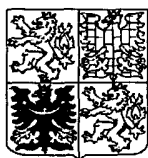


PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu:

287 114

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **1996 - 2203**

(22) Přihlášeno: **19.01.1995**

(30) Právo přednosti:
26.01.1994 SE 1994/9400241

(40) Zveřejněno: **11.12.1996**
(Věstník č. 12/1996)

(47) Uděleno: **13.07.2000**

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku: **13.09.2000**
(Věstník č. 9/2000)

(86) PCT číslo: **PCT/SE95/00044**

(87) PCT číslo zveřejnění: **WO 95/20411**

(13) Druh dokumentu: **B6**

(51) Int. Cl.⁷:
A 61 K 9/00
A 61 K 9/12
A 61 M 11/00

(73) Majitel patentu:

AGA AKTIEBOLAG, Lidingö, SE;

(72) Původce vynálezu:

Hammarlund Nils, Sollentuna, SE;

(74) Zástupce:

**Korejzová Zdeňka JUDr., Spálená 29, Praha 1,
11000;**

(54) Název vynálezu:

**Léčebný prostředek v podobě aerosolu a použití
směsi plynů**

(57) Anotace:

Léčebný prostředek v podobě aerosolu, tvořeného kapalinovými částicemi, které sestávají z léku nebo jej obsahují, a plynou směsí, je upraven tak, že plyná směs obsahuje helium a/nebo neon a popřípadě další plyny, například kyslík. Součástí řešení tvoří také použití směsi plynů, obsahující helium a/nebo neon pro výrobu tohoto prostředku.

CZ 287114 B6

Léčebný prostředek v podobě aerosolu a použití směsi plynů

Oblast vynálezu

5

Vynález se týká léčebného prostředku ve formě aerosolu, tvořeného kapalinovými částicemi, které sestávají z léku nebo jej obsahují, a plynou směsí. Součástí řešení tvoří také použití směsi plynů pro výrobu takového prostředku.

10

V případě infekcí dýchacího traktu, jako je astma nebo chronický zánět průdušek, je velmi prospěšné, aby se lék mohl podat inhalací, a to jak pokud jde o udržovací léčení, tak i při akutním ohrožení nemocí. Lék se vhodně podává pomocí rozprašovače, obvykle poháněného stlačeným vzduchem nebo čistým plyným kyslíkem.

15

Dosavadní stav techniky

Jedním problémem, zjištěným při ošetřování inhalací, je dodat lék do místa, kde nejvíce pomůže. Užije-li se tradičního rozprašovacího zařízení, pak velká část podané dávky zůstane v ústní dutině a hltnu a pouze malá část dávky se dostane do průduškové soustavy. Vysoce účinný rozprašovač byl popsán v EP-B1-0191018. Tímto rozprašovačem se dosáhne zlepšeného obvodového ukládání rozprašovaného léku a tím i lepšího účinku, menšího nebezpečí vedlejších účinků, menší spotřeby léku a kratších dob ošetřování.

25

Studie na lidech, trpících slabým až mírným astmatem, ukázaly, že ukládají inhalované částice více uprostřed průduškového útvaru než zdraví lidé. To může být způsobeno například silnějším sklonem k turbulenci v dýchacích cestách astmatiků, což zase může být dáno tím, že dýchací cesty u těchto osob jsou úzké nebo částečně blokové, jak tomu je například v případě cystické fibrózy.

30

V US 5228434 se popisuje použití xenonu jako anestetizačního prostředku, dodávajícího ve formě plyné směsi. Xenon má vysokou hustotu a k získání směsi s nižší hustotou se proto ke směsi přidává helium. Uvedený patentový spis však nenavrhuje ani neuvádí možnost zpracování léčiva ve formě aerosolu, který by se účinněji ukládal do dýchacích cest nemocného než až dosud užívané aerosolové prostředky.

35

Účelem vynálezu je dále zlepšit periferní ukládání léků, dodaných do dýchacích cest pacienta, a tím snížit potřebnou účinnou dávku léku nebo zkrátit potřebnou dobu ošetření nebo kombinace obojího. Z léčebného hlediska je důležité, aby účelu zákroku bylo dosaženo rychle. Účinnější uložení a nižší dávky léku snižují také nebezpečí vedlejších účinků.

40

Dalším účelem vynálezu je vytvořit léčebný prostředek v podstatě aerosolu, sestávajícího z kapalných částic, které sestávají ze směsi léčiva a plynu nebo obsahují tuto směs, která je schopna dopravit kapalinu, obsahující lék, dále dolů do dýchacích cest pacienta, než dosud používané proudy plynu.

45

Ještě dalším účelem vynálezu je způsob použití plyné směsi pro vytvoření aerosolu, při němž aerosol sestává z kapalných částic, které obsahují léčivo, a z proudu nosného plynu, který je schopen zanést kapalinu, obsahující lék, dolů do dýchacích cest až do plicních sklípků, dále než dosud používané proudy plynu.

