

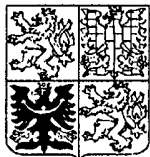
UŽITNÝ VZOR

(11) Číslo dokumentu:

5434

ČESKÁ
REPUBLIKA

(19)



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **5753-96**

(22) Přihlášeno: 16. 09. 96

(47) Zapsáno: 04. 12. 96

(13) Druh dokumentu: **U1**

(51) Int. Cl.⁶:

A 61 K 33/18

A 61 K 39/00

(73) Majitel:

Iljin Aleksandr Ivanovič, Almaty, KZ;
Sarkesjan Albert Artuševič, Almaty, KZ;
Borisov Pavel Georgievič, Almaty, KZ;
Franz Petr, Praha, CZ;

(72) Původce:

Iljin Aleksandr Ivanovič, Almaty, KZ;
Sarkesjan Albert Artuševič, Almaty, KZ;
Borisov Pavel Georgievič, Almaty, KZ;
Krasjuk Aleksandr Michailovič, Almaty, KZ;
Franz Petr, Praha, CZ;
Ifraimov David Nasimovič, Oktjabrka, KZ;

(54) Název užitého vzoru:

Antimikrobní léčebný přípravek

Antimikrobní léčebný přípravek

Oblast techniky

Technické řešení se týká antimikrobního léčebného přípravku, který obsahuje jako aktivní složku nejméně jedno antibiotikum. Technické řešení se tedy týká oblasti veterinárního lékařství a medicínské praxe. Antimikrobní léčebný přípravek působí jak na grampozitivní, tak i na gramnegativní bakterie, protozoa a fungi. Může se použít pro léčení infekčních nemocí vyvolávaných koky, bacily, některými plísněmi, houbami a prvoky.

Dosavadní stav techniky

Jsou známa antibiotika s antiseptickým účinkem při vnějším použití, například Bacitracinum, Gelimycinum, Gramicidum C, Mircrocidum a jiná. Produkují je Bacillum liheniformis, Actinomyces flavochromogeus, var. heliomycini, var. C Bacillus brevis a některé kmeny Penicillinum.

Uvedená antibiotika se používají pro ošetření infikovaných poranění kůže, léčení zažívacího a dýchacího traktu, kde se využívá jejich lokální antimikrobní účinek.

Uvedená antibiotika však nejsou absorbována krví, popřípadě přecházejí do krve v koncentracích, které nemají terapeutický účinek (A. P. Krasilnikov, Anticeptics Reference Book, Vyshaya shkola, 1995, str. 135-138).

Je známa široká škála antibiotik, například peniciliny, cephalosporiny, carbapenemy, monobactamy, aminoglykosidy, quinolony, tetracykliny, macrolidy a jiné skupiny antibiotik. Tato antibiotika se širokým spektrem účinku se používají externě, perorálně, intramuskulárně a intravenózně.

Bohužel, antibiotika jako celek mají sice nesporné přednosti, jednotlivá antibiotika však mají určité nedostatky, jako je hematoxita, hepatoxita, vyvolávání alergických jevů a podobně (L. S. Strachunski, S. N. Kozlov, Antibiotics: clinical pharmacology, Smolensk, Ami Press, 1994, str. 208).

Je všeobecně známo, že zásadním nedostatkem antibiotik je neustále se zvyšující rezistence mikroorganismů proti těmto antibiotikům, což vyžaduje hledání nových antibiotik.

Dále je známo, že nebylo pozorováno přizpůsobení patogenních mikroorganismů na jodoformy, chloraminy a halogeny.

Nicméně, v prostředích bohatých na proteiny, ke kterým náleží všechny živé organismy, se aktivita těchto látek podstatně snižuje (V. Esanu, A. Profeta, Antiviral Antiseptiks / Handbuch der Antiseptik, Berlin, 1987, sv. 11/3, str. 98-118).

Antimikrobnímu léčebnému přípravku podle tohoto technického řešení jsou svou technickou podstatou nejbližší antibiotika tetracyklinové řady, která zásluhou svého biosyntetického mechanismu mohou obsahovat části původních molekul: dipeptidy (penicillin

N získaný z *Penicillium chrysogenum*), polyketidy (7-chlortetracyklin) (General Organic Chemistry, vol. 11, překlad z angličtiny od N. K. Kochetkov, M. Khimiya, 1986, str. 352-353, 452 - 454).

Tetracykliny jsou antimikrobní léčiva, která obsahují různé funkční skupiny, v některých případech je to halogen, například chlor.

Nevýhodou antibiotik tetracyklinové řady je skutečnost, že tato antibiotika vyvolávají nežádoucí reakce, například alergické reakce, poruchy metabolismu, dysbacteriosis a podobně, přičemž více nebo méně rychle se objevují bakterie, které jsou vůči těmto antibiotikům rezistentní.

Úkolem předmětného technického řešení je nalezení nového léčebného přípravku, který bude působit jak na grampozitivní, tak i na gramnegativní bakterie, plísně, houby a prvoky. Přípravek má mít nízkou toxicitu a má být aplikovatelný podobnými způsoby jako antibiotika.

Podstata technického řešení

Uvedené nedostatky známých antimikrobních léčebných přípravků tohoto druhu do značné míry odstraňuje antimikrobní léčebný přípravek, který obsahuje jako aktivní složku nejméně jedno antibiotikum, podle tohoto technického řešení, jehož podstata spočívá v tom, že jako další složku obsahuje jod v molárním poměru antibiotikum/jod nA : mI, kde A je antibiotikum, I je jod, n je proměnná v rozsahu 1 - 3 a m je proměnná v rozsahu 0,3 - 5.

Pokud se v souvislosti s tímto technickým řešením hovoří o antibiotiku, rozumí se tím léčebné preparáty, tlumící růst původců infekčních nemocí, například bakterií. Tato třída preparátů, to jest antibiotik, obsahuje preparáty přírodní, které jsou produkovány mikroorganismy, preparáty polosyntetické, získané modifikací přírodních preparátů, a konečně preparáty syntetické, z nichž lze uvést například sulfonamidy, chinolony a podobně. V antimikrobním léčebném přípravku podle tohoto technického řešení může být použito antibiotikum nebo kombinace antibiotik z libovolné z uvedených skupin, zmíněnou definovanou přísadu jodu k tomuto antibiotiku či jejich kombinaci. Výsledný antimikrobní léčebný přípravek podle tohoto technického řešení tedy zásluhou již zmíněné přísady jodu patří tedy mezi antibiotika polosyntetická, popřípadě syntetická.

Antimikrobní léčebný přípravek podle tohoto technického řešení je jako prášek snadno rozpustný ve vodě a v závislosti na obsahu jodu má světle žlutou až hnědou barvu se slabým charakteristickým zápachem po jodu.

Toxicita antimikrobního léčebného přípravku podle tohoto technického řešení nepřesahuje toxicitu antibiotik a jeho farmakologická kinetika je podobná kinetice antibiotik, která obsahuje.

Postup výroby antimikrobního léčebného přípravku podle technického řešení je založen na komplexních vzájemných reakcích mezi aprotionickými kyselinami, ke kterým náleží jod, a polyfunkčními

ligandy, ke kterým náležejí antibiotika.

Samotný postup výroby antimikrobního léčebného přípravku spočívá v komplexních vzájemných reakcích mezi jodem a antibiotiky při daných molárních poměrech za vhodných podmínek, při použití obvyklých bezpečnostních opatření, aby se předešlo halogenaci molekul antibiotika nebo rozbití cyklického řetězce.

Příklad provedení technického řešení

Podstata technického řešení je dále objasněna na neomezuujícím příkladu jeho provedení.

Dále uváděné údaje se týkají antimikrobního léčebného přípravku, který jako antibiotika obsahuje tetracyklin a levomycetin v různých poměrech vůči jodu.

Bakteriologické testy účinku antimikrobního léčebného přípravku se prováděly běžnými metodami na kulturách *Pseudomonas aeruginosa*, *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus milleri*, *Salmonella* a *Proteus*.

K 1 ml mikrobiální suspenze s obsahem 0,25 mld. mikrobů se přidávají různá množství antimikrobního léčebného přípravku. Roztoky se udržují po dobu jedné hodiny na pokojové teplotě a následně se aplikují do výživného prostředí. Dosažené výsledky jsou v porovnání s kontrolními testy shrnuty v následující tabulce:

Výsledky bakteriologických testů antimikrobního léčebného přípravku

složení roztoků	Tetracyklin:jod			Tetracyklin			Levomycetin:jod			Levomycetin		
	5:1	1:1	1:0,001				5:1	1:1	1:0,001			
mg/l	250	50	5	250	50	5	250	50	5	250	50	5
Salmonella	-	-	+	-	+	+	-	-	-	-	+	+
Staph. aureus	-	-	-	-	+	+	-	-	-	-	+	+
Strept. milleri	-	-	-	-	+	+	-	-	-	-	+	+
Pseudomonas aeruginosa	-	-	+	+	+	+	-	-	-	-	+	+
Proteus	-	-	-	+	+	+	-	-	-	-	+	+

- bez růstu bakterií
+ s růstem bakterií.

Z uvedených výsledků je patrné, že, ve srovnání s výchozími antibiotiky, antimikrobní léčebný přípravek podle tohoto technic-

kého řešení obsahující tato antibiotika ve stejných koncentracích má široké spektrum účinku při koncentracích nejméně 100-krát nižších.

Ve srovnání s výchozími antibiotiky nebyly zjištěny žádné kmeny mikroorganismů, které by byly rezistentní vůči antimikrobnímu léčebnému přípravku podle tohoto technického řešení.

Vysokou účinnost antimikrobního léčebného přípravku prokázaly i testy na laboratorních a užitkových zvířatech a na jednom z původců tohoto technického řešení.

N Á R O K Y N A O C H R A N U

Antimikrobní léčebný přípravek, který obsahuje jako aktivní složku nejméně jedno antibiotikum, v y z n a č u j í c í s e t í m, že jako další složku obsahuje jod v molárním poměru antibiotikum/jod nA : mI, kde A je antibiotikum, I je jod a n je proměnná v rozsahu 1 - 3 a m je proměnná v rozsahu 0,3 - 5.

Konec dokumentu
