



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **112106**

(13) **U**

(51) МПК

**A61K 33/06** (2006.01)

**A61K 33/14** (2006.01)

**A61K 33/18** (2006.01)

**A61K 31/74** (2006.01)

**A61P 31/12** (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ**

(21) Номер заявки: **u 2016 03154**

(22) Дата подання заявки: **28.03.2016**

(24) Дата, з якої є чинними  
права на корисну  
модель: **12.12.2016**

(46) Публікація відомостей  
про видачу патенту: **12.12.2016, Бюл.№ 23**

(72) Винахідник(и):

**Владико Володимир Петрович (UA),  
Нижник Володимир Васильович (UA),  
Кеба Микола Олександрович (UA),  
Нижник Василь Володимирович (UA),  
Соловйов Анатолій Іванович (UA)**

(73) Власник(и):

**Владико Володимир Петрович,  
вул. Пролетарська, 25, с. Рокитне,  
Яготинський р-н, Київська обл., 07713 (UA),  
Нижник Василь Володимирович,  
вул. Святошинська, 6, кв. 47, м. Київ, 03115  
(UA)**

**(54) АНТИВІРУСНА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ**

(57) Реферат:

Антивірусна фармацевтична композиція містить кристалічний йод, йодид калію, хлорид літію, декстрин, хлорид натрію, полівініловий спирт, воду для ін'єкцій. Вона додатково містить хлорид магнію.

**UA 112106 U**



Корисна модель належить до медицини і загальної хімії та стосується фармацевтичної композиції, що має антивірусну дію, та може бути застосована в терапевтичній практиці як ефективний препарат проти вірусних захворювань.

Відома достатньо велика кількість медичних препаратів, що містять як активний компонент вільний хімічний елемент або іон. Найпростішим прикладом є препарати на основі вільного йоду, оскільки давно відомими є його властивості навіть при розведенні до 1:1000 забезпечувати потужний антивірусний та антибактеріальний ефект. Найпоширенішим препаратом є розчин Люголя та його модифікації. Препарати йоду мають дуже широкий спектр дії, починаючи з поверхневої дезінфекції ран і до гормональної терапії.

Відомий препарат "Арменікум" (патент WO 01/78751 A1, опубл. 25 жовтня 2001 року), в якому описаний багатокомпонентний колоїдно-полімерний розчин, що містить йод, літій і комплексний полімер. Колоїдним компонентом "Арменікуму" є полісахариди, водорозчинні синтетичні полімери і їх комплекси. Одним з активних компонентів препарату є йод.

Склад "Арменікуму", мас. %:

кристалічний йод	0,06-0,08
йодид калію	0,9-1,2
декстрин	5,0-10,0
хлорид літію	0,001-0,002
хлорид натрію	0,4-0,6
полівініловий спирт	0,1-0,3
вода для ін'єкцій	решта.

Препарат "Арменікум" зареєстровано в Україні, № UA/5458/01/01, Наказ № 777 від 28.11.2006 р. Препарат "Арменікум" зареєстрований для лікування тільки ВІЛ-інфекції.

До недоліків препарату "Арменікум" можна віднести те, що коли він починає діяти в клітині крові, то іони йоду послаблюють клітину, що в цілому погано діє на організм людини. Літій має властивість витіснити магній з біохімічних систем організму людини. Внаслідок чого дія препарату "Арменікум" є не дуже ефективною для пацієнтів з ослабленим станом здоров'я, які хворіють на хронічні вірусні захворювання.

В основу запропонованої корисної моделі поставлено задачу створення композиції, що має антивірусну дію, та може бути застосована в терапевтичній практиці, як ефективний препарат проти вірусних захворювань та суттєвим покращенням стану хворих після проведення антивірусної терапії.

Поставлена задача вирішується тим, що антивірусна фармацевтична композиція містить кристалічний йод, йодид калію, хлорид літію, декстрин, хлорид натрію, полівініловий спирт, воду для ін'єкцій. Згідно з корисною моделлю, додатково містить хлорид магнію, в наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

кристалічний йод	0,06-0,08
йодид калію	0,9-1,2
декстрин	5,0-10,0
хлорид літію	0,001-0,002
хлорид натрію	0,4-0,6
хлорид магнію	0,4-0,6
полівініловий спирт	0,1-0,3
вода для ін'єкцій	решта.

