



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **69859**

(13) **U**

(51) МПК

A61K 9/02 (2006.01)

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2011 14224**

(22) Дата подання заявки: **01.12.2011**

(24) Дата, з якої є чинними
права на корисну
модель: **10.05.2012**

(46) Публікація відомостей **10.05.2012, Бюл.№ 9**
про видачу патенту:

(72) Винахідник(и):

**Тихонов Олександр Іванович (UA),
Білошицька Ірина Вікторівна (UA)**

(73) Власник(и):

**Тихонов Олександр Іванович,
вул.Червоноармійська, 8/10-А, кв. 55,
м.Харків, 61052 (UA)**

(74) Представник:

**Лерантович Еліна Томашівна, реєстр.
№285**

(54) ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ "ЛОРАВІТ" У ФОРМІ СУПОЗИТОРІЇВ З АНТИГІСТАМІННОЮ ДІЄЮ ДЛЯ ДІТЕЙ

(57) Реферат:

Фармацевтична композиція у формі супозиторіїв з антигістамінною дією для дітей містить як діючу речовину лоратадин гідрохлориду та допоміжні речовини і додатково містить масляний розчин α -токоферолу ацетату, як допоміжні речовини супозиторну основу та спирт етиловий.

UA 69859 U

Корисна модель належить до медицини і хіміко-фармацевтичної промисловості, зокрема до створення, виробництва і застосування антигістамінних засобів для дітей, у формі супозиторіїв.

Препарати для лікування алергії, представлені на фармацевтичному ринку України, відрізняються широтою і різноманітністю асортименту, але більшість із них іноземного виробництва; асортимент вітчизняних засобів залишається досить обмеженим, особливо для дітей молодшого віку.

Найближчим аналогом є таблетка з муколітичними та антигістамінними властивостями (пат. UA №47107, А61К 9/20, 11.01.2010, бюл. № 1). Таблетка з муколітичними та антигістамінними властивостями включає як діючу речовину лоратадин, амброксолу гідрохлорид та крохмаль, магнію стеарат як допоміжні речовини та додатково допоміжні речовини - лактози моногідрат, мікрокристалічну целюлозу, повідон, метилпарабен, пропілпарабен, кремнію діоксид колоїдний безводний, натрію крохмальгліколят, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

амброксолу гідрохлорид	25,0-42,0
лоратадин	1,0-5,0
лактози моногідрат	20,0-35,0
крохмаль кукурудзяний або	
паста крохмалю	12,0-25,0
целюлоза мікрокристалічна	10,0-20,0
повідон	0,5-1,5
метилпарабен	0,2-0,35
пропілпарабен	0,045-0,060
магнію стеарат	0,5-1,5
кремнію діоксид колоїдний	
безводний	0,1-1,0
натрію крохмаль гліколят	1,0-5,0.

В основу корисної моделі поставлено задачу удосконалити фармацевтичну композицію шляхом створення оригінальної композиції з діючої речовини та допоміжних активних речовин, завдяки чому досягається оптимальне поєднання технологічних властивостей лікарської форми, яка має антигістамінну дію, з метою профілактики та лікування алергічних захворювань у дітей молодшого віку.

Поставлена задача вирішується таким чином, що фармацевтична композиція, що заявляється, містить як діючу речовину лоратадин гідрохлориду, допоміжні речовини (супозиторну основу та спирт етиловий 95 %), та додатково 30 % масляний розчин α -токоферолу ацетату, при наступному співвідношенні компонентів, мас. г:

лоратадин гідрохлориду	0,003-0,01
30 % масляний розчин α -токоферолу ацетату	0,0000185-0,000025
супозиторну основу	0,9-1,7
спирт етиловий 95	0,010-0,020.

Лоратадин пролонгованої дії, трициклічний антигістамінний, селективний блокатор периферичних H1 гістамінових рецепторів, без центральної седативної дії. Його дія відбувається через конкурентне блокування H1 рецепторів на ефекторних клітинах. Лоратадин показує антигістамінний ефект, починаючи з 1 до 3-х годин, досягає максимуму з 8 до 12 годин і продовжується до 24 годин. Попереджає розвиток та полегшує перебіг алергічних реакцій. Має протиалергічну, протисвербіжну, незначну протизапальну, протиексудативну дію. Зменшує проникність капілярів, попереджує розвиток набряку тканин, знімає спазми гладкої мускулатури.

Лоратадин при пероральному прийомі швидко і повністю абсорбується в шлунково-кишковому тракті. Ступінь зв'язування з білками плазми крові лоратадину до 99 %, Розподілення по тканинах відбувається за 1-2 години. Використовують при захворюваннях дихальних шляхів, що супроводжуються нав'язливим, сухим кашлем, порушенням бронхіальної секреції, затрудненим відходженням секрету, при обструктивних захворюваннях дихальних шляхів, зі спастичним та алергічним компонентом.

Введення до складу 30 % масляного розчину α -токоферолу ацетату (вітамін Е) було обумовлено тим, що він має значну антиоксидантну, імуностимулюючу та протизапальну дію, що у свою чергу, потенціює протизапальний ефект лоратадину гідрохлориду.

Для вирішення підбору носіїв як основ для супозиторіїв були вибрані найбільш раціональні основи - супоцир, вітепсол і твердий жир.

Препарат, що заявляється, є антигістамінним препаратом без седативного ефекту. Склад препарату підібрано згідно з добовою терапевтичною дозою діючої речовини.

Активні компоненти і компоненти основи заявленого засобу представлені дозволеними до використання фармацевтично прийнятними речовинами, проте їх якісне та кількