



MINISTERE DES AFFAIRES ECONOMIQUES

NUMERO DE PUBLICATION : 1007315A6

NUMERO DE DEPOT : 09300754

Classif. Internat. : A61K

Date de délivrance le : 16 Mai 1995

Le Ministre des Affaires Economiques,

Vu la loi du 28 Mars 1984 sur les brevets d'invention, notamment l'article 22;

Vu l'arrêté royal du 2 Décembre 1986 relatif à la demande, à la délivrance et au maintien en vigueur des brevets d'invention, notamment l'article 28;

Vu le procès verbal dressé le 19 Juillet 1993 à 14H05 à l'Office de la Propriété Industrielle

ARRETE:

ARTICLE 1.- Il est délivré à : A. MENARINI Industrie Farmaceutiche Riunite S.R.L.
Via Sette Santi 3-5, I-50131 FIRENZE(ITALIE)

représenté(e)s par : OVERATH Philippe, CABINET BEDE, Place de l'Alma, 3 - B 1200
BRUXELLES.

un brevet d'invention d'une durée de 6 ans, sous réserve du paiement des taxes annuelles, pour : COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES CONTENANT DE L'ACÉTYLCYSTEINE.

ARTICLE 2.- Ce brevet est délivré sans examen préalable de la brevetabilité de l'invention, sans garantie du mérite de l'invention ou de l'exactitude de la description de celle-ci et aux risques et périls du(des) demandeurs(s).

Bruxelles, le 16 Mai 1995
PAR DELEGATION SPECIALE :

WUYTS L.
Directeur.

DESCRIPTION

Compositions pharmaceutique contenant de l'acétylcystéine

La présente invention se rapporte à une composition pharmaceutique contenant de l'acétylcystéine, substance connue pour sa propriété de pouvoir fluidifier du mucus.

En médecine on utilise l'acétylcystéine comme mucolytique et expectorant dans le but de fluidifier les sécrétions visqueuses denses du système respiratoire en cas de bronchite et autres affections pulmonaires.

Comme médicament l'acétylcystéine est généralement administrée par voie orale sous forme de poudre, de granulé ou de comprimé soluble dans l'eau.

Toutefois l'acétylcystéine est une substance hautement acide, qui a en plus un goût extrêmement déplaisant, causé par le groupement sulfhydrile dans sa structure chimique,

il est donc important de l'incorporer dans des formes orales faciles et agréables à absorber, d'autant plus que le médicament s'adresse aussi aux jeunes enfants.

Il a déjà été proposé d'ajouter à l'acétylcystéine du sucre ou du saccharose en vue d'en améliorer le goût, mais ces substances contiennent pas mal de calories et peuvent créer un problème lors de traitements longs chez les personnes qui souffrent de diabète par exemple.

Il existe donc une demande pour médicaments à base d'acétylcystéine qui ne contient pas de sucre, tout en ayant un goût agréable et sous une forme orale facile à absorber.

La présente invention propose une composition à base d'acétylcystéine, sous forme de granulé, poudre ou comprimé, soluble dans l'eau, contenant un édulcorant synthétique, un dolcifiant ainsi qu'un arôme.

Comme l'édulcorant et le dolcifiant doivent être des substances compatibles entre elles et avec l'acétylcystéine, il est important de sélectionner très soigneusement ces substances.

Des recherches approfondies ont démontrées qu'en utilisant dans des proportions bien
5 spécifiques comme édulcorant la saccharine et comme dolcifiant le mannitol, on obtient une excellente formulation pharmaceutique.

En effet la valeur énergétique de la saccharine étant insignifiante et le mannitol n'étant pas resorbé par le tractus gastro-intestinal, cette composition ne comporte pas de contre-
indications. De plus on associera de préférence à cette composition un goût spécifique
10 que le consommateur pourra reconnaître, par exemple l'arôme orange, et un colorant pour usage pharmaceutique. Il est clair que tout autre arôme, tel pêche, abricot, pamplemousse, citron ou autre goût de fruit, pourra également être utilisé

La composition selon l'invention comporte (en pourcentages en poids): de 10 à 20% de N-acétylcystéine

15 de 0.5 à 3% de saccharine sodique
de 3 à 15% d'arôme
de 50 à 70% de mannitol

les parts en poids des composants totalisant 100.

La préparation de cette formulation sous forme de granulé se fait suivant les procédés
20 classiques, bien connus par l'homme de l'art de l'industrie pharmaceutique.

La composition suivant l'invention sous forme de granules est bien soluble dans l'eau à température ambiante et par conséquent facile à absorber et possède un goût agréable lui permettant d'être sans problèmes administrée aux jeunes enfants. Cette composition
pourra avantageusement être conditionnée en sachets de 1 gramme ou de multiples de
25 1 gramme.

A titre d'exemple ci-après deux formulations type:

Formulation de 1 gramme:

	N-acétylcystéine	200,0 mg
	Saccharine sodique	15,0 mg
30	Arôme (orange)	100,0 mg
	Mannitol	684,2 mg
	Colorant E110	0,8 mg

conditionnée sous forme de granulés en sachets.

Formulation de 3 grammes:

	N-acétylcystéine	600,0 mg
5	Saccharine sodique	40,0 mg
	Arôme (fruit)	300,0 mg
	Mannitol	2057,3 mg
	Colorant E110	2,7 mg

conditionnée sous forme de granulés en sachets.

REVENDICATIONS

1. Composition pharmaceutique à base d'acétylcystéine, caractérisée en ce qu'elle est constituée par:

	N-acétylcystéine	10 à 20% en poids
	Saccharine sodique	0,5 à 3% en poids
5	Arôme	5 à 15% en poids
	Mannitol	50 à 70% en poids

2. Composition suivant la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle comporte également un colorant pour usage pharmaceutique.

10

3. Composition suivant la revendication 1 ou 2, caractérisée en ce qu'elle est conditionnée sous forme de granulés en sachets.

4. Médicament à base de la composition suivant la revendication 3, caractérisé par la formulation suivante:

	N-acétylcystéine	200,0 mg
	Saccharine sodique	15,0 mg
	Arôme (orange)	100,0 mg
	Mannitol	684,2 mg
20	Colorant E110	0,8 mg

5. Médicament à base de la composition suivant la revendication 3, caractérisé par la formulation suivante:

	N-acétylcystéine	600,0 mg
25	Saccharine sodique	40,0 mg
	Arôme (fruit)	300,0 mg
	Mannitol	2057,3 mg
	Colorant E110	2,7 mg