

**BIOKÉMIAI ANYAGOK ALKALMAZÁSA EMBERI TEST
SZERVEIBEN TALÁLHATÓ SIMAIZOMSEJTEK ÖSSZEHÚZÓ-
DÁSA OKOZTA, EGÉSZSÉGGEL KAPCSOLATOS ÁLLAPOTOK
MEGELŐZÉSÉRE ÉS KEZELÉSÉRE ALKALMAS KÉSZÍTMÉ-
NYEKBEN**

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

KIVONAT

A találmány biokémiai anyagok alkalmazása emberi test szerveiben található simaizomsejtek összehúzódása okozta, egészséggel kapcsolatos állapotok megelőzésére és kezelésére alkalmas készítményekben, amelyek vitaminokat, aminosavakat és gyógyászatilag elfogadható nyomelemeket tartalmaznak. A találmány értelmében alkalmazott készítmény lehet tabletta, pasztilla, injekció, infúzió, inhalálószer, kúp vagy egyéb gyógyászatilag elfogadható hordozókkal és/vagy leadási eszközzel előállított, beadásra alkalmas alakban.

D. Bachmann & Bente

PK

1.1.3.3.1

A1

**BIOKÉMIAI ANYAGOK ALKALMAZÁSA EMBERI TEST SZER-
VEIBEN TALÁLHATÓ SIMAIZOMSEJTEK ÖSSZEHÚZÓDÁSA
OKOZTA, EGÉSZSÉGGEL KAPCSOLATOS ÁLLAPOTOK MEG-
ELŐZÉSÉRE ÉS KEZELÉSÉRE ALKALMAS KÉSZÍTMÉNYEK BEN
KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY**

A találmány tárgya biokémiai anyagok alkalmazása emberi test szerveiben található simaizomsejtek összehúzódása okozta, egészséggel kapcsolatos állapotok megelőzésére és kezelésére alkalmas készítményekben.

Számos betegség oka még ismeretlen. Ismeretlen eredetű ilyen betegségek között vannak a leggyakrabban előforduló betegségek, közöttük a magas vérnyomás, asztma, zöldhályog és fülzúgás. A magas vérnyomás esetén az egyik legtekintélyesebb gyógyászati kézikönyv azt állapítja meg, hogy a betegek 90%-ánál e betegség oka ismeretlen [Harrison's Principles of Internal Medicine]. Világszerte több száz millió ember szenved ezekben az egészséggel kapcsolatos állapotokban, és az ezek kezelhetetlenségéből a társadalomnak származó gazdasági kár ténylegesen mérhetetlen.

Világszerte sok millió ember szenved asztmában. Utolsó stádiumában az asztma legyengülést okozó betegség, ami lehetetlenné teszi a munkavégzést, és társadalmi elszigeteléshez vezet. E betegség oka még ismeretlen, még ha allergének, genetikai hajlam és pszichológiai tényezők szerepet is játszanak abban. E betegség közös kórmechanizmusa a tüdőben lévő légzőcsatornák (apró hörgők) és az oxigéncsere szintereként szolgáló léghólyagokhoz vivő utak elzáródása. Ezt az elzáródást kiváltó és ezáltal asztmát okozó sejtszintű mechanizmusok azonban még nem ismertek.

Fülzúgás a hallászavarok egyik formája, amely a legtöbb esetben hirtelen és figyelmeztető jelek nélkül lép fel. Fülzúgásban és ezzel kapcsolatos hallászavarban szenvedő betegek számát világszerte 1 milliót meghaladóra teszik. E betegség eredete és kóroktana nem ismert, és jelenleg nincs hatásos kezelés fülzúgásban szenvedő betegek hallásának javítására. Ennek következtében e betegek nagy része éveken és évtizedeken keresztül szenved megromlott hallásban, ami munkaképességük és társadalmi életük szempontjából gyakran hátrányos következményekkel jár.

Különböző szervekben fellépő, az egészséggel kapcsolatos, látszólag eltérő állapotok változatait feltehetően ugyanazon sejttípus, a simaizomsejteknek nevezett sejtek biokémiai zavara okozza. Ez a típusú izomsejt - szemben többek között a kéz vagy láb izmaival - nem szabályozható tudatosan. Simaizomsejtek megfelelő anyagcserefunkciója megoldást jelenthetne az egészséggel kapcsolatos nehézségek elkerülésére az összes olyan szervben, amelyekben simaizomsejtek kritikus funkcionális szerepet játszanak.

