

РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(19) RU (11) **2 747 147** (13) C1

(51) МПК

A61K 31/05 (2006.01)A61K 47/44 (2006.01)A61K 36/09 (2006.01)A61P 35/00 (2006.01)A61K 36/11 (2006.01)A61K 36/14 (2006.01)A61K 36/15 (2006.01)A61K 36/23 (2006.01)A61K 36/258 (2006.01)A61K 36/53 (2006.01)A61K 36/61 (2006.01)

(52) СПК

A61K 31/05 (2021.02)A61K 31/05 (2021.02)A61K 36/09 (2021.02)A61K 47/44 (2021.02)A61K 36/11 (2021.02)A61P 35/00 (2021.02)A61K 36/14 (2021.02)A61K 36/15 (2021.02)A61K 36/23 (2021.02)A61K 36/258 (2021.02)A61K 36/53 (2021.02)A61K 36/61 (2021.02)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

Статус: действует (последнее изменение статуса: 06.05.2022)
 Пошлина: учтена за 3 год с 23.06.2022 по 22.06.2023. Установленный срок для уплаты пошлины за 4 год: с 23.06.2022 по 22.06.2023. При уплате пошлины за 4 год в дополнительный 6-месячный срок с 23.06.2023 по 22.12.2023 размер пошлины увеличивается на 50%.

(21)(22) Заявка: **2020121242**, 22.06.2020(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
22.06.2020Дата регистрации:
28.04.2021Приоритет(ы):
(22) Дата подачи заявки: **22.06.2020**(45) Опубликовано: **28.04.2021** Бюл. № **13**

(56) Список документов, цитированных в отчете о поиске: EA 017659 B1, 28.02.2013. US 6395279 B1, 28.05.2002. RU 2477142 C2, 10.03.2013. RU 2310460 C2, 20.11.2007. <http://produkt-pitaniya.ru/masla-zhiry-rastitelnoe-maslo>, найдено в интернете, Wayback Internet Archive Machine, 17.04.2015.

Адрес для переписки:
 115478, Москва, Каширское ш., 24,
 Федеральное государственное бюджетное учреждение "Национальный медицинский исследовательский центр онкологии имени Н.Н. Блохина" Министерства здравоохранения Российской Федерации, отдел патентной и изобретательской работы

(72) Автор(ы):

**Бочарова Ольга Алексеевна (RU),
 Барышникова Мария Анатольевна (RU),
 Зайчик Борис Царельевич (RU),
 Карпова Регина Васильевна (RU),
 Бочаров Евгений Валериянович (RU),
 Вашакмадзе Леван Арчилович (RU),
 Казеев Илья Владимирович (RU),
 Кучеряну Валериян Григорьевич (RU),
 Косоруков Вячеслав Станиславович (RU),
 Матвеев Всеволод Борисович (RU),
 Стилиди Иван Сократович (RU)**

(73) Патентообладатель(и):

Федеральное государственное бюджетное учреждение "Национальный медицинский исследовательский центр онкологии имени Н.Н. Блохина" Министерства здравоохранения Российской Федерации (ФГБУ "НМИЦ онкологии им. Н.Н. Блохина" Минздрава России) (RU)

(54) Фармацевтическая композиция, проявляющая цитотоксичность в отношении клеток карциномы толстой кишки человека

(57) Реферат:

Изобретение относится к фармацевтической композиции, проявляющей цитотоксичность в отношении клеток карциномы толстой кишки человека, характеризующейся тем, что она представляет собой масляный раствор, содержащий альфа-пинен, бета-пинен, бета-мирцен, 1,8-цинеол, сабинен, абиетиновую кислоту, гинзенозиды Re, Rb1, Rg2, флороглюцин, усниновую кислоту и растительное масло в качестве фармацевтически приемлемого растворителя при следующем содержании

компонентов, мг/л: альфа-пинен 430-530; бета-пинен 400-500; бета-мирцен 300-400; 1,8-цинеол 380-480; сабинен 330-430; абиетиновая кислота 280-380; гинзенозид Re 300-400; гинзенозид Rb1 350-450; гинзенозид Rg2 300-400; флороглюцин 150-250; усниновая кислота 100-200; растительное масло - остальное. 6 табл., 4 пр., 2 ил.

Изобретение относится к фармакологической промышленности и медицине, в частности онкологии, касается создания фармацевтической композиции на основе действующих веществ, выделенных из растений, которая может быть использована у больных колоректальным раком с перитонеальным карциноматозом.

Колоректальный рак занимает одно из ведущих мест в России и в мире. Ежегодно в мире диагностируются более 1 млн. новых случаев. Из них примерно 50% больных погибают ежегодно от этого заболевания. Более 25% больных на момент постановки диагноза имеют IV стадию заболевания (Злокачественные новообразования в России в 2015 году. Заболеваемость и смертность / под редакцией А.Д. Каприна, В.В. Старинского, Г.В. Петровой. М.: МНИОИ им. П.А. Герцена - филиал ФГБУ «НМИРЦ» Минздрава России, 2017).

Растения - ценный источник биологически активных соединений с разнообразным терапевтическим потенциалом (Fridlender, M.; Kapulnik, Y.; Koltai, H. Plant derived substances with anti-cancer activity: From folklore to practice. Front. Plant Sci. 2015, 6,799.).

По оценкам исследователей, более 60% лекарств с противоопухолевой активностью являются либо растительными экстрактами, либо веществами, полученными из растений (Fridlender M, Kapulnik Y, Koltai H. Plant derived substances with anti-cancer activity: From folklore to practice. Front Plant Sci. 2015;6:799; Ijaz, S.; Akhtar, N.; Khan, M.S.; Hameed, A.; Irfan, M.; Arshad, M.A.; Ali, S.; Asrar, M. Plant derived anticancer agents: A green approach towards skin cancers, Biomed. Pharmacother., 2018, 103, 1643-1651.).

В состав большинства видов лекарственных растений, представляющих интерес для применения в онкологии, входят такие группы веществ вторичного метаболизма, как фенольные соединения (простые фенолы, флавоноиды, фенольные кислоты, дубильные вещества и др.), терпеноиды (моно-, дитерпеноиды, тритерпеновые сапонины и др.), азот/серосодержащие соединения (алкалоиды и др.) (Shin S.A., Moon S.Y., Kim W.Y., Paek S.M., Park H.H., Lee C.S. Structure-based classification and anti-cancer effects of plant metabolites. // Int J Mol Sci 2018;19(9): 2651-2685.). Они обладают выраженными противоопухолевыми, антиоксидантными, иммуномодулирующими, противовоспалительными, антибактериальными свойствами (Gali-Muhtasib, H.; Hmadi, R.; Kareh, M.; Tohme, R.; Darwiche, N. Cell death mechanisms of plant-derived anticancer drugs: Beyond apoptosis. 2015,20,1531-1562.).

Более выраженный эффект проявляют комбинированные средства растительного происхождения.

Например, из уровня техники известен патент RU 2693378 C1, опублик. 02.07.2019, который раскрывает фармацевтическую композицию, проявляющую цитотоксическое действие в отношении клеток рака мочевого пузыря человека, которая представляет собой масляный фитоэкстракт плодов можжевельника обыкновенного, травы зверобоя продырявленного, цветков пижмы обыкновенной, плодов шиповника, корневищ лапчатки прямостоячей, корневищ и корней родиолы розовой, корней женьшеня настоящего, корней солодки голой, листьев мяты перечной, корневищ и корней валерианы лекарственной, травы душицы обыкновенной, листьев эвкалипта прутовидного, почек сосны обыкновенной, почек березы, взятых в определенных соотношениях.

Лекарственные средства, представляющие собой фитоэкстракты, в том числе, раскрытые в приведенном источнике, обычно хорошо переносятся, имеют менее тяжелые побочные эффекты. Однако входящие в их состав комплексы биологически активных веществ, особенно многокомпонентные, трудно стандартизуются, и могут существенно отличаться по количественному составу и биологически активным свойствам, наличию балластных веществ, в силу как особенностей растительного сырья (географическое происхождение, условия выращивания), так и технологии экстракции.

Использование чистых выделенных биоактивных фитокомпонентов позволяет обеспечить более высокий уровень терапевтической эффективности, более легкое усваивание организмом и хранение препаратов в течение длительного периода. Поэтому выявление и изучение природных комплексов биологически активных веществ в соответствии с их структурой, нетоксичных для нормальных клеток и здорового организма, но способных ингибировать развитие опухолевых процессов,