Причинно-наслідковий зв'язок між новими суттєвими ознаками і очікуваним технічним результатом полягає в наступному:

Застосування магнію в запропонованій антивірусній фармацевтичній композиції дозволить ефективно лікувати вірусні захворювання, таких як грип, герпес, вірус Епштейна-Барр, гепатит С.

Магній - один з найпоширеніших елементів, що зустрічаються в природі, що входить до складу хлорофілу, бере активну участь в розвитку організму, є невід'ємною частиною безлічі процесів: від формування кісткової тканини і енергетичного обміну, до відлагодженої роботи нервової системи.

Магній впливає на травлення, імунну систему, формування кісток, процес утворення нових клітин, роботу м'язових тканин, нирок, серця, мозку, допомагає при передачі нервових імпульсів.

20 % магнію знаходиться в м'язах, 19 % в інших енергоємних органах організму (мозок, серце, печінка, нирки та ін.) і 1 % в позаклітинній рідині.

У крові 60-75 % магнію знаходиться в іонізованій формі.

Магній також бере участь у формуванні ферментів і біологічно активних речовин, синтезі білка, виробленні енергії і передачі нервових імпульсів, зменшує здатність згущуватися крові,

підвищуючи стійкість еритроцитів, що, у свою чергу, покращує доставку кисню в тканини організму.

Катіон магнію активізує більше 300 систем ферментів в організмі людини, залучених в метаболізм вуглеводів, ліпідів, білків і ДНК, взаємодіючи або з субстратом або з ферментом безпосередньо. Через високу спорідненість  $Mg^{2+}$  до фосфату він залучений також у всі процеси фосфорилування, де АТФ існує як  $[ATP \cdot Mg^{2+}]$  комплекс і тому він виконує ключову роль в метаболізмі енергії.

Mg - так само формує комплекси і з фосфоліпідами клітинних мембран, сприяючи цим клітинній структурі в цілому.

При гіпомагніємії відбувається уповільнення практично усіх життєвих процесів на клітинному рівні, що пов'язано з порушенням вільного переміщення іонів мінералів (переважно магнію і калію).

Нестача магнію знижує імунітет, опірність інфекціям та вірусам, стійкість до стресів, запальних процесів, провокує зменшення профіцит антитіл в клітинах, що знищують віруси. Послаблення організму в результаті дефіциту магнію відбувається із-за припинення вироблення антитіл і фагоцитів, покликаних знищувати хвороботворні бактерії та віруси. Окрім цього дефіцит магнію в організмі спричиняє пригнічення синтезу фагоцитів, як одного з активних факторів елімінації вірусів позаклітинного простору.

Пропонована корисна модель забезпечує нову антивірусну фармацевтичну композицію, що складається з активного компонента, яким є вільний хімічний елемент і/або речовина, що здатна утворювати іони, комплексоутворювача, що може зв'язуватись з активним компонентом або іоном, який він утворює, донору іону магнію та допоміжних фармацевтично прийнятних речовин. Несподівано виявилось, що така композиція забезпечує значно кращі терапевтичні якості за рахунок синергічного ефекту її складових компонентів. Такими якостями є значно підвищена активність та стійкість активної речовини, знижена токсичність композиції та можливість її внутрішньовенного введення.

Композиція за цією корисною моделлю є колоїдно-полімерним розчином, в якому розчинені неорганічні речовини. Активним компонентом є вільний хімічний елемент і/або речовина, що здатна утворювати іони, при чому він одночасно може знаходитися в декількох формах - молекулярній, іонній, комплексній за рахунок різноманітних реакцій, що проходять в розчині.

