



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 361 227**

51 Int. Cl.:

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 31/205 (2006.01)

A61K 33/06 (2006.01)

A61K 31/198 (2006.01)

A23L 1/29 (2006.01)

A61K 9/14 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **07008906 .5**

96 Fecha de presentación : **02.05.2007**

97 Número de publicación de la solicitud: **1854453**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **14.11.2007**

54

Título: **Composiciones acuosas estables al almacenamiento, que comprenden un compuesto de magnesio y L-carnitina.**

30

Prioridad: **12.05.2006 EP 06009865**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
15.06.2011

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
15.06.2011

73

Titular/es: **VERLA-PHARM ARZNEIMITTELFABRIK
APOTHEKER H.J. VON EHRLICH GmbH & Co. KG.
Hauptstrasse 98
D-82327 Tutzing, DE**

72

Inventor/es: **Hopf, Günter**

74

Agente: **Elzaburu Márquez, Alberto**

ES 2 361 227 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

Composiciones acuosas estables al almacenamiento, que comprenden un compuesto de magnesio y L-carnitina

5 La presente invención se refiere a composiciones acuosas o, respectivamente gelatinosas, estables al almacenamiento, que comprenden hidrocloreto de L-aspartato de magnesio y L-carnitina, y a su utilización para la preparación de un medicamento para fomentar el metabolismo, especialmente del tejido muscular, y el desarrollo muscular o, respectivamente, para su utilización como suplemento alimentario o en el sector veterinario como aditivo del pienso, especialmente para caballos, aves de corral, palomas, cerdos, ganado vacuno, ovejas y camellos.

10 En el estado actual de la técnica se conocen soluciones acuosas que contienen magnesio (por ejemplo Nupafeed®, comercializado por Verla-Pharm), las cuales contienen aproximadamente 50% de hidrocloreto de aspartato de magnesio. Sin embargo, estas y otras concentraciones mayores de magnesio son problemáticas en el caso de este tipo de soluciones en virtud de la creciente tendencia a la cristalización del compuesto de magnesio que contienen.
15 Por esta razón, no se puede obtener ninguna solución acuosa con un elevado contenido de compuesto de magnesio que sea estable al almacenamiento durante un espacio de tiempo prolongado.

El documento EP 0 680 345 A2 divulga composiciones acuosas con carnitina y cloruro de magnesio.

20 El objeto técnico en que se fundamenta la presente invención consiste, por tanto, en poner a disposición una solución que contenga iones magnesio, que permanezca estable durante un largo espacio de tiempo, que especialmente presente una elevada concentración de magnesio y que no muestre cristalización alguna no deseada del compuesto de magnesio o de otros componentes utilizados.

25 Este objetivo se soluciona por la puesta a disposición de las formas de ejecución caracterizadas en las reivindicaciones.

Conforme a la presente invención, se prepara una composición acuosa o, respectivamente, gelatinosa, la cual comprende el compuesto complejo de magnesio hidrocloreto de L-aspartato de magnesio, en un contenido en el intervalo de 50 a 75% en peso y carnitina en un contenido de al menos 5% en peso.
30

El compuesto complejo de magnesio utilizado en la presente invención tiene una solubilidad en agua suficientemente buena. Además, el compuesto complejo de magnesio presenta una buena biodisponibilidad y un favorable comportamiento de liberación en el organismo humano y animal.
35

Conforme a la presente invención, la composición acuosa o, respectivamente, gelatinosa comprende 50 a 75% en peso, de modo más preferido 50 a 70% en peso del compuesto complejo de magnesio y, al menos, 5% en peso de L-carnitina.

40 La L-carnitina o, respectivamente, betaína del ácido 3-hidroxi-4-(trimetilamonio)-butírico es una sustancia higroscópica, bien soluble en agua e incolora que representa un componente característico de la musculatura estriada y que sobre todo en el metabolismo de los ácidos grasos sirve como vehículo para grupos acilo a través de la membrana mitocondrial.

45 La composición conforme a la invención contiene L-carnitina, puesto que por adición de L-carnitina se puede impedir eficazmente o al menos retardar claramente la cristalización de sales de magnesio o, respectivamente, de compuestos complejos de magnesio. De manera particularmente preferida, el contenido de L-carnitina, referido a la composición global, se encuentra en un intervalo de aproximadamente 5 a aproximadamente 35% en peso, siendo mayormente preferido un intervalo de 7 a 30% en peso.
50

Sorprendentemente, se comprobó que incluso en el caso de una concentración muy baja de L-carnitina en la solución acuosa conforme a la invención se podía evitar eficazmente o al menos retardar claramente la cristalización problemática de una sal de magnesio y/o de un compuesto complejo de magnesio. Por ejemplo, es posible obtener una solución acuosa estable con 70% en peso de hidrocloreto de aspartato de magnesio si en la solución hay presente 5% en peso de L-carnitina. El efecto inhibitorio de la cristalización se puede incrementar aún más, si en la solución anterior se encuentran presentes 15% en peso de L-carnitina.
55

El contenido de compuesto complejo de magnesio, referido a la composición global, es de al menos 50% en peso, obteniéndose también soluciones acuosas estables con $\geq 60\%$ en peso e incluso 70% en peso, las cuales no muestran tendencia alguna o una tendencia a la cristalización fuertemente retardada, si se encuentran presente $\geq 5\%$ en peso, preferentemente $\geq 7\%$ en peso de L-carnitina. El contenido de compuesto complejo de magnesio, referido a la composición global se encuentra en el intervalo de 50 a 75% en peso, siendo mayormente preferido un contenido en el intervalo de 50 a 70% en peso.
60

La composición acuosa conforme a la invención puede contener, además, coadyuvantes habituales tales como estabilizantes, sustancias de aroma, conservantes, medicamentos o colorantes. Conforme a una forma de ejecución preferida, en la composición acuosa conforme a la invención hay contenido sorbato de potasio, siendo
65

particularmente preferido un contenido de aproximadamente 0,05 a 0,2% en peso de sorbato de potasio.

5 La composición acuosa conforme a la invención se puede preparar por simple mezcladura de agua, el compuesto complejo de magnesio, L-carnitina y eventualmente uno a varios coadyuvantes. Sin embargo, es preferible preparar la composición acuosa conforme a la invención por disolución de L-carnitina en una solución formada con anterioridad de agua, el compuesto complejo de magnesio y eventualmente uno o varios coadyuvantes.

10 La composición acuosa o, respectivamente, gelatinosa conforme a la invención se puede transformar también en un correspondiente producto secado por pulverización, el cual se obtiene por secado por pulverización de una composición acuosa conforme a la presente invención.

15 Aparte de esto, conforme a la presente invención, la utilización en el sector humano de la composición acuosa o del producto del secado por pulverización anteriormente descritos, se pone a disposición en forma de medicamento o, respectivamente, de suplemento alimentario o, en el sector veterinario, en forma de suplemento del pienso especialmente para caballos, aves de corral, palomas, cerdos, ganado vacuno, ovejas y camellos.

20 La composición acuosa conforme a la invención se presta particularmente bien para ser suministrada a caballos o camellos por medio de un denominado inyector para el hocico. Mediante la utilización de la composición conforme a la invención se puede impedir eficazmente el bloqueo no deseado del émbolo del inyector por cristalización del compuesto de magnesio en él contenido.

25 Por consiguiente, la L-carnitina incorporada a la composición conforme a la invención no manifiesta sólo el sorprendente efecto de inhibir la cristalización o, respectivamente, estabilizar la solución acuosa, sino que en su propiedad de fomentar el metabolismo, especialmente del tejido muscular, y el desarrollo muscular o, respectivamente, el incremento del rendimiento en personas y animales, ofrece otras propiedades ventajosas al emplear la composición conforme a la invención en forma de medicamento, suplemento alimentario o en forma de aditivo del pienso.

30 Los ejemplos siguientes se indican para explicar la presente invención con más detalle, sin que constituyan una limitación a ésta.

