



(19)
Bundesrepublik Deutschland
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) **DE 10 2006 062 264 A1** 2008.06.26

(12)

Offenlegungsschrift

(21) Aktenzeichen: **10 2006 062 264.2**

(22) Anmeldetag: **22.12.2006**

(43) Offenlegungstag: **26.06.2008**

(51) Int Cl.⁸: **A61K 31/122** (2006.01)

A61K 31/121 (2006.01)

A61P 1/16 (2006.01)

A61P 31/20 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

(71) Anmelder:

**Joh. Barth & Sohn GmbH & Co. KG, 90482
Nürnberg, DE**

(74) Vertreter:

Stippl Patentanwälte, 90482 Nürnberg

(72) Erfinder:

Hellerbrand, Claus, Dr., 93053 Regensburg, DE

(56) Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht
gezogene Druckschriften:

EP 16 66 051 A2

WO 07/0 21 694 A2

WO 07/0 16 578 A2

**JP 2006306800 AA und Ansprüche sowie
Beschreibung**

als Computer-Übersetzung;

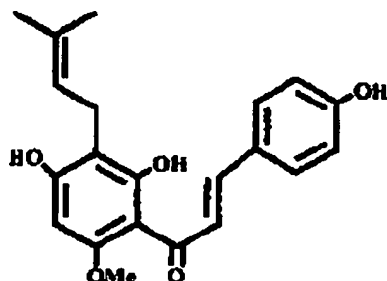
**Buckwold, V.E. [u.a.]: Antiviral activity of hop
constituents against a series of DNA and RNA
viruses, In: Antivir. Res., 2004, Vol. 61, S. 57-
62;**

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

Prüfungsantrag gemäß § 44 PatG ist gestellt.

(54) Bezeichnung: **Verwendung von Xanthohumol zur Vorbeugung und/oder Bekämpfung von Lebererkrankungen**

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft
die Verwendung von Xanthohumol mit der Formel



als Wirkstoff für die Herstellung eines Präparats zur Vor-
beugung und/oder Bekämpfung von Lebererkrankungen.

Beschreibung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol als Wirkstoff zur Vorbeugung und/oder Bekämpfung von Lebererkrankungen.

Stand der Technik

[0002] Xanthohumol ist ein Prenylflavenoid, welches im Hopfen vorkommt. Verschiedene Untersuchungen zeigen biologische Effekte von Xanthohumol.

[0003] So wird beispielsweise in der EP 1 543 834 A1 die anti-karzenogene Wirkung von Xanthohumol beschrieben.

[0004] Aus der EP 0 679 393 B1 ist bekannt, dass Xanthohumol eine stark inhibierende Wirkung gegenüber einer Knochenresorption aufweist und daher als Mittel zur Behandlung von Osteoporose eingesetzt werden kann.

[0005] Die DE 103 08 864 A1 beschreibt ein neues Brauverfahren, mit dem ein Bier hergestellt werden soll, welches aufgrund eines besonderen Brauverfahrens einen erhöhten Anteil an Xanthohumol und damit gesteigerte gesundheitsfördernde Wirkungen begründet.

Aufgabenstellung

[0006] Die vorliegende Erfindung hat sich zur Aufgabe gestellt, weitere gesundheitsfördernde Anwendungen von Xanthohumol sowie Isoxanthohumol aufzufinden.

[0007] Diese Aufgabe wird durch die Verwendung von Xanthohumol als Wirkstoff für die Herstellung eines Präparats zur Vorbeugung und/oder Bekämpfungen von Lebererkrankungen gelöst.

[0008] Die vorstehende Aufgabe wird ferner durch die Verwendung von Isoxanthohumol als Wirkstoff für die Herstellung eines Präparats zur Vorbeugung und/oder Behandlung von Lebererkrankungen gelöst.

