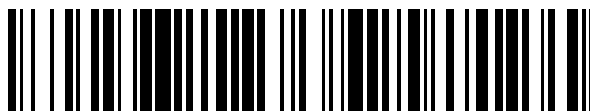


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 375 784**

21 Número de solicitud: 201132073

51 Int. Cl.:

A61K 31/195 (2006.01)

A61K 47/32 (2006.01)

12

SOLICITUD DE PATENTE

A1

22 Fecha de presentación: **22.12.2011**

43 Fecha de publicación de la solicitud: **06.03.2012**

43 Fecha de publicación del folleto de la solicitud:
06.03.2012

71 Solicitante/s:
LABORATORIOS KIN S.A.
CIUTAT DE GRANADA 123
08018 BARCELONA, ES

72 Inventor/es:
BALASCH RISUEÑO, Joaquín y
SANCHO RIERA, Enriqueta

74 Agente: **Curell Aguilá, Mireia**

54 Título: **Gel de ácido tranexámico**

57 Resumen:

Gel de ácido tranexámico. Gel de ácido tranexámico que comprende entre un 1% y un 14% en peso de ácido tranexámico, y entre un 0,1 y un 10% en peso de por lo menos un carbómero. El gel puede comprender también unos conservantes y un disolvente y tiene el pH comprendido 10 entre 6,5 y 7,5.

ES 2 375 784 A1

DESCRIPCIÓN

Gel de ácido tranexámico.

Campo de la invención

La invención se refiere a un gel de ácido tranexámico.

5 Estado de la técnica

Actualmente el ácido tranexámico se administra en forma de comprimidos por vía oral, o bien por vía parenteral. Por vía oral se absorbe rápidamente a través del tracto intestinal y la duración de la acción, por esta vía es de 4 a 6 horas (tras la administración de 500 mg).

10 Un campo de aplicación es en intervenciones en la cavidad bucal. Así, por ejemplo, se emplea para controlar posibles hemorragias después de intervenciones dentales en hemofílicos. En el caso de niños, su uso es limitado, siendo su principal utilización en extracción dental.

15 En el documento ES 2.272.064 se describe una composición farmacéutica acuosa para aplicar en la mucosa que comprende una o más sustancias insolubles en agua y/o poco solubles en agua, y una o más medicamentos, y que tiene una presión osmótica de menos de 150 mOsm. Estas composiciones pueden comprender ácido tranexámico (0,1%). Estas composiciones son composiciones líquidas y tienen unas concentraciones de electrolitos muy bajas, es decir son soluciones hipotónicas.

Existe sin embargo la necesidad de composiciones que comprendan ácido tranexámico con las que se obtenga un mejor resultado terapéutico.

Sumario de la invención

20 Esta finalidad se consigue mediante un gel de ácido tranexámico caracterizado porque comprende entre un 1% y un 14% en peso de ácido tranexámico, y entre un 0,1 y un 10% en peso de por lo menos un carbómero. Los carbómeros son polímeros sintéticos de alto peso molecular de ácido acrílico, preferentemente con alilsucrosa o aliléteres de pentaeritritol. También se incluyen dentro de los carbómeros las sales y los derivados de estos compuestos.

25 Efectivamente, esta composición forma un gel lo que facilita la aplicación tópica. Además esta composición tiene una osmolaridad claramente hipertónica. El gel se puede aplicar directamente en el lugar de la herida provocada por una extracción dental. De esta forma se disminuyen o evitan los efectos secundarios provocados por otras formas farmacéuticas, como son los trastornos gastrointestinales (que pueden ser producidos por los comprimidos administrados por vía oral) o los efectos hipotensivos (descritos en casos de administración intravenosa rápida).

30 Adicionalmente, el gel es bioadhesivo y es estable. Se ha descubierto que, sorprendentemente, con concentraciones de ácido tranexámico inferiores al 14% se forma un gel bioadhesivo estable, mientras que con concentraciones superiores se forma un precipitado de una forma más o menos aleatoria en el tiempo. Al ser bioadhesivo, el gel permanece en el lugar de aplicación aunque sea una zona de difícil permanencia. De esta manera, el efecto hemostático hace que se favorezca la formación del coágulo necesario para evitar el sangrado, taponando de forma eficaz la herida.

