(19) LIETUVOS RESPUBLIKA VALSTYBINIS PATENTŲ BIURAS V P B

(10) **LT 2017 521 A**

(12) **PARAIŠKOS APRAŠYMAS**

(21) Paraiškos numeris: **2017 521**

(51) Int. Cl. (2018.01): **A61K 31/00**

(22) Paraiškos padavimo data: **2017-07-28**

(41) Paraiškos paskelbimo data: **2018-02-12**

(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: —

(71) Pareiškėjas:

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

(72) Išradėjas:

Algirdas ŽUKAUSKAS, LT

(74) Patentinis patikėtinis/atstovas:

Gediminas PRANEVIČIUS, Advokatų profesinė bendrija IP FORMA, Užupio g. 30, LT-01203 Vilnius, LT

(54) Pavadinimas:

Akių lašai su morkų ir mėlynių ekstraktais ir jų gamybos būdas

(57) Referatas:

Išradimas skirtas oftalmologijai, tiksliau - akių lašams, turintiems savo sudėtyje morkų ir mėlynių ekstraktų, skirtų regėjimo aštrumo išsaugojimui, ir jų gamybos būdui. Farmacinis preparatas akims kompleksiškai apima morkų ir mėlynių ekstraktus, panaudotus su bet kokiu neutralaus rūgštingumo baziniu monokomponenčiu arba daugiakomponenčiu tirpalu, kur morkų ir mėlynių ekstraktų kiekis tirpale neviršija 10 % tirpalo masės, morkų ir mėlynių ekstraktų tarpusavio santykis tirpale yra nuo 3:7 iki 7:3, o gauto preparato pH yra ribose tarp 6,9 - 7,6.

LT 2017 521 A

AKIŲ LAŠAI SU MORKŲ IR MĖLYNIŲ EKSTRAKTAIS IR JŲ GAMYBOS BŪDAS

Išradimas skirtas oftalmologijai, tiksliau – akių lašams, turintiems savo sudėtyje morkų ir mėlinių ekstraktų, skirtų regėjimo aštrumo išsaugojimui, ir jų gamybos būdui.

Yra žinoma, kad morkų ir mėlynių ekstraktai savo sudėtyje turi cheminių medžiagų, naudingų akims ir regėjimo ilgaamžiškumui išsaugoti. Morkos savo sudėtyje turi daug beta karotino, t.y. vitamino A, kuris būtinas normaliam akies tinklainės funcionavimui ir, manoma, prevencijai nuo senatvinės kataraktos. Mėlynės gerina regėjimą dėl jose esančių fenolių antocianų, kurie saugo akies lęšiuką, stabdo kataraktos vystymąsi, teigiamai veikia tinklainės kraujagysles, taip pagerina tinklainės ir regos nervo mitybą, padeda išvengti tinklainės kraujosruvų. Morkų ir mėlynių ekstraktai savo sudėtyje turi cheminių medžiagų, dalyvaujančių rodopsino sintezėje, kuris yra esminis regos funkcijai palaikyti. Teigiamą mėlynių poveikį patvirtino ne vienas eksperimentas. Tarkim, nustatyta, kad vartodami mėlynių ekstraktą, net 75 proc. žmonių kataraktos pažeistomis akimis ėmė geriau matyti.

Rumunijos patento paraiškoje RO131313 aprašytas natūralus fitoterapinis produktas akims ir jo gamybos būdas. Pagal šį išradimą, produktas savo sudėtyje turi juodojo šilkmedžio koncentruotų sulčių arba sausų miltelių, šaltalankio ir/arba vilkauogių miltelių ir/arba morkų miltelių ir/arba raudonųjų pomidorų žievių miltelių, mėlynių koncentrato arba sausų miltelių, miežių želmenų sulčių arba sausų miltelių, seleno mielių arba levandos ir/arba rozmarino esencijos aliejaus santykiais 10-25:10 – 15:10 – 25:10 – 15:1,5 – 10:0,5-10 dalių 100 dalių produkto. Mišinys homogenizuojamas, gautosios granulės sufasuojamos į kapsules arba suspaudžiamos į tabletes. Preparatas vartojamas peroraliai.

Skirtingai nuo anksčiau aprašytojo išradimo, šiame išradime pasiūlyti akių lašai, savo sudėtyje turintys morkų ir mėlynių ekstraktų, lašinami tiesiogiai į akis, todėl pasižymintys betarpišku ir greitu poveikiu.

Akių lašams naudojami vandenyje tirpūs morkų ir mėlynių ekstraktai. Juos galima naudoti su bet kokiu neutralaus pH (6,9-7,6) akių lašams skirtu mono- ar daugiakomponenčiu tirpalu. 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 abeji ekstraktai yra silpnai rūgštiniai, todėl svarbu patikrinti galutinio tirpalo pH, ir, jei pH yra žemiau 6,9 ar daugiau nei 7,6, atitinkamai sureguliuoti, papildomai įmaišant reikalingų pagalbinių medžiagų, naudojamų bazinio tirpalo gamyboje, pvz., atitinkamai NaOH arba Boro rūgšties. pH matuojamas potenciometriškai. Nedideli pH nukrypimai gali dirginti akis, dideli pH nukrypimai yra pavojingi.

Bendras oftalmologinio tirpalo stabilumas turi būti patikrintas, įmaišius morkų ir mėlynių ekstraktus. Šiame išradime buvo naudojamas glicerino oftalmologinis tirpalas injekcinio vandens pagrindu, morkų ir mėlynių ekstraktų įterpimo poveikis bendram tirpalo stabilumui nepastebėtas.

