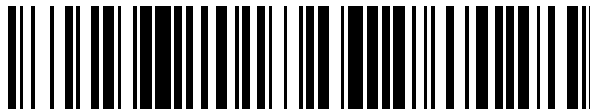


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 539 425**

21 Número de solicitud: 201530421

51 Int. Cl.:

A61K 31/18 (2006.01)

A61K 31/192 (2006.01)

A61K 33/30 (2006.01)

A61P 13/08 (2006.01)

12

SOLICITUD DE PATENTE

A1

22 Fecha de presentación:

30.03.2015

43 Fecha de publicación de la solicitud:

30.06.2015

71 Solicitantes:

**BLANXART SENA, Enrique (100.0%)
C/ Murcia 1, 4º 3º
08026 Barcelona ES**

72 Inventor/es:

BLANXART SENA, Enrique

74 Agente/Representante:

FORNELLS CARRERAS, Montserrat

54 Título: **Composición farmacéutica para el tratamiento de la inflamación y/o agrandamiento de la próstata**

57 Resumen:

El objeto de esta patente de invención es una composición farmacéutica para el tratamiento de la inflamación y/o agrandamiento de la próstata, en particular por causas no bacterianas. Esta composición contiene una combinación de 3 sustancias activas, tamsulosina, ibuprofeno y cinc, en concreto hidrocloreuro de tamsulosina en una proporción de entre 0,30 miligramos y 0,60 miligramos, gluconato de cinc en una proporción de entre 30 miligramos y 50 miligramos e ibuprofeno en una proporción de entre 300 miligramos y 800 miligramos, contenidos en una formulación de liberación prolongada, sea en una misma formulación o en formulaciones separadas que incluyen al menos una de las sustancias activas.

DESCRIPCIÓN

La presente invención se refiere a una composición farmacéutica para el tratamiento de la inflamación y/o agrandamiento de la próstata, en particular por causas no bacterianas.

5

Antecedentes de la invención

Es sobradamente conocido que la próstata es una glándula de un tamaño similar a una castaña presente únicamente en la anatomía del hombre y que interviene en dos actos concretos, la micción y la eyaculación, por lo que está íntimamente relacionada con la secreción de fluidos. Esta glándula tiene una acusada tendencia a sufrir diversas patologías, en particular una variabilidad de tamaño, sea por inflamación o por un agrandamiento progresivo que se produce con el paso de los años. Esta última afectación, denominada hiperplasia prostática benigna o BPH, es una patología que afecta a los hombres especialmente a partir de los 45/50 años y puede estar relacionada o no con la prostatitis, es decir, la inflamación de la próstata por causas bacterianas o no bacterianas, una inflamación que afecta también a hombres de menor edad. Cuando se trata de prostatitis no bacteriana o abacteriana, la inflamación suele estar relacionada con el aparato urinario ya que la próstata está situada debajo de la vejiga, rodeando el principio de la uretra, por lo que se ve directamente afectada por el llenado y vaciado de la orina. La inflamación de la próstata puede deberse, entre otras causas, a una alteración del vaciado de la vejiga en el que la orina, por reflujo, entra en los conductos de la próstata, depositando en ella las sustancias que contiene (ácido úrico, etc.)

La inflamación de la próstata no bacteriana y la hiperplasia prostática benigna requieren tratamiento médico para aliviar su sintomatología puesto que en ambos casos la próstata presiona la vejiga, incidiendo directamente en la micción y causando molestias importantes al paciente, provocando, por ejemplo, una retención urinaria que puede derivar en problemas renales por acumulación de líquido o bien afectan al control de la vejiga, provocando incontinencia. También puede provocar dificultades en las relaciones sexuales al inducir una disfunción eréctil.

En cualquier caso, el tratamiento que debe aplicarse tiene por objeto reducir la inflamación de la próstata y relajar la musculatura periférica que rodea la próstata y la vejiga para facilitar el flujo de la orina y aliviar la sensación de obstrucción de la uretra.

Hay, por supuesto, tratamientos quirúrgicos y tratamientos no quirúrgicos para lograr principalmente la desinflamación de la próstata y que consisten en una resección de la glándula prostática pero en general la primera predisposición médica pasa por un tratamiento de menor agresividad basado en la utilización de diversos fármacos y/o
5 tratamientos alternativos para reducir la inflamación no bacteriana de la próstata, reduciendo su tamaño para evitar que presione la vejiga y eliminar, de este modo, una posible obstrucción de la salida de la orina. Es el caso, por ejemplo, de formulaciones que contienen específicamente tamsulosina como sustancia activa principal, un antagonista selectivo de los receptores adrenérgicos alfa 1 (vasoconstrictores) que ha demostrado ser
10 eficaz en la relajación de la musculatura de la uretra y la próstata, con lo que alivia la presión de la vejiga y facilita la micción. Sin embargo, de acuerdo con lo expuesto en diversos estudios de la hiperplasia benigna de la próstata y la prostatitis no bacteriana, la tamsulosina ha demostrado ser eficaz en un porcentaje aproximado del 25%, no resolviendo la inflamación y/o agrandamiento de la próstata en muchos casos.

