



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 356 819**

51 Int. Cl.:

A23L 1/302 (2006.01)

A23L 1/304 (2006.01)

A61K 31/375 (2006.01)

A61K 31/355 (2006.01)

A61K 33/30 (2006.01)

A61K 33/04 (2006.01)

A23L 1/30 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **04100040 .7**

96 Fecha de presentación : **08.01.2004**

97 Número de publicación de la solicitud: **1437051**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **14.07.2004**

54

Título: **Luteína ocuvite.**

30

Prioridad: **09.01.2003 DE 203 00 305 U**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
13.04.2011

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
13.04.2011

73

Titular/es:

**Dr. Gerhard Mann Chem.-Pharm. Fabrik GmbH
Brunsbütteler Damm 165-173
D-13581 Berlin, DE**

72

Inventor/es: **Bellmann, Günther Dr. y
Claus-Herz, Gudrun Dr.**

74

Agente: **Ungria López, Javier**

ES 2 356 819 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

Luteína ocuvite .

5 La presente invención se refiere a un producto de combinación de micronutrientes. El producto de combinación de micronutrientes puede usarse por ejemplo para el complemento nutritivo en caso de degeneración macular relacionada con la edad.

Se conoce generalmente que el ojo es un órgano de alto rendimiento, que está expuesto a grandes esfuerzos debido al continuo proceso de visión. Por la acción de la luz y del oxígeno se originan los llamados "radicales libres", que pueden conducir a cambios patológicos en la retina.

10 Se conoce generalmente que muchas influencias externas, tales como por ejemplo una alimentación desequilibrada, el tabaquismo y el consumo de alcohol, contaminación ambiental, estrés o radiación ultravioleta, pueden conducir a una liberación de radicales. Pero también los procesos normales del metabolismo liberan a corto plazo sustancias altamente activas, que someten a esfuerzo y pueden dañar el cuerpo. El cuerpo posee un sistema de protección "antioxidante" para la degradación de estos "radicales libres", en el que participan de forma decisiva las vitaminas C y E, los carotinoides de tipo vitamina luteína y zeaxantina, así como los oligoelementos selenio y cinc. El sistema ofrece una protección óptima sólo cuando todos sus componentes activos están disponibles en una cantidad suficiente.

15 El ojo está expuesto en un alto grado a estrés oxidativo debido al proceso de visión y la continua acción de la luz. Por eso tiene una demanda incrementada de un suministro suficiente de las sustancias antioxidantes vitamina C, vitamina E, cinc y los carotinoides de tipo vitamina luteína y zeaxantina.

20 En la juventud se asegura la demanda de micronutrientes en gran parte mediante una alimentación equilibrada. Sin embargo, esto es más difícil de asegurar con el aumento de la edad mediante la alimentación. A los órganos que requieren una concentración particularmente alta de los carotinoides luteína y zeaxantina pertenece la mácula del ojo. Por la expresión médica "mácula lútea" se entiende el centro de la retina, es decir, el punto de visión más nítida. Aquí se encuentran las células visuales más sensibles del ojo.

25 Con un suministro deficiente prolongado de la mácula con micronutrientes aumenta el riesgo de desarrollar una "degeneración macular asociada a la edad" (DMAE). La DMAE tiene por consecuencia una disminución de la agudeza visual, en el peor de los casos hasta llegar a la ceguera. En los mayores de 65 años, la degeneración macular asociada a la edad es la causa principal de pérdida de agudeza visual y ceguera.

30 Los preparados vitamínicos conocidos en el estado de la técnica contienen diversas composiciones, frecuentemente sobredosificadas, de vitaminas y oligoelementos, que sin embargo no están dirigidos a un suministro de la mácula del ojo. De esta manera, una mayoría de estas composiciones contiene altas fracciones de vitaminas y oligoelementos de efecto antioxidante, sin embargo ni luteína ni zeaxantina. Una desventaja de estos preparados es su deficiente consideración de la mácula, que tiene una función central en el proceso de visión.

35 Otra desventaja de preparados antioxidantes disponibles en el mercado consiste en que no se tiene suficientemente en consideración la dependencia de la edad de la necesidad de vitaminas y minerales. Particularmente con la edad se pueden manifestar rápidamente síntomas de deficiencia por un suministro insuficiente debido a una alimentación deficiente o desequilibrada, o por enfermedad, particularmente en vista a enfermedades, tales como por ejemplo, DMAE, que los preparados regulados a ese fin no tienen en cuenta lo suficiente.

40 Los preparados antioxidantes disponibles son a menudo monopreparados de vitamina C, que se administran en altas dosificaciones y que a menudo no contienen oligoelementos o vitaminas adicionales. Estos preparados tienen la desventaja de que no son apropiados para una terapia de larga duración o para una profilaxis ilimitada en el tiempo, ya que estas dosis son demasiado elevadas para una ingestión prolongada en el tiempo, o pueden conducir en la alta dosificación a problemas con la tolerancia. Además, una ingestión de dosis elevada conduce a una ingestión aumentada a corto plazo, sin embargo en total no se absorbe una gran parte excesiva del principio activo debido al gran excedente.

45 El documento GB 2 301 775 desvela el uso de luteína y zeaxantina de forma separada o en combinación con el tratamiento de la degeneración macular asociada a la edad (DMAE).

50 El documento WO 01/19388 desvela bolitas, que comprenden xantofilas y carotinas y/o retinoides, suplementos dietéticos que comprenden estas bolitas y métodos para su uso.

El documento US 2002/0182266 desvela suplementos dietéticos, cuyos ingredientes esenciales son vitamina C, vitamina E, beta-carotina, cinc y cobre.

55 El documento US 5.976.568 desvela un sistema modular de suplementos dietéticos. El documento US 5.976.568 se refiere particularmente a un sistema completo modular de suplementos multivitamínicos y minerales, compuesto de siete módulos diferentes para mejorar la salud pública mediante aseguramiento de una ingestión adecuada de micronutrientes que son necesarios para la prevención de enfermedades y protección contra pérdidas

de nutrientes y déficits de nutrientes.

5 El documento EP 1 214 893 desvela composiciones para mejorar la salud, que comprenden al menos (a) 800 µg de vitamina A, 1000 mg de vitamina C, 400 UI de vitamina E, 200 µg de vitamina K (b) 10 mg de betacarotina, 6 mg de luteína, 5 mg de licopeno, 100 µg de zeaxantina, (c) 7,5 mg de vitamina B1, 7,5 mg de vitamina B2, 15 mg de niacina, 15 mg de ácido pantoténico, 7,5 mg de vitamina B6, 200 µg de ácido fólico, 6,75 µg de vitamina B12, (d) 200 µg de selenio, 10 mg de cinc, 120 µg de cromo, 2 mg de cobre, 4 mg de manganeso, 100 µg de yodo, 100 µg de molibdeno, (e) 200 µg de biotina, 450 mg de betaína, 100 mg de oligo-proantocianidina (OPC), 150 mg de complejo de polifenol, 600-5000 mg mezclados de omega-3 y 6, 4-6 g de oligosacáridos, particularmente oligofruktosa y/o beta-glucano, 4-6 g de inulina, y eventualmente sustancias adicionales a fin de estabilizar y formular los compuestos mencionados anteriormente.

10 Por tanto, existe la necesidad de un agente que contrarreste un suministro deficiente a la mácula con micronutrientes. Por lo demás, existe la necesidad de un agente, que como tal no provoque efectos secundarios perjudiciales para la salud y que pueda servir sin reparos para la prevención de síntomas de deficiencia y que también se pueda usar cuando ya exista degeneración macular asociada a la edad.

15 Por tanto, el objetivo de la presente invención es poner a disposición un agente que supere las desventajas mencionadas anteriormente del estado de la técnica. Particularmente, el objetivo de la presente invención es poner a disposición un agente que ofrezca un suministro completo de la mácula.

Este objetivo se resuelve mediante un producto de combinación de micronutrientes, comprendiendo el producto de combinación de micronutrientes los principios activos:

- 20 a. 0,6 - 1,2 g de luteína;
- b. 0,05 - 0,1 g de zeaxantina;
- c. 5,6 - 11,2 g de vitamina C;
- d. 0,8 - 2 g de vitamina E;
- e. 2,0 - 3,0 mg de selenio;
- 25 f. 0,5 - 1 g de cinc.

Se ha mostrado sorprendentemente que la mácula se fortaleció notablemente debido a la combinación optimizada de los carotinoides de tipo vitamina luteína y zeaxantina. Además se ha mostrado sorprendentemente que los carotinoides de tipo vitamina usados de forma optimizada de acuerdo con la invención provocan una protección preventiva mejorada de la mácula debido a su capacidad de captar radicales existentes.

30 Sin limitarse a una teoría determinada, se supone que los carotinoides de tipo vitamina luteína y zeaxantina se acumulan selectivamente en altas concentraciones en la mácula y protegen así esta zona mediante filtrado de la luz y la captación de los "radicales libres" perjudiciales. A este fin, el abastecimiento calculado de esos micronutrientes esenciales puede por tanto contribuir a proteger el ojo de la generación de una degeneración macular asociada a la edad o a retardar su avance.

35 El producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la invención no es un fármaco. Se puede usar como un complemento nutritivo de refuerzo o para la administración conjunta, por ejemplo, en el tratamiento de una degeneración macular asociada a la edad.

40 También puede ser apropiada de acuerdo con la invención una realización del producto de combinación de micronutrientes que está libre de beta-carotina y/u óxido de cobre. Una ingestión oral de beta-carotina puede conducir en dosificaciones elevadas en combinación con fármacos a daños, particularmente en fumadores. El producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la invención puede estar libre de beta-carotina. Se puede influenciar positivamente de forma ventajosa en la tolerancia del producto de combinación de micronutrientes, particularmente para fumadores, mediante una realización del producto de combinación de micronutrientes que está libre de beta-carotina. El producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la invención también puede estar libre de óxido de cobre.

45 Se ha mostrado sorprendentemente que el uso de acuerdo con la invención de la zeaxantina combinado con cinc influye positivamente en el suministro de los consumidores frente al uso de monoprocedimientos. En su función como suplemento dietético, el producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la invención presenta zeaxantina, que en combinación equilibrada con luteína, el oligoelemento cinc y vitaminas de efecto antioxidante adicionales contribuye, debido a un suministro equilibrado de la mácula, a la prevención de un daño por radicales a la acción del agente de acuerdo con la invención, por lo que se influye positivamente en la mejora de la capacidad visual en la edad avanzada y se dificulta la aparición de una degeneración macular asociada a la edad. Debido al uso de acuerdo con la invención de los carotinoides de tipo vitamina con propiedades antioxidantes conjuntamente con cinc, el producto de combinación de micronutrientes presenta un efecto nutritivo o dietético mejorado.