[0009] Die beanspruchte Verwendung hat den Vorteil, dass Lebererkrankungen unter Verwendung eines natürlichen Wirkstoffs sowohl präventiv als auch durch Behandlung wirksam vermieden bzw. bekämpft werden können. Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol haben keinerlei Nebenwirkungen. Dies ermöglicht es, wirkungsvoll über eine lange Zeit chronischen Lebererkrankungen, insbesondere chronischen Lebererkrankungen durch regelmäßige Einnahme, prophylaktisch vorzubeugen.

[0010] Ganz besonderes gut geeignet ist Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol zur Vorbeugung oder akuten Behandlung von Leberzirrhose oder Leberfibrose. Es hat sich bei Untersuchungen überraschend herausgestellt, dass Xanthohumol Stoffwechselmechanismen hemmt, die von ganz besonderer Bedeutung für die durch Adipositas (Übergewicht) und Diabetes vermittelte Leberschädigung sind. Adipositas und Diabetes sind für einen großen Teil der Leberzirrhosen verantwortlich. Die Tendenz ist steigend. Insgesamt stellen chronische Lebererkrankungen mittlerweile ein bedeutendes wirtschaftliches Problem dar. Durch kontinuierliche Einnahme von Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol kann ein wirksamer prophylaktischer Schutz ohne Nebenwirkungen für die gesamte Bevölkerung aufgebaut werden.

[0011] Weiterhin haben Untersuchungen gezeigt, dass Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol auch antivirale Eigenschaften besitzen und gegen Hepatitis, insbesondere gegen Hepatitis B und Hepatitis C sehr gute Wirkung zeigen. Bei Hepatitis B oder Hepatitis C handelt es sich um die häufigste Ursache für die Entstehung chronischer Lebererkrankungen. Epidemiologische Untersuchungen in Deutschland haben gezeigt, dass ca. 2% der Bevölkerung an einer chronischen Hepatitis B oder Hepatitis C leiden. Es handelt sich hierbei also ebenfalls um ein Problem von zentraler gesellschaftlicher Bedeutung. Durch die prophylaktische Aufnahme von Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol kann somit einerseits der Anteil an Hepatitis-Erkrankungen, d. h. Erkrankungen an Hepatitis B bzw. C wirksam reduziert werden, andererseits der Verlauf einer bereits bestehenden Hepatitis-Erkrankung günstig beeinflusst werden.

[0012] Für die Behandlung der Leberfibrose gibt es derzeit noch keine gesicherten Therapieformen. Eine Inhibierung bzw. ein Stopp der Fibrosierung kann nur durch die Eliminierung der schädigenden Ursache, also z. B. im Fall von Hepatitis-Virus-Infektion durch Eliminierung der Hepatitis-Viren erreicht werden. Die Eliminierung

der schädigenden Ursache gelingt jedoch nur bei einem Teil der Patienten mit chronischen Lebererkrankungen bzw. ist bei Patienten mit genetischen Lebererkrankungen derzeit generell nicht möglich. Im Falle von Hepatitis-Virus-Infektionen ist hier bisher ein Einsatz von Medikamenten mit starken Nebenwirkungen erforderlich. Selbst bei Einsatz solcher Medikamente wird lediglich bei einem Teil der Patienten eine Virus-Elimination erreicht. Der Einsatz von Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol kann hier erfreulicherweise Abhilfe schaffen.

[0013] Schließlich besitzt Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol auch anti-karzenogene Effekte. Für Leberkrebs bzw. hepatozelluläres Karzinom (HCC) gibt es derzeit neben der chirurgischen Methode keine gesicherte Therapie, die das Überleben der Patienten verbessern würde. Derzeit kann durch chirurgisches Entfernen ein Erfolg lediglich bei einem sehr kleinen Teil der HCC-Patienten erreicht werden, da das HCC meist bei Diagnosestellung schon zu groß ist oder Metastasen ausgebildet hat. Es hat sich gezeigt, dass Xanthohumol gegen Leberkrebs therapeutisch eingesetzt werden kann.

[0014] Zusätzlich kann das Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol gerade bei Personen mit einem hohen Risikoprofil (genetisches Risiko, Adipösen, Diabetiker) prophylaktisch eingesetzt werden.