Asztma esetében feltételezzük, hogy megtalálható a közös sejtméchanizmus. Az apró hörgők falai és a léghólyagok csatornái simaizomsejtek rétegét tartalmazzák. Ha e sejtek összehúzódnának, ezeknek a tüdővezetékeknek az átmérője - a kiváltó októl függetlenül - csökkenne, ami a légzés és oxigéncsere csökkenését eredményezné. Így aszmában és/vagy elzáródásos tüdőbetegségben szenvedő beteg jellemző tünetei lépnének fel.

Fülzúgás és halláskárosodás esetén elképzelhető, hogy a halláskárosodást azoknak a simaizomsejteknek a görcse okozza, amelyek a belső fül és az akusztikus jeleket továbbító idegsejtek vérellátásáért felelős véredények falát alkotják. Feltételezzük továbbá, hogy a fül kapillárisaiban lévő ezen simaizomsejtek görcsét koenzimek vagy e sejtek optimális anyagcseréjéhez alapvető fontosságú egyéb, bioenergiát szolgáltató molekulák hiánya okozza.

E koncepciót a tudományos irodalom korábban nem ismertette.

Újabban előrehaladás történt sejtek anyagcseréjének megértésében és azok megfelelő működésének fenntartásában bizonyos biokémiai vegyületek által betöltött szerep tisztázásában. Ennek megfelelően simaizomsejtek anyagcseréjében fennálló zavar kiküszöbölése különböző szervekben fellépő, egészséggel kapcsolatos számos állapot meggátlásának és kezelésének eszköze lehet.

Megállapítottuk továbbá, hogy a sejtek működésének zavarát kiválthatja bizonyos biokémiai vegyületek hiánya, amelyek koenzimként szükségesek a trikarbonsavciklusban, az úgynevezett Krebs-ciklusban, a légzési láncban és simaizomsejtekben lejátszódó egyéb anyagcsere-folyamatokhoz. A következőkben nem korlátozó jelleggel felsoroljuk azokat a szerveket és betegségeket, amelyeknek esetén egészséggel kapcsolatos állapotok potenciálisan megelőzhetők és kezelhetők:

- véredények, tüdő, szem, húgy-ivarszervi traktus és gyomor-bél traktus;

- magas vérnyomás, angina pectoris, fülzúgás, impotencia, asztma és elzáródásos tüdőbetegségek egyéb típusai, zöldhályog és megnövekedett szemnyomás egyéb alakjai, menstruáció előtti szindróma, terméketlenség, húgyvezeték és húgycső görcsei, csuklás, gyomorgörcsök és az epevezetékben fellépő görcsök.

Fentiek alapján a találmány biokémiai anyagok alkalmazása emberi test szerveiben található simaizomsejtek összehúzó-dása okozta, egészséggel kapcsolatos állapotok megelőzésére és kezelésére alkalmas készítményekben, amelyek vitaminokat, aminosavakat és gyógyászatilag elfogadható nyomelemeket tartalmaznak.

A találmány továbbá biokémiai anyagok alkalmazása legalább részben emberi test szerveiben található simaizomsejtek összehúzó-dása okozta, egészséggel kapcsolatos állapotok megelőzésére és kezelésére alkalmas készítményekben, amelyek aszkorbinsav, gyógyászatilag elfogadható aszkorbátok és/vagy ezek elegyei közül választott legalább egy aszkorbátvegyületet tartalmaznak.

A találmány ezenkívül biokémiai anyagok alkalmazása, ahol a készítmény arginin-hidroklorid, gyógyászatilag elfogadható argininsók és/vagy ezek elegyei közül választott legalább egy argininszármazékot tartalmaz.

A találmány továbbá biokémiai anyagok alkalmazása, ahol a készítmény aszkorbátvegyület és argininszármazék mellett magnézium vagy gyógyászatilag elfogadható magnéziumsók és/vagy ezek elegyei közül választott legalább egy magnéziumvegyületet tartalmaz.

A találmány további kiviteli alakja biokémiai anyagok alkalmazása, ahol a készítmény továbbá a következők közül, azok dózisértékétől függetlenül választott egy vagy több biokémiai anyagot tartalmaz: aszkorbinsav, aszkorbil-palmitát, β -, γ - és δ -tokoferol-keverék, β -karotin, biotin, kalcium-aszkorbát, kalcium-citrát, kalcium-glicinát, α -karotint, luteint, zea- és kriptoxantint tartalmazó karotinoidkeverék, cholkalciferol, króm-glicinát, citrusnövény eredetű bioflavonoid, Q10 koenzim, réz-glicinát, cianokobolamin, d- α -tokoferol, d-kalcium-pantoténát, di-kalcium-foszfát, folsav, inozitol, L-arginin, L-karnitin, L-cisztein, L-lizin, L-prolin, L-szelenometionin, magnézium-aszkorbát, magnézium-citrát, magnézium-glicinát, mangán-kelet, molibdén-glicinát, niacin, niacinamid, kálium-kelet, piknogenol, pirodoxin, riboflavin, tiamin és cink-glicinát.

A találmány még további kiviteli alakja biokémiai anyagok alkalmazása, ahol a készítmény tabletta, pasztilla, injekció, infúzió, inhalációszer, kúp vagy egyéb gyógyászati lagon elfogadható hordozókkal és/vagy leadási eszközzel előállított, beadásra alkalmas alakban van.

Az ismertetett koncepciót az egészséggel kapcsolatos fenti állapotok közül számos esetben, így magas vérnyomás, asztma és fülzúgás esetében klinikailag vizsgáltuk.

Biokémiai anyagokat tartalmazó ilyen készítményekkel végzett kezelés legalább részben a simaizomsejtek jelentős relaxálásához vezet, ami a következő hatásokat eredményezi: a nagy ütőerek (így aorta) artériás átmérője nő - csökkentve a magas vérnyomást; a közepes méretű ütőerek (így koronaerek) artériás átmérője nő - angina pektorisz tüneteit csökkentve; a

kis artériák és kapillárisok (így a fülben lévő artériák) átmérője nő - a hallás javulását eredményezve; a tüdőben lévő apró hörgők és légútiágak simaizomsejtjei relaxálnak a légút átmérőjének növekedéséhez vezetve, ami csökkenti az asztma tüneteit; a szem csatornarendszerének relaxálása növeli többek között a könnycsatornák átmérőjét, ennek következtében csökken a szemnyomás - csökkentve a zöldhályog és megvakulás veszélyét; a petevezetékekben és a méhben lévő simaizomsejtek relaxálása az izomszövet relaxálását eredményezi, ami javítja a termékenységet és csökkenti a menstruáció előtti szindróma tüneteit; az epevezetékben, húgyvezetékben és húgycsőben lévő simaizomsejtek relaxálása a vezetékek átmérőjét növeli, ezáltal csökken epekövek vagy vesekövek által kiváltott görcsök veszélye.

A leíráshoz csatolt 1. ábra betegek tüdőterfogatának változását mutatja be az elvégzett vizsgálatok során.

A 2. ábrán betegek hallásának javulása látható a javulás mértékének függvényében.

A következőkben a találmányt nem korlátozó értelmű példákkal szemléltetjük.

Az alábbiakban felsorolt biokémiai anyagokat tartalmazó készítményeket adjuk be betegeknek a megadott napi dózisban:

biokémiai anyagok	mennyiség
aszkorbinsav	680 mg
aszokorbil-palmitát	620 mg
β -, γ - és δ -tokoferol-keverék	22 mg
β -karotin	1665 NE
biotin	65 μ g
kalcium-aszkorbát	1050 mg
kalcium-citrát	200 mg
kalcium-glicinát	35 mg
α -karotint, luteint, zea- és kriptoxantint tartalmazó karotinoidelegy	50 μ g
cholkalciferol	130 NE
króm-glicinát	10 μ g
citrusnövény eredetű bioflavonoid	650 mg
Q10 koenzim	7 mg
réz-glicinát	330 μ g
cianokobolamin	20 μ g
d- α -tokoferol	230 NE
d-kalcium-pantotenát	40 mg
dikalcium-foszfát	15 mg
folsav	90 μ g
inozitol	35 mg
L-arginin	790 mg
L-karnitin	35 mg
L-cisztein	35 mg
L-lizin	110 mg
L-prolin	110 mg
L-szelenometionin	20 μ g

magnézium-aszkorbát	1050 mg
magnézium-citrát	400 mg
magnézium-glicinát	40 mg
mangán-kelát	1300 µg
molibdén-glicinát	4 µg
niacin	10 mg
niacinamid	35 mg
kálium-kelát	20 mg
piknogenol	7 mg
pirodoxin	10 mg
riboflavin	7 mg
tiamin	7 mg
cink-glicinát	7 mg

NE: nemzetközi egység

A biokémiai anyagokat tartalmazó ezen példa szerinti készítmény egyedi komponensei változtathatók ugyan, azonban azok több, mint 80%-a - függetlenül azok mennyiségétől - a megadott anyagokkal azonos. Ezenkívül az egyedi komponensek naponta beadott mennyisége a fentiekben megadott mennyiségükre vonatkoztatva legalább 10% és legfeljebb 1000% között van.

A találmány koncepcióját 8 asztmás beteggel lefolytatott feltáró klinikai vizsgálatban tanulmányozzuk. Ezek a betegek 4 hónapon keresztül napi dózisként a fentiekben felsorolt biokémiai vegyületeket kapják. Mindegyik beteg esetén a vizsgálat kezdetekor és a vizsgálat végén mérjük a tüdő térfogatát. A vizsgálat során az asztmás betegek tüdőtérfogata átlagosan 20%-ot meghaladó mértékben növekszik. E vizsgálatok leg-

szignifikánsabb eredménye az a tény, hogy a legkisebb kiindulási térfogatú betegek esetén a tüdőtérfogat %-os növekedése sokkal nagyobb. Ez azt mutatja, hogy az alkalmazott kezelés különösen hatásos súlyos asztmában és légzési elégtelenségben szenvedő betegek esetén, amint az 1. ábrán látható.

A találmány koncepcióját fülzúgásban szenvedő 18 beteggel 4 hónapon keresztül folytatott feltáró klinikai vizsgálatban tanulmányozzuk. A hallóképességet műszeres hallásvizsgálattal objektív módon dokumentáljuk. A kezelés előtt és után lefolytatott műszeres hallásvizsgálat eredményeit a 2. ábra foglalja össze. 5 beteg hallóképessége nem vagy csak csekély (0-10 dB) mértékben nő, 8 beteg esetében a hallásjavulás 10-20 dB, 2 betegnél 20-30 dB, további 2 betegnél 30-40 dB, míg 1 beteg hallásjavulása 40 és 50 dB közötti.

A bemutatott vizsgálati eredmények igazolják a találmány szerinti készítmény beadásának hatásosságát olyan betegek esetében, akik testük szerveiben lévő simaizomsejtek összehúzódására legalább részben visszavezethető, egészséggel kapcsolatos állapotban szenvednek. Bár a találmányt előnyös kiviteli alakjain és példákon keresztül mutattuk be, megjegyzendő, hogy a találmány nincs ezen megoldásokra korlátozva, hanem a találmány oltalmi körét a csatolt igénypontok és azok szerinti megoldások ekvivalensei határozzák meg.

Szabadalmi igénypontok

1. Biokémiai anyagok alkalmazása emberi test szerveiben található simaizomsejtek összehúzódása okozta, egészséggel kapcsolatos állapotok megelőzésére és kezelésére alkalmas

készítményekben, amelyek vitaminokat, aminosavakat és gyógyászati lag elfogadható nyomelemeket tartalmaznak.

2. Biokémiai anyagok alkalmazása legalább részben emberi test szerveiben található simaizomsejtek összehúzódása okozta, egészséggel kapcsolatos állapotok megelőzésére és kezelésére alkalmas készítményekben, amelyek aszkorbinsav, gyógyászati lag elfogadható aszkorbátok és/vagy ezek elegyei közül választott legalább egy aszkorbátvegyületet tartalmaznak.

3. Biokémiai anyagok 2. igénypont szerinti alkalmazása, ahol a készítmény arginin-hidroklorid, gyógyászati lag elfogadható argininsók és/vagy ezek elegyei közül választott legalább egy argininszármazékot tartalmaz.

4. Biokémiai anyagok 2. vagy 3. igénypont szerinti alkalmazása, ahol a készítmény magnézium vagy gyógyászati lag elfogadható magnéziumsók és/vagy ezek elegyei közül választott legalább egy magnéziumvegyületet tartalmaz.

5. Biokémiai anyagok 1-4. igénypontok bármelyike szerinti alkalmazása, ahol a készítmény továbbá a következők közül, azok dózisától függetlenül választott egy vagy több biokémiai anyagot tartalmaz: 680 mg aszkorbinsav, 620 mg aszokorbil-palmitát, 22 mg β -, γ - és δ - tokoferol-keverék, 1665 NE β -karotin, 65 μ g biotin, 1050 mg kalcium-aszkorbát, 200 mg kalcium-citrát, 35 mg kalcium-glicinát, 50 μ g α -karotint, luteint, zea- és kriptoxantint tartalmazó karotinoidelegy, 130 NE cholcalciferol, 10 μ g króm-glicinát, 650 mg citrusnövény eredetű bioflavonoid, 7 mg Q10 koenzim, 330 μ g réz-glicinát, 20 μ g cianokobolamin, 230 NE d- α -tokoferol, 40 mg d-kalcium-pantotenát, 15 mg

dikalcium-foszfát, 90 µg folsav, 35 mg inozitol, 790 mg L-arginin, 35 mg L-karnitin, 35 mg L-cisztein, 110 mg L-lizin, 110 mg L-prolin, 20 µg L-szelenometionin, 1050 mg magnézium-aszkorbát, 400 mg magnézium-citrát, 40 mg magnézium-glicinát, 1300 µg mangán-kelát, 4 µg molibdén-glicinát, 10 mg niacin, 35 mg niacinamid, 20 mg kálium-kelát, 7 mg piknogenol, 10 mg pirodoxin, 7 mg riboflavin, 7 mg tiamin és 7 mg cink-glicinát.

6. Biokémiai anyagok 1-5. igénypontok bármelyike szerinti alkalmazása, ahol a formáláshoz használt egyedi komponensek több, mint 80%-a mennyiségüktől függetlenül azonos.

7. Biokémiai anyagok 1-6. igénypontok bármelyike szerinti alkalmazása, ahol az egyedi komponensek naponta beadott mennyisége az egyedi komponensek 5. igénypont szerinti mennyiségére vonatkoztatva legalább 10% és legfeljebb 1000% között van.

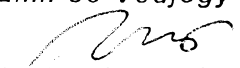
8. Biokémiai anyagok 1-7. igénypontok bármelyike szerinti alkalmazása, ahol a készítmény tabletta, pasztilla, injekció, infúzió, inhalálószer, kúp vagy egyéb gyógyászatilag elfogadható hordozókkal és/vagy leadási eszközzel előállított, beadásra alkalmas alakban van.

Dr. Matthias Rath

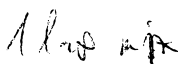
helyett a meghatalmazott:

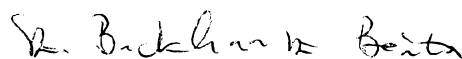
DANUBIA

Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.


dr. Vitális László

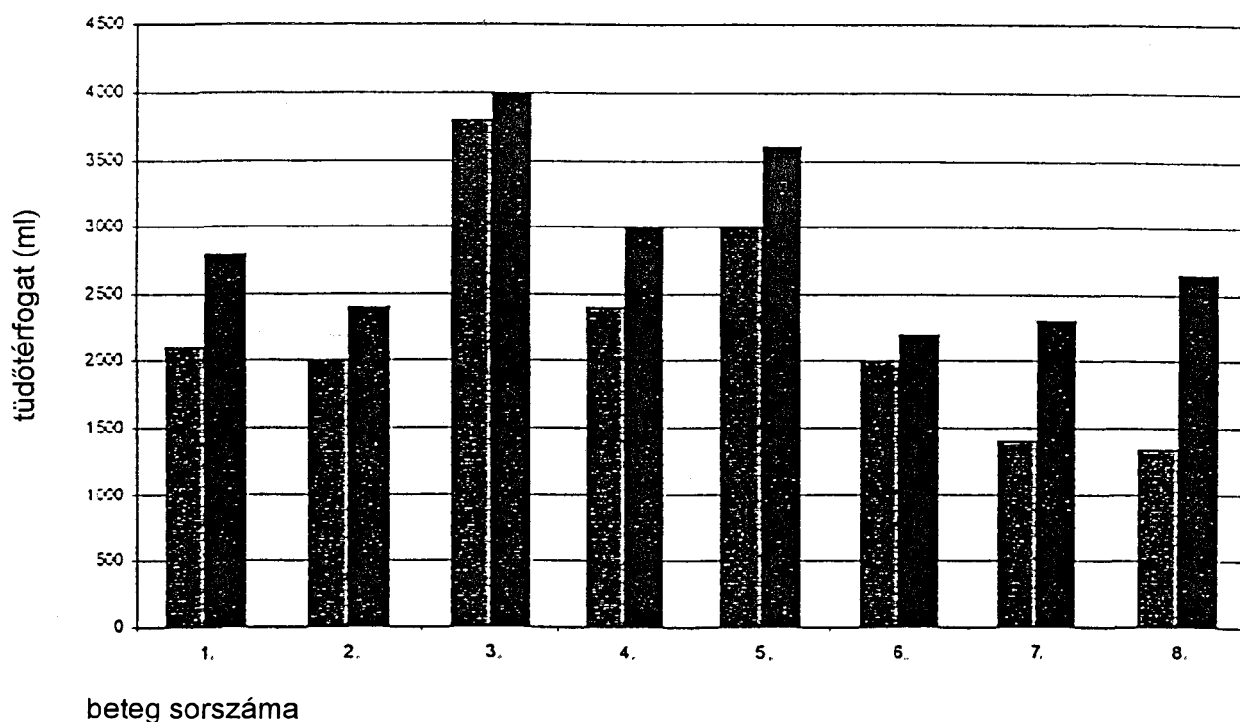
szabadalmi ügyvivő





1. ÁBRA

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY



2. ÁBRA

