



(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ

(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ

(11)



1-0026798

(51)⁷ A61K 31/57

(13) B

(21) 1-2018-04995

(22) 08/11/2018

(45) 25/12/2020 393

(43) 25/01/2019 370A

(76) 1. Nguyễn Thị Triệu (VN)

645/20 Trần Xuân Soạn, KP2, phường Tân Hưng, quận 7, thành phố Hồ Chí Minh

2. Trần Minh Đức (VN)

645/20 Trần Xuân Soạn, KP2, phường Tân Hưng, quận 7, thành phố Hồ Chí Minh

(54) CHẾ PHẨM DÙNG ĐỂ THOÁI TRIỂN U XƠ TỬ CUNG

(57) Sáng chế đề cập đến chế phẩm dùng để thoái triển u xơ tử cung ở phụ nữ trong độ tuổi sinh sản và trong thai kỳ có chứa pregnenolon tự nhiên được tinh chiết từ củ mài (*Dioscorea persimilis* Prain et Burkill) và coenzym pyridoxal phosphat.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế thuộc lĩnh vực dược phẩm, cụ thể là sáng chế đề cập đến chế phẩm dùng để ngăn chặn sự phát triển của các khối u xơ tử cung trong thai kỳ. Sáng chế có một lượng vừa đủ pregnenolon tự nhiên được tinh chiết từ củ mài (*Dioscorea persimilis Prain et Burkill*) kết hợp với một coenzym pyridoxal phosphat để làm cho khối u mềm ra và mất đi.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Pregnenolon được tạo ra ở tuyến thượng thận và hệ thần kinh trung ương. Pregnenolon được tổng hợp từ cholesterol là tiền chất của progesteron, estrogen và DHEA. Ở một số người pregnenolon sẽ giảm đi theo tuổi tác dẫn đến sự mất cân đối progesteron, estrogen, là nguyên nhân gây nên sự phát triển bất thường của tế bào cơ tử cung tạo ra nhiều khối u xơ tử cung. Pregnenolon cần thiết cho phụ nữ tuổi sinh sản và mang thai, theo dõi những sản phụ đã có u xơ tử cung trước đây khi mang thai các khối u này sẽ phát triển rất nhanh làm choán chỗ, thai phụ sẽ gặp nhiều vấn đề trong mang thai và sinh con, có nguy cơ sảy thai, sinh non. Chế phẩm duy trì một lượng vừa đủ pregnenolon tự nhiên được tinh chiết từ củ mài và kết hợp với một coenzym pyridoxal phosphat cần thiết để làm cho các sợi cơ của khối u mềm ra, dần trải và hòa nhập vào cơ tử cung, tử cung trở về bình thường lúc đó thai nhi sẽ phát triển theo cách tự nhiên.

Đây là chế phẩm duy nhất có sự kết hợp hoàn hảo, liều lượng nằm trong sự kiểm soát của FDA, chế phẩm đã làm thoái triển khối u, làm giảm những nguy cơ có thể xảy ra trên những phụ nữ trong độ tuổi sinh sản, những biến chứng gây ra vô sinh, rong kinh, rong huyết phải bóc tách khối u, nguy cơ cắt bỏ tử cung, làm giảm những nguy cơ có thể xảy ra trên những sản phụ thuộc nhóm có u xơ tử cung trong thai kỳ.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Mục đích của sáng chế là ngăn chặn sự phát triển nhanh chóng của các khối u xơ tử cung. Để đạt được hiệu quả này chế phẩm cung cấp một lượng vừa đủ pregnenolon và coenzym pyridoxal phosphat. Theo một phương án, sáng chế đề xuất chế phẩm dùng để thoái triển các khối u xơ tử cung trong đó chế phẩm này chứa các thành phần sau (tính theo % khối lượng):

Pregnenolon:	80,00;
Pyridoxal phosphat:	12,00;
Tá dược:	8,00.

Mô tả chi tiết sáng chế

Sau đây, sáng chế được mô tả chi tiết với các phương án thực hiện cụ thể. Tuy nhiên, các phương án thực hiện này chỉ nhằm làm rõ bản chất của sáng chế chứ không nhằm hạn chế phạm vi yêu cầu bảo hộ của sáng chế.

Sử dụng tiền chất pregnenolon cho việc tạo ra progesteron tự nhiên, progesteron là một hormon steroid có nhiều chức năng và nhiệm vụ quan trọng trong cơ thể người phụ nữ, là chất trung gian trong chuyển hóa trong việc sản xuất các steroid nội sinh khác. Đối với trường hợp này sử dụng progesteron để phục hồi mô tế bào cơ tử cung đã nhân lên mất kiểm soát do sự mất cân đối giữa estrogen và progesteron. Progesteron được bổ sung do sự mất cân đối cần duy trì ổn định và có sự hỗ trợ của pyridoxal phosphat lúc đó sẽ đạt được mong muốn tế bào cơ tử cung phát triển trong trật tự.

Pyridoxal phosphat là dạng hoạt động của vitamin B6, là coenzym của enzym aminotransferaza làm chất xúc tác cho quá trình trao đổi amin của các axit amin, là chất xúc tác cho sự phân phối lại nitơ giữa các axit amin và các oxy-axit tương ứng tham gia vào quá trình chuyển hóa protein. Sự phân bố và

nồng độ ổn định tương đối trong tế bào của pyridoxal phosphat đã chứng minh được mức độ hiệu quả trong việc kiểm soát được sự thoái triển của u xơ tử cung.

Theo một phương án, sáng chế dùng để thoái triển u xơ tử cung trong thai kỳ, trong đó chế phẩm này chứa các thành phần sau (tính theo % khối lượng):

pregnenolon: 80,00;

pyridoxal phosphat: 12,00;

tá dược: 8,00.

Chế phẩm này được dùng ở dạng viên nén 50mg với liều dùng 1 viên/lần/ngày.

Chế phẩm theo sáng chế được dùng cho sản phụ có nguy cơ sảy thai hoặc sinh non do u xơ phát triển trong thành khoang tử cung (submucosal), u xơ phát triển trong thành tử cung (intramural) và cân nhắc trong trường hợp mọc ở bên ngoài tử cung (subserosal). Sáng chế được sử dụng ngay khi phát hiện có thai và có kèm theo u xơ tử cung.

Tác dụng phụ của chế phẩm không được phát hiện.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ 1: Quy trình điều chế chế phẩm theo sáng chế ở dạng viên nén (100 viên).

Cụ thể:

pregnenolon: 4000mg;

pyridoxal phosphat: 600mg;

tá dược: 400mg.

Trộn đều hỗn hợp sau đó phân liều và dập viên.

Ví dụ 2: Thử nghiệm chứng minh sự thoái triển u xơ tử cung trong thai kỳ của chế phẩm theo sáng chế.

Để tiến hành thử nghiệm chứng minh tác dụng của chế phẩm theo sáng chế, lựa chọn 20 người tình nguyện là các phụ nữ có độ tuổi từ 18 đến 40.

Tiền sử bệnh

- Xét nghiệm công thức máu: Bình thường
- Xét nghiệm đường máu: Bình thường
- Xét nghiệm mỡ máu: Bình thường
- Xét nghiệm viêm gan B: (-)
- Xét nghiệm HIV: (-)
- Siêu âm bụng tổng quát, siêu âm tử cung và 2 phần phụ. Tử cung có từ 1 đến 3 khối u xơ có kích thước từ 10mm đến 50mm trước thai kỳ.

Lựa chọn các sản phụ mang thai > 8 tuần tuổi, theo dõi thai qua siêu âm phát hiện thai phát triển bình thường nhưng các khối u xơ đã lớn rất nhanh so với kích thước ban đầu.

Đối tượng thử nghiệm được chia thành hai nhóm:

Nhóm 1: nhóm đối chứng, được sử dụng giả dược.

Nhóm 2 : sử dụng chế phẩm theo sáng chế.

Thời gian thử nghiệm được tiến hành trong 32 đến 34 tuần và bắt đầu vào tuần thứ 8 của thai kỳ.

Dữ liệu thử nghiệm được xác định dựa trên:

Đo kích thước khối u qua siêu âm sau mỗi 4 tuần và đo kích thước khối u qua siêu âm sau mỗi lần khám thai chính.

Kết quả cho thấy, nhóm sử dụng giả dược không có biểu hiện tích cực, các khối u vẫn lớn nhanh gây biến đổi hình dạng tử cung khi mang thai, tiên lượng mẹ và thai nhi theo tiên lượng đã có trước đây. Đối với nhóm sử dụng chế phẩm theo sáng chế nhận thấy 100% có đáp ứng. Theo đó cho thấy rằng, chế

phẩm theo sáng chế có tác dụng thoái triển các khối u xơ tử cung trong thai kỳ, thai nhi phát triển bình thường, người mẹ tránh được băng huyết sau sinh.

Hiệu quả có lợi của sáng chế

Việc sử dụng đầu tiên phương pháp kết hợp các dược chất để tạo ra chế phẩm này đã làm giảm những nguy cơ thường gặp như vô sinh, rong kinh, rong huyết, nhau bong non, sinh non, thai nhi khó khăn trong định vị trong tử cung, băng huyết sau sinh, ..., trên những phụ nữ trong tuổi sinh sản và trên sản phụ có các khối u xơ tử cung khi mang thai và sinh con.

Bằng cách nghiên cứu sự kết hợp của các thành phần hóa học trong chế phẩm này đã làm thoái triển các khối u xơ tử cung.

Tác động hiệp đồng của cặp đôi hoạt chất đã làm ngưng sự tiến triển của khối u, làm mềm chúng và dần trải vào cơ tử cung, khoảng 22 tuần thai đã không còn nhìn thấy các khối u xơ qua siêu âm.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Chế phẩm dùng để thoái triển u xơ tử cung ở phụ nữ trong độ tuổi sinh sản và phụ nữ mang thai có u xơ tử cung, trong đó chế phẩm này chứa các thành phần sau (tính theo % khối lượng):

pregnenolon: 80,00;

pyridoxal phosphat: 12,00;

tá dược: 8,00;

và trong đó chế phẩm này ở dạng viên nén có trọng lượng 50mg.