[0015] Was die Darreichung anbelangt, ist gemäß der Erfindung eine Verwendung dahingehend vorgesehen, dass das Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol als wirksamer Bestandteil einer pharmazeutischen Zusammensetzung mit einem pharmazeutisch annehmbaren Träger wie z. B. Mannit, Saccharose, Laktose, Glukose, Fructose, Maltose usw. zugeführt werden.

[0016] Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol eignet sich ganz besonders dafür, als Wirkstoff einem Nahrungsmittel beigelegt zu werden bzw. einem Getränk beigelegt zu werden.

[0017] Hinsichtlich der Gewinnung von Xanthohumol aus Hopfenpflanzen wird auf die EP 0 679 393 B1 und die EP 1 543 834 A1 vollinhaltlich verwiesen.

Beispiel 1

[0018] Nachstehend wird eine beispielhafte Zusammensetzung eines Arzneimittels wiedergegeben.

Pulvermischung zur Direktverpressung

Xanthohumol (Reinsubstanz)	5 g
Mikrokristalline Zellulose	10 Gew.%
Natriumcarboxymethylstärke	3 Gew.%
Hochdisperses Siliciumdioxid	1 Gew.%
Magnesiumstearat	1 Gew.%
Tablettose (Lactose-Monohydrat)	Rest auf 100 Gew.%

Beispiel 2

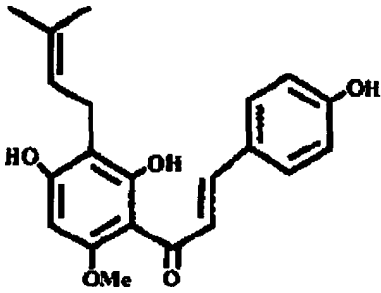
[0019] Nachstehend wird eine beispielhafte Zusammensetzung eines Nahrungsmittels mit hinzugefügtem Xanthohumol als Wirkstoff wiedergegeben.

Xanthohumol (Reinsubstanz in Pulverform) 500 mg pro 200 ml
Milchprodukt (cremig, z. B. Joghurt)

[0020] Die obige Zusammensetzung für ein Nahrungsmittel erlaubt aufgrund der einfach durchzuführenden Beimengung in ein cremiges Nahrungsmittel eine für die erforderliche Menge von Xanthohumol optimale Darreichung.

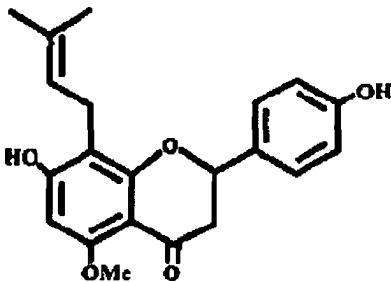
Patentansprüche

1. Verwendung von Xanthohumol mit der Formel



als Wirkstoff für die Herstellung eines Präparats zur Vorbeugung und/oder Bekämpfung von Lebererkrankungen.

2. Verwendung von Isoxanthohumol mit der Formel



als Wirkstoff für die Herstellung eines Präparats zur Vorbeugung und/oder Bekämpfung von Lebererkrankungen.

3. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass es sich bei der Lebererkrankung um Leberzirrhose oder Leberfibrose handelt.

4. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass es sich bei der Lebererkrankung um eine virale Leberentzündung, insbesondere um Hepatitis, insbesondere um Hepatitis B oder Hepatitis C handelt.

5. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass es sich bei der Lebererkrankung um die nicht-alkoholische Steatosis-Hepatitis (NASH) handelt.

6. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass es sich bei der Lebererkrankung um Leberkrebs handelt.

7. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass das Xanthohumol oder Isoxanthohumol als wirksamer Bestandteil einer pharmazeutischen Zusammensetzung mit einem pharmazeutisch annehmbaren Träger zugeführt wird.

8. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass das Xanthohumol oder Isoxanthohumol als Wirkstoff einem Nahrungsmittel beigegeben ist.

9. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass das Xanthohumol bzw. Isoxanthohumol als Wirkstoff einem Getränk beigegeben ist.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen