de aceite de silicona se forma establemente con la presencia simultánea de la masa grasa insoluble en agua. Otra ventaja del procedimiento según la invención es que la masa de supositorio se enfría por sí misma durante la homogeneización. Así no es necesario un enfriamiento energéticamente costoso adicional de la masa de supositorio, por lo que el procedimiento según la invención es económicamente ventajoso en comparación con procedimientos conocidos para la preparación de preparaciones sólidas para aplicación rectal, vaginal u oral.

65 A continuación se explica más detalladamente la invención en formas de realización preferidas.

**Ejemplos**

5 H.S. \*1965 hembra: enfermedad de Bechterev desde hace más de 10 años. Tratamiento de los dolores crónicos con Celebrex. La enfermedad progresa y tampoco puede influirse esencialmente con Celebrex. Los efectos secundarios de Celebrex causan claramente dificultades a la paciente. Después de una semana de tratamiento con el supositorio según la invención con aplicación diaria, el estado general ya mejoró y después de 4 semanas de tratamiento pudo retirarse Celebrex.

10 H.A. \*1964 hembra: diagnóstico de tumor de mama después de operación, ciclos de quimioterapia y radiación. La paciente recibió los supositorios según la invención con aplicación diaria para mejorar la calidad de vida. Después de algunos días ya remitieron los dolores de articulaciones debidos a la terapia y la paciente pudo llevar de nuevo una vida activa.

15 R.B. \*1955 varón: diagnóstico: bloqueo de los cuerpos vertebrales en la región de las vértebras lumbares

El paciente se produjo un bloqueo vertebral en la región de las vértebras lumbares durante trabajos de colocación de suelos y ya no pudo caminar derecho. Después de la aplicación de un supositorio según la invención ya pudo continuar su trabajo.

20 S.J. \*1955 hembra: diagnóstico de síndrome de fatiga.

La paciente con síntomas típicos de agotamiento como insomnio, imposibilidad de concentración, temperatura subfebril y apatía general. Después del tratamiento con un supositorio según la invención volvió después de poco tiempo a su bienestar. Si se necesita se realiza un tratamiento adicional a intervalos semanales.

25 P. K. \*1969 hembra: diagnóstico de ataque de migraña.

Para el tratamiento, dos de los supositorios según la invención se aplicaron con una separación de una hora. Después la paciente estuvo libre de molestias.

30

35

40

45

50

55

60

65

## ES 2 336 479 T3

### REIVINDICACIONES

5 1. Supositorio para aplicación rectal y vaginal que contiene una emulsión de aceite de silicona sólida, en el que el supositorio contiene el 0,01-85% en peso de dimeticona y el 0,01-45% en peso de dimetilsulfóxido.

10 2. Supositorio según la reivindicación 1, **caracterizado** porque el supositorio está constituido por el 0,01-85% en peso de dimeticona, el 0,01-35% en peso de emulsionante hidrófobo con un valor de HLB de 1 a 7 y/o un emulsionante hidrófilo con un valor de HLB de 7 a 14 y/o el 0,01-35% en peso de una mezcla de emulsionante hidrófobo e hidrófilo con un valor de HLB de 1 a 14,

15 0,1-99% en peso de solución salina biocompatible,

0,01-40% en peso de dimetilsulfóxido,

0,01-35% en peso de glicerina,

20 0,01-45% en peso de alcohol cetilestearílico,

0,01-85% en peso de masa grasa insoluble en agua.

25 3. Supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 2, **caracterizado** porque el supositorio está constituido por

8,3% en peso de dimeticona,

3,2% en peso de polisorbato 80,

30 11,5% en peso de alcohol cetilestearílico,

8,3% en peso de dimetilsulfóxido,

9,8% en peso de solución salina fisiológica,

35 9,8% en peso de glicerina,

49,1% en peso de manteca de cacao.

40 4. Supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 3, **caracterizado** porque la dimeticona presenta una viscosidad cinemática superior a  $50 \text{ mm}^2 \text{ s}^{-1}$ .

45 5. Supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 4, **caracterizado** porque el supositorio puede resorberse durante un espacio de tiempo de 2-6 horas.

6. Supositorio según la reivindicación 5, **caracterizado** porque el supositorio puede resorberse durante un espacio de tiempo de 4 horas.

50 7. Supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 6, **caracterizado** porque el supositorio está combinado con principios activos solubles en agua y/o solubles en grasas.

8. Supositorio según la reivindicación 7, **caracterizado** porque los principios activos solubles en agua se seleccionan del grupo constituido por "antibióticos, analgésicos, vitaminas, peróxido de hidrógeno".

55 9. Supositorio según la reivindicación 7, **caracterizado** porque los principios activos solubles en grasas son vitaminas solubles en grasas.

60 10. Supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 9 para el tratamiento de enfermedades autoinmunitarias, neoplasias, bloqueos en el área espinal.

11. Supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 9 para el tratamiento de enfermedades genitales, en el que el supositorio contiene una solución acuosa de peróxido de hidrógeno.

65 12. Uso del supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 9 para la preparación de un fármaco para el tratamiento de enfermedades autoinmunitarias, neoplasias, bloqueos en el área espinal.

## ES 2 336 479 T3

13. Uso del supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 9 para la preparación de un fármaco para el tratamiento de enfermedades genitales, en el que la preparación contiene una solución acuosa de peróxido de hidrógeno.

5 14. Procedimiento para la preparación de un supositorio según una de las reivindicaciones 1 a 11 que contiene una emulsión de aceite de silicona sólida que presenta al menos las etapas de procedimiento:

- calentamiento de todos los constituyentes del supositorio en el baño caliente hasta 60-99°C,
- homogeneización con 12000 a 14000 rpm, preferiblemente con 13000 rpm,
- llenado de la masa de supositorio en moldes de colada.

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65