



(51) МПК
A23L 1/30 (2006.01)
A23L 1/304 (2006.01)
A23L 1/076 (2006.01)

**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
 ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21)(22) Заявка: **2009144461/13, 30.11.2009**

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
30.11.2009

Приоритет(ы):

(22) Дата подачи заявки: **30.11.2009**

(45) Опубликовано: **27.02.2011** Бюл. № 6

(56) Список документов, цитированных в отчете о поиске: **RU 2002120548 А, 10.04.2004. RU 2287334 С2, 20.11.2006. ХАСМАТУЛЛИНА Н.З. Апитерапия. - Пермь: Мобиле, 2005, с.158, 220. RO 119924 В1, 30.06.2005.**

Адрес для переписки:

111250, Москва, ул. Авиамоторная, 53, ЗАО "Патентный поверенный", Г.Н.Андрущак

(72) Автор(ы):

Елистратов Дмитрий Геннадьевич (RU)

(73) Патентообладатель(и):

Общество с ограниченной ответственностью "Парафарм" (RU)

(54) БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНАЯ ДОБАВКА К ПИЩЕ ДЛЯ ПРОФИЛАКТИКИ ЗАБОЛЕВАНИЙ ОСТЕОПОРОЗОМ

(57) Реферат:

Изобретение относится к биологически активным добавкам (БАД) к пище и предназначено для профилактического воздействия при состояниях, связанных с остеопорозом. БАД к пище представляет собой, в мас. %: соединение кальция, выбранное из ряда: кальция карбонат, кальция цитрат, кальция глюконат, кальция аспартат, фосфат кальция и лимоннокислый кальций - 16,25-

93,75; трутневый расплод - 6,25-83,33. БАД к пище выполнена в порошкообразном, таблетированном или капсулированном виде. Изобретение позволяет получить БАД к пище, поддерживающий нормальный уровень тестостерона в организме, обеспечивающей эффективное усвоение кальция организмом и удержание его в костной ткани длительное время.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.
A23L 1/30 (2006.01)
A23L 1/304 (2006.01)
A23L 1/076 (2006.01)

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21)(22) Application: **2009144461/13, 30.11.2009**

(24) Effective date for property rights:
30.11.2009

Priority:

(22) Date of filing: **30.11.2009**

(45) Date of publication: **27.02.2011 Bull. 6**

Mail address:

**111250, Moskva, ul. Aviamotornaja, 53, ZAO
"Patentnyj poverennyj", G.N.Andrushchak**

(72) Inventor(s):

Elistratov Dmitrij Gennad'evich (RU)

(73) Proprietor(s):

**Obshchestvo s ogranichennoj otvetstvenost'ju
"Parafarm" (RU)**

(54) BIOLOGICALLY ACTIVE FOOD SUPPLEMENT FOR OSTEOPOROSIS PROPHYLACTICS

(57) Abstract:

FIELD: food industry.

SUBSTANCE: invention deals with biologically active food supplements and is intended for prophylactic impact in case of osteoporosis-related conditions. The biologically active supplement contains the following ingredients, wt %: a calcium compound selected from among calcium carbonate, calcium citrate, calcium gluconate, calcium aspartate and calcium acetate - 16.25-93.75; drone brood -

6.25-83.33. The biologically active supplement may be fabricated in the form of a powder, pills or capsules.

EFFECT: invention enables production of a biologically active supplement maintaining the normal level of testosterone in the organism providing for efficient assimilation of calcium by the organism and long-term retention of calcium in bone tissue.

2 ex

RU 2 4 1 2 6 1 6 C 1

RU 2 4 1 2 6 1 6 C 1

Изобретение относится к биологически активным добавкам (БАД) к пище и предназначено для профилактического воздействия при состояниях, связанных с остеопорозом.

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50

Всем известна проблема остеопороза (уменьшение количества кальция в костных структурах). Для ее решения применяются препараты кальция на основе: кальция карбонат, кальция цитрат, кальция глюконат, аспартат кальция, аскорбат кальция, аминоксидат кальция, фуемарат кальция, сукцинат кальция, фосфат кальция, лимоннокислого кальция и др. соединения. Известно, что препараты кальция усваиваются лучше с витамином Д. Поэтому известно много лекарственных средств, например таблетки кальция глюконат (номер регистрации Р №000140/02-2001 МЗ РФ), таблетки «Кальций-Д3 Никомед» (номер регистрации П №013478/01-2001) и другие.

Недостаток известных средств следующий:

- 1) к сожалению, все известные средства направлены только на увеличение поступления кальция в организм, а не направлены на устранение причин, по которым кальций начинает выводиться из костей;
- 2) при приеме препаратов кальция кальций может поступать не только в кости, но и в другие органы и системы, в частности кальцифицировать конкременты в почках, что вызывает проблему функционирования почек.