Дана нова форма біологічно активної речовини, так само як і вільний активний компонент може корелювати нормальний перебіг біохімічних реакцій вірусу, шляхом блокування дії синтезу життєво необхідних для них білків, ферментів або модифікації інформації, що несе РНК або ДНК вірусу.

Присутність комплексоутворювача, що може координувати молекули та іони за рахунок донорно-акцепторних взаємодій по типу цвітер-іонів, забезпечує знижену токсичність активного компонента, його більшу стійкість, зокрема до гідролізу, пролонгованість дії та інші властивості. При введенні препарату у кров протікає взаємопроникнення його структур та крові з вірусами або бактеріальними клітинами, що в ній містяться, а також відбувається транспорт препарату до місця локалізації вірусів в тих чи інших органах.

Іони літію та магнію, що генерує донор таких іонів, покращує провідність клітинних мембран та сприяє латеральній дифузії в бішарі клітинних мембран за рахунок малих розмірів катіонів.

Наприклад, коли активним компонентом є вільний йод, то молекули йоду та трийодид-іони, координовані в просторову сітку за допомогою комплексоутворювача, йодують  $>N-H$  і  $-NH_2$  групи пуринових та пірамідонових основ, що входять до складу нуклеїнових кислот вірусів та бактерій, ефективно пригнічуючи їх реплікацію.

Таким чином, об'єктом цієї корисної моделі є фармацевтична композиція, що складається з активного компонента, яким є вільний хімічний елемент і/або речовина, що здатна утворювати іони, комплексоутворювача, що може зв'язуватись з активним компонентом або іоном, який він утворює, донора іону літію та іони магнію та допоміжних фармацевтично прийнятних речовин. Антивірусна фармацевтична композиція за даною корисною моделлю має сильну антивірусну дію, та може застосовуватись внутрішньовенно.

Проведені *in vitro* та *in vivo* дослідження пропонованої фармацевтичної композиції на моделі вірусу простого герпесу 1-го типу. Встановлено показники цитотоксичності, противірусної активності та відповідно визначений хіміотерапевтичний індекс дозволяє віднести дану композицію до перспективних противірусних препаратів. На моделі герпетичного менінгоенцефаліту мишей при внутрішньочеревному введенні антивірусної фармацевтичної композиції виявлено противірусну активність з зниженням титру вірусу. Встановлено зниження смертності тварин в порівнянні з контрольною групою тварин інфіковані вірусом без додавання препарату на 75,7 %.

Попередньо проведені дослідження дозволили встановити оптимальну концентрацію хлориду магнію, а саме 0,4-0,6 %. Прорівняльний аналіз композицій без додавання та з додаванням хлориду магнію дозволив встановити, що саме остання фармацевтична композиція мала виражений противірусний і стабільний ефект саме в діапазоні вказаних концентрацій.

5

Таблиця

Противірусна активність антивірусної фармацевтичної композиції на моделі герпесвірусного менингоенцефаліту мишей

Композиція	Розведення композиції	Кількість мишей	Загинуло	Летальність (%)	КЗ	ІЕ%
Досліджувана антивірусна фармацевтична композиція	1:10	20	5	24+9,7	4,1	75,7
	1:50	20	8	40+9,1	2,5	60,9
	1:100	20	11	57+8,8	1,8	44,4

КЗ (Коефіцієнт захисту);  
ІЕ (Індекс ефективності).

Технічний результат полягає в створенні фармацевтичної композиції, що має виражену противірусну активність і може бути запропонована в терапевтичній практиці.

10

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

Антивірусна фармацевтична композиція, що містить кристалічний йод, йодид калію, хлорид літію, декстрин, хлорид натрію, полівініловий спирт, воду для ін'єкцій, яка **відрізняється** тим, що додатково містить хлорид магнію, в наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

кристалічний йод 0,06-0,1  
йодид калію 0,9-1,5  
декстрин 5,0-12,0  
хлорид літію 0,001-0,006  
хлорид натрію 0,4-0,9  
хлорид магнію 0,4-0,9  
полівініловий спирт 0,1-0,6  
вода для ін'єкцій решта.

15

Комп'ютерна верстка Т. Вахричева

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