Reikalavimai ekstraktui:

Kadangi tiek morkų, tiek mėlynių ekstraktai yra natūralios kilmės, jų cheminė sudėtis yra varijuojanti, priklausomai nuo įvairių sąlygų: surinkimo laiko, kilmės, ekstrakcijos metodo ir pan. Užtikrinant efektyvumą, rekomenduojamos normos yra morkų ekstraktas – nuo 1% iki 20% beta karoteno ir mėlynių ekstraktas – nuo 1% iki 20% polifenolinių junginių. Tarpusavio santykis tirpale yra nuo 3:7 iki 7:3. Ekstraktų kiekis ir dalis tirpale priklauso nuo siekiamo efekto ir akių lašų paskirties, tačiau neturėtų viršyti 10% viso tirpalo.

Akių lašų izotoniškumas yra svarbus tiek, kiek yra reikalinga pagal produkto paskirtį. Pavyzdžiui, akies praplovimui skirtuose lašuose klampumas gali būti iki 5 mPa Xs, tuo tarpu akies obuolio audinių gydymui skirtuose akių lašuose klampumas turėtų būti apie 10-20 mPa Xs, siekiant ilgiau išlaikyti aktyviąsias medžiagas ant ragenos paviršiaus ir, tokiu būdu, padidinant preparato efektyvumą.

Akių lašų tirpalas paruošiamas sekančiu būdu: bazinis tirpalas dalinamas į dvi dalis. Vienoje dalyje ištirpinamas morkų ekstraktas, maišant tirpalą, pašildytą iki 30°C, kitoje – mėlynių ekstraktas, maišant tirpalą, pašildytą tirpalą iki 30°C. Tuomet abu tirpalai sumaišomi į vieną. Tirpalas filtruojamas per 10 mikronų membraninį filtrą, jei jame nėra konservantų, tai papildomai aseptiškai apdorojamas filtravimo per 0,2 mikronų filtrą būdu.

Klinikiniam tyrimui buvo naudojama tokios sudėties akių lašai: penkiems pacientams 14 dienų buvo lašinamas tirpalas be morkų-mėlynių ekstraktų, kitiems penkiems pacientams buvo lašinamas tas pats tirpalas, tik jau su morkų-mėlynių ekstraktų mišiniu. Pastarojo poveikis buvo statistiškai teigimas visiems penkiems pacientams, matuojant regėjimo aštrumą ir pokyčius, esant skirtingam apšvietimui, kai, tuo tarpu, pirmuoju atveju jokių pokyčių nepastebėta. Tai rodo, kad akių lašai su morkų ir mėlynių ekstraktais gali pagerinti oftalmologinio tirpalo poveikį bei efektyvumą.

IŠRADIMO APIBRĖŽTIS

1. Farmacinis preparatas akims, savo sudėtyje turintis morkų ir mėlynių išvestinių produktų, besiskiriantis tuo, kad tie produktai yra morkų ir mėlynių ekstraktai, ištirpinti neutraliame baziniame tirpale, kurio pH yra ribose nuo 6,9 iki 7,6, kur morkų ir mėlynių ekstraktų tarpusavio santykis tirpale yra nuo 3:7 iki 7:3, o bendras ekstraktų kiekis neviršija 10% tirpalo masės.

2. Preparatas pagal 1 punktą, besiskiriantis tuo, kad rekomenduojamos ekstraktų normos yra morkų ekstraktas – nuo 1% iki 20% beta karoteno ir mėlynių ekstraktas – nuo 1% iki 20% polifenolinių junginių.

3. Preparatas pagal 1 punktą, besiskiriantis tuo, kad preparato bazinis tirpalas yra glicerino oftalmologinis tirpalas injekcinio vandens pagrindu.

4. Preparatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, besiskiriantis tuo, kad preparatas yra akių lašai, kurių izotoniškumas priklauso nuo preparato paskirties, t.y. akių praplovimui skirtų lašų klampumas siekia iki 5 mPa Xs, tuo tarpu akies obuolio audinių gydymui skirtuose akių lašuose klampumas yra ribose tarp 10-20 mPa Xs, siekiant ilgiau išlaikyti aktyviąsias medžiagas ant ragenos paviršiaus.

5. Farmacinio preparato akims su morkų ir mėlynių ekstraktais gavimo būdas, apimantis morkų ir mėlynių išvestinių produktų kombinuotą panaudojimą preparate, besiskiriantis tuo, kad susideda iš šių stadijų:
   - bazinį tirpalą padalija į dvi dalis;
   - vienoje dalyje ištirpina morkų ekstraktą, antroje – mėlynių ekstraktą, maišant tirpalus, pašildytus iki 30°C;
   - abu tirpalus sumaišo į vieną, parenkant jų tarpusavio santykį nuo 3:7 iki 7:3, o bendrą kiekį tirpale iki 10% tirpalo masės;
   - išmatuoja ir sureguliuoja gauto preparato pH ribose nuo 6,9-7,6;
   - gautą oftalmologinį preparatą išfiltruoja per 10 mikronų membraninį filtrą.

6. Būdas pagal 5 punktą, besiskiriantis tuo, kad, jei gautame preparate nėra konservantų, jį papildomai apdoroja per 0,2 mikronų filtrą.