Т.е. лечение остеопороза препаратами кальция - это то же самое, что пытаться налить воду в дырявую бочку. Больше значение имеет не количество поступающего кальция, а способность организма усвоить его и использовать по назначению.

С другой стороны, известно, что в сохранении плотности минерального вещества костей как у молодых, так и у пожилых мужчин важную роль играют андрогены - мужские годовые гормоны. У мужчин с гипогонадизмом (то есть сниженным уровнем мужского полового гормона - тестостерона) отмечается более низкая плотность костей и более высокая частота переломов. Низкий уровень тестостерона является одной из причин остеопороза, то есть снижения минеральной плотности костей у мужчин, следовательно, представляет собой фактор риска возникновения переломов.

Уровень тестостерона в женском организме, в среднем, в 25 раз меньше, чем в мужском, поэтому даже незначительное падение уровня тестостерона ведет к остеопорозу. Этим еще объясняется то, что остеопорозом женщины болеют чаще, чем мужчины.

Мужские половые гормоны - андрогены (в первую очередь, тестостерон) оказывают на костную ткань как прямое, так и не прямое (опосредованное) действие. Прямое действие тестостерона на костную ткань определяет различия в строении мужского и женского скелетов. Непрямые эффекты тестостерона на костеобразование осуществляются опосредованно через действие эстрогенов, женских половых гормонов, которые образуются из андрогенов под воздействием фермента ароматазы. Поскольку основным эстрогеном в мужском организме является тестостерон, то снижение его секреции ведет и к снижению костной плотности.

Следовательно, у мужчин с диагностированным остеопорозом необходимо проведение гормонального обследования, включающего определение тестостерона, эстрадиола и секс-стероид-связывающего глобулина. В свою очередь, у всех мужчин с низким содержанием половых гормонов необходимо проведение денситометрии с целью выявления остеопороза.

Для лечения снижения костной плотности и остеопороза используются различные медикаментозные препараты - препараты кальция, витамина Д и бисфосфонаты.

Однако доказано, что эффективность данных препаратов минимальна, если уровень тестостерона остается пониженным, потому что именно тестостерон обеспечивает должное усвоение препаратов, направленных на восстановление костной плотности. Таким образом, лечение нарушений костной плотности должно быть комплексным, направленным как на восстановление дефицита (при его наличии) тестостерона, так и на прием препаратов кальция.

Однако при реализации этой теории возникли трудности с известными препаратами, поддерживающими уровень тестостерона в организме (например, тестостерона пропионат), т.к. все они требуют строжайшего медицинского контроля.

Причина в том, что препараты тестостерона отнесены к допингам и имеют много отрицательных воздействий на организм человека. При поступлении тестостерона извне в организм человека выработка организмом собственного тестостерона еще больше снижается. С другой стороны, как было показано выше, организм постоянно нуждается в поступлении кальция.

Поэтому целью данного изобретения является создание биологически активной добавки к пище постоянного приема, которая бы восполняла содержание кальция в организме, поддерживала уровень тестостерона в организме, а также способствовала лучшему усвоению кальция и удержанию его в организме.

Эта цель достигается тем, что предлагается БАД к пище для профилактики заболеваний остеопороза, представляющая собой, в мас. %:

соединение кальция, выбранное из ряда: кальция карбонат, кальция цитрат, кальция глюконат, кальция аспартат, фосфат кальция и лимоннокислый кальций - 16,67-93,75 трутневый расплод - 6,25-83,33.

Заявленная БАД к пище выполнена в порошкообразном, таблетированном или капсулированном виде.

Техническим результатом является получение БАД к пище, поддерживающей нормальный уровень тестостерона в организме, обеспечивающей эффективное усвоение кальция организмом и удерживание его в костной ткани длительное время, что, в свою очередь, способствует профилактике заболеваний остеопорозом.

Введение трутневого расплода объясняется следующим. Трутневый расплод - это донатор половых энтомологических гормонов: пролактина, эстрадиола, прогестерона, тестостерона - оказывающих стимулирующее действие на репродуктивные функции мужчин и женщин. Насыщенный гормонами и витаминами, не являющимися гормонозаменителями, трутневый расплод эффективен при нарушениях гормонального фона, выступает стимулятором центральных механизмов регуляции интенсивности образования андрогенов и исключает возможность заместительной терапии. Проведенные исследования в НИИ Пчеловодства г.Рыбное Рязанской области доказали безопасность применения трутневого расплода, с другой стороны, они доказали гонадотропный эффект от применения трутневого расплода со стимулирующей центральных звеньев, контролирующих синтез тестостерона. («Теория и средства апитерапии», Москва, 2007. Кривцов Н.И. и др.). Таким образом, использование трутневого расплода позволяет поддерживать уровень тестостерона в организме.