- 5 Las propiedades ventajosas se obtienen de la selección optimizada de los componentes individuales, que se seleccionaron especialmente para combatir daños oxidativos de la mácula por radicales, y que compensan un déficit de antioxidantes causado por alimentación deficiente o factores de riesgo, tales como por ejemplo, tabaquismo y consumo de alcohol, contaminación ambiental, estrés o radiación UV. Es particularmente ventajoso que por el contenido optimizado de los oligoelementos cinc y selenio se obtenga una mejora clara de las propiedades antioxidantes de los carotinoides de tipo vitamina luteína y zeaxantina y de las vitaminas C y E.
- 10 Otra ventaja del producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la invención consiste en el efecto sinérgico en vista a un amplio suministro global de la mácula. La mácula se fortalece mediante la combinación optimizada de vitaminas y oligoelementos, particularmente de los carotinoides de tipo vitamina luteína y zeaxantina y cinc.
- 15 Por lo demás es ventajoso que las dosificaciones del agente de acuerdo con la invención no ocasionan efectos secundarios perjudiciales y que pueden servir tanto como profilaxis como para la compensación de un suministro deficiente existente de la mácula. Esto es ventajoso para el tratamiento tanto nutritivo como dietético en caso de degeneración macular asociada a la edad.
- 20 El producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la invención puede fomentar las propiedades antioxidantes de los carotinoides luteína y zeaxantina, y de las vitaminas C y E, mediante la combinación de los oligoelementos cinc y selenio. Un efecto positivo se muestra particularmente por la administración nutritiva o dietética de refuerzo en estados de deficiencia y en la prevención nutritiva de la generación de una situación de deficiencia, que pueda conducir a una degeneración macular asociada a la edad.
- 25 El producto de combinación de micronutrientes puede estar presente en forma sólida, líquida y/o de gel, preferiblemente, el producto de combinación de micronutrientes se presenta en formas de preparados, seleccionados del grupo que comprende comprimidos, cápsulas, polvo, granulado, soluciones y/o comprimidos efervescentes con composición igual o diferente.
- 30 El producto de combinación de micronutrientes puede presentar aditivos que mejoran la biodisponibilidad, la solubilidad y/o la velocidad de solubilidad. Además, el producto de combinación de micronutrientes puede presentar disgregantes, sustancias que mejoran la caducidad, sustancias enmascaradoras del sabor, sustancias que mejoran el sabor, cargas, agentes de recubrimiento y/o agentes de desmoldeo.
- 35 Son apropiados los aditivos habituales, conocidos por el experto, son cargas preferidas por ejemplo celulosa y/o lactosa, son agentes de desmoldeo preferidos los jabones metálicos, por ejemplo estearato de magnesio. Para el enmascaramiento o mejora del sabor se pueden utilizar sustancias seleccionadas del grupo que comprende aromas naturales, miméticos o sintéticos, esencias, aceites esenciales, glutamatos naturales o sintéticos, inosatos, guanilatos y/o glicina o sus mezclas. Se prefieren aromas frutales para la mejora del sabor. Otros aditivos preferidos son colorantes, estabilizantes y/o edulcorantes.
- 40 En una realización preferida, el producto de combinación de micronutrientes comprende, en relación a 100 g del producto de combinación de micronutrientes, los principios activos:
- 0,6 g de luteína;
 - 0,05 g de zeaxantina;
 - 5,6 g de vitamina C;
 - 0,8 g de vitamina E;
 - 2,0 mg de selenio;
 - 0,5 g de cinc.
- 45 En otra realización preferida, el producto de combinación de micronutrientes comprende, en relación a una dosis diaria, los principios activos:
- 6,0 mg de luteína;
 - 0,5 mg de zeaxantina;
 - 60,0 mg de vitamina C;
 - 8,8 mg de vitamina E;
 - 20 µg de selenio;
 - 5 mg de cinc.
- 50 El preparado de micronutrientes también puede contener aditivos, sustancias acompañantes y/o materia prima que sean más pesados que los propios principios activos, con lo que las cantidades indicadas en referencia a

una dosis diaria o dosis unitaria pueden ser menores o también mayores.

En una realización preferida, el producto de combinación de micronutrientes comprende, en relación a una dosis unitaria, los principios activos:

- 5
- a. 3,0 mg de luteína;
 - b. 0,25 mg de zeaxantina;
 - c. 30,0 mg de vitamina C;
 - d. 4,4 mg de vitamina E;
 - e. 10 µg de selenio;
 - f. 2,5 mg de cinc.

10 En una realización preferida, el producto de combinación de micronutrientes presenta, en relación a una dosis unitaria, 0,02 g de proteínas, 0,06 g de grasa y/o 0,19 g de hidratos de carbono. Además, el producto de combinación de micronutrientes presenta, en relación a una dosis unitaria, de forma preferida 0,02 unidades de hidratos de carbono.

15 Por una dosis unitaria se comprende en el sentido de esta solicitud una unidad de administración del producto de combinación de micronutrientes, una dosis unitaria del producto de combinación de micronutrientes corresponde, por ejemplo, a un comprimido, una cápsula o una única unidad de administración de otra forma de preparado, tal como polvo o granulado. Por una dosis diaria se comprende en el sentido de esta solicitud la cantidad del producto de combinación de micronutrientes que se administra por día.

20 La dosis diaria y/o dosis unitaria se reparte de forma preferida en varias formas de preparado iguales o distintas, pudiendo presentar las formas de preparado principios activos y/o contenidos de principios activos iguales o diferentes.

25 El producto de combinación de micronutrientes se puede usar de forma preferida en la degeneración macular asociada a la edad para la elaboración de un agente para la prevención dietética y el tratamiento de enfermedades oculares. Además, el producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la invención sigue siendo apropiado como agente para el suplemento dietético.