50

Podstata vynálezu

Podstatu vynálezu tvoří léčebný prostředek v podobě aerosolu, tvořeného kapalinovými částicemi, které sestávají z léku nebo jej obsahují, a plynnou směsí. Prostředek je upraven tak, že plynná směs obsahuje helium a/nebo neon.

Součástí řešení tvoří také použití směsi plynů, obsahující helium a/nebo neon pro vytvoření léčebného prostředku pro podání ve formě aerosolu. Při výrobě se postupuje tak, že kapalina, která sestává z léčiva nebo jej obsahuje, se přemění na aerosol s obsahem malých částic kapaliny pomocí proudu plynu, v němž se kapalinové částice shromažďují, přičemž plyn obsahuje helium a/nebo neon.

Podle vynálezu se tedy periferní uložení léků, zavedených do dýchacích cest, zlepší, je-li lék ve tvaru kapaliny nebo je-li rozpuštěn nebo rozptýlen v kapalině, která se přemění na kapalně částice a zavede do nosného plynu, který obsahuje helium a/nebo neon. Nosný plyn je s výhodou směs helia a/nebo neonu a kyslíku, zejména helia a kyslíku. Koncentrace helia a/nebo neonu bude s výhodou činit nejméně 70 procent objemových nosného plynu. Použitá kapalina bude kompatibilní s dýchacími cestami a může to být například voda.

Výhoda použití helia a/nebo neonu jako nosného plynu pro částice kapaliny, které jsou tvořeny lékem nebo jej obsahují, záleží v tom, že při normálním tlaku a normálních teplotách má zejména helium, avšak také neon, menší hustotu a viskozitu než ostatní plynné látky, například vzduch. Této vlastnosti se využije pro zavedení léků dolů do nejjemnějších dýchacích cest, do plicních sklípků, a menší turbulencí.

Popis obrázků na výkresech

Vynález bude nyní podrobněji popsán v souvislosti s přiloženým výkresem.

Na obr. 1 je schematický pohled v průřezu na rozprašovač, ve kterém jsou částice kapaliny vytvářeny pomocí proudu plynu.

Na obr. 2 je schematický pohled v průřezu na rozprašovač, ve kterém jsou kapalně částice vytvářeny ultrazvukem.

Příklady provedení vynálezu

Obr. 1 znázorňuje rozprašovač 1, který sestává z nádržky 2, obsahující kapalinu 3. Kapalina může být lék nebo může sestávat z roztoku léku nebo z disperze léku, například léku proti astmatu. Rozprašovač 1 také obsahuje dva navzájem oddálené a navzájem rovnoběžné kotouče 4, 5, z nichž spodní kotouč 5 je spojen s kapalinou 3 vedením 7. Vedení 7 končí v malém otvoru 10 v horní ploše kotouče 5. Vedení 7 je spojeno s vedením 8 hnacího plynu přímo pod otvorem 10. Toto vedení 8 hnacího plynu je spojeno se zdrojem plynu, obvykle vzduchu nebo kyslíku. Rozprašovač obsahuje také výstup 9 pro vytvořený aerosol.

Kapalina 3, obsahující lék, je umístěna v nádržce 2, když se užije rozprašovače 1. Hnací plyn proudí vedením 8 do vedení 7 a potom otvorem 10. Plyn tím odebírá kapalinu 3 z nádržky 2 sáním, přičemž kapalina provází proud plynu do horního kotouče 4, kde se kapalina radiálně rozstříkuje a tvoří na okrajích kotouče malé kapalinové kapičky, které jsou dopravovány proudem plynu směrem k výstupu 9.

Obr. 2 znázorňuje rozprašovač 20, ve kterém jsou kapičky kapaliny vytvářeny ultrazvukem. Rozprašovač 1 obsahuje nádržku 12, která obsahuje kapalinu 13, ve které je lék rozpuštěn nebo dispergován. Pod nádržkou 12 je uložen zdroj 11 ultrazvuku. Vedení 18 plynu, spojené se zdrojem stlačeného plynu, ústí do výstupu 9. Použitý plyn je obvykle vzduch nebo kyslík.

Nádržka 12 je naplněna kapalinou, když se užije rozprašovače 20. Zdroj ultrazvuku je neznázorněným způsobem připojen ke zdroji energie za účelem vytváření malých částecek kapaliny na povrchu kapaliny. Plyn, proudící vedením 18, unáší tyto kapalinové částice výstupním otvorem 9.

Podle jiného provedení rozprašovače, podobného provedení podle obr. 1, je horní kotouč 3 nahrazen kotoučem, rychle se otáčejícím. Kapalina, opouštějící otvor ve spodním kotouči, naráží na otáčející se kotouč a je tím dělena na malé částice.

Podle vynálezu se pro vytváření aerosolu, obsahujícího lék, užívá plyn nebo plynové směsi, jejíž složky mají nízkou molekulovou hmotnost. Plyn se vyznačuje tím, že obsahuje helium a/nebo neon. Plyn může také s výhodou obsahovat kyslík kromě helia a/nebo neonu. Výhodný lehký plyn je helium. Obsah kyslíku nemá být menší než 15 % hmotnostních a je s výhodou přibližně 20 % nebo vyšší. U výhodného provedení je obsah helia a/nebo neonu nejméně 70 % objemových.

Vhodné léky pro přeměnu na tvar aerosolu jsou například BRICANYL a ADRENALIN, nabízený firmou Draco, VENTOLINNE a BECOTIDE, nabízený firmou Glaxo, a LOMUDAL, nabízený firmou Fisons.

PATENTOVÉ NÁROKY

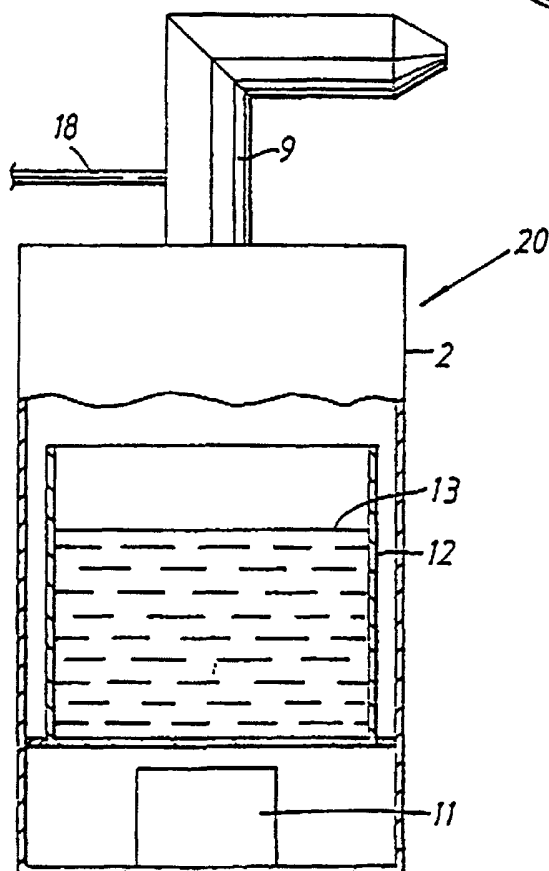
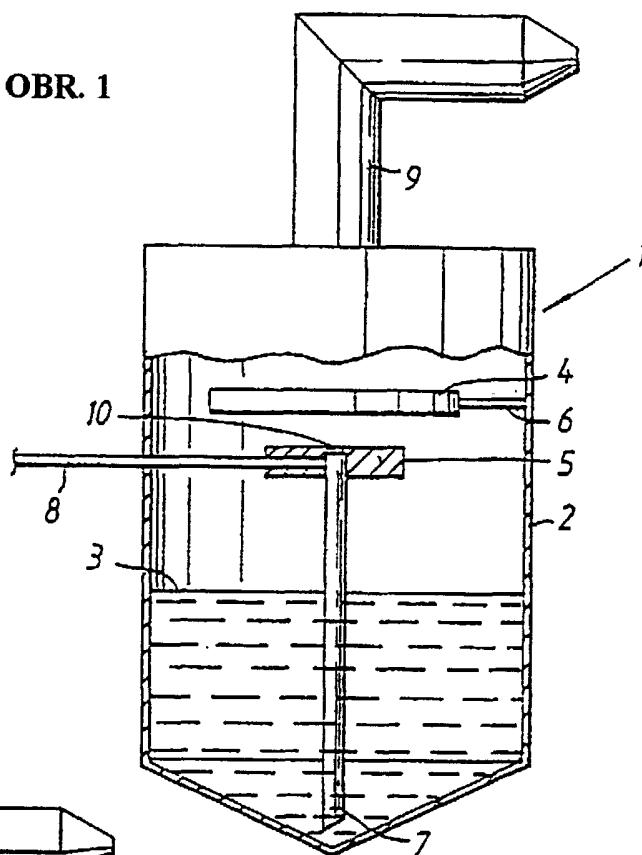
1. Léčebný prostředek v podobě aerosolu, tvořeného kapalinovými částicemi, které sestávají z léku nebo jej obsahují, a plynou směsí, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že plyná směs obsahuje helium a/nebo neon.

2. Léčebný prostředek podle nároku 1, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že plyná směs je směs, obsahující helium a/nebo neon a kyslík.

3. Léčebný prostředek podle nároku 1 nebo 2, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že plyná směs obsahuje nejméně 70 % objemových helia a/nebo neonu.

4. Použití směsi plynů, obsahující helium a/nebo neon, pro vytvoření léčebného prostředku pro podání ve formě aerosolu.

OBR. 1



OBR. 2

Konec dokumentu