



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **36201** (13) **U**

(51) МПК (2006)

**A61K 9/06****A61K 31/18****A61K 31/63****A61K 47/00**МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ**ОПИС  
ДО ПАТЕНТУ  
НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ**видається під  
відповідальність  
власника  
патенту**(54) ПРЕПАРАТ НІМЕКСИД-ГЕЛЬ ДЛЯ МІСЦЕВОГО ЗАСТОСУВАННЯ**

1

2

(21) u200810310

(22) 12.08.2008

(24) 10.10.2008

(46) 10.10.2008, Бюл.№ 19, 2008 р.

(72) ДОВЖУК ВІКТОРІЯ ВАЛЕНТИНІВНА, UA, ЧУ-  
ЄШОВ ВЛАДИСЛАВ ІВАНОВИЧ, UA, ГУРЕЄВА  
СВІТЛАНА МИКОЛАЇВНА, UA(73) НАЦІОНАЛЬНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ  
ІМЕНІ О.О. БОГОМОЛЬЦЯ, UA(57) Препарат німексид-гель для місцевого засто-  
сування, до складу якого входять німесулід та во-  
да очищена, який **відрізняється** тим, що додатко-  
во містить димексид, карбопол, триетаноламін при  
наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

німесулід	1,0
димексид	3,0
карбопол	1,5
триетаноламін	0,021
вода очищена	до 100.

Корисна модель, що заявляється, належить до протизапальних засобів для зовнішнього застосування, а саме до німесулідних композицій для місцевого застосування на основі гелевих систем.

Німесулід - це відома антизапальна речовина, терапевтична ефективність якої вже перевірена, але який має небажані хіміко-фізичні характеристики; головною перешкодою для використання німесуліду в композиціях для місцевого застосування є його нерозчинність у воді та з іншого боку погана розчинність у розчинника /вихідних матеріалах, які звичайно застосовують у таких композиціях. /1/.

На сьогодні найбільш перспективною й безпечною лікарською формою нестероїдних протизапальних препаратів /НПЗП/ є форми для місцевого застосування /2/. При цьому різко знижується їхній системний вплив, а отже - і ймовірність розвитку побічних ефектів. Місцеві лікарські форми НПЗП можуть призначатися в сполученні із системними препаратами у випадках недостатнього анальгетичного ефекту або поганої переносимості системних НПЗП. Сумісне /місцеве й системне/ застосування НПЗП дозволяє знизити дозу перорального препарату й одержати більше швидкий анальгетичний ефект. Проведення локальної терапії досить ефективно й надзвичайно зручно при суглобному й м'язовому болю й характеризується рядом виразних переваг у порівнянні із системним застосуванням НПЗП:

- відносна простота й безпека застосування,
- слабо виражена системна дія й, як наслідок - значно менша виразність побічних ефектів, у першу чергу з боку травного каналу,
- забезпечення високої концентрації активних речовин у місці нанесення препарату,
- можливість сполучення в одному препараті декількох речовин, різних по механізмі й спрямованості терапевтичного ефекту.

На українському ринку представлено 29 торговельних назв місцевих форм НПЗП, біля чверті з них становлять вітчизняні препарати. Фармацевтична промисловість України випускає, в основному, таблетовані й ін'єкційні форми НПЗП, значно менше - м'яких /гелі, мазі, суппозиторії/.

Таким чином, виникає необхідність розширення асортименту м'яких лікарських форм місцевої дії на українському ринку, за рахунок розробки нових більш безпечних препаратів на основі селективних блокаторів. Перспективною пропозицією в цьому аспекті є м'які лікарські форми на основі німесуліда»

Найбільш вдалою лікарською формою препаратів, призначення для протизапальної локальної терапії, є саме гель. Використання спиртових розчинників при готуванні гелю забезпечує швидке всмоктування лікарського засобу в шкіру. Крім того, застосування гелю більш гігієнічно в порівнянні із застосуванням мазі або крему, економно, оскільки максимальна кількість препарату, що наносить-

(13) **U**(11) **36201**(19) **UA**

ся проходить шкірний бар'єр. Препарати у формі гелю володіють додатковою зволожуючою дією на шкіру, а повільна дифузія активної речовини в тканині дозволяє досягти пролонгованого ефекту препарату. Тому розробки препарату на основі німесулід у формі гелю є найбільш вигідною.

Найближчим аналогом-прототипом є німесулідна гелева система для місцевого застосування, що включає до свого складу німесулід /3/. Однак, ця система негативно впливає на гідратацію шкіри, що приводить до виникнення ускладнень.

Задача корисної моделі полягає у створенні такого протизапального засобу для місцевого застосування, який би мав чудову всмоктуючу властивість та зберігав би шкіру»

В результаті досліджень недоліків застосування німесуліда як препарату для зовнішнього застосування було встановлено, що їх можна уникнути, якщо німесулід введений в основу в тонкоподрібненому вигляді. В цьому випадку німесулід несподівано проявляє фармацевтичну ефективність, рівну чи більшу, чим у фармацевтичних препаратів у вигляді його розчинів. При цьому можуть бути зменшені витрати дисперсійного середовища та, відповідно, підвищення збереження шкіри, не виникає забарвлення фармацевтичного препарату» Таким чином можуть бути вирішені всі проблеми зовнішнього застосування.

Поставлена задача досягається тим, що у відомому препараті, до складу якого входить німесулід, згідно корисної моделі додатково вводять димексид, карбопол, триетаноламін в наступних співвідношеннях компонентів, мас. %: німесулід - 1,0, димексид 3,0, карбопол 1,5, триетаноламін 0,021, вода очищена до 100,0.

Відмінною особливістю запропонованого препарату німексид-гель для місцевого застосування є уведення до його складу димексида, карбополу та триетаноламіну.

Карбопол - згущувач, розподільвальна та емульгуюча речовина. Гарний згущувач, добре розчиняється у воді, легко змішується з будь-якими активними інгредієнтами, введення його в систему дозволяє поліпшити як споживчі властивості препарату, так і їхні економічні характеристики за рахунок зниження вмісту основоутворюючих речовин і їхньої заміни на воду, тому що гелі на 99-98% складаються з води.

Димексид добре змішується з водно-спиртовим розчином у всіх співвідношеннях. Має здатність проникати через біологічні мембрани, у тому числі, через шкірні бар'єри. Препарат володіє помірним антисептичним і фібринолітичним ефектом. Він також підсилює проникнення через шкіру лікарської речовини.

Препарат представляє собою злепка прозорий, блідо-жовтого кольору гель зі слабким специфічним запахом.

Основне призначення: Німексид-гель сучасний не стероїдний протизапальний препарат з високою анальгетичною і протизапальною дією. Застосовується при різних станах, які характеризуються білью, запаленням та обмеженням руху, таких як остеоартрит, периартрит, посттравматичні або гострі м'язево-склеротичні патології.

#### ЛІТЕРАТУРА:

1. Насонов Е.Л. Применение нестероидных противовоспалительных препаратов: терапевтические перспективы. РМЖ, - 2002, - 10, 4,-с.206-212.

2. Цагарейшвили Г.В., Головкин В.А., Грошовий Т.А. Биофармацевтические, фармакокинетические и технологические аспекты создания мягких лекарственных средств. Мецниереба, Тбилиси, 1987

3. Патент РФ №2181285. 1998г.

Гелевая система нимесулида для местного применения и способы ее получения /варианты/.