

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 633 445**

51 Int. Cl.:

**A61K 9/00** (2006.01)  
**A61K 9/08** (2006.01)  
**A61K 47/10** (2007.01)  
**A61K 36/00** (2006.01)  
**A61K 47/26** (2006.01)  
**A61K 47/36** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.01.2007** **E 07000329 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **10.05.2017** **EP 1844764**

54 Título: **Composición para usar como laxante**

30 Prioridad:

**12.04.2006 DE 102006017672**

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

**21.09.2017**

73 Titular/es:

**MARIA CLEMENTINE MARTIN KLOSTERFRAU  
VERTRIEBSGESELLSCHAFT MBH (100.0%)  
GEREONSMUHLENGASSE 1-11  
50670 KOLN, DE**

72 Inventor/es:

**VESTWEBER, ANNA-MARIA, DR. MED. y  
GREVE, HARALD, DR.**

74 Agente/Representante:

**ELZABURU, S.L.P**

**ES 2 633 445 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

Composición para usar como laxante

5 La presente invención se refiere a una composición, en particular una composición farmacéutica, preferiblemente para usar como laxante (purgante). De manera especial, la presente invención hace referencia a una composición, preferiblemente una composición farmacéutica, basada en al menos un poliol, así como al menos una sustancia no digerible de la dieta (fibra) y/o al menos un prebiótico, y al uso de esta composición como laxante (purgante).

10 Las causas del estreñimiento pueden ser múltiples: a menudo, los desencadenantes del estreñimiento son un aporte demasiado escaso de líquidos, una alimentación desequilibrada con un contenido excesivamente bajo de fibra y/o la ausencia de movimiento físico. Sin embargo, también el estrés, medicamentos o una flora intestinal alterada pueden contribuir a que el intestino se torne perezoso. El contenido intestinal pierde mucha agua y éste se hace más seco, más sólido y con menor capacidad de deslizamiento y, como consecuencia, el vaciado intestinal resulta difícil y, con frecuencia, también doloroso.

15 Para tratar el estreñimiento se administran los llamados laxantes que se pueden utilizar de la forma más variada. Los laxantes, llamados también "purgantes", están disponibles en las presentaciones más diversas, entre las cuales se encuentran también múltiples laxantes vegetales. En términos generales, con este término se designan los medios para eliminar el estreñimiento ("constipación") mediante la activación de la evacuación intestinal (defecación) y/o el reblandecimiento de las heces fecales (heces) de consistencia aumentada.

20 Como laxantes se puede diferenciar, por una parte, los lubricantes tales como aceites de mala o nula absorción, por ejemplo, glicerina y parafina, aceites minerales con incorporación de agar-agar a modo de carga, o fenoltaleína como laxante difenólico activo sobre el intestino grueso, en donde con el uso crónico de estos aceites existe el riesgo, entre otros, de producir estados deficitarios de vitaminas (por ejemplo, vitaminas A, D, E y K); por otra parte, cargas, es decir, agentes no digeribles y no absorbibles, que se hinchan con la absorción de agua y que desencadenan el reflejo de defecación por el aumento de volumen tales como agar-agar, metilcelulosa y, por ejemplo, linaza como remedio casero. Adicionalmente, actúan como laxantes las sustancias que ejercen un efecto 25 inhibidor de la reabsorción de líquidos y sodio, favoreciendo al mismo tiempo la secreción de líquidos (junto con electrolitos tales como  $\text{Na}^+$ ,  $\text{K}^+$ ,  $\text{Ca}^{2+}$ ,  $\text{Cl}^-$ , etc.) en la región del intestino grueso, es decir, laxantes conocidos como anti-adsorptivos y secretagogos (los denominados agentes del intestino grueso) y, concretamente, las antraquinonas que actúan a través de los productos finales, las agliconas, generados por las bacterias del intestino, así como laxantes difenólicos tales como fenoltaleína, bisacodilo y sus ésteres de ácido sulfúrico, así como picosulfato sódico, que actúan a través de difenoles que se liberan en el intestino grueso, así como ácidos biliares. Se conocen, además, los laxantes osmóticos ("osmo-laxantes") que actúan por la retención de cantidades osmóticamente equivalentes de líquido en la luz intestinal, por ejemplo, levulosa, así como laxantes salinos, iones sulfato (tales como, por ejemplo, sal de Karlsbad, agua de sulfato de magnesio, sal de Glauber, etc.). Por último, se utilizan también laxantes que estimulan la síntesis de prostaglandinas en el intestino delgado tales como, por ejemplo, aceite 35 de ricino.

