

PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

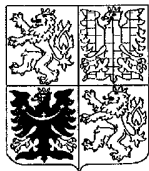
zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(21) Číslo dokumentu:

2000 - 88

(13) Druh dokumentu: **A3**

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLUVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **10.07.1998**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **16.07.1997**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **1997/RM000435**

(33) Země priority: **IT**

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **16.08.2000**
(Věstník č. 8/2000)

(86) PCT číslo: **PCT/IB98/01056**

(87) PCT číslo zveřejnění: **WO99/03364**

(51) Int. Cl. ⁷:

A 23 L 1/30

A 23 L 1/305

A 61 K 35/78

A 61 P 15/12

A 61 P 25/00

(71) Přihlašovatel:

SIGMA-TAU INDUSTRIE FARMACEUTICHE
RIUNITE S. P. A., Roma, IT;

(72) Původce:

Cavazza Claudio, Roma, IT;

(74) Zástupce:

Vandělíková Jana Ing., Petráská 12, Praha 1, 11000;

(54) Název přihlášky vynálezu:

Nutriční přípravek pro stresované subjekty

(57) Anotace:

Přípravek pro zdravotní výživu vhodný ke zlepšení a léčbě stavů neklidu způsobeného stresem sestává z následující kombinace. (a) L-karnitin nebo alkanoyl-L-karnitin; (b) směs přírodních rostlinných přípravků; (c) sójový lecitin; (d) kyselina jablečná. Přírodní přípravky jsou vybrány výhodně ze skupiny sestávající z přírodního extraktu *Corynanthe yohimbe* nebo yohimbinu, přírodního extraktu *Panax ginsenga*, přírodního extraktu *Paullinia cupana* nebo guarany a přírodního extraktu *Turnera diffusa* nebo damianu.

Nutriční přípravek pro stresované subjekty

Oblast techniky

Předložený vynález se týká nutričního přípravku nebo zdravotní výživy subjektů ve stavu ochablosti jako důsledku stresu.

Dosavadní stav techniky

V rozvinutých zemích postihuje stresový syndrom značný počet lidí. Příčiny stresu jsou mnohočetné a jsou přisuzovány hlavně životním podmínkám ve velké a přeplněné městské zástavbě a problémům, způsobeným nadměrným provozem, hlukem a znečištěním. Jiná příčina tkví v problémech spojených s pracovní aktivitou nebo ekonomickými starostmi.

Tento syndrom postihuje všechny sociální vrstvy, avšak hlavně lidi zapojené do pracovního procesu, kteří jsou často předmětem vysokého stresu z konkurence zaviněné jak pracovním prostředím, tak jejich společenskými vztahy.

Obecně řečeno syndrom stresu „nemoci“ z vyčerpání nevyžaduje tedy uložení na lůžko, ale je jistě častou příčinou vyžadující vyřazení z práce. Jelikož postihuje značný počet jedinců, přináší během pracovního roku značné břímě ekonomických škod celé společnosti. Stresový syndrom, který byl v minulosti nazýván „nervové zhroucení“ je charakterizován tím že, při absenci aktivního onemocnění, je průvodním stavem neklid, nedostatek síly, vyčerpání, stavy mentální a fyzické únavy, nedostatek soustředění a pozornosti a nedostatek sexuální aktivity a libida.

Pro léčbu stresu neexistují specifická léčiva. Dočasné sejmutí příčin stresu například strávením dovolené na příjemném místě a v odpočinkovém prostředí má jistě kladný

účinek působící regeneraci mentální a fyzické pohody se zlepšením tělesného výkonu a zvýšením sexuální aktivity a libida.

To však není vždy z různých příčin, jako jsou například pracovní povinnosti, rodinné záležitosti a ekonomické obtíže, možné.

Značný počet pacientů trpících stresem je léčeno benzodiazepiny nebo léčivy s látkou, která je účinná při špatném duševním rozpoložení. Benzodiazepiny se používají ke zmírnění takových symptomů úzkosti nebo podráždění, avšak působí zpětnou vazbou návyk, zrovna tak jako u mužského pohlaví v reprodukčním věku dále potlačuje libido a sexuální aktivitu jako spouštěcí mechanismus, což je příčinou dalšího neklidu.

Známo je již mnoho látek, které jsou vhodné k léčbě sexuální impotence psychického nebo jiného původu. Rovněž tak jsou známy látky zakládající stimulační aktivitu. Pokud se například při léčbě pacientů při normálně probíhající dialýze použije L-karnitin, způsobí u těchto pacientů normální obnovení sexuálních funkcí (De Felice, SL, Lyons P, Gaffar, MC, Sheridan, MJ., Dial-Transplant, 25, (6), 368-373, 1996).

