

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 535 324**

51 Int. Cl.:

A61K 36/00 (2006.01)

A61K 31/47 (2006.01)

A61K 36/28 (2006.01)

A61K 36/758 (2006.01)

A61K 36/66 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.12.2005 E 09152200 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **28.01.2015 EP 2135615**

54 Título: **Composiciones que comprenden extractos de Sanguinaria o Macleaya**

30 Prioridad:

17.12.2004 IT MI20042414

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

08.05.2015

73 Titular/es:

**INDENA S.P.A. (100.0%)
VIA ORTLES, 12
20139 MILANO, IT**

72 Inventor/es:

**BOMBARDELLI, EZIO;
RONCHI, MASSIMO y
DI NICOLÒ, PAOLA**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 535 324 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 que comprenden extractos de *Sanguinaria* o *Macleaya*

La presente invención se refiere a composiciones novedosas que contienen antocianósidos y/o procianidinas en combinación con alcaloides bactericidas de isoquinolina y opcionalmente con un extracto lipófilo de *Zanthoxylum bungeanum* y/o *Echinacea angustifolia*.

Antecedentes tecnológicos

El enrojecimiento y la inflamación con formación de placas de la garganta son una característica frecuente de la gripe común, el resfriado y otras enfermedades catarrales. El catarro común y la gripe, que afectan de media hasta tres veces al año tanto a niños como a adultos, están relacionados con infecciones víricas leves provocadas por rinovirus (40 %), coronavirus (10 %) y en una proporción menor por adenovirus y virus paragripales. Aunque no existen tratamientos específicos para estas patologías, se consideran útiles los antihistamínicos y los descongestionantes, ya que la reducción del edema alivia el dolor y reduce la duración de la enfermedad que subyace a la inflamación. Dichas afecciones pueden conllevar algunas veces complicaciones debidas a infecciones bacterianas secundarias, ya que los senos nasales se obstruyen a menudo por la congestión de las mucosas en las que pueden proliferar fácilmente gérmenes patógenos. En este evento, es necesario someterse a un tratamiento antibiótico.

Divulgación de la invención

La presente invención se refiere a composiciones novedosas que contienen

a. procianidinas,

b. alcaloides de isoquinolina extraídos de *Sanguinaria canadensis*, *Macleaya cordata* o *Macleaya macrocarpa* y

c. un extracto lipófilo de *Zanthoxylum bungeanum*

De acuerdo con la presente invención, las procianidinas se derivan preferentemente de extractos de *Vitis vinifera*, obtenidos como se describe en el documento GB 1541469 o de extractos de *Camelia sinensis*, como se divulga en el documento EP 0814823, o de otras plantas que las contienen, preferentemente plantas comestibles.

El contenido en procianósidos que contienen los extractos puede variar desde 20 hasta 80 mg por dosis unitaria.

De acuerdo con la invención, "alcaloides de isoquinolina" quiere decir alcaloides de isoquinolina que tienen actividad antibacteriana, particularmente sanguinarinas y queleritrinas, preferentemente obtenibles de extractos acuoso-alcohólicos de *Sanguinaria canadensis*, *Macleaya cordata* o *Macleaya macrocarpa*. Tienen un espectro amplio de actividad antimicrobiana. El 0,2% de las soluciones acuoso-alcohólicas han mostrado actividad terapéutica en una serie de afecciones del tracto respiratorio superior, actuando sobre bacterias gram positivas y gram negativas, micetos, hongos y protozoos patógenos. Los extractos que contienen estos alcaloides han mostrado una actividad tópica antiinflamatoria fuerte. Los extractos que contienen los alcaloides de isoquinolina están típicamente presentes en cantidades de 2 a 20 mg por unidad de dosis.

Las composiciones de la invención también comprenden extractos lipófilos de *Zanthoxylum bungeanum* enriquecidos en isobutilamidas. Dichos extractos tienen actividad tópica analgésica útil por inhibición de conducción nerviosa. Cada uno de dichos extractos se puede añadir a las composiciones de la invención en cantidades que varían de 0,02 a 0,05 mg por unidad de dosis.