Хотя компоненты, входящие в состав заявляемой БАД к пище, известны в народной и традиционной медицине, но их сочетание в одном продукте из уровня техники не известно.

Совместное применение указанных компонентов обеспечивает более эффективное усвоение кальция организмом, поскольку кальций не только поступает, но и

благодаря трутневому расплоду удерживается в костной ткани. Нами обнаружена способность трутневого расплода повышать усвояемость кальция организмом и удерживать его в костной ткани длительное время, то есть обеспечивать пролонгированный эффект от введения кальция в костную ткань. Кроме того, введение кальция совместно с трутневым расплодом позволяет снизить дозировку соединений кальция, что исключит процесс камнеобразования в почках и другие негативные последствия приема препаратов кальция (например, расстройство желудочно-кишечного тракта).

Соотношение соединения кальция и трутневого расплода варьируется в широком диапазоне. Широта диапазона определяется индивидуальными параметрами человека: возрастом, полом, состоянием здоровья и др. факторами.

Известно, что верхний допустимый предел применения препаратов кальция составляет 1000-1500 мг в день. Совместное применение трутневого расплода и соединения кальция позволяет снизить суточную дозировку кальция, т.к. повышает биодоступность (усвояемость) кальция и препятствует резорбции кости (вымыванию кальция).

Исходя из выше сказанного, максимальное потребление кальция - 600 мг.

Минимальное потребление кальция определяется минимальной потребностью организма в ионизированном кальции - 200 мг.

Максимальное потребление трутневого расплода определяется целесообразностью применения и составляет 1000 мг.

Минимальное потребление трутневого расплода - 40 мг (см. RU 2233666 C1, 10.08.2004) и определяется фармакологической активностью.

Поэтому диапазон применения компонентов в составе предложенной БАД к пище следующий:

Трутневый расплод: 40 мг - 1000 мг или 6,25%-83,33%

Кальций: 200 мг - 600 мг или 16,67%-93,75%

Таким образом, совместное применение трутневого расплода и соединения кальция в добавке позволяет существенно уменьшить максимальное (верхнее) суточное потребление кальция с 1500 мг до 600 мг, что в свою очередь уменьшает побочное отрицательное влияние кальция на организм человека, расширяет круг лиц, которым возможно применять препараты кальция. Снижение МАХ суточного потребления дозы кальция необходимо, потому что при назначении препаратов кальция в дозах 1000-1500 мг очень часто возникает обратное заболевание - гиперкальцемия. Так у обследованных 1000 пациентов, длительно получающих препараты от остеопороза, у 86 человек была выявлена гиперминерализация 1-3 степеней тяжести (Струков В.И. «Актуальные проблемы остеопороза», Пенза, 2009, Ростра).

Указанное выше количественное соотношение позволяет обеспечить для каждого индивидуума оптимальное поступление кальция и его наиболее полное усвоение благодаря заявленному количеству трутневого расплода, которое обеспечивает в добавке определенное содержание сульфгидрильных групп ферментов, а также тестостерона, прогестерона, пролактина и эстрадиола. Трутневый расплод богат аминокислотами. Аминокислоты, в свою очередь, являются транспортерами кальция в клетку (Струков В.И. «Актуальные проблемы остеопороза», Пенза, 2009, Ростра). Для усвоения кальция требуются также витамины А, С, Е, Д и микроэлементы: магний, медь, цинк, фосфор. Все это есть в трутневом расплоде.

В результате этого, весь поступающий кальций полностью усваивается костной тканью. Неожиданно было установлено, что удержание кальция в костной ткани

пролонгированное время обеспечивается определенным количеством сульфгидрильных групп ферментов трутневого расплода, витаминами Д и Е, в результате которого процесс его вымывания замедляется. Кроме того, длительный период нормальной плотности костной ткани объясняется достаточно большим количеством фосфора в трутневом расплоде, который поступает в организм в указанном выше количестве, что способствует усвоению кальция.

Таким образом, впервые была решена задача не только насыщения костной ткани кальцием, но и пролонгированное его удержание в ней, за счет совместного использования препаратов кальция и трутневого расплода в заявленном соотношении. Значительно уменьшился риск переломов по соотношению с препаратами аналогами, так как повышение минеральной плотности кости на 5% снижает риск переломов на 35%, а дополнительные антирезорбтивные свойства заявленного средства понижают риск переломов еще на 20%.

