

(19)



(10) **LT 6293 B**

(12) **PATENTO APRAŠYMAS**

(11) Patent numeris: **6293**

(51) Int. Cl. (2016.01): **A61K 36/00**
A61K 35/00

(21) Paraiškos numeris: **2015 508**

(22) Paraiškos padavimo data: **2015-11-05**

(41) Paraiškos paskelbimo data: **2016-06-27**

(45) Patent paskelbimo data: **2016-08-10**

(62) Paraiškos, iš kurios dokumentas išskirtas, numeris: —

(86) Tarptautinės paraiškos numeris: —

(86) Tarptautinės paraiškos padavimo data: —

(85) Nacionalinio PCT lygio procedūros pradžios data: —

(30) Prioritetas: —

(72) Išradėjas:

Algirdas ŽUKAUSKAS, LT

(73) Patent savininkas:

UAB „ORIGMED“, Laisvės al. 101A, LT-44291 Kaunas, LT

(74) Patentinis patikėtinis/atstovas:

Gediminas PRANEVIČIUS, Advokatų kontora VARUL, Konstitucijos pr. 7, LT-09308 Vilnius, LT

(54) Pavadinimas:

Farmacinis preparatas akims su propoliu ir alaviju (*Aloe vera*) ir jo gavimo būdas

(57) Referatas:

Išradimas skirtas medicinai, būtent, oftalmologijai, ir gali būti panaudotas farmacinių preparatų, skirtų akių ligų profilaktikai ir gydymui, esant įvairaus pobūdžio konjunktyvitams, sudirgimams, sausų akių sindromui ar ragenos pažeidimams, gamybai. Farmacinis preparatas akims kompleksiskai apima propolio ir alavijo (*Aloe vera*) vandens ekstraktus, panaudotus su bet kokių neutralaus rūgštingumo baziniu monokomponentu arba daugiakomponentu tirpalu, kur propolio ir alavijo ekstraktų kiekis tirpale neviršija 20 % tirpalo masės, propolio ir alavijo ekstraktų tarpusavio santykis tirpale yra diapazone nuo 3:7 iki 7:3, o gauto preparato pH yra ribose tarp 6,9-7,6.

Išradimo sritis

Išradimas skirtas medicinai, būtent – oftalmologijai, ir gali būti panaudotas farmacinių preparatų, skirtų akių ligų profilaktikai ir gydymui, esant įvairaus pobūdžio konjunktyvitams, sudirgimams ar ragenos pažeidimams, gamybai.

Technikos lygis

Propolis ir alavijas (*Aloe vera*) natūraliai pasižymi antiseptinėmis ir gijimą skatinančiomis savybėmis, todėl gali būti panaudoti kaip pagalbiniai arba pagrindiniai aktyvūs farmacinių preparatų akims ingredientai. Yra sukurta daug išradimų, skirtų atskirai propolio arba alavijo panaudojimui farmacinių preparatų, skirtų akims, gamybai. Japonijos patento paraiškoje Nr. JP2006248946 aprašytas preparatas funkcinį regėjimo sutrikimų gydymui, kuriame aktyvus ingredientas yra propolis, naudojamas vandens tirpalo, alkoholio ekstrakto ar vandens-alkoholio ekstrakto pavidalu. Rusijos patento paraiškoje Nr. RU2298408 aprašytas farmacinis preparatas kataraktos gydymui, turintis propolio vandens ekstrakto santykiu 1:5. Rusijos patento paraiškoje Nr. RU2512801 atskleistas farmacinis-profilaktinis akių balzamas, kurio sudėtyje yra iki 5 % propolio, skirtas visų formų akių patologijų, įskaitant odenos ir ragenos uždegimams, taip pat – potrauminiams padariniams, gydymui. Vokietijos patento paraiškoje Nr. DE4038692 aprašytasis preparatas akių ligų gydymui savo sudėtyje turi alavijo gelio. Agentas prasiskverbia į lęšiuką ir stabdo jo drumstėjimą, gerina regėjimą. Ypatingai skirtas naudoti, esant padidėjusiam akispūdžiui. Tarptautinėje patento paraiškoje Nr. WO2006068899 aprašytos naujos akių lašų kompozicijos, turinčios alavijo.