Todos los laxantes anteriormente citados están lastrados, en caso de uso crónico, por el riesgo de trastornos del equilibrio de agua/electrolitos y alteraciones del intestino grueso y, algunos de ellos, también exhiben efectos adversos particulares, que son específicos de determinadas sustancias.

40 Además, los laxantes según el estado de la técnica pueden asociarse con frecuencia a efectos adversos importantes, sobre todo cuando se usan de manera prolongada y a dosis altas. Estos efectos adversos comprenden principalmente pérdida de electrolitos (entre otros, pérdida de potasio y, de este modo, intensificación del estreñimiento), melanosis coli (por ejemplo, con laxantes basados en derivados de antraquinona), formación de granulomas de cuerpos extraños (por ejemplo, con aceites de parafina), enteritis hemorrágicas y reacciones de hipersensibilidad peligrosas para la vida (por ejemplo, con fenoltaleína), así como flatulencias agudas (por ejemplo, con sustancias hinchantes) o dolores abdominales (por ejemplo, con derivados de antraquinona).

45 El abuso de laxantes, es decir, la ingesta incorrecta de estos productos, a menudo de origen psíquico, se manifiesta clínicamente por caliuresis, hipopotasemia intermitente y atrofia de la mucosa intestinal. Debido a la pérdida de potasio se puede producir parálisis por hipopotasemia.

50 Por otra parte, se conocen también los llamados purgantes naturales, especialmente en forma de las denominadas combinaciones de laxantes naturales tales como las que contienen determinadas sustancias vegetales, por ejemplo, extracto de coloquintida, aloe, resina de jalapa, podofilina (que es potencialmente teratogénica y carcinogénica).

55 Para conocer detalles adicionales sobre los laxantes se pueden consultar, por ejemplo, Pschyrembel, Diccionario de Medicina, 257ª edición, Editorial Walter de Gruyter, 1993, página 852, palabra clave: "laxantes", así como el Diccionario de Medicina de Roche, 3ª edición, Editorial Urban & Schwarzenberg, 1993, página 3, palabra clave: "productos purgantes", cuya descripción completa para estas entradas se incorpora como referencia a este documento.

De forma adicional, se conocen laxantes naturales basados en semillas de ispágula (*Psyllium*) o sus componentes y similares, los cuales frecuentemente carecen de una acción laxante suficiente.

5 Como laxantes osmóticos se conocen, en especial, los preparados a base de macrogol como principio activo. Estos preparados comerciales no siempre producen el efecto laxante deseado y, en particular, a menudo falta la estimulación de la actividad intestinal. Los documentos WO 97/03685, WO 2005/007170, US 2005/142099 proponen una combinación de poliol (polietilenglicol) y una fibra dietética o lactulosa (un prebiótico) como laxante. Por consiguiente, la presente invención tiene como tarea fundamental poner a disposición una composición, en particular una composición farmacéutica, que sea adecuada para el uso como laxante y capaz de evitar al menos en gran medida o, por lo menos, aliviar los inconvenientes anteriormente mencionados del estado de la técnica.

10 Por lo tanto, es objeto de la presente invención – según un primer aspecto de la presente invención – una composición, en particular una composición farmacéutica, tal como la que se describe en la reivindicación 1.

15 La expresión “composición farmacéutica” o “preparación farmacéutica” o similar, según se utiliza en el marco de la presente invención, se debe considerar en su concepto más extenso y designa no sólo los preparados farmacéuticos o productos farmacéuticos como tales, sino también los llamados productos medicinales, complementos alimenticios o similares.

En todos los datos cuantitativos que se mencionan a continuación, en el marco de la composición según la invención o la combinación seleccionada por el experto en la materia, se debe prestar atención a que sumen siempre 100% en peso. Evidentemente, esta indicación resulta evidente para el experto en la materia.

20 La cantidad de poliol(es) presente en la composición según la invención puede variar dentro de un extenso intervalo. En general, y con respecto a la composición, la composición según la presente invención contiene poliol(es) en cantidades de 10 hasta 99,5% en peso, en especial 40 hasta 99% en peso, preferiblemente 60 hasta 99% en peso, de forma especialmente preferida, 80 a 98% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 90 a 97% en peso. No obstante, en determinados casos individuales o en lo que se refiere al uso, puede ser necesario desviarse de las cantidades anteriormente indicadas, sin apartarse del marco de la presente invención.