Ejemplos

35 Ejemplo 1 (especialmente como producto para uso veterinario) (no conforme a la invención)

Un gel acuoso estable al almacenamiento, que no mostraba tendencia alguna a la cristalización durante el almacenamiento de varias semanas a 20°C, se obtuvo al mezclar los siguientes componentes:

40 43,35 g de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio
0,05 g de sorbato de potasio
30,24 g de agua
26,36 g de L-carnitina

45 Ejemplo 2 (especialmente como producto para uso veterinario) (no conforme a la invención)

Un gel acuoso estable al almacenamiento, que no mostraba tendencia alguna a la cristalización durante el almacenamiento de varias semanas a 20°C, se obtuvo al mezclar los siguientes componentes:

50 49,84 g de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio
0,05 g de sorbato de potasio
20,00 g de agua
30,10 g de L-carnitina

Ejemplo 3 (especialmente como producto para uso veterinario) (no conforme a la invención)

55 Una solución acuosa estable al almacenamiento, que no mostraba tendencia alguna a la cristalización durante el almacenamiento de varias semanas a 20°C, se obtuvo al mezclar los siguientes componentes:

60 28,13 g de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio
0,029 g de sorbato de potasio
54,86 g de agua
16,99 g de L-carnitina

Ejemplo 4 (especialmente como producto para uso humano)

Un gel acuoso estable al almacenamiento, que no mostraba tendencia alguna a la cristalización durante el almacenamiento de varias semanas a 20°C, se obtuvo al mezclar los siguientes componentes:

65 60,51 g de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio
0,07 g de sorbato de potasio

29,93 g de agua
9,49 g de L-carnitina

5 Ejemplo 5 (especialmente como producto para uso humano) (no conforme a la invención)

Una solución acuosa estable al almacenamiento, que no mostraba tendencia alguna a la cristalización durante el almacenamiento de varias semanas a 20°C, se obtuvo al mezclar los siguientes componentes:

43,22 de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio
0,07 g de sorbato de potasio
10 49,93 g de agua
6,78 g de L-carnitina

Ejemplo 6 (no conforme a la invención)

15 Una solución gelatinosa acuosa estable al almacenamiento, que no mostraba tendencia alguna a la cristalización durante el almacenamiento de varias semanas a 20°C, se obtuvo al mezclar los siguientes componentes:

51,2 de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio
0,1 g de sorbato de potasio
20 48,7 g de agua
100 g de L-carnitina

Ejemplo 7 (no conforme a la invención)

25 Una solución gelatinosa acuosa estable al almacenamiento, que no mostraba tendencia alguna a la cristalización durante el almacenamiento de varias semanas a 20°C, se obtuvo al mezclar los siguientes componentes:

51,2 de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio
0,1 g de sorbato de potasio
48,7 g de agua
30 150 g de L-carnitina

Ejemplo comparativo 1

35 Una solución acuosa no estable al almacenamiento, que al cabo de unos pocos días presentaba un precipitado cristalino de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio, se obtuvo al mezclar los siguientes componentes:

70 g de hidrocloreuro de L-aspartato de magnesio
0,1 g de sorbato de potasio
30 g de agua

REIVINDICACIONES

- 5 1. Composición acuosa o, respectivamente, gelatinosa, que comprende el compuesto complejo de magnesio hidrocloreto de L-aspartato de magnesio con un contenido en un intervalo de 50 a 75% en peso y L-carnitina con un contenido de al menos 5% en peso.
- 10 2. Composición según la reivindicación 1, en donde el contenido de L-carnitina se encuentra en un intervalo de 5 a 35% en peso.
- 10 3. Composición según la reivindicación 1 o 2, que comprende además uno o varios coadyuvantes.
- 15 4. Utilización de una composición según una de las reivindicaciones 1 a 3, como suplemento alimentario o como aditivo para piensos,
- 15 5. Utilización de una composición según una de las reivindicaciones 1 a 3, para la preparación de un medicamento para fomentar el metabolismo, especialmente del tejido muscular, y el desarrollo muscular.