Lidová medicína (a pověry) v orientálních a jihoamerických zemích (Čína, Brazílie) věří dosud na od nepaměti všeobecně přijímané extrakty kořenů, kůry a listů různých „exotických“ rostlin s vícenásobnými terapeutickými a stimulačními účinky. Ginseng byl používán v čínské medicíně po více jak 2000 let k léčbě sexuální impotence, i při jiných onemocněních. Také je ke zlepšení sexuální funkce dobře známá účinnost yohimbinu; viz například „Clinical Studies in Impotence“ (Klinické studie impotence): K. Reid, et al., Lancet, 2, 421-423, 1987. Guarana je brazilskou domorodou populací

používána k přípravě stimulačního nápoje (Pharmacognosy, Edward P. Claus, Varro E. Tyler, Lynn R. Brady, 6. vyd., s. 292-293). O damianě je také dlouho známo, že je podle lidové pověry obdařena stimulační aktivitou (J. Psychoactive Drugs, 16, (3), 267-268, 1984).

Podstata vynálezu

Účelem tohoto vynálezu je nyní zajistit terapeutickou zdravotní výživu vhodnou pro úlevové a léčebné stavy neklidu způsobeného stresem a vzbuzení sexuální vitality. Terapeutická zdravotní výživa podle vynálezu sestává z následujících sloučenin v kombinaci:

- 1) L-karnitin nebo alkanoyl-L-karnitin, ve kterém má lineární nebo rozvětvený alkanoyl 2 až 8, lépe 2 až 6 uhlíkových atomů nebo jedna z jeho farmakologicky přijatelných solí;
- 2) ginseng (přírodní extrakt Panax ginseng);
- 3) yohimbin (přírodní extrakt Coryanathe yohimbe);
- 4) guarana (přírodní extrakt Paullinia cupana);
- 5) damiana (přírodní extrakt Turnera diffusa, var. aphrodisiaca);
- 6) sójový lecitin a
- 7) kyselina jablečná.

Alkanoyl L-karnitin se přednostně volí ze skupiny sestávající z acetyl-, propionyl-, butyryl-, valeryl- a isovaleryl-L-karnitinu, nebo jedné z jeho farmakologicky přijatelné sole.

Farmakologicky přijatelnou solí L-karnitinu nebo alkanoyl-L-karnitinu se míní jakákoliv jeho sůl s kyselinou, která nedává popud k nežádoucím toxickým nebo vedlejším účinkům. Takové kyseliny jsou farmakologům a odborníkům ve farmacii dobře známy.

Mezi příklady farmakologicky přijatelných solí L-karnitinu nebo alkanoyl-L-karnitinu, a to aniž by tím byl vynález nějak omezován, patří chlorid, bromid, orotát, kyselý

aspartát, kyselý citrát, kyselý fosforečnan, fumarát a kyselý fumarát, mléčnan, maleinát a kyselý maleinát, kyselý šťavelan, kyselý síran, glukofosfát, vínan a kyselý vínan.

Složky kombinace podle tohoto vynálezu jednou spojeny, vykazují neočekávanou potenci synergického účinku, který přináší zlepšení tělesného výkonu a mentální a tělesné kondice pacientů trpících stresovým syndromem. Velmi důležitý a překvapující je synergický účinek představovaný kombinací ginsenga, yohimbinu a L-karnitinu v obnovení sexuální aktivity a libida.

Účinek kombinace ve skutečnosti zřejmě převyšuje součet účinků jednotlivých složek.

Zvláště zajímavá je interakce mezi kyselinou jablečnou a L-karnitinem. Komplementární účinek uplatněný těmito dvěma sloučeninami na vytvoření energie dvěma metabolickými cestami - kyseliny jablečné přes Krebsův cyklus a L-karnitinu přes β -oxidaci - stimuluje tělo ke vzniku velkého množství užitečné energie, k tomu, aby se jednotlivec vymanil ze stavu vyčerpání, ochablosti nebo asthenie způsobené stresem.

Interakce mezi guaranem a damianou vyúsťuje také v intenzivní stimulační účinek umožňující většině subjektů vykazujících stav strnulosti nebo nedostatku zájmu, dostat se s tohoto stavu.

