

RZECZPOSPOLITA
POLSKA



Urząd Patentowy
Rzeczypospolitej Polskiej

(12) **OPIS PATENTOWY** (19) **PL** (11) **227701**

(13) **B1**

(21) Numer zgłoszenia: **406623**

(22) Data zgłoszenia: **21.12.2013**

(51) Int.Cl.

A61K 36/752 (2006.01)
A61K 36/9066 (2006.01)
A61K 38/39 (2006.01)
A61K 38/48 (2006.01)
A61K 31/355 (2006.01)
A61K 31/4415 (2006.01)
A61K 31/714 (2006.01)
A61K 33/06 (2006.01)
A61K 33/30 (2006.01)
A61P 19/02 (2006.01)

(54) **Preparat wspomagający leczenie i profilaktykę ścięgien i więzadeł stawowych**

(43) Zgłoszenie ogłoszono:

22.06.2015 BUP 13/15

(45) O udzieleniu patentu ogłoszono:

31.01.2018 WUP 01/18

(73) Uprawniony z patentu:

**PRZEDSIĘBIORSTWO FARMACEUTYCZNE
LEK-AM SPÓŁKA Z OGRANICZONĄ
ODPOWIEDZIALNOŚCIĄ, Zakroczym, PL**

(72) Twórca(y) wynalazku:

ARKADIUSZ HEJDUK, Wiązowna, PL

(74) Pełnomocnik:

rzecz. pat. Grażyna Padée

PL 227701 B1

Opis wynalazku

Przedmiotem wynalazku jest preparat wspomagający leczenie i profilaktykę ścięgien i więzadeł stawowych.

Choroby i dysfunkcje stawów stanowią obecnie istotny problem coraz liczniejszej grupy osób. Wśród przyczyn dysfunkcji stawów znajdują się m.in. stany przeciążeniowe, związane ze zbyt intensywnym lub nieumiejętnym uprawianiem sportu lub niewłaściwym trybem życia. Coraz częściej występują kontuzje stawów, ze względu na siedzący tryb życia i nieprzygotowanie narządów ruchu do nawet umiarkowanego wysiłku. Urazy nie omijają również osób systematycznie uprawiających sport. Więzadła i ścięgna są tymi elementami narządu ruchu człowieka, które są szczególnie narażone na kontuzje, urazy i związane z nimi stany zapalne i inne problemy.

Kontuzje i urazy ścięgien i więzadeł leczy się chirurgicznie albo zachowawczo, unieruchamiając staw. W obu przypadkach, po zakończeniu leczenia, konieczna jest rehabilitacja. W tej fazie szczególnie istotne jest wspomaganie regeneracji ścięgien i więzadeł. Ważna jest także systematyczna dbałość o utrzymanie bądź poprawę ich kondycji.

Na rynku są dostępne liczne preparaty farmaceutyczne oraz suplementy diety wspomagające regenerację stawów oraz mające na celu profilaktykę narządu ruchu. W znakomitej większości są to preparaty skomponowane w taki sposób, aby wykazywały pozytywne działanie przede wszystkim na chrząstkę stawową. Uszkodzenia i zwyrodnienia chrząstki są bowiem najczęściej powodem problemów stawowych. Natomiast do najczęstszych uszkodzeń, naciągnięć i naderwań dochodzi w obrębie więzadeł i ścięgien.

Jednym z często wykorzystywanych składników w preparatach wspomagających narząd ruchu jest hydrolizowany kolagen. Preparaty hydrolizowanego kolagenu znajdują w szczególności zastosowanie w przypadku schorzeń stawów, głównie choroby zwyrodnieniowej stawów (ChZS) [Benito-Ruiz P, Camacho-Zambrano MM, Carrillo-Arcenales JN, Mestanza-Peralta MA, Vallejo-Flores CA, Vargas-López SV, Villacís-Tamayo RA, Zurita-Gavilanes LA. *A randomized controlled trial on the efficacy and safety of a food ingredient, collagen hydrolysate, for improving joint comfort*. Int J Food Sci Nutr. 2009; 60 Suppl 2: 99–113. doi: 10.1080/09637480802498820. Epub 2009 Feb 11]. Wyniki badań *in vitro* wskazują na stymulujące oddziaływanie hydrolizowanego kolagenu na komórki chrząstek stawowych (chondrocyty) [Oesser S, Seifert J. *Stimulation of type II collagen biosynthesis and secretion in bovine chondrocytes cultured with degraded collagen*. Cell Tissue Res. 2003 Mar; 311(3): 393–9. Epub 2003 Feb 25.] oraz komórki błony maziowej [Ohara H, Iida H, Ito K, Takeuchi Y, Nomura Y. *Effects of Pro-Hyp, a collagen hydrolysate-derived peptide, on hyaluronic acid synthesis using in vitro cultured synovium cells and oral ingestion of collagen hydrolysates in a guinea pig model of osteoarthritis*. Biosci Biotechnol Biochem. 2010; 74(10): 2096–9. Epub 2010 Oct 7]. Działanie to polega na pobudzeniu do zwiększonej syntezy kolagenu typu II przez chondrocyty i pobudzeniu do zwiększonej syntezy kwasu hialuronowego przez komórki błony maziowej. Funkcję regeneracji chrząstki stawowej najsukuteczniej pełni kolagen typu II, będący naturalnym składnikiem tkanki chrzęstnej. Wiadomo, że dobre efekty uzyskuje się łącząc kolagen z witaminą C, która pomaga w prawidłowej produkcji kolagenu. Źródłem witaminy C mogą być ekstrakty roślinne, np. z dzikiej róży.

Nie prowadzono badań nad hydrolizatem kolagenu w odniesieniu do problemów zdrowotnych w obrębie ścięgien i więzadeł.

W preparatach farmaceutycznych przeznaczonych do wspomagania regeneracji chrząstki stawowej często wykorzystuje się także ekstrakt z kłącza kurkumy (*Curcuma longa*), będącej źródłem kurkuminy, związku wykazującego wielokierunkowe działanie terapeutyczne, m.in. w zakresie leczenia i profilaktyki mięśni i stawów. Stwierdzono również, że ekstrakt z kurkumy wspomaga leczenie stanów zapalnych ścięgien.

Zarówno chrząstka stawowa, jak i więzadła i ścięgna, są zbudowane z tkanki łącznej. Chrząstka stawowa zbudowana jest z tkanki łącznej chrzęstnej szklistej, która charakteryzuje się dużą sprężystością i niewielką wytrzymałością na przeciążenia elongacyjne. Natomiast więzadła i ścięgna są zbudowane z tkanki łącznej zbitej, której sprężystość jest nieznacząca. Ze względu na odmienne właściwości tkanki łącznej chrzęstnej i zbitej konieczne jest inne podejście do komponowania preparatów, których głównym przeznaczeniem jest wspomaganie regeneracji więzadeł i ścięgien.

Celem wynalazku było opracowanie preparatu do podawania doustnego przeznaczonego do wspomagania leczenia i profilaktyki więzadeł i stawów.

Preparat według wynalazku składa się z: ekstraktu z pestek grejpfruta w ilości 25–50% wag., ekstraktu z kłącza kurkumy długiej w ilości 15–25% wag., hydrolizowanego kolagenu typu I w ilości

12–20% wag., bromelainy w ilości 2–10% wag., papainy w ilości 1–8% wag. oraz kompleksu witamin i składników mineralnych w ilości 10–25% wag. oraz dodatkowo zawiera co najmniej jedną farmaceutycznie dopuszczalną substancję pomocniczą.

Korzystnie ekstrakt z pestek grejpfruta zawiera 15–20% wag. witaminy C, a ekstrakt z kurkumy zawiera 8–12% wag. kurkuminy.

Kompleks witamin i składników mineralnych zawiera magnez, cynk, mangan, witaminy z grupy B, zwłaszcza witaminę B2, B6, B12, witaminę E. Najkorzystniej kompleks składa się z: magnezu, cynku, manganu, witaminy B12, przy czym zawiera magnez w ilości 12–18% wag., cynk w ilości 0,2–1,5% wag., a mangan w ilości 0,05–1,0% wag. w stosunku do masy całej kompozycji. Dodatkowo kompozycja może zawierać kwas hialuronowy.

Preparat według wynalazku ma skład dobrany w taki sposób, aby zapewnić korzystne działanie na więzadła i ścięgna. Połączenie kolagenu z witaminą C, której źródłem jest w tym przypadku wyciąg z pestek grejpfruta, wspomaga odbudowę tkanki, a kurkumina wpływa korzystnie na proces leczenia stanu zapalnego związanego z urazem. Istotnymi składnikami preparatu według wynalazku są enzymy proteolityczne pochodzenia roślinnego: bromelaina (której źródłem jest ananas) i papaina (pochodząca z papai). Enzymy te wspomagają proces rozkładu białek obecnych w towarzyszącym stanowi zapalnemu wysiękowi, dzięki czemu redukcja wysięku jest ułatwiona.

Ponadto preparat zawiera kompleks witamin i minerałów. Zasadniczo znane jest stosowanie tych grup składników w preparatach odżywczych i każdy zestaw znanych składników kompleksu będzie tu przydatny. W szczególności jednak korzystnym zestawem będzie połączenie cynku, magnezu i manganu oraz witaminy B12. Witamina B12 odgrywa ważną rolę w procesie podziału komórek, cynk i magnez pomagają w prawidłowej syntezie białka, w utrzymaniu zdrowych kości oraz biorą udział w procesie podziału komórek, a mangan wspomaga prawidłowe tworzenie tkanek łącznych.

Łącznie składniki preparatu pomagają w prawidłowym obrocie kolagenu w tkankach, co ma szczególnie istotne znaczenie dla regeneracji i utrzymania właściwego stanu tkanki łącznej. Składniki preparatu regulują prawidłową syntezę białek oraz podział komórkowy, co ma znaczenie w procesie regeneracji tkanek, szczególnie w rekonwalescencji. Preparat dostarcza także zestawu aminokwasów odpowiedniego z punktu widzenia potrzeb regeneracji tkanki łącznej, szczególnie zasobów kolagenu. Dodatkowo składniki preparatu pomagają w redukcji stanu zapalnego towarzyszącego urazom poprzez oddziaływanie na dwa mechanizmy związane ze stanem zapalnym: obniżenie poziomu białka C-reaktywnego we krwi oraz przyspieszenie redukcji wysięku, poprzez wzmożony rozkład substancji białkowych obecnych w wysięku. Szczególnie istotnym z punktu widzenia pacjenta jest efekt zmniejszenia bólu towarzyszącego urazom oraz przyspieszenie rekonwalescencji.

Preparat jest przeznaczony do stosowania po urazach ścięgien i więzadeł, podczas rehabilitacji porazowej, po zabiegach chirurgicznych stawów. Jest także wskazany dla osób aktywnie uprawiających sport, narażonych na przeciążenia więzadeł, ścięgien i stawów.

Preparat według wynalazku może być formułowany w różnych postaciach znanych dla preparatów farmaceutycznych i suplementów diety do podawania doustnego, takich jak tabletki, tabletki powlekane, kapsułki, saszetki itp. W celu nadania preparatowi odpowiedniej formy stosuje się znane dodatki, takie jak substancje wypełniające, substancje przeciwzbrylające, substancje spulchniające itp. środki właściwe dla danej formy.

Preparat według wynalazku został bliżej przedstawiony w przykładach.

P r z y k ł a d 1

Skomponowano preparat o następującym składzie:

1. Ekstrakt z nasion grejpfruta (zawierający 17% wag. witaminy C)	235 mg
w tym witaminy C	40 mg
2. Ekstrakt z kłącza kurkumy długiej (standaryzowany na 10% kurkuminy)	125 mg
w tym kurkumina	12,5 mg
3. Hydrolizowany kolagen typu I	100 mg
4. Bromelaina	40 mg
5. Papaina	25 mg
6. Magnez w postaci wodorowęglanu magnezu	94 mg
7. Cynk w postaci jednowodnego siarczanu cynku	5,0 mg
8. Mangan w postaci jednowodnego siarczanu manganu	1,0 mg
9. Witamina B12	0,000625 mg

Wyżej opisany preparat sformułowano w postaci tabletki powlekanej, w której jako substancje pomocnicze zostały użyte: dwutlenek krzemu (substancja przeciwbrylająca), stearynian magnezu (substancja przeciwbrylająca), sól sodowa karboksymetylocelulozy usieciowiona (substancja spulchniająca), celuloza mikrokrystaliczna (substancja wypełniająca); składniki otoczki: hydroksypropylometyloceluloza (substancja glazurująca), polidekstroza (substancja glazurująca), glikol polietylenowy (substancja glazurująca), ryboflawina (barwnik), talk (substancja przeciwbrylająca), dwutlenek tytanu (barwnik), karmina (barwnik), maltodekstryna (substancja wypełniająca).

Przykład 2

Skomponowano preparat o następującym składzie:

1. Ekstrakt z nasion grejpfruta (zawierający 17% wag. witaminy C)	200 mg
2. Ekstrakt z kłącza kurkumy długiej (standaryzowany na kurkuminy)	160 mg
3. Hydrolizowany kolagen typu I	90 mg
4. Bromelaina	50 mg
5. Papaina	15 mg
6. Magnez w postaci wodorowęglanu magnezu	80 mg
7. Cynk w postaci jednowodnego siarczanu cynku	2,0 mg
8. Mangan w postaci jednowodnego siarczanu manganu	4,0 mg
9. Witamina B6	0,000625 mg

Zastrzeżenia patentowe

1. Preparat wspomagający leczenie i profilaktykę ścięgien i więzadeł stawowych, zawierający ekstrakt z kłącza kurkumy długiej, witaminy i minerały oraz dodatkowo co najmniej jedną dopuszczalną farmaceutycznie substancję pomocniczą, **znamienny tym**, że składa się z ekstraktu z pestek grejpfruta w ilości 25–50% wag., ekstraktu z kłącza kurkumy długiej w ilości 15–25% wag., hydrolizowanego kolagenu typu I w ilości 12–20% wag., bromelainy w ilości 2–10% wag., papainy w ilości 1–8% wag. oraz kompleksu witamin i składników mineralnych w ilości 10–25% wag., przy czym w skład kompleksu witamin i składników mineralnych wchodzi, pojedynczo lub w mieszaninie: witamina B12, witamina B6, witamina E, magnez w ilości 12–18% wag., cynk w ilości 0,2–1,5% wag., mangan w ilości 0,05–1,0% wag. w stosunku do masy całej kompozycji.
2. Preparat według zastrz. 1, **znamienny tym**, że zawiera ekstrakt z pestek grejpfruta o udziale 15–20% wag. witaminy C.
3. Preparat według zastrz. 1, **znamienny tym**, że zawiera ekstrakt z kurkumy o udziale 8–12% wag. kurkuminy.
4. Preparat według zastrz. 1, **znamienny tym**, że dodatkowo zawiera kwas hialuronowy.