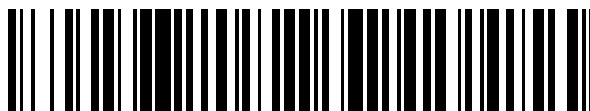


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 544 543**

51 Int. Cl.:

**A61K 31/025** (2006.01)

**A61P 17/06** (2006.01)

**A61P 17/00** (2006.01)

**A61K 9/00** (2006.01)

**A61K 31/185** (2006.01)

**A61K 31/035** (2006.01)

**A61K 31/695** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **15.05.2012 E 12726034 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.07.2015 EP 2729137**

54 Título: **Composiciones tópicas para usar en la prevención y/o tratamiento de la dermatitis**

30 Prioridad:

**06.07.2011 IT MI20111260**

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

**01.09.2015**

73 Titular/es:

**CUTRUPI, CARMELO (100.0%)**

**Via Museo 1/III  
39100 Bolzano, IT**

72 Inventor/es:

**CUTRUPI, CARMELO**

74 Agente/Representante:

**LAZCANO GAINZA, Jesús**

**ES 2 544 543 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).

# ES 2 544 543 T3

## Descripción

Composiciones tópicas para usar en la prevención y/o tratamiento de la dermatitis

### 5 Campo de la invención

La presente invención se refiere a composiciones tópicas que contienen bromociclono para usar en la prevención y/o tratamiento de la dermatitis.

### 10 Estado de la técnica

La dermatitis es una enfermedad de la piel consistente en una reacción inflamatoria de la piel que se manifiesta como una irritación. La dermatitis puede tener muchas causas diferentes, que pueden, por ejemplo, ser químicas, físicas, microbianas o parasíticas.

15

La dermatitis puede ser además el resultado de una enfermedad de la piel de causa alérgica, como el eccema atópico o la neurodermitis, o de causa autoinmune, como la psoriasis.

20

Las formas no contagiosas de la dermatitis son además denominadas eccema.

La dermatitis a menudo se exagera en situaciones de estrés.

El eccema es por definición una reacción inflamatoria de la dermis (dermatitis), que es pruriginosa y no contagiosa.

25

Las formas más comunes de eccema son la neurodermitis (también llamada eccema atópico o dermatitis atópica), típico de la cara, el cual es un trastorno crónico o crónico/recidivante, desencadenado por varios factores, que pueden ser inmunológicos y no inmunológicos; dermatitis alérgica, conocida también como dermatitis de contacto, eccema esteatoico; eccema dishidrótico, que aparece en los dedos, la palma de las manos y la planta de los pies; eccema discoide, que aparece principalmente en las piernas; y dermatitis seborreica.

30

El tratamiento del eccema depende de la forma en que se manifiesta; sin embargo generalmente se emplean tratamientos con cortisona, esteroides tópicos, emolientes y cremas hidratantes.

35

La psoriasis, que es una de las formas más comunes de enfermedad de la piel en el mundo, ocurre en 1,4-4,82% de la población mundial.

Es una enfermedad inflamatoria no infecciosa de la piel, generalmente crónica y recidivante.

40

La manifestaciones más comunes son pápulas eritematosas bien definidas y placas cubiertas con escamas plateadas o perladas. Las lesiones son de varios tamaños, y su severidad puede variar desde unos pocos puntos de descamado parecido a la caspa hasta una dermatosis general con artritis (artritis psoriática), exfoliaciones y erupciones debilitantes.

45

Las lesiones ocurren con mayor frecuencia en el cuero cabelludo, las áreas extensoras del codo y la rodilla y el área lumbosacra, pero en algunas formas aparecen además en áreas flexoras, en los genitales, planta de los pies y palma de las manos.

Existen varias formas de psoriasis, tales como la discoide (la forma más común) y la psoriasis en placa, gotosa e inversa.

50

Los tratamientos de la psoriasis incluyen como medicamentos de primera elección en formas de extensión limitada, emolientes tópicos como vaselina, cortisona y/o agentes reductores; agentes queratolíticos y análogos de la vitamina D.

Los desórdenes anteriormente descritos son altamente debilitantes, tanto desde el punto de vista psicológico como físico.

55

Los medicamentos que se emplean para tratar la dermatitis incluyen el metotrexato y la ivermectina, que han demostrado ser tóxicos.

60

Los medicamentos corrientemente disponibles no producen una curación permanente completa de la enfermedad, y su empleo provoca una variedad de efectos colaterales.

Como estos desórdenes son tan generalizados, aún existe la necesidad de emplear preparaciones alternativas para la prevención y/o tratamiento de la dermatitis, especialmente el eccema y la psoriasis.

Resumen de la invención

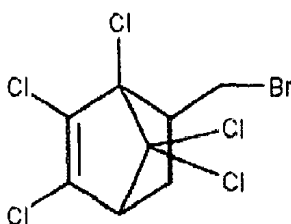
5 La presente invención se refiere a composiciones tópicas que contienen bromociclono para usar en la prevención y/o tratamiento de la dermatitis.

Descripción de la invención

10 Sorprendentemente se encontró que las composiciones que contienen bromociclono son útiles en la prevención y/o tratamiento de la dermatitis.

El bromociclono, 5-(bromometil)-1,2,3,4,7,7-hexaclorobiciclo[2.2.1]-hept-2-eno, es un compuesto de fórmula:

15



20

25 Las composiciones de acuerdo con la invención han probado ser eficaces en el tratamiento de queratosis y/o desórdenes inflamatorios de la piel y la dermis. Las composiciones tópicas son útiles en particular en la prevención y/o tratamiento del eccema (tal como la dermatitis atópica) y la psoriasis (tal como psoriasis en placa).

30 Las composiciones de acuerdo con la invención pueden además incluir, como constituyentes activos, ácido silícico y/o oleato sódico de metiltaurina 6-cloro-3-hidroxi-1-metilbenzol.

Dichas composiciones se administran tópicamente.

35 La presente invención se refiere a composiciones farmacéuticas que contienen bromociclono, y opcionalmente oleato sódico de metiltaurina 6-cloro-3-hidroxi-1-metilbenzol, y al menos un excipiente o portador farmacéuticamente aceptable.

40 Los excipientes o portadores farmacéuticamente aceptables pueden ser, por ejemplo, agua, alcohol, alcohol etílico, surfactantes y otros excipientes o portadores de acuerdo con la Farmacopea Internacional.

Las composiciones tópicas pueden ser formuladas por métodos convencionales.

45 Las formas de dosificación preferidas son, por ejemplo, disoluciones, lociones, geles, cremas, ungüentos, champúes, apósitos impregnados y otras formas de dosificación adecuadas de acuerdo con la Farmacopea Internacional

De acuerdo con un aspecto preferido, las composiciones se emplean para uso humano.

Los ejemplos dados a continuación ilustran adicionalmente la invención.

50 Ejemplo

Se llevó a cabo un estudio experimental para probar la eficacia de las composiciones tópicas en el tratamiento de la dermatitis.

55 El ensayo se llevó a cabo empleando disoluciones con diferentes concentraciones de los constituyentes activos de acuerdo con la severidad de la enfermedad tratada.

En el ensayo participaron 26 voluntarios..

60 Los pacientes se trataron por un período que varió de 1 semana a 4 meses con la disolución de acuerdo con la invención aplicada tópicamente dos veces al día (mañana y tarde), de acuerdo con la tolerancia individual y la enfermedad tratada.

Evaluación de la eficacia

La extensión y severidad de la dermatitis se determinó antes y después del tratamiento en cada paciente sobre la base de la siguiente escala de 0 a 10:

5

- 0 = Ausencia total de síntomas y la enfermedad
- 1 = Ausencia casi total de síntomas y la enfermedad e
- 2 = Curación de la mayoría de los síntomas y la enfermedad
- 3 = Buena mejoría en los síntomas y la enfermedad
- 4 = Mejoría en los síntomas y la enfermedad
- 5 = Leve mejoría de los síntomas y la enfermedad
- 6 = Mejoría gradual en algunos síntomas
- 7 = Leve mejoría en algunos síntomas
- 8 = Persistencia del 50% de las lesiones
- 9 = Persistencia de algunos síntomas y de las lesiones
- 10 = Persistencia sin cambios de los síntomas y la enfermedad.

10

15

La evaluación antes y después del tratamiento se llevó a cabo por el investigador médico.

20

Los resultados se exponen en la Tabla.

**Tabla**

25

Paciente	Evaluación antes del tratamiento	Evaluación después del tratamiento	Trastorno
1	10	0	Psoriasis vulgaris
2	9	0	Psoriasis vulgaris
3	9	1	Psoriasis vulgaris
4	10	1	Psoriasis vulgaris
5	10	1	Psoriasis vulgaris
6	10	2	Psoriasis vulgaris
7	10	2	Psoriasis vulgaris
8	9	2	Psoriasis vulgaris
9	9	0	Psoriasis vulgaris
10	9	0	Psoriasis vulgaris
11	10	1	Psoriasis intertriginosa
12	9	0	Psoriasis pustular
13	9	0	Psoriasis discoide
14	10	1	Dermatitis atópica
15	9	1	Dermatitis atópica
16	9	0	Dermatitis atópica
17	10	1	Dermatitis atópica
18	10	1	Dermatitis atópica
19	10	0	Dermatitis atópica
20	10	1	Dermatitis de contacto atópica

60

5	<b>21</b>	9	1	Dermatitis de contacto atópica
	<b>22</b>	10	1	Dermatitis de contacto atópica
	<b>23</b>	10	0	Dermatitis de contacto atópica
10	<b>24</b>	9	0	Dermatitis eccematosa exfoliativa
	<b>25</b>	10	0	Eccema dishidrótico
	<b>26</b>	9	1	Eccema discoide

15

Conclusiones

20

Las opiniones de la eficacia de la composición expresadas por el investigador médico después del tratamiento indicaron que la composición de acuerdo con la invención es eficaz en el tratamiento de la psoriasis vulgaris, la psoriasis intertriginosa, la psoriasis pustular, la psoriasis discoide, la dermatitis atópica, la dermatitis de contacto atópica, la dermatitis eccematosa exfoliativa, el eccema dishidrótico y el eccema discoide.

25

Estos resultados se confirmaron por las opiniones de los voluntarios, quienes consideraron que la composición fue eficaz.

Reivindicaciones

- 5
1. Composiciones tópicas que contienen bromociclono para usar en la prevención y/o tratamiento de la dermatitis.
  2. Composiciones tópicas para uso como se reivindica en la reivindicación 1, que contienen además ácido silícico.
- 10
3. Composiciones tópicas para usar como se reivindica en reivindicación 1 o 2, que contienen además sal de oleato sódico de metiltaurina 6-cloro-3-hidroxi-1-metilbenzol.
  4. Composiciones tópicas como se reivindican en las reivindicaciones 1-3, para usar en la prevención y/o tratamiento del eccema.
- 15
5. Composiciones tópicas como se reivindica en las reivindicaciones 1-3, para usar en la prevención y/o tratamiento de la psoriasis.