Tačiau nei viename iš patentinių dokumentų nėra užuominos apie kompleksinį abiejų preparatų – propolio ir alavijo – panaudojimą gamybai preparato, skirto akių ligoms gydyti.

Trumpas išradimo aprašymas

Šio išradimo tikslas buvo sukurti preparatą akims, apimantį kombinuotą propolio ir alavijo (*Aloe vera*) panaudojimą, kuris pasižymėtų efektyviomis akių ligų profilaktinėmis ir gydomosiomis savybėmis, kurių neturėjo ankstesni žinomi tos pačios

srities preparatai.

Šio tikslo įgyvendinimui buvo panaudoti vandenyje tirpūs propolio ir alavijo ekstraktai kartu su bet koku neutralaus rūgštingumo baziniu monokomponenčiu arba daugiakomponenčiu tirpalu, kur propolio ir alavijo ekstraktų kiekis tirpale neviršija 20 % tirpalo masės, propolio ir alavijo ekstraktų tarpusavio santykis tirpale yra diapazone nuo 3:7 iki 7:3, o gauto preparato pH yra ribose tarp 6,9-7,6.

Išsamus išradimo aprašymas

Akių lašams panaudoti vandenyje tirpūs propolio ir alavijo ekstraktai. Kadangi propolio ir alavijo ekstraktai yra natūralios kilmės, tai jų cheminė sudėtis yra varijuojanti, priklausomai nuo įvairių sąlygų: surinkimo laiko, kilmės, ekstrakcijos būdo ir pan. Užtikrinant galutinio produkto efektyvumą, rekomenduojamos propolio normos yra nuo 0,3 % iki 5,0 % fenolinių junginių, alavijo – nuo 0,3 % iki 5,0 % aloino.

Propolio ir alavijo ekstraktus galima naudoti su bet koku neutralaus rūgštingumo baziniu monokomponenčiu arba daugiakomponenčiu akių lašams skirtu tirpalu, kurio pH būtų ribose tarp 6,9-7,6. Nepastebėta jokia neigiama reakcija su kokiomis nors tradiciškai akių lašų gamyboje naudojamomis medžiagomis, todėl bazinio tirpalo, skirto akių lašams sudėtis, nėra svarbi išradimui, išskyrus ta apimtimi, kad tą bazinį tirpalą galima lašinti į akis ir jis pats savaime yra stabilus. Vandenyje tirpūs abu – propolio ir alavijo – ekstraktai yra šarminiai, todėl svarbu patikrinti galutinio tirpalo rūgštingumą, ir jei jo pH yra žemiau 6,5, reikia papildomai pridėti atitinkamo rūgštinio tirpalo, pavyzdžiui, boro rūgšties. pH matuojamas potenciometriškai. Nedideli pH nukrypimai gali dirginti akis, dideli pH nukrypimai yra pavojingi sveikatai.

Propolio ir alavijo ekstraktų kiekis ir jų dalis tirpale priklauso nuo siekiamo efekto ir akių lašų paskirties, tačiau neturėtų viršyti 20 % masės. Ekstraktų tarpusavio santykis taip pat priklauso nuo siekiamo efekto, bet optimalus būtų atitinkamai nuo 3:7 iki 7:3, tokiu būdu užtikrinant abiejų medžiagų poveikį.

Preparatas gaunamas tokiu būdu: bazinis tirpalas padalijamas į dvi dalis. Vienoje ištirpinamas propolio ekstraktas, antroje – alavijo ekstraktas. Tada abu tirpalai sumaišomi į vieną. Tirpalas filtruojamas per 10 mikronų membraninį filtrą. Jei jame nėra konservantų, tuomet papildomai aseptiškai apdorojamas filtravimo per 0,2 mikronų filtrą būdu.