La expresión "tratamiento dietético" se describe más detalladamente en la directiva de la UE 1999/21/EG, que se incorporó como derecho alemán desde el 01.01.2002 como 10º decreto para la modificación del decreto de dietas.

30 Debido a los principios activos ventajosos del producto de combinación de micronutrientes, el mismo también se puede utilizar, en el marco de una consulta nutricional dietética, como alimento, particularmente como suplemento dietético. Preferiblemente se puede utilizar el producto de combinación de micronutrientes como suplemento nutritivo para la administración conjunta en la degeneración macular asociada a la edad. El tratamiento se puede fomentar nutritivamente. Se ha mostrado que se puede contrarrestar particularmente una inminente deficiencia de nutrientes en personas mayores.

35 A continuación se describen unos ejemplos de productos de combinación de micronutrientes:

Se entiende que las formas de preparados seleccionados del grupo que comprende comprimidos, cápsulas, polvo, granulado, soluciones y/o comprimidos efervescentes, presentan los coadyuvantes habituales para la formulación de las respectivas formas de preparados, de tal manera que en los ejemplos solamente se representan los principios activos contenidos.

40 Ejemplo 1

Producto de combinación de micronutrientes que comprende 1 comprimido con los siguientes principios activos:

- 45
- 3,0 mg de luteína;
 - 0,25 mg de zeaxantina;
 - 30,0 mg de vitamina C;
 - 4,4 mg de vitamina E;
 - 10 µg de selenio;
 - 2,5 mg de cinc.

Ejemplo 2

Producto de combinación de micronutrientes, dosis diaria que comprende 2 comprimidos con respectivamente los siguientes principios activos:

- 5
- 3,0 mg de luteína;
 - 0,25 mg de zeaxantina;
 - 30,0 mg de vitamina C;
 - 4,4 mg de vitamina E;
 - 10 µg de selenio;
 - 2,5 mg de cinc.

REIVINDICACIONES

1. Producto de combinación de micronutrientes, caracterizado por que el producto de combinación de micronutrientes comprende, en relación a 100 g del producto de combinación de micronutrientes, los principios activos:
- 5 a. 0,6 - 1,2 g de luteína;
b. 0,05 - 0,1 g de zeaxantina;
c. 5,6 - 11,2 g de vitamina C;
d. 0,8 - 2 g de vitamina E;
e. 2,0 - 3,0 mg de selenio;
- 10 f. 0,5 - 1 g de cinc.
2. Producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que el producto de combinación de micronutrientes está presente en forma sólida, líquida y/o de gel, y en el que de forma preferida se presenta el producto de combinación de micronutrientes en formas de preparados seleccionados del grupo que comprende comprimidos, cápsulas, polvo, granulado, soluciones y/o comprimidos efervescentes.
- 15 3. Producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, caracterizado por que el producto de combinación de micronutrientes presenta aditivos que mejoran la biodisponibilidad, la solubilidad y/o la velocidad de solubilidad.
4. Producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes, caracterizado por que el producto de combinación de micronutrientes presenta disgregantes, sustancias que mejoran la caducidad, sustancias enmascaradoras del sabor, sustancias que mejoran el sabor, cargas, agentes de recubrimiento y/o agentes de desmoldeo.
- 20 5. Producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes, caracterizado por que el producto de combinación de micronutrientes comprende, en relación a 100 g del producto de combinación de micronutrientes, los principios activos:
- 25 a. 0,6 g de luteína;
b. 0,05 g de zeaxantina;
c. 5,6 g de vitamina C;
d. 0,8 g de vitamina E;
e. 2,0 mg de selenio;
- 30 f. 0,5 g de cinc.
6. Producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes, caracterizado por que el producto de combinación de micronutrientes comprende, en relación a una dosis unitaria, los principios activos:
- 35 a. 3,0 mg de luteína;
b. 0,25 mg de zeaxantina;
c. 30,0 mg de vitamina C;
d. 4,4 mg de vitamina E;
e. 10 µg de selenio;
f. 2,5 mg de cinc.
- 40 7. Uso de un producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes para la elaboración de un agente para la prevención dietética y el tratamiento de enfermedades oculares, de forma preferida en degeneración macular asociada a la edad.
8. Uso de un producto de combinación de micronutrientes de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes como agente para el suplemento dietético.