35 Preferentemente el gel comprende al menos un conservante y/o antifúngico del grupo formado por ácido parahidroxibenzoico, derivados de ácido parahidroxibenzoico, y mezclas de los anteriores (también denominados parabenos), y muy preferentemente del grupo formado por metilparahidroxibenzoato (también denominado metilparaben, y comercializado, por ejemplo, bajo el nombre de Nipagin®), propilparahidroxibenzoato (también denominado propilparaben, y comercializado, por ejemplo, bajo el nombre de Nipazol®) y mezclas de los anteriores.

Ventajosamente el gel comprende un disolvente del grupo formado por propilenglicol, alcohol isopropílico, alcohol etílico, polietilenglicol, estearato de polietilenglicol y derivados de polietilenglicol. Preferentemente el gel comprende entre un 5% en peso y un 50% en peso del disolvente.

45 Preferentemente el gel comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, ya que con estas concentraciones es particularmente eficaz y, sin embargo, sigue siendo totalmente estable.

Ventajosamente el gel comprende entre un 0,5% y un 5% en peso de por lo menos un carbómero.

Los carbómeros pueden tener diversos pesos moleculares. Preferentemente tienen un peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 . Son comercializados, por ejemplo, bajo el nombre Carbopol®.

50 El Carbopol® 934 tiene un peso molecular de 3.000.000 y presenta una alta viscosidad relativa en las aplicaciones tópicas [(29.400 - 39.400 cP (0.5% de peso en pH 7.5)]. Químicamente es un polímero hidrosoluble del ácido acrílico entrecruzado con un aliléter de sacarosa o de pentaeritritol.

El Carbopol® 940, con un peso molecular de 4.000.000, está constituido por polímeros de ácido acrílico reticulado con aliléter de pentaeritritol. Sus geles presentan una muy alta viscosidad relativa [(40.000 – 60.000 cP (0.5% de peso en pH 7.5)].

5 El Carbopol® 974 (como el 934) es también un polímero de alto peso molecular del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol. Posee la capacidad de sostener la cesión de los ingredientes activos dispersos en la matriz, por lo que se considera muy apto para su aplicación oral. Se obtienen productos de uso tópico de alta viscosidad relativa [(29.400 - 39.400 cP (0.5% de peso en pH 7.5)].

10 El Carbopol® 1342, con un elevado peso molecular, resulta también idóneo en la formación de cremas y geles. Es un copolímero de ácido acrílico y un alquimetacrilato de cadena larga entrecruzado con aliléteres de pentaeritritol. Las aplicaciones tópicas formuladas con este carbómero muestran una mediana viscosidad relativa [(9.500 – 26.500 cP (0.5% de peso en pH 7.5)].

Todos ellos resultan adecuados y válidos para formar geles de aplicación oral.

Hay diversas composiciones del gel que son particularmente ventajosas, como son las siguientes:

15 - entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 4% en peso de un polímero, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol (preferentemente Carbopol® 974), entre un 10% y un 35% en peso de propilenglicol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben (Nipagin®) y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben (Nipazol®).

20 – entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 4% en peso de un polímero, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol (preferentemente Carbopol® 974), entre un 30% y un 35% en peso de etanol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben (Nipagin®) y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben (Nipazol®).

25 – entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 5% en peso de un polímero, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol (preferentemente Carbopol® 974), entre un 10% y un 40% en peso de polietilenglicol 200, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben (Nipagin®) y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben (Nipazol®).

– entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 5% en peso de un polímero, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol (preferentemente Carbopol® 974), entre un 10% y un 40% en peso de polietilenglicol 400, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben (Nipagin®) y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben (Nipazol®).

30 – entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 5% en peso de un polímero hidrosoluble del ácido acrílico entrecruzado con un aliléter de sacarosa o de pentaeritritol, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 (preferentemente Carbopol® 934), entre un 10% y un 30% en peso de propilenglicol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben (Nipagin®) y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben (Nipazol®).

35 – entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 4% en peso de un polímero del ácido acrílico reticulado con aliléter de pentaeritritol, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 (preferentemente Carbopol® 940), entre un 10% y un 40% en peso de propilenglicol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben (Nipagin®) y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben (Nipazol®).

40 – entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 2% y un 6% en peso de un copolímero de ácido acrílico y un alquimetacrilato de cadena larga entrecruzado con aliléteres de pentaeritritol, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 (preferentemente Carbopol® 1342), entre un 10% y un 45% en peso de propilenglicol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben (Nipagin®) y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben (Nipazol®).

Preferentemente el gel comprende un 8% en peso de ácido tranexámico.