L-karnitin a sójový lecitin příznivě metabolizují mastné kyseliny, a tím vykonávají hypolipemický účinek na tělo, který je nepřímou zpětnou reakcí, co se týká zlepšení stresového syndromu, zaměřen na zlepšení normálního zdravotního stavu jedince.

Poměrný hmotnostní poměr L-karnitinu nebo alkanoyl-L-karnitinu ke ginsengu, yohimbinu, guaraně a damianu se může měnit v širokých mezích. Tento poměr by se

měl pohybovat v mezích od 1:0,1:0,0025:0,1:0,1 do 1:10:0,25:100:100. Jednomu z poměrů, kterému se dává přednost je poměr 1:1:0,025:1:1.

Formou příkladů neomezujících nikterak vynález jsou sáčkované přípravky podle tohoto vynálezu, které obsahují složky v této kombinaci:

Přípravek 1

L-karnitin.HCl	200 mg
ginseng	200 mg
sójový lecitin	400 mg
aspartam	20 mg
sacharoza	1500 mg
tangerinová příchut'	100 mg
yohimbin	5 mg
kyselina jablečná	50 mg
granulovaný manitol q.s. do	3000 mg

Přípravek 2

L-karnitin.HCl	200 mg
ginseng	200 mg
sójový lecitin	200 mg
aspartam	20 mg
sacharoza	1000 mg
tangerinová příchut'	100 mg
yohimbin	5 mg
guarana	200 mg
damiana	200 mg
kyselina jablečná	50 mg
granulovaný manitol q.s. do	3000 mg

Přípravek 3

L-karnitin.HCl	200 mg
ginseng	200 mg
sójový lecitin	200 mg
aspartam	20 mg
sacharoza	1000 mg
tangerinová příchuť	100 mg
yohimbin	5 mg
guarana	500 mg
damiana	500 mg
kyselina jablečná	50 mg
granulovaný manitol q.s. do	3000 mg

Přípravek podle vynálezu může navíc obsahovat vitaminy, kovy, koenzymy, anorganické nebo organické antioxidanty nebo jejich prekurzory.

Patentové nároky

1. Přípravek pro zdravotní výživu vhodný ke zlepšení a léčbě stavů neklidu způsobeného stresem vyznačující se tím, že sestává z následující kombinace:
 - (a) L-karnitin nebo alkanoyl-L-karnitin, ve kterém má lineární nebo rozvětvený alkanoyl 2 až 8, lépe 2 až 6 uhlíkových atomů nebo jedna z jejich farmakologicky přijatelných solí;
 - (b) směs přírodních rostlinných přípravků;
 - (c) sójový lecitin;
 - (d) kyselina jablečná.
2. Přípravek podle nároku 1 vyznačující se tím, že alkanoyl-L-karnitin se vybírá ze skupiny sestávající z acetyl-, propionyl-, butyryl-, valeryl- a isovelarylkarnitinu nebo jedné z jeho farmakologicky přijatelných solí.
3. Přípravek podle nároku 1 vyznačující se tím, že přírodní extrakty se vybírají ze skupiny sestávající z přírodního extraktu Corynanthe yohimbe nebo yohimbinu, přírodního extraktu Panax ginseng nebo ginsenga, přírodního extraktu Paullinia cupana nebo guarany a přírodního extraktu Turnera diffusa nebo damianu.
4. Přípravek podle nároku 3 vyznačující se tím, že vzájemný hmotnostní poměr L-karnitinu nebo alkanoyl-L-karnitinu ke ginsengu, yohimbinu, guaraně a damianu se pohybuje v mezích od 1:0,1:0,0025:0,1:0,1 do 1:10:0,25:100:100.
5. Přípravek podle nároku 4 vyznačující se tím, že jmenovaný poměr je 1:1:0,025:1:1.
6. Přípravek podle nároků 1 až 5 vyznačující se tím, že obsahuje dále vitaminy, kovy, koenzymy, anorganické nebo organické antioxidanty nebo jejich prekurzory.

28.04.00

- 8 -

7. Použití přípravků podle nároků 1 až 6 k léčbě sexuální impotence způsobené stresem nebo psychicky.
8. Použití přípravků podle nároků 1 až 6 k léčbě stavů vyčerpání, nedostatku sil nebo asthenie způsobených stresem.
9. Přípravek podle nároků 1 až 6, vyznačující se tím, že je ve formě tuhé, polotuhé, tekuté, polotekuté, prášku, zrn, tablet, tobolek, granulí nebo prášku pro orální použití.