



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **108536** (13) **U**
(51) МПК (2016.01)
A61K 36/00
A61P 3/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: u 2015 12750	(72) Винахідник(и): Левицький Анатолій Павлович (UA), Макаренко Ольга Анатоліївна (UA), Селіванська Ірина Олександрівна (UA), Фурдичко Анастасія Іванівна (UA), Ступак Олена Павлівна (UA), Деньга Оксана Василівна (UA)
(22) Дата подання заявки: 23.12.2015	
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: 25.07.2016	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 25.07.2016, Бюл.№ 14	(73) Власник(и): ДЕРЖАВНА УСТАНОВА "ІНСТИТУТ СТОМАТОЛОГІЇ АМН УКРАЇНИ", вул. Рішельєвська, 11, м. Одеса, 65026 (UA)

(54) АНТИДИСБІОТИЧНИЙ ЗАСІБ "ЛЕКВИН"

(57) Реферат:

Антидисбіотичний засіб містить кверцетин, інулін і цитрат кальцію. Додатково містить лецитин.

UA 108536 U

Корисна модель належить до медицини і стосується засобів для профілактики та лікування дисбіотичних хвороб, до яких належать найбільш поширені неінфекційні захворювання (такі як атеросклероз, ожиріння, цукровий діабет 2 типу, пародонтит та інші) [Сердюк А. М., Полька Н. С., Гуліч М. П. Профілактика неінфекційних захворювань, що пов'язані зі способом життя, особливостями харчування та фізичною активністю, - вагомий напрям національної стратегії охорони здоров'я населення України // Журнал АМН України. 2010. - т. 16, № 2. - С. 299-306].

Серед антидисбіотичних засобів, які вже використовуються в медицині, можна назвати препарати про-, пре- і синбіотиків [Левицький А. П., Волянський Ю. Л., Скидан К. В. Пребиотики и проблема дисбактериоза // Харьков: ЭДЭНА, 2008.-100 с., Левицкий А. П. Применение антидисбиотических средств в стоматологии // Вісник стоматології. - 2014. - № 4 (89). - С. 89-92.], екстракти з листя пшениці (Левицький А. П., Макаренко О. А., Деньга О. В., Деньга А. Э., Лепский Влад. В., Ленский Вяч. В. Фитоадаптогены в профилактике и лечении кариеса зубов // Одесса: КП ОГТ, 2013.-120 с.), винограду [Левицький А. П., Селиванская И. А., Воронкова А. В., Гончарук С. В., Левченко Е. М. Сравнительная лечебная эффективность оральных аппликаций мукозальных гелей с про- и пребиотиками у крыс с экспериментальным дисбиозом // Актуальные проблемы транспортной медицины.-2013. -№ 4 (34). -С. 118-123.], дисахарид лактулоза [Меркулова Ю. В. Фармакологические свойства и клинические аспекты применения препаратов лактулозы // Фармаком.-2007. - № 3. -С. 37-46.].

Найближчим аналогом до ангидисбіотичного засобу може бути препарат "Квертулін" (Патент № 71429 МПК А61Р 1/16. Гепатопротектор ("Квертулін") / А.П.Левицький, О. М.Левченко, М.І. Скідан [та ін.]. - Заявка № у 2012 00359 від 12.01.2012. -Опубл. 10.07.2012. - Бюл. № 13), що містить пребіотик інулін, біофлавоноїд кверцетин і цитрат кальцію. Однак, недоліком квертуліну є те, що кверцетин, який входить до його складу, дуже мало розчиняється у водних середовищах і тому ступінь його всмоктування недостатньо висока.

Засвоюваність кверцетину збільшується в присутності поверхнево-активних речовин [Andersen O. M., Markham K. R. Flavonoids: chemistry, biochemistry and application. - Tayler and Francis CRC Press, 2005.-1256 p.]. Однією з таких речовин може бути лецитин - природна сполука, яка входить до складу мембран і ліпопротеїдів [Andersen O. M., Markham K. R. Flavonoids: chemistry, biochemistry and application. - Tayler and Francis CRC Press, 2005.-1256 p., Звягинцева Т. В., Чернобай А. И., Дергачева А. В. Эссенциальные фосфолипиды в гастроэнтерологии // Сучасна гастроентерологія.-2004. - № 2. - С. 51-56.].

В основу корисної моделі поставлена задача удосконалення антидисбіотичного засобу шляхом включення до його складу додаткового компоненту з ряду поверхнево-активних речовин, здатних підвищувати ступінь всмоктування кверцетину, що дозволить отримати засіб високої антидисбіотичної і протизапальної дії.

