

UŽITNÝ VZOR

(11) Číslo dokumentu:

37 942

(13) Druh dokumentu: **U1**

(51) Int. Cl.:

A61K 36/89 (2006.01)
A61P 31/14 (2006.01)

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **2024-41954**
(22) Přihlášeno: **14.05.2024**
(47) Zapsáno: **11.06.2024**

(73) Majitel:
Ústav výzkumu globální změny AV ČR, v. v. i.,
Brno, Staré Brno, CZ
Botanický ústav AV ČR, v. v. i., Průhonice, CZ
Ústav chemických procesů AV ČR, v. v. i., Praha 6,
Lysolaje, CZ

(72) Původce:
prof. Ing. Jan Tríska, CSc., České Budějovice,
České Budějovice 2, CZ
RNDr. Naděžda Vrchotová, CSc., České
Budějovice, České Budějovice 2, CZ
Mgr. Jan Bednář, Doudleby, CZ
Mgr. Andrea Kučerová, Ph.D., Třeboň, Břilice, CZ
Ing. Štěpán Horník, Ph.D., Praha 4, Chodov, CZ

(74) Zástupce:
NEOLEGAL - advokátní a patentová kancelář, Ing.
Jaroslav Novotný, Římská 2135/45, 120 00 Praha 2,
Vinohrady

(54) Název užitého vzoru:
Přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19

CZ 37942 U1

Přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19

Oblast techniky

5

Technické řešení se týká přípravku na bázi ethanolového a ethanol-vodného extraktu rostliny, nebo kořenové biomasy ostřice šupinoplodé (*Carex lepidocarpa*), pro zmírnění účinků Covidu 19.

Dosavadní stav techniky

Na konci roku 2019 se začal šířit po celém světě syndrom těžkého akutního respiračního onemocnění SARS-CoV-2, který si na lidstvu vybral a stále vybírá obrovskou daň. Miliony lidí zaplatily tuto epidemii životem a stále dochází k novým vlnám onemocnění. Po vypuknutí onemocnění Covid-19 se začal okamžitě provádět screening antivirových léků, aby byly identifikovány ty, které by mohly inhibovat infekčnost a replikaci SARS-CoV-2. Na začátku pandemie bylo zjištěno, že antimalarický inhibitor proteázy chlorochin fosfát a jeho derivát hydroxychlorochin vykazovaly určitý inhibiční účinek na vstup SARS-CoV-2. Obě zmíněné látky inhibují aktivitu kathepsinu L zvýšením hodnoty endozomálního pH potřebného pro virovou/buněčnou fúzi. K dnešnímu dni FDA schválil několik anti-SARS-CoV-2 preparátů, včetně remdesiviru, molnupiraviru a nirmatrelviru-ritonaviru (Paxlovid). Tyto léky však vykazovaly omezenou klinickou účinnost. Proto jsou stále testovány a očekávají se nové léčebné terapie, které by byly bezpečnější a poskytly by účinnější antivirová a ochranná léčiva a vakcíny. Během tohoto vývojového procesu se tím také otevírá příležitost pro ryze přírodní látky. Dá se s jistotou předpokládat, že v přírodě se ještě nacházejí takové látky, mezi nimiž musí být několik dosud neobjevených složek léků, které by bylo možno použít k léčbě virových infekcí. Wang et al. (2023) provedli screening sloučenin extrahovaných z rostlin prostřednictvím infekčních testů s použitím pseudoviru SARS-CoV-2 a testů buněčné fúze a duálního štěpeného proteinu (DSP) k identifikaci inhibitorů vstupu SARS-CoV-2. Screeningové experimenty odhalily, že dva oligomery resveratrolu, miyabenol C a *trans-ε*-viniferin, specificky inhibovaly vstup SARS-CoV-2 zacílením hostitelské proteázy kathepsinu L. Pomocí povrchové plasmonové rezonance bylo zjištěno, že hodnoty rovnovážné disociační konstanty (K_D) miyabenol C-kathepsin L a *trans-ε*-viniferin-kathepsin L byly 5,54 a 8,54 μM , což ukazuje vynikající vazebnou schopnost uvedených látek pro kathepsin L. *Trans-ε*-viniferin se nachází v réví, ze kterého se dá izolovat extrakcí různými rozpouštědly (Rayne S., et al., 2008). V réví jsou výtěžky *trans-ε*-viniferinu cca 0,1 % u miyabenolu C jsou výtěžky ještě mnohem nižší. Další nevýhodou izolace těchto látek z réví je sezónní charakter sběru suroviny, většinou se jedná o zimní řez keřů révy vinné a vzniklá biomasa odřezaných výhonů se musí buď ihned extrahovat, anebo skladovat za vhodných podmínek, což přináší s sebou další požadavky na vhodné skladovací prostory.

40

Úkolem původců tohoto technického řešení bylo vyvinout přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19 na rostlinné bázi s možností jeho snadného získávání a zaručeným účinkem.

Podstata technického řešení

Uvedené nedostatky odstraňuje přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19, podle tohoto technického řešení, jehož podstata spočívá v tom, že sestává z vodného, nebo vodno-alkoholického extraktu rostliny ostřice šupinoplodé (*Carex lepidocarpa*), s výhodou využití kořenové biomasy pro extrakci.

50

Výhody tohoto přípravku spočívají v tom, že biomasa kořenů ostřice šupinoplodé obsahuje cca 3 % směsi *trans-ε*-viniferinu a miyabenolu C, což je přibližně 30 x více než publikované údaje u réví, a je to přímo směs dvou potřebných látek účinkujících proti SARS-CoV-2 a inhibujících kathepsin L. Další obrovskou výhodou je možnost pěstování této ostřice celoročně v hydroponii.

55

Velkou výhodou je možnost pěstování v aeroponii, která je další možností, jak získat zdroj pro výrobu uvedeného přípravku z biomasy kořenů. Připravený extrakt může sloužit k vývoji aplikace pro nosní spreje, event. přípravku pro potlačení rozvoje virového onemocnění v horních cestách dýchacích ve formě např. ústní vody, kloktadla atd.

5

Ke zvýšení stability přípravku je možno přidat β -glukan, resp. karboxymethyl glukan, které mají samy o sobě imunomodulační a antivirovou aktivitu a schopnost vytvářet prostorové struktury pro kapalné farmaceutické formulace (Varricchio et al., 2014).

10

Příklady uskutečnění technického řešení

1. Přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19 je sušená, nebo lyofilizovaná a rozdrcená rostlina ostřice šupinoplodé (*Carex lepidocarpa*), která se extrahuje v horké vodě, nebo ve vodě s obsahem alkoholu při zvýšené teplotě 50 °C. Po vychladnutí na tělesnou teplotu je možno extrakt aplikovat ve formě kloktadla, anebo může sloužit jako surovina pro přípravu nosního spreje. Pro zvýšení stability přípravku dále obsahuje β -glukan, resp. karboxymethyl glukan.

15

2. Přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19 je sušená, nebo lyofilizovaná a rozdrcená kořenová biomasa rostliny ostřice šupinoplodé (*Carex lepidocarpa*), která se extrahuje v horké vodě, nebo ve vodě s obsahem alkoholu při zvýšené teplotě 50 °C. Po vychladnutí na tělesnou teplotu je možno extrakt aplikovat ve formě kloktadla, anebo může sloužit jako surovina pro přípravu nosního spreje. Pro zvýšení stability přípravku dále obsahuje β -glukan, resp. karboxymethyl glukan.

20

Literatura

25

Rayne S., Karacabey E., Mazza G. (2008). Grape cane waste as a source of *trans*-resveratrol and *trans*-viniferin: High-value phytochemicals with medicinal and anti-phytopathogenic applications. *Industrial Crops and Products* 27, 335–340.

30

Varricchio A.M., Capasso M., della Volpe A., Malafrente L., Mansi N., Varricchio A., Ciprandi G. (2014). Resveratrol plus carboxymethyl- β -glucan in children with recurrent respiratory infections: a preliminary and real-life experience. *Italian Journal of Pediatrics* 40, 93.

35

Wang Ch, Ye X, Ding Ch, Zhou M, Li W, Wang Y, You Q, Zong S, Peng Q, Duanmu D, Chen H, Sun B, Qiao J. (2023). Two resveratrol oligomers inhibit cathepsin L activity to suppress SARS-CoV-2 entry. *J. Agric. Food Chem.* 71, 5535–5546.

NÁROKY NA OCHRANU

1. Přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19, **vyznačující se tím**, že obsahuje vodný nebo vodno-alkoholický extrakt rostliny ostřice šupinoplodé - *Carex lepidocarpa*.

5 2. Přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19, podle nároku 1, **vyznačující se tím**, že vodným nebo vodno-alkoholickým extraktem, je extrakt z kořenové biomasy rostliny ostřice šupinoplodé - *Carex lepidocarpa*.

3. Přípravek pro zmírnění účinků Covidu 19, podle nároku 1, **vyznačující se tím**, že dále obsahuje β -glukan - karboxymethyl glukan.

10