15 Igualmente, y como ocurre con múltiples patologías en que se presenta un cuadro de inflamación crónica o aguda, se aconseja tomar antiinflamatorios del tipo no esteroidal para disminuir dicha inflamación, pero siguen resultando eficaces en un porcentaje reducido, en especial en el tratamiento de la hiperplasia benigna de la próstata.

20 En cuanto a tratamientos alternativos, se aconseja ingerir, por ejemplo, ácidos grasos Omega-3, semillas de calabaza y todo tipo de vegetales y alimentos con propiedades diuréticas para facilitar la micción.

25 Objeto de la invención

La presente invención se refiere a una composición farmacéutica para el tratamiento de la inflamación y/o agrandamiento de la próstata, en particular por causas no bacterianas, la cual provoca molestias persistentes para el paciente que, con el tiempo, pueden derivar en
30 afectaciones de mayor importancia que requieren tratamiento quirúrgico.

En particular, la composición que se reivindica está especialmente formulada para actuar ante la prostatitis o inflamación de la próstata no bacteriana, siendo igualmente efectiva para aliviar el agrandamiento de la próstata que comporta la hiperplasia benigna de
35 próstata (BPH) puesto que actúa para disminuir la inflamación de la próstata y relajar los músculos pélvicos y periféricos de la vejiga y uréter.

Esta composición contiene una combinación de tres sustancias activas, en concreto tamsulosina, ibuprofeno y cinc, todas ellas en una formulación preferentemente sólida, encapsulada y de administración oral.

5 La formulación contiene hidrocloreto de tamsulosina en una proporción de entre 0,30 miligramos y 0,60 miligramos, gluconato de cinc en una proporción de entre 30 miligramos y 50 miligramos y ibuprofeno en una proporción de entre 300 miligramos y 800 miligramos, contenidos en una misma formulación de liberación prolongada o bien en formulaciones separadas de liberación prolongada que incluyen al menos una de las sustancias activas.

10

En esta composición se concentran las tres sustancias activas citadas que tienen, cada una en particular, distintas propiedades que, sumadas, actúan de una forma eficaz ante la inflamación de la próstata, tanto si se debe a una prostatitis no bacteriana o como si es una manifestación de la hiperplasia benigna de próstata

15

El hidrocloreto de tamsulosina aporta sus propiedades de relajante muscular, en particular del músculo liso prostático.

20

El gluconato de cinc es un elemento químico muy presente en la glándula prostática, la cual concentra el índice más elevado de cinc presente en los órganos del cuerpo humano, resultando especialmente relacionado con la función sexual y también muy necesario para activar una correcta contracción de la masa muscular, es decir, interviene específicamente en el tono del músculo liso prostático y zonas próximas en las que los receptores adrenérgicos alfa 1 (vasoconstrictores), ya citados, aparecen con unos niveles de

25

El ibuprofeno es, por si mismo, un eficaz antiinflamatorio.

30

Todo ello comporta que la composición que se presenta tenga un alta efectividad en los procesos que comportan la inflamación de la próstata.

Tanto el contenido como la cubierta de la cápsula contienen los excipientes que sean pertinentes y que no se reivindican en esta patente.

35

La posología preferente es de una cápsula o dosis cada 24 horas.

No se considera necesario hacer más extensa esta descripción para que cualquier experto en la materia comprenda el alcance de la invención y las ventajas que de esta composición se derivan. Los términos en que se ha redactado esta memoria deberán ser tomados siempre en sentido amplio y no limitativo.

REIVINDICACIONES

1ª Composición farmacéutica para el tratamiento de la inflamación y/o agrandamiento de la próstata, caracterizada porque contiene una combinación de tres sustancias activas,
5 tamsulosina, ibuprofeno y cinc.

2ª Composición farmacéutica, según la 1ª reivindicación, caracterizada esencialmente porque la tamsulosina se presenta como hidrocloreuro.

10 3ª Composición farmacéutica, según la 1ª reivindicación, caracterizada esencialmente porque el cinc se presenta como gluconato.

4ª Composición farmacéutica, según la 1ª y 2ª reivindicaciones, caracterizada esencialmente porque contiene hidrocloreuro de tamsulosina en una proporción de entre
15 0.30 miligramos y 0,60 miligramos.

5ª Composición farmacéutica, según la 1ª y 3ª reivindicaciones, caracterizada esencialmente porque contiene gluconato de cinc en una proporción de entre 30 miligramos y 50 miligramos.
20

6ª Composición farmacéutica, según la 1ª reivindicación caracterizada, esencialmente porque contiene ibuprofeno en una proporción de entre 300 miligramos y 800 miligramos.