Для получения заявленной биологически активной добавки к пище берут измельченное в порошок соединение кальция, выбранное из ряда: кальция карбонат, кальция цитрат, кальция глюконат, кальция аспарат, фосфат кальция, лимоннокислый кальций в количестве 16,67%-93,75% мас.% и смешивают с трутневым расплодом в количестве 6,25%-83,33% мас.% до однородности. Полученную смесь затем таблетуют или капсулируют. Биологически активная добавка представляет собой однородный порошок светло-бежевого цвета с влажностью 1-3,5%, который подвергают капсулированию или таблетированию. В таблетке или капсуле содержится 1 г смеси.

Для приготовления БАД к пище трутневый расплод используют в форме лиофилизата. Для получения лиофилизата личинки трутневого расплода гомогенизируют с помощью миксера. Гомогенат представляет собой густую сметанообразную жидкость желтого цвета и характерного запаха. Содержание сухого вещества в гомогенате составляет не более 22,5%. Лيوфилизат получают замораживанием гомогената в течение 2-3 часов при температуре минус 35-40°C с последующей сублимацией в вакууме при остаточном давлении 0,1-0,6 мм рт.ст. в течение 40-48 часов, с доведением температуры к концу сушки до 25-30°C. Лيوфилизат представляет собой порошок от бежевого до желтого цвета с высокой гигроскопичностью и остаточной влажностью 1-3,5%. Т.е. условия получения лиофилизата позволяют сохранить компонентный состав сухого вещества гомогената трутневого расплода без изменений, за исключением содержания влаги.

Примеры получения БАД к пище.

Пример 1

Берут измельченный в порошок кальция глюконат в количестве 17 кг и смешивают с 83 кг лиофилизата трутневого расплода. Смесь перемешивают до однородности, затем готовый продукт капсулируют.

Пример 2

Берут измельченный в порошок кальция карбоната в количестве 90 кг и смешивают с лиофилизатом трутневого расплода в количестве 10 кг. Смесь перемешивают до однородности, после чего таблетуют.

Для профилактики остеопороза БАД к пище принимают по 1 капсуле 3 раза в день в течение 1 месяца вне приема пищи. Перерыв в приеме составляет 1 месяц. В этот период содержание Са в сыворотке крови не снижается. То есть содержание Са поддерживается на нормальном уровне.

Указанный технический результат подтверждается следующим примером.

Пример 1. Испытуемая 1959 г.р. Определение минеральной плотности кости в дистальном отделе предплечья на аппарате денситометрии ДТХ-200 фирмы «Osteometr» показатель T -1,4. С диагнозом остеопения принимала глюконат кальция по 1 г 3 раза в день. Проведен 6-месячный курс профилактического приема. Повторно проведенные через 6 месяцев исследования выявили снижение плотности кости до T -1,6. Т.е. минеральная плотность кости (МПК) уменьшилась. После месячного перерыва приема содержания кальция в сыворотке крови ниже нормы.

Справочно: норма МПК - показания T-критерия от +1 до -1 стандартных отклонений от пиковой костной массы

Остеопения 1 степени - МПК от -1 до -1,5

Остеопения 2 степени - МПК от -1,5 до -2

Остеопения 3 степени - МПК от -2 до -2,5

Остеопороз 1 степени - МПК от -2,5 и менее без переломов

Остеопороз 2 степени - МПК от -2,5 и менее при наличии остеопоротических переломов костей.

T-шкала денситометра означает количество стандартных отклонений выше или ниже среднего показателя пика костной массы. T-критерий уменьшается параллельно с постепенным снижением костной массы при увеличении возраста, используется для оценки МПК у взрослых.

Пример 2. Та же испытуемая с диагнозом остеопения и показателем минеральной плотности кости T -1,6 принимала биологически активную добавку к пище по 1 капсуле 3 раза в день. Проведен 6-месячный курс профилактического приема по схеме 1 месяц приема, 1 месяц перерыв. Минеральная плотность кости возросла до T -1,2. Содержание Са в сыворотке крови нормализовалось. Повторно проведенные через 3 месяца исследования выявили то, что содержания кальция в сыворотке крови не снизилось.

Таким образом, предложенная БАД к пище не только поддерживает нормальный уровень тестостерона и восполняет недостаток кальция в организме, но также способствует более эффективному усвоению кальция и удержанию его в костной ткани длительное время (т.е. обладает пролонгирующим действие) и тем самым является отличным средством для профилактики заболеваний остеопорозом.

Формула изобретения

Биологически активная добавка к пище, выполненная в порошкообразном, таблетированном или капсулированном виде и предназначенная для профилактики остеопороза, представляющая собой, мас. %: соединение кальция, выбранное из ряда:

кальция карбонат, кальция цитрат,	
кальция глюконат,	
кальция аспаргат,	
фосфат кальция,	
лимонно-кислый кальций	16,67-93,75
трутневый расплод	6,25-83,33