Akių lašų izotoniškumas yra svarbus tiek, kiek tai yra reikalinga pagal produkto paskirtį. Pavyzdžiui, akies praplovimui skirtuose lašuose klampumas gali būti labai mažas, tuo tarpu pooperaciniam gydymui skirtuose akių lašuose klampumas turėtų būti didesnis, siekiant ilgiau išlaikyti aktyvias medžiagas ant ragenos paviršiaus ir, tokiu būdu, padidinant produkto efektyvumą.

Klinikiniams tyrimams buvo naudojami tokios sudėties akių lašai:

Dešimčiai pacientų su uždegiminiais akių sudirgimais 5 dienas buvo lašinamas tirpalas be propolio ir alavijo. Kitai dešimčiai pacientų su uždegiminiais akių sudirgimais buvo lašinamas tas pats tirpalas, tik jau su propoliu ir alaviju. Pastarosios sudėties preparato poveikio greitis buvo 30 % didesnis, o indikacijų pasikartojimas 30 dienų bėgyje nepasireiškė visiškai, kai, tuo tarpu, pirmuoju atveju 20 % pacientų simptomai po kurio laiko atsinaujino.

Dešimčiai pacientų su sausų akių sindromu 5 dienas buvo lašinamas tirpalas be propolio ir alavijo. Kitai dešimčiai pacientų su sausų akių sindromu buvo lašinamas tas pats tirpalas, tik jau su propoliu ir alaviju. Pastarosios sudėties preparato poveikio greitis buvo momentinis, kai, tuo tarpu, paprastas tirpalas 80 % pacientų nepadarė jokio poveikio. Indikacijų pasikartojimas, lašinant antrąjį preparatą kas antrą dieną po du kartus per dieną 30 dienų bėgyje, pasireiškė tik 10 % pacientų, kai tuo tarpu pirmuoju atveju trumpalaikis simptomatikos pagerėjimas buvo jaučiamas dėl tirpalo suteikiamo drėkinimo, tačiau poveikis buvo labai trumpalaikis ir reikalaujantis dažno tirpalo lašinimo.

Tai rodo, kad akių lašai su propoliu ir alaviju gali pagerinti oftalmologinio tirpalo poveikį bei efektyvumą.

IŠRADIMO APIBRĖŽTIS

1. Farmacinis preparatas akims, turintis propolio arba alavijo (aloe Vera, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kompleksškai apima propolio ir alavijo vandens ekstraktus, panaudotus su bet koku neutralaus rūgštingumo baziniu monokomponenčiu arba daugiakomponenčiu tirpalu, kur propolio ir alavijo ekstraktų kiekis tirpale neviršija 20 % tirpalo masės.

2. Preparatas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad propolio ir alavijo ekstraktų tarpusavio santykis tirpale yra diapazone nuo 3:7 iki 7:3.

3. Preparatas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad propolio normos yra nuo 0,3 % iki 5,0 % fenolinių junginių, alavijo – nuo 0,3% iki 5,0 % aloino.

4. Preparatas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad preparato pH yra ribose tarp 6,9-7,6.

5. Preparatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad preparatas yra akių lašai.

6. Farmacinio preparato akims su propoliu ir alaviju (Aloe vera) gavimo būdas, apimantis propolio arba alavijo panaudojimą preparate, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad susideda iš šių stadijų:

bazinį tirpalą padalija į dvi dalis;

vienoje ištirpina propolio ekstraktą, antroje – alavijo ekstraktą, parenkant jų tarpusavio santykį nuo 3:7 iki 7:3;

abu tirpalus sumaišo į vieną;

išmatuoja ir sureguliuoja gauto preparato pH ribose nuo 6,9-7,6;

gautą oftalmologinį preparatą išfiltruoja per 10 mikronų membraninį filtrą.

7. Būdas pagal 6 punktą, besiskiriantis tuo, kad, jei gautame preparate nėra konservantų, jį papildomai apdoroja per 0,2 mikronų filtrą.

8. Farmacinis preparatas akims pagal 1-5 punktus, gautas būdu pagal 6-7 punktus, skirtas panaudoti oftalmologijoje akių susirgimų, tokių kaip uždegiminiai akių sudirgimai, sausų akių sindromas, konjunktyvitai, ragenos pažeidimai, profilaktikai ir gydymui.