Las composiciones de la invención contendrán, además de los componentes a y b, también un extracto lipófilo enriquecido en isobutilamidas de *Zanthoxylum bungeanum*. El extracto de *Zanthoxylum bungeanum* puede prepararse por ejemplo de acuerdo con el documento WO 00/02570. Las composiciones de la invención son capaces de evitar la formación de placas purulentas infectadas con diversos saprófitos de la cavidad oral, evitando así el uso de antibióticos, reduciendo mientras el progreso de la infección. En particular, las composiciones de la invención demostraron ejercer un efecto sinérgico principalmente sobre la duración de la afección. Además, las composiciones de la invención son capaces de ejercer acciones favorables, limpiando la cavidad oral y eliminando la placa dental, gracias al efecto reductor de la adhesividad bacteriana, como ya se ha mencionado, tanto de los extractos de mirtilo como de las procianidinas y a la alta actividad de alcaloides de isoquinolina sobre cepas bacterianas anaeróbicas.

Las composiciones farmacéuticas se formularán preferentemente como comprimidos para la disolución lenta en la cavidad oral o como formas masticables, en particular gomas de mascar, que proporcionan la liberación lenta de los principios activos. Estas composiciones se usan tanto en tratamientos profilácticos como en tratamientos curativos, así como para la higiene de la cavidad oral.

Por consiguiente, la presente invención también se refiere al uso de

a. procianidinas,

b. alcaloides de isoquinolina extraídos de *Sanguinaria canadensis*, *Macleaya cordata* o *Macleaya microcarpa* y

c. extracto lipófilo de *Zanthoxylum bungeanum*,

para la preparación de composiciones para la prevención y el tratamiento de infecciones bacterianas de la cavidad oral y para la higiene de la cavidad oral.

De acuerdo con un aspecto preferente, las composiciones de la presente invención también contendrán aceites esenciales.

Dichas composiciones se prepararán de acuerdo con procedimientos convencionales bien conocidos, tales como los descritos en el manual "Remington's Pharmaceutical Handbook", Mack Publishing Co., N.Y., Estados Unidos, junto con excipientes adecuados.

Ejemplo I – 1000 mg de comprimidos masticables que contienen

	1.	Extracto alcohólico de <i>Vitis vinifera</i>	80 mg
	2.	Extracto alcohólico de <i>Sanguinaria canadensis</i>	2 mg
	3.	Extracto purificado de <i>Zanthoxylum bungeanum</i>	0,025 mg
10	4.	Lecitina de soja	30 mg
	5.	Ácido cítrico anhidro	5 mg
	6.	L-cisteína	5 mg
	7.	Lactosa	200 mg
	8.	Manitol	512,475 mg
15	9.	Metilcelulosa	40 mg
	10.	Palmitoestearato de glicerol	50 mg
	11.	Aromas de bayas	40 mg
	12.	Acesulfamo de potasio	0,5 mg
	13.	Talco	10 mg
20	14.	Bicarbonato de sodio	25 mg

REIVINDICACIONES

1. Composiciones que contienen una combinación de:

- 5 a. procianidinas extraídas de *Vitis vinifera*,
 b. sanguinarinas y queleritrinas extraídas de *Sanguinaria canadensis*, *Macleaya cordata* o *Macleaya macrocarpa*
 y
 c. extracto lipófilo de *Zanthoxylum bungeanum*.

2. Composiciones según la reivindicación 1 en forma de comprimidos o gomas de mascar.

3. El uso de una combinación de:

- 10 a. procianidinas extraídas de *Vitis vinifera*,
 b. sanguinarinas y queleritrinas extraídas de *Sanguinaria canadensis*, *Macleaya cordata* o *Macleaya macrocarpa*
 y
 c. extracto lipófilo de *Zanthoxylum bungeanum*.

15 para la preparación de composiciones para la prevención y el tratamiento de infecciones bacterianas de la cavidad oral.

4. El uso de una combinación de:

- 20 a. procianidinas extraídas de *Vitis vinifera*,
 b. sanguinarinas y queleritrinas extraídas de *Sanguinaria canadensis*, *Macleaya cordata* o *Macleaya macrocarpa*
 y
 c. extracto lipófilo de *Zanthoxylum bungeanum*,

para la preparación de composiciones para la higiene de la cavidad oral.