7ª Composición farmacéutica, según las reivindicaciones de la 1 a la 6, caracterizada
25 esencialmente porque el hidrocloreuro de tamsulosina, el gluconato de cinc y el ibuprofeno están contenidos en una misma formulación de liberación prolongada.

8ª Composición farmacéutica, según las reivindicaciones de la 1 a la 6, caracterizada esencialmente porque el hidrocloreuro de tamsulosina, el gluconato de cinc y el ibuprofeno
30 están contenidos en formulaciones separadas de liberación prolongada que incluyen al menos una de las sustancias activas.

9ª Composición farmacéutica, según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada esencialmente porque está aplicada al tratamiento de la inflamación de la
35 próstata provocada por la prostatitis no bacteriana.

10ª Composición farmacéutica, según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada esencialmente porque está aplicada al tratamiento de la inflamación de la próstata provocada por la hiperplasia benigna de próstata (BPH).



- ②① N.º solicitud: 201530421
②② Fecha de presentación de la solicitud: 30.03.2015
③② Fecha de prioridad:

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TECNICA

⑤① Int. Cl.: Ver Hoja Adicional

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑤⑥ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
Y	US 2004198826 A1 (BAIKER WOLFGANG et al.) 07.10.2004, párrafos [0017],[0018],[0021],[0023],[0024].	1-10
Y	US 4946688 A (FAHIM MOSTAFA S) 07.08.1990, columna 2, líneas 46-59; columna 5, líneas 7-46.	1-10
A	CN 1436532 A (TANG DEHONG) 20.08.2003, (resumen) [en línea] [recuperado el 19.06.2015]. Recuperado de: EPOQUE WPI Database; DW 200401; nº acceso 2004-000239.	1-10
A	WO 2010077723 A1 (HAUCK JOHN F et al.) 08.07.2010, reivindicaciones.	1-10
A	US 2006121129 A1 (HARVEY BRYCE M et al.) 08.06.2006, párrafos [0056],[0061]-[0066]; ejemplos.	1-10

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
22.06.2015

Examinador
N. Vera Gutiérrez

Página
1/4

CLASIFICACIÓN OBJETO DE LA SOLICITUD

A61K31/18 (2006.01)

A61K31/192 (2006.01)

A61K33/30 (2006.01)

A61P13/08 (2006.01)

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

A61K, A61P

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, CAS, WPI, BIOSIS, MEDLINE, EMBASE, NPL,, XPES, XPESP2

Fecha de Realización de la Opinión Escrita: 22.06.2015

Declaración

Novedad (Art. 6.1 LP 11/1986)	Reivindicaciones 1-10	SI
	Reivindicaciones	NO
Actividad inventiva (Art. 8.1 LP11/1986)	Reivindicaciones	SI
	Reivindicaciones 1-10	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	US 2004198826 A1 (BAIKER WOLFGANG et al.)	07.10.2004
D02	US 4946688 A (FAHIM MOSTAFA S)	07.08.1990

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 una composición farmacéutica que contiene una combinación de tamsulosina, ibuprofeno y cinc, útil en el tratamiento de la inflamación de próstata provocada por hiperplasia benigna de próstata o por prostatitis no bacteriana.

El documento D01 divulga una composición farmacéutica para el tratamiento de la hiperplasia prostática benigna, que comprende 0,1-1,5 mg de hidrocloreto de tamsulosina y 0,1-20 mg de un antiinflamatorio no esteroideo, por ejemplo ibuprofeno. La composición se presenta en forma de formulación de liberación retardada (párrafos [0021], [0024]).

El documento D02 divulga un método para el tratamiento de la hipertrofia prostática benigna que consiste en la inyección intraprostática de iones de cinc, en una concentración de 0,25-20% en peso. Se menciona el gluconato de cinc como la fuente de iones de cinc particularmente adaptada a la administración por esta vía (columna 5, líneas 31-46).

No se han encontrado en el estado de la técnica documentos que divulguen una composición farmacéutica que contenga una combinación de tamsulosina, ibuprofeno y cinc. Por ello, se considera que la invención tal como se define en las reivindicaciones 1-10 de la solicitud es nueva (Artículo 6.1 L.P.).

Sin embargo, se considera que la administración conjunta de tamsulosina, ibuprofeno y cinc para el tratamiento de la inflamación de próstata provocada por hiperplasia benigna de próstata o prostatitis no bacteriana, supone una mera yuxtaposición de elementos conocidos en el estado de la técnica. En general, no se puede considerar inventivo el hecho de combinar dos o más principios activos para tratar una enfermedad particular en el caso de que dichos agentes activos sean conocidos de manera individual como terapéuticamente eficaces en el tratamiento de esa enfermedad. En cuanto a las cantidades de los principios activos presentes en la composición, se trata de valores empleados en la práctica habitual, ya recogidos en el estado de la técnica.

En consecuencia, se considera que la invención tal como se define en las reivindicaciones 1-10 de la solicitud no implica actividad inventiva (Artículo 8.1 L.P.).