Поставлена задача вирішується тим, що антидисбіотичний засіб "Леквин" то містить пребіотик інулін, біофлавоноїд кверцетин, цитрат кальцію, згідно з корисною моделлю додатково містить соняшниковий лецитин у наступному співвідношенні компонентів (у %):

кверцетин	0,6-1,0
інулін	31-37
лецитин	25-35
цитрат кальцію	до 100.

Оптимальна рецептура "Леквину" встановлена дослідниками.

Причинно-наслідкові зв'язки:

Введення до складу засобу лецитину - за рахунок цього підвищується засвоюваність кверцетину, що дозволить отримати засіб високої антидисбіотичної і протизапальної дії.

Дослідження антидисбіотичної дії запропонованого препарату та прототипу було здійснено на щурах, у яких викликали експериментальний дисбіоз за допомогою лінкоміцину і вживання високожирового раціону (вміст жиру 20 %). Із першого дня досліді протягом 20 днів тварини отримували per os "Леквин" або препарат прототипу "Квертулін".

Після евтаназії щурів на 21-й день досліді в гомогенатах печінки, слизовій тонкої кишки і ясен визначали ступінь дисбіозу за Левицьким (за співвідношенням відносних активностей уреазі і лізоциму). Крім того, визначали рівень біохімічного маркера запалення - вміст малонового діальдегіду (МДА).

Відповідні дані наведено в таблицях 1 і 2. Як видно з цих даних, "Леквин" має антидисбіотичною активністю, не поступаючись квертуліну, а в слизовій оболонці тонкої кишки навіть суттєво її перевищуючи.

Таблиця 1

Вплив препарату "Леквин" на ступінь дисбіозу
в тканинах щурів з експериментальним дисбіозом

№№ пп	Групи	Ступінь дисбіозу		
		печінка	тонка кишка	ясна
1	Норма	1,00±0,25	1,00±0,25	1,00±0,25
2	Дисбіоз	5,18±0,60 p<0,001	4,72±0,39 p<0,001	1,88±0,30 p<0,05
3	Дисбіоз + Леквин	2,06±0,31 p<0,05 p ₁ <0,01	2,47±0,29 p<0,05 p ₁ <0,05	1,25±0,26 p>0,3 p ₁ >0,05
4	Дисбіоз + квертулін	2,63±0,35 p<0,05 p ₁ <0,05 p ₂ >0,3	4,18±0,35 p<0,001 p ₁ >0,3 p ₂ <0,05	1,35±0,26 p>0,3 p ₁ >0,05 p ₂ >0,5

Примітки: p - в порівнянні з групою 1; p₁ - в порівнянні з групою 2; p₂ - в порівнянні з групою 3.

Таблиця 2

Вплив препарату "Леквин" на вміст МДА
в тканинах щурів з експериментальним дисбіозом

№№ пп	Групи	МДА, ммоль/кг		
		печінка	тонка кишка	ясна
1	Норма	13,6±0,6	7,8±0,2	10,9±0,6
2	Дисбіоз	15,4±0,6 p<0,05	8,8±0,3 p<0,05	14,7±0,4 p<0,001
3	Дисбіоз + Леквин	13,7±0,7 p>0,6 p ₁ >0,05	7,9±0,3 p>0,6 p ₁ <0,05	11,1±0,5 p>0,5 p ₁ <0,01
4	Дисбіоз + квертулін	14,0±0,6 p>0,3 p ₁ >0,05 p ₂ >0,05	8,0±0,3 p>0,3 p ₁ >0,05 p ₂ >0,8	12,0±0,2 p<0,05 p ₁ <0,05 p ₂ <0,05

Примітки: p - в порівнянні з групою 1; p₁ - в порівнянні з групою 2; p₂ - в порівнянні з групою 3;

"Леквин", на відміну від квертуліну, більш ефективно впливає на рівень МДА, що свідчить про його високу протизапальну дію, за якою він значно перевищує квертулін.

- 5 Таким чином, запропонований засіб "Леквин" має суттєві переваги в антидисбіотичній і протизапальній дії, що дає підстави для його широкого використання в медицині, як профілактичного засобу при неінфекційних захворюваннях.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

10

Антидисбіотичний засіб, що містить кверцетин, інулін і цитрат кальцію, який **відрізняється** тим, що додатково містить лецитин, в такому співвідношенні, мас. %:

кверцетин 0,6-1,0
инулін 31-37
лецитин 25-35
цитрат кальцію решта до 100.

Комп'ютерна верстка О. Гергіль

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601