45 Ventajosamente el gel comprende un 0,3% en peso de metilparaben (Nipagin®) y/o un 0,05% en peso de propilparaben (Nipazol®).

Preferentemente el pH del gel está comprendido entre 6,5 y 7,5.

ES 2 375 784 A1

Ejemplos

Ejemplo 1:

Composición:

Ácido tranexámico (principio activo)	8,00 g
Carbopol® 974 (gelificante, bioadhesivo)	1,00 g
Nipagin® (conservante, antifúngico)	0,30 g
Nipazol® (conservante, antifúngico)	0,05 g
Propilenglicol (disolvente)	20,00 g
Agua desionizada (diluyente)	70,65 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

Procedimiento de fabricación:

5 1ª FASE:

Se disuelve el ácido tranexámico en agua, se agita hasta total disolución

2ª FASE:

Se disuelven el Nipagin® y Nipazol® en propilenglicol agitando hasta disolución total.

3ª FASE:

- 10 Se añade a la solución obtenida en la fase 1 el Carbopol® 974 y se agita (agitador de ancla) hasta formación de un gel transparente.

4ª FASE:

Se incorpora al gel obtenido en la 3ª fase la solución obtenida en la 2ª fase. Se agita (agitador de ancla) hasta incorporación homogénea, obteniéndose un gel transparente dotado de propiedades bioadhesivas.

15 5ª FASE:

Se añade al gel un agente alcalinizante para obtener un pH final comprendido entre 6,5- 7,5.

Control galénico – Caracterización del gel

Características organolépticas	Gel homogéneo, transparente y bioadhesivo.
pH del gel	7,07
Viscosidad	11.629 mPas
Extensibilidad	679,79 mm ²

Estabilidad a partir de ensayos de centrifugación:

- 20 Se ponen 5 g de gel en tubo de centrifugación. En otro tubo igual se colocan 5 g de agua desionizada. Se centrifuga a 5000 rpm durante 15 minutos y no se observa separación de fases.

Ejemplo 2:

Ácido tranexámico	8,00 %
Carbopol® 974	1,00 %
Propilenglicol	20,00 %
Nipagin®	0,30 %
Nipazol®	0,05 %
Agua desionizada	c.s.p. 100 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

ES 2 375 784 A1

Procedimiento de fabricación: el mismo del ejemplo 1.

Ejemplo 3:

Ácido tranexámico	6 a 8 %
Carbopol® 974	0,5 a 4 %
Propilenglicol	10 a 35 %
Nipagin®	0,1 a 0,6 %
Nipasol®	0,01 a 0,06 %
Agua desionizada	c.s.p. 100 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

Procedimiento de fabricación: el mismo del ejemplo 1.

5 Ejemplo 4:

Ácido tranexámico	8 %
Carbopol® 974	0,5 a 4 %
Alcohol 96°	30 a 35 %
Nipagin®	0,30 %
Nipasol®	0,05 %
Agua desionizada	c.s.p. 100 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

Procedimiento de fabricación: el mismo del ejemplo 1, pero utilizando un disolvente distinto: alcohol 96°.

Ejemplo 5:

Ácido tranexámico	8 %
Carbopol® 974	0,5 a 5 %
Polietilenglicol 200	10 a 40 %
Nipagin®	0,3 %
Nipasol®	0,05 %
Agua desionizada	c.s.p. 100 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

10 Procedimiento de fabricación: el mismo del ejemplo 1, pero utilizando un disolvente distinto: polietilenglicol 200.

Ejemplo 6:

Ácido tranexámico	8 %
Carbopol® 974	0,5 a 5 %
Polietilenglicol 400	10 a 40 %
Nipagin®	0,3 %
Nipasol®	0,05 %
Agua desionizada	c.s.p. 100 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

Procedimiento de fabricación: el mismo del ejemplo 1, pero utilizando un disolvente distinto: polietilenglicol 400.

Ejemplo 7:

Ácido tranexámico	8 %
Carbopol® 934	0,5 a 5 %
Propilenglicol	10 a 30 %
Nipagin®	0,30 %
Nipasol®	0,05 %
Agua desionizada	c.s.p. 100 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

Procedimiento de fabricación: el mismo del ejemplo 1, pero sustituyendo el Carbopol® 974 por otro tipo de distinta polimerización (Carbopol® 934).

Ejemplo 8:

Ácido tranexámico	8 %
Carbopol® 940	0,5 a 4 %
Propilenglicol	10 a 40 %
Nipagin®	0,30 %
Nipasol®	0,05 %
Agua desionizada	c.s.p. 100 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

5

Procedimiento de fabricación: el mismo del ejemplo 1, pero sustituyendo el Carbopol® 974 por otro tipo de distinta polimerización (Carbopol® 940).

Ejemplo 9:

Ácido tranexámico	8 %
Carbopol® 1342	2 a 6 %
Propilenglicol	10 a 45 %
Nipagin	0,30 %
Nipasol	0,05%
Agua desionizada	c.s.p. 100 g
NaOH c.s.p. pH 6,5 a 7,5	

Procedimiento de fabricación: el mismo del ejemplo 1, pero sustituyendo el Carbopol® 974 por otro tipo de distinta polimerización (Carbopol® 1342).

10

REIVINDICACIONES

- 1 – Gel de ácido tranexámico caracterizado porque comprende entre un 1% y un 14% en peso de ácido tranexámico, y entre un 0,1 y un 10% en peso de por lo menos un carbómero.
- 5 2 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un conservante del grupo formado por ácido parahidroxibenzoico, derivados de ácido parahidroxibenzoico, y mezclas de los anteriores, preferentemente del grupo formado por metilparahidroxibenzoato, propilparahidroxibenzoato y mezclas de los anteriores.
- 3 – Gel según una de las reivindicaciones 1 ó 2, caracterizado porque comprende un disolvente del grupo formado por propilenglicol, alcohol isopropílico, alcohol etílico, polietilenglicol, estearato de polietilenglicol y derivados de polietilenglicol.
- 10 4 – Gel según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico.
- 5 - Gel según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque comprende entre un 0,5% y un 5% en peso de por lo menos un carbómero.
- 15 6 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende entre un 5% en peso y un 50% en peso de dicho disolvente.
- 7 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 4% en peso de un polímero, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol, entre un 10% y un 35% en peso de propilenglicol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben.
- 20 8 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 4% en peso de un polímero, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol, entre un 30% y un 35% en peso de etanol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben.
- 25 9 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 5% en peso de un polímero, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol, entre un 10% y un 40% en peso de polietilenglicol 200, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben.
- 30 10 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 5% en peso de un polímero, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , del ácido acrílico reticulado con aliléteres de sacarosa o de pentaeritritol, entre un 10% y un 40% en peso de polietilenglicol 400, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben.
- 35 11 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 5% en peso de un polímero hidrosoluble del ácido acrílico entrecruzado con un aliléter de sacarosa o de pentaeritritol, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , entre un 10% y un 30% en peso de propilenglicol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben.
- 40 12 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 0,5% y un 4% en peso de un polímero del ácido acrílico reticulado con aliléter de pentaeritritol, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , entre un 10% y un 40% en peso de propilenglicol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben.
- 45 13 – Gel según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende entre un 6% y un 10% en peso de ácido tranexámico, entre un 2% y un 6% en peso de un copolímero de ácido acrílico y un alquilmacrilato de cadena larga entrecruzado con aliléteres de pentaeritritol, de peso molecular comprendido entre 7×10^5 y 4×10^9 , entre un 10% y un 45% en peso de propilenglicol, entre un 0,15 y un 0,65 en peso de metilparaben y entre un 0,015 y un 0,06% de propilparaben.
- 14 – Gel según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizado porque comprende un 8% en peso de ácido tranexámico.
- 15 – Gel según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, caracterizado porque comprende un 0,3% en peso de metilparaben.
- 50 16 – Gel según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, caracterizado porque comprende un 0,05% en peso de propilparaben.
- 17 – Gel según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, caracterizado porque su pH está comprendido entre 6,5 y 7,5.



OFICINA ESPAÑOLA
DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

②① N.º solicitud: 201132073

②② Fecha de presentación de la solicitud: 22.12.2011

③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TÉCNICA

⑤① Int. Cl.: **A61K31/195** (2006.01)
A61K47/32 (2006.01)

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
X	JP 9124878 A (SHISEIDO CO LTD) 13.05.1997 (resumen) [en línea] [recuperado el 07.02.2012]. Recuperado de: HCAPLUS en STN, Chemical Abstracts Service (Columbus, Ohio, EEUU), nº acceso 1997:449529.	1-6,14-17
X	JP 9301852 A (SHISEIDO CO LTD) 25.11.1997 (resumen) [en línea] [recuperado el 07.02.2012]. Recuperado de: HCAPLUS en STN, Chemical Abstracts Service (Columbus, Ohio, EEUU), nº acceso 1997:754287 & EPOQUE EPODOC Database.	1-6,14-17
A	WO 2011078700 A1 (MACALISTER, DON) 30.06.2011, párrafos [0064]-[0072],[0077]-[0085],[0090]; ejemplo.	1-17
A	CA 2161652 C (EASTERN VIRGINIA MEDICAL SCHOOL) 10.07.2007, página 3, líneas 5-21; página 5, líneas 5-8; reivindicaciones 1-5.	1-17

Categoría de los documentos citados

X: de particular relevancia

Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la misma categoría

A: refleja el estado de la técnica

O: referido a divulgación no escrita

P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación de la solicitud

E: documento anterior, pero publicado después de la fecha de presentación de la solicitud

El presente informe ha sido realizado

para todas las reivindicaciones

para las reivindicaciones nº:

Fecha de realización del informe
14.02.2012

Examinador
N. Vera Gutiérrez

Página
1/4

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación)

A61K

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

INVENES, EPODOC, REGISTRY, WPI, CAS, MEDLINE, BIOSIS, EMBASE, NPL

Fecha de Realización de la Opinión Escrita: 14.02.2012

Declaración

Novedad (Art. 6.1 LP 11/1986)	Reivindicaciones 7-17	SI
	Reivindicaciones 1-6	NO
Actividad inventiva (Art. 8.1 LP11/1986)	Reivindicaciones 7-13	SI
	Reivindicaciones 1-6, 14-17	NO

Se considera que la solicitud cumple con el requisito de aplicación industrial. Este requisito fue evaluado durante la fase de examen formal y técnico de la solicitud (Artículo 31.2 Ley 11/1986).

Base de la Opinión.-

La presente opinión se ha realizado sobre la base de la solicitud de patente tal y como se publica.

1. Documentos considerados.-

A continuación se relacionan los documentos pertenecientes al estado de la técnica tomados en consideración para la realización de esta opinión.

Documento	Número Publicación o Identificación	Fecha Publicación
D01	JP 9124878 A (SHISEIDO CO LTD)	13.05.1997
D02	JP 9301852 A (SHISEIDO CO LTD)	25.11.1997

2. Declaración motivada según los artículos 29.6 y 29.7 del Reglamento de ejecución de la Ley 11/1986, de 20 de marzo, de Patentes sobre la novedad y la actividad inventiva; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

La invención se refiere a un gel de ácido tranexámico caracterizado porque comprende entre un 1% y un 14% en peso de ácido tranexámico y entre un 0,1 y un 10% en peso de por lo menos un carbómero.

El documento D01 divulga composiciones en forma de gel para formulaciones cosméticas y farmacéuticas de aplicación tópica, que comprenden un aminoácido neutro, un polímero de carboxivinilo y agua. Se preparan geles con la siguiente composición: etanol (20%), Carbopol-941 (0,2%), éter polioxietileno-oleico (1%), metilparabén (0,1%), ácido tranexámico (7%), perfumes y agua.

En el documento D02 se describe una composición en forma de gel que contiene ácido tranexámico en una proporción de 0,01 - 30% y al menos un polímero de carboxivinilo modificado con alquilo como agente gelificante, por ejemplo un copolímero de ácido acrílico-alquil metacrilato (Carbopol 1342) en un rango entre 0,01-10%. El pH se ajustó a 5,7 para obtener un gel.

A la vista de los documentos D01 y D02 se considera que las reivindicaciones 1-6 de la solicitud no son nuevas (Artículo 6.1 L.P.).

Respecto a la reivindicación 14, relativa a la cantidad de ácido tranexámico en la composición (8%), se considera que no implica actividad inventiva dado que se trata de un valor muy próximo al divulgado en el estado de la técnica y dicha selección no lleva asociada ninguna ventaja técnica.

En cuanto a las reivindicaciones 15, 16 y 17, relativas a las cantidades de metilparabén y propilparabén en la composición y al pH de la misma, no es posible reconocer actividad inventiva, ya que se considera que la optimización de las cantidades administradas de dichos conservantes y el ajuste del pH de la formulación forman parte de la práctica rutinaria del experto en la materia.

No se han encontrado en el estado de la técnica documentos que divulguen geles con las características detalladas en las reivindicaciones 7-13, ni indicios que lleven al experto en la materia a concebir geles con esa composición concreta.

Por tanto, las reivindicaciones 7-13 de la solicitud cumplen los requisitos de novedad y actividad inventiva según los Artículos 6.1 y 8.1 de la Ley de Patentes.