25 Con referencia a la fibra dietética y/o el o los prebióticos, éstos también pueden variar dentro de amplios intervalos. En general, la composición según la invención contiene, con respecto a la composición, fibra dietética y/o prebiótico o prebióticos en cantidades de 0,5 a 30% en peso, en especial 0,6 a 10% en peso, preferiblemente 0,7 a 5% en peso, de forma especialmente preferida, 0,8 a 3% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 1 a 2% en peso.

30 En relación con el poliol o la mezcla de polioles usados según la invención, estas sustancias tienen en general actividad osmótica, sobre todo mediante fijación de agua. Adicionalmente, los polioles utilizados según la invención pueden ser solubles y/o capaces de hincharse en un líquido, especialmente en agua. En este caso, el poliol usado según la invención debe ser esencialmente no reabsorbible, es decir, no debe ser reabsorbido en el tracto gastro/intestinal tras su administración por vía oral. Tal como se ha descrito anteriormente, el poliol que se utiliza según la invención tiene, convenientemente, actividad osmótica y, especialmente, fija agua por ósmosis. Tras la administración por vía oral de la composición según la invención, por lo general con agua, el poliol usado según la invención absorbe la cantidad de agua ingerida a modo de esponja invisible y la transporta a través del tracto gastro/intestinal hacia el intestino grueso, sin retirar líquidos del organismo. De este modo, las heces endurecidas se reblandecen y es posible evacuarlas sin dificultad. Al mismo tiempo, tal como se expondrá más adelante, la fibra dietética administrada en combinación o el prebiótico administrado en combinación estimulan la actividad intestinal. En total, es posible lograr una evacuación normal, más blanda y fácil de manera especialmente cuidadosa y fiable, estimulando la actividad intestinal.

En términos generales, como poliol se utiliza, según la invención, un polialquilenglicol, preferiblemente un polietilenglicol.

45 El peso molecular (masa molecular) del poliol usado, en especial del polialquilenglicol, preferiblemente, polietilenglicol, puede variar dentro de amplios intervalos. En general, el peso molecular medio del poliol empleado, en especial del polialquilenglicol, preferiblemente, polietilenglicol, se encuentra en el intervalo de 1.000 hasta 10.000 g/mol (Dalton), en especial, 2.000 a 8.000 g/mol, preferiblemente, 2.500 a 5.500 g/mol, preferiblemente 3.000 a 5.000 g/mol y, de manera especialmente preferida, 3.200 a 4.200 g/mol.

50 De manera preferida según la invención, se utiliza como poliol un polietilenglicol con un peso molecular medio en el intervalo de 2.500 a 5.000 g/mol, preferiblemente, 3.000 a 5.000 y, de forma muy especialmente preferida, 3.200 a 4.200 g/mol.

55 De manera muy preferida según la invención, se puede usar como poliol un polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 3.350 g/mol o aproximadamente 4.000 g/mol, o una mezcla de un polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 3.350 g/mol y un polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 4.000 g/mol, preferiblemente del tipo Macrogol 3350 y/o Macrogol 4000.

Macrogol está compuesto por una estructura con actividad osmótica y no reabsorbible, con un peso molecular medio de 3.350 g/mol o 4.000 g/mol y, en el marco de la combinación o composición según la invención, se utiliza para el tratamiento del estreñimiento. Macrogol, tanto con un peso molecular de 3.350 g/mol como también con un peso molecular de 4.000 g/mol, se presenta en forma de polvo o granulado y, junto con la fibra dietética o el prebiótico, disuelto o suspendido en agua, y se puede beber como solución o suspensión con agua (por ejemplo, aproximadamente 125 mL por 10 a 50 g de la composición). La solución o suspensión atraviesa, entonces, el estómago y el tracto intestinal superior sin ningún otro efecto físico y farmacológico. Solamente en el intestino grueso tiene lugar de manera exhaustiva el efecto osmótico deseado, anteriormente mencionado: el agua, debido al proceso osmótico, queda retenida en el intestino grueso y se fija al Macrogol o al poliol que fija dicha agua. De este modo, se produce el reblandecimiento fecal y un aumento del volumen de las heces, mediante lo cual, a través de reflejos de dilatación en el colon, se produce la estimulación del peristaltismo que, en la región del recto, provoca el reflejo de defecación. Durante este proceso, el organismo no absorbe el poliol o el Macrogol desde el intestino, sino que se elimina inalterado.

En el caso de ingesta regular, tampoco existe el riesgo de acostumbamiento que se observa con los laxantes actuales y cuya acción no se puede explicar por los efectos físicos. El efecto principal de la composición según la invención es esencialmente la fijación de agua en el volumen intestinal por ósmosis, de manera que se produce el reflejo de dilatación en el colon y se desencadena el peristaltismo intestinal, cuyo resultado es una evacuación fecal más fácil, que se asocia con la estimulación de la actividad intestinal natural por medio de la combinación con la fibra dietética y/o el prebiótico.

En lo que respecta a la fibra dietética y/o el prebiótico utilizados según la invención, éstos se pueden seleccionar especialmente del grupo que consiste en celulosa, lignina, pentosanos, queratinas, agar-agar, fibra dietética soluble tales como fructo- o galactooligosacáridos, preferiblemente inulina, así como sus derivados y mezclas.

El concepto de fibra dietética tal como se utiliza en el marco de la presente invención designa componentes nutricionales que el organismo humano no puede digerir, tales como especialmente las fibras dietéticas anteriormente mencionadas, es decir, celulosa, lignina, queratina, pentosano, agar-agar, etc. La fibra dietética más importante es la celulosa que está presente, junto con la lignina y los pentosanos, en las paredes de las células vegetales, y que por su parte son componentes frecuentes de las fibras vegetales (de donde proviene la expresión fibras dietéticas que se utiliza en este contexto). El sistema digestivo humano no puede degradar enzimáticamente estas fibras polímeras en oligómeros o monómeros que puedan ser reabsorbidos como tales; por el contrario, atraviesan el sistema digestivo de manera esencialmente inalterada. Con la expresión fibras dietéticas solubles se designan compuestos tales como fructo- o galactooligosacáridos (por ejemplo, inulina), que hacen posible preparar bebidas transparentes que contienen fibras dietéticas. Supuestamente, debido a la irritación mecánica de las paredes intestinales y a su capacidad para fijar productos metabólicos perjudiciales, las fibras dietéticas son importantes para la digestión y estimulan el peristaltismo intestinal. Más información en relación con el concepto de fibras dietéticas se puede consultar, por ejemplo, en el Diccionario de Química Römpf, Editorial Georg Thieme, Stuttgart/Nueva York, 1996, 10ª edición, Volumen 1, páginas 351-352, palabra clave: "fibra dietética", así como en la bibliografía referida en dicha obra, cuyo contenido íntegro de las citas bibliográficas mencionadas se incorpora en su totalidad al presente documento como referencia.

En relación con el concepto de prebiótico tal como se utiliza en el marco de la presente invención, se trata de componentes nutricionales especialmente indigeribles con efectos positivos para la salud. Los prebióticos estimulan selectivamente el crecimiento de determinadas bacterias intestinales.

De manera preferida según la invención, se utiliza como prebiótico inulina, designada también por sus sinónimos dahlina, alantina o almidón de alantá; se trata de un polvo higroscópico incoloro que se disuelve en agua, sobre todo al calentarla, para formar una solución coloidal, pero que es insoluble en alcoholes y éteres. La inulina es un polifructosano lineal con 30 a 60 unidades de fructosa con uniones  $\beta$ 2-1, presente en forma de furanósido. Su peso molecular es de aproximadamente 5.000 g/mol. La inulina está presente sola o junto con almidones como hidrato de carbono de reserva en el tubérculo de la dalia, alcachofas, el tubérculo de tупinambo, raíces de achicoria, raíces del diente de león, en las células de la alantá y otras compuestas y de manera menos habitual en familias vegetales relacionadas (campanuláceas, lobeliáceas).

La inulina es especialmente apropiada como prebiótico dado que, por una parte, estimula el crecimiento de bacterias intestinales beneficiosas y actúa también como fibra dietética soluble apta para diabéticos y carece de propiedades cariogénicas. De forma especial, la inulina se puede utilizar para el enriquecimiento en fibra dietética.

Más información en relación con la sustancia inulina se puede consultar, por ejemplo, en el Diccionario de Química Römpf, Editorial Georg Thieme, Stuttgart/Nueva York, 1997, Volumen 3, páginas 1948-1949, palabra clave: "inulina", así como en la bibliografía referida en dicha obra, cuyo contenido íntegro de las citas bibliográficas mencionadas se incorpora en su totalidad al presente documento como referencia.

De manera preferida según la invención, la fibra dietética y/o el prebiótico se pueden agregar en forma de inulina, semillas de ispágula, semillas de lino, guar y/o lactulosa. Según la invención, se prefiere de manera muy especial utilizar, tal como se ha descrito anteriormente, inulina como fibra dietética y/o prebiótico.

Además de los componentes mencionados anteriormente (es decir, poliol(es) por una parte y fibra(s) dietética(s) y/o prebiótico o prebióticos, por otra), la composición según la invención puede contener convenientemente también al menos un electrolito, preferiblemente una mezcla de electrolitos diferentes. Esto resulta especialmente ventajoso porque de este modo es posible mantener el equilibrio de electrolitos a pesar de la acción laxante de la composición según la invención.

La cantidad de electrolitos que se usa puede variar dentro de amplios intervalos; en general, se encuentra en intervalo de 0,5 a 10% en peso, preferiblemente, 1 a 5% en peso, de forma especialmente preferida 1,5 a 4% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 2 a 3,5% en peso, con respecto a la composición según la invención. No obstante, en casos individuales o en función del uso, puede ser necesario desviarse de las cantidades indicadas, sin apartarse del marco de la presente invención. En el caso de una mezcla de diferentes electrolitos, los datos cuantitativos anteriormente mencionados se refieren a la suma de todos los electrolitos presentes en la composición según la invención.

Los electrolitos eventualmente utilizados se pueden seleccionar, en particular, de sales alcalinas y/o alcalino-térreas orgánicas y/o inorgánicas, así como sus mezclas. Preferiblemente, la composición según la invención contiene una mezcla de sales alcalinas y/o alcalino-térreas tanto orgánicas como inorgánicas.

La sal alcalina y/o alcalino-térrea orgánica es, en especial, la sal alcalina y/o alcalino-térrea de un ácido orgánico, en particular, ácido cítrico y/o ácido tartárico, de forma especialmente preferida, ácido cítrico. De manera especialmente referida según la invención, la sal alcalina y/o alcalino-térrea orgánica es un citrato alcalino y/o alcalino-térreo. Estas sales alcalinas y/o alcalino-térreas orgánicas permiten una mejor absorción de los electrolitos como resultado de las sustancias minerales de origen orgánico y, adicionalmente, producen la alcalinización deseada del tracto gastro/intestinal. De este modo, es posible conservar de manera especial el equilibrio de los electrolitos.

Con respecto a la sal alcalina y/o alcalino-térrea inorgánica, se trata en este caso particular de un cloruro inorgánico, preferiblemente cloruro de sodio y/o potasio.

Por medio de la mezcla de sales alcalinas y/o alcalino-térreas inorgánicas y orgánicas, usada preferiblemente según la invención, se logra una absorción especialmente correcta y se impide eficazmente la pérdida de electrolitos causada por la acción laxante de la composición según la invención.

Además, puede estar previsto que la composición según la invención contenga también ácido fólico, sobre todo en cantidades de 0,1 a 10% en peso, preferiblemente, 0,5 a 5% en peso y, de manera especialmente preferida, 1 a 4% en peso con respecto a la composición según la presente invención. En el contexto de la composición según la invención, el ácido fólico tiene la misión de estimular los tejidos regenerativos, en particular, el tejido epitelial del intestino.

Para mejorar la solubilidad o la capacidad de suspensión de la composición según la invención en líquidos, especialmente en agua, es conveniente agregar a la composición según la invención, además del contacto con estos líquidos, sobre todo agua, coadyuvantes capaces de generar gases, preferiblemente dióxido de carbono, preferiblemente carbonatos y/o hidrógeno carbonatos inorgánicos, combinados en general con ácidos orgánicos, en particular ácido cítrico y/o ácido tartárico. Dicho con otras palabras, se puede agregar a la composición según la invención lo que se denomina composición efervescente, de manera que mejore la solubilidad o la capacidad de suspensión en agua y se optimice la administración de la composición según la invención por vía oral. Estos coadyuvantes se agregan, de manera especial, en cantidades de 0,1 hasta 20% en peso, preferiblemente 0,5 a 10% en peso y, de forma especialmente preferida, de 1 a 5% en peso con respecto a la composición según la invención. El experto en la materia conoce estas técnicas.

De acuerdo con una realización especialmente preferida según la invención, la composición de la presente invención se distingue por la fórmula siguiente, en la que todos los datos cuantitativos que se indican a continuación se refieren respectivamente a la composición según la invención y la suma de todos los componentes se debe combinar, tal como resulta evidente para el experto en la materia, para dar una suma de 100% en peso, en donde la fórmula contiene:

- al menos un polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 3.350 g/mol y/o aproximadamente 4.000 g/mol, preferiblemente un Macrogol, en especial en cantidades de 10 a 99,5% en peso, especialmente 40 a 99% en peso, preferiblemente 60 a 99% en peso, de forma especialmente preferida 80 a 98% en peso y, de manera muy especialmente preferida, de 90 a 97% en peso;

- al menos una fibra dietética y/o al menos un prebiótico, preferiblemente inulina, en especial en cantidades de 0,5 a 30% en peso, especialmente 0,6 a 10% en peso, preferiblemente 0,7 a 5% en peso, de forma especialmente preferida 0,8 a 3% en peso y, de manera muy especialmente preferida, de 1 a 2% en peso;

- al menos un electrolito, preferiblemente una mezcla de diferentes electrolitos, en especial una mezcla de cloruro(s) alcalino(s) y sal(es) alcalina(s) y/o alcalino-térrea(s) de ácidos orgánicos, preferiblemente citratos,

especialmente en cantidades de, en total, 0,5 a 10% en peso, preferiblemente 1 a 5% en peso, de forma especialmente preferida 1,5 a 4% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 2 a 3,5% en peso.

5 Además de los ingredientes y/o componentes activos anteriormente mencionados, la composición según la invención puede contener también aditivos y/o coadyuvantes farmacéuticos habituales. Estos se pueden seleccionar en particular del grupo que consiste en cargas, diluyentes, aglutinantes, reticulantes, estabilizantes, colorantes, agentes tampón, aromatizantes, saborizantes y/o conservantes.

Por lo general, la composición según la invención está en forma sólida, preferiblemente en forma de polvo o granulado y se prevé que su administración se lleve a cabo por vía oral después de mezclarla con agua.

10 De manera conveniente, la composición según la invención se presenta en envases individuales que contienen una dosis preparada para administrar una sola vez, especialmente en cantidades de 5 a 50 g, preferiblemente 10 a 40 g por envase individual. Para la administración por vía oral, la citada cantidad de la composición según la invención se puede disolver o suspender con suficiente líquido (por ejemplo, aproximadamente 100 a 200 mL de agua), y se administra por vía oral.

15 Un objeto adicional de la presente invención, según un segundo aspecto de la presente invención, es el uso de la composición según la presente invención como laxante o purgante.

A los efectos del uso según la invención, la composición según la invención se administra, tal como se ha descrito anteriormente, por vía oral, generalmente como solución o suspensión acuosas.

En general, la composición se administra a dosis diarias de 1 a 100 g, especialmente 5 a 50 g, preferiblemente 10 a 40 g de composición.

20 Como se ha descrito anteriormente, la composición según la invención se puede utilizar para el tratamiento sintomático del estreñimiento (constipación). Se trata de un producto laxante que, debido a su exclusiva composición, no sólo actúa de manera especialmente fiable y cuidadosa, sino que por la presencia de electrolitos conserva, además, el equilibrio de minerales, sobre todo por la combinación de electrolitos inorgánicos y orgánicos, y debido a la presencia de fibra dietética y/o prebióticos, refuerza o regenera la flora intestinal y estimula, de este modo, la digestión o la actividad intestinal de forma autónoma. Por lo general, la composición según la invención contiene, además del poliol y la fibra dietética y/o prebióticos, preferiblemente una mezcla de sustancias minerales inorgánicas y orgánicas.

25 El poliol actúa como vehículo para el líquido (agua) con el que se ingiere la solución bebible o la suspensión bebible. Adicionalmente, fija agua en el intestino, de manera que las heces endurecidas se reblandecen con el líquido y aumenta el volumen fecal. De este modo, se activan de forma natural los movimientos intestinales (peristaltismo intestinal). Los electrolitos aportados se encargan de mantener el equilibrio mineral. Por otra parte, la presencia de fibra dietética y/o prebióticos, sobre todo de inulina, refuerza la flora intestinal que contiene bacterias importantes para la función y el mantenimiento de la salud intestinal. De esta forma, la composición según la invención presta un apoyo beneficioso a la actividad del intestino de tres modos diferentes, sin provocar efectos de habituación y con una acción especialmente fiable y cuidadosa.

30 El experto en la materia podrá deducir y llevar a la práctica fácilmente otras realizaciones, modificaciones y variaciones adicionales, así como ventajas de la presente invención, sin necesidad de apartarse del marco de la presente invención.

### Ejemplos de realización

40 Una primera composición según la invención (composición I) se formula con los siguientes componentes (sin datos relativos a los aditivos y coadyuvantes habituales), en la que la unidad de administración que se ingiere con agua contiene aproximadamente 14 g, que para su administración se pueden disolver o suspender en aproximadamente 100 a 200 mL de líquido, respectivamente: 95% en peso de polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 4.000 g/mol (Macrogol 4000), 2% en peso de inulina y 3% en peso de electrolitos (citrato de magnesio, citrato de calcio y cloruro de potasio en una proporción en peso de aproximadamente 1:2:0,24).

45 De igual manera, se formula una segunda composición según la invención (composición II), en la que, no obstante, el prebiótico inulina se sustituye completamente por la misma cantidad de lactulosa.

50 Por otra parte, se formula una composición comparativa no según la invención, en la que la parte de prebiótico se sustituye por Macrogol 4000, es decir, la composición comparativa no acorde con la invención carece por completo de prebiótico en su fórmula.

Las composiciones citadas anteriormente se administran a cuatro voluntarios por grupo (es decir, en total doce voluntarios), con edades comprendidas entre 50 y 75 años, en donde el tratamiento consiste en tres tomas al día.

En este contexto, en el plazo de un mes se observan los mejores resultados con la composición según la invención que contiene inulina (composición I). Los pacientes recuperaron al cabo de dos días de tratamiento la capacidad para evacuar regularmente.

5 En el caso de la composición II según la invención, este efecto se manifestó sólo después de aproximadamente cuatro a cinco días y no fue tan constante como con la composición II que contiene inulina, aunque también fue muy satisfactorio.

10 Por el contrario, en el caso de los pacientes tratados con la composición comparativa no fue posible eliminar el estreñimiento en grado suficiente; de manera particular, se observa la falta de estímulo de la actividad intestinal. A continuación, después del cambio de tratamiento, se administró a estos pacientes la composición I según la invención, con lo que en todos los casos se produjo un efecto laxante suficiente y constante.

Los resultados confirman las propiedades favorables de una combinación de un poliol con un prebiótico, en comparación con un poliol solo. Dado que con todas las composiciones se proporciona una cantidad suficiente de electrolitos biodisponibles, se conserva el equilibrio electrolítico. Los mejores resultados se obtienen con inulina como prebiótico.

15

## REIVINDICACIONES

1. Composición, en especial composición farmacéutica, que contiene en combinación

- al menos un poliol en cantidades de 10 a 99,5% en peso;

5 - al menos una fibra dietética y/o al menos un prebiótico en cantidades de 0,5 a 30% en peso, y

- al menos un electrolito en cantidades de 0,5 a 10% en peso,

en donde todos los datos cuantitativos citados anteriormente se refieren respectivamente a la composición.

10 2. Composición según la reivindicación 1 que, con respecto a la composición, contiene poliol(es) en cantidades de 40 a 99% en peso, preferiblemente 60 a 99% en peso, de forma especialmente preferida 80 a 98% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 90 a 97% en peso, y/o que, con respecto a la composición, contiene fibra(s) dietética(s) y/o prebiótico en cantidades de 0,6 a 10% en peso, preferiblemente 0,7 a 5% en peso, de forma especialmente preferida 0,8 a 3% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 1 a 2% en peso.

15 3. Composición según las reivindicaciones 1 o 2, en la que el poliol tiene actividad osmótica, en especial fija agua por ósmosis, y/o en la que el poliol es capaz de disolverse y/o hincharse en un líquido, especialmente agua, y/o en la que el poliol esencialmente no es reabsorbible, y/o en la que el poliol es un polialquilenglicol, preferiblemente un polietilenglicol, y/o en la que el poliol tiene un peso molecular medio en el intervalo de 1.000 a 10.000 g/mol, en especial 2.000 a 8.000 g/mol, preferiblemente 2.500 a 5.500 g/mol, preferiblemente 3.000 a 5.000 g/mol y, de forma especialmente preferida, 3.200 a 4.200 g/mol.

20 4. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores, en la que el poliol es un polietilenglicol con un peso molecular medio en el intervalo de 2.500 a 5.500 g/mol, preferiblemente 3.000 a 5.000 g/mol y, de forma muy especialmente preferida, 3.200 a 4.200 g/mol, y/o en la que el poliol es un polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 3.350 g/mol o aproximadamente 4.000 g/mol, o una mezcla de un polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 3.350 g/mol y un polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 4.000 g/mol, preferiblemente del tipo Macrogol 3350 y/o Macrogol 4000.

25 5. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores, en la que la fibra dietética y/o el prebiótico se seleccionan del grupo de celulosa, lignina, pentosanos, queratinas, agar-agar, fibras dietéticas solubles tales como fructo- o galactooligosacáridos, preferiblemente inulina, así como sus derivados y mezclas, y/o en la que la fibra dietética y/o el prebiótico se agregan en forma de inulina, semillas de ispágula (*Psyllium*), guar y/o lactulosa, y/o en la que la fibra dietética y/o el prebiótico son inulina.

30 6. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores, que contiene una mezcla de diferentes electrolitos, especialmente en cantidades de 1 a 5% en peso, de forma especialmente preferida, 1,5 a 4% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 2 a 3,5% en peso con respecto a la composición, en particular en la que el o los electrolitos se seleccionan de sales alcalinas y/o alcalino-térreas orgánicas y/o inorgánicas, así como sus mezclas, preferiblemente una mezcla de sales alcalinas y/o alcalino-térreas orgánicas e inorgánicas.

35 7. Composición según la reivindicación 6, en la que la sal alcalina y/o alcalino-térrea es una sal alcalina y/o alcalino-térrea de un ácido orgánico, en especial ácido cítrico y/o ácido tartárico, de forma especialmente preferida ácido cítrico y, de manera muy especialmente preferida, es un citrato alcalino y/o alcalino-térreo, y en la que sal alcalina y/o alcalino-térrea inorgánica es un cloruro, en especial cloruro de sodio y/o potasio.

40 8. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores que contiene, además, ácido fólico, especialmente en cantidades de 0,1 a 10% en peso, preferiblemente 0,5 a 5% en peso y, de forma especialmente preferida, 1 a 4% en peso con respecto a la composición.

45 9. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores que contiene, además, al menos un coadyuvante que genera gas, especialmente dióxido de carbono, en contacto con el agua, preferiblemente un carbonato y/o un hidrógeno carbonato inorgánicos, eventualmente en combinación con ácidos orgánicos tales como, en particular, ácido cítrico y/o ácido tartárico, especialmente en cantidades de 0,1 a 20% en peso, preferiblemente 0,5 a 10% en peso y, de forma especialmente preferida, 1 a 5% en peso con respecto a la composición.

10. Composición, especialmente según una o varias de las reivindicaciones anteriores, caracterizada por la fórmula siguiente, que contiene:

50 - al menos un polietilenglicol con un peso molecular medio de aproximadamente 3.350 g/mol y/o aproximadamente 4.000 g/mol, preferiblemente un Macrogol, especialmente en cantidades de 10 a 99,5% en peso, en especial 40 a 99% en peso, preferiblemente 60 a 99% en peso, de forma especialmente preferida 80 a 98% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 90 a 97% en peso;

- al menos una fibra dietética y/o al menos un prebiótico, preferiblemente inulina, especialmente en cantidades de 0,5 a 30% en peso, en especial 0,6 a 10% en peso, preferiblemente 0,7 a 5% en peso, de forma especialmente preferida 0,8 a 3% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 1 a 2% en peso;

- 5 - al menos un electrolito, preferiblemente una mezcla de diferentes electrolitos, en particular una mezcla de cloruro(s) alcalino(s) y sales alcalinas y/o alcalino-térreas de ácidos orgánicos, preferiblemente citratos, sobre todo en cantidades totales de 0,5 a 10% en peso, preferiblemente 1 a 5% en peso, de forma especialmente preferida 1,5 a 4% en peso y, de manera muy especialmente preferida, 2 a 3,5% en peso;

en donde todos los datos cuantitativos anteriormente citados se refieren respectivamente a la composición.

- 10 11. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores que contiene, además, aditivos y/o coadyuvantes farmacéuticos habituales, en especial de los grupos de cargas, diluyentes, aglutinantes, reticulantes, estabilizantes, colorantes, agentes tampón, aromatizantes, saborizantes y/o conservantes.

12. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores, en la que la composición se presenta en forma sólida, preferiblemente en forma de polvo o granulado.

- 15 13. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores para la administración por vía oral, después de mezclar con agua y/o para utilizar como laxante (purgante).

14. Composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores, en la que la composición se presenta en envases individuales que contienen la dosis terminada, especialmente en cantidades de 5 a 50 g, preferiblemente 10 a 40 g por envase individual.

- 20 15. Uso de una composición según una o varias de las reivindicaciones anteriores para preparar un medicamento de acción laxante (purgante), en donde la composición se administra por vía oral, preferiblemente en forma de una solución o suspensión acuosas, y/o especialmente en donde la composición se administra a dosis diarias de 1 a 100 g, en especial 5 a 50 g y, preferiblemente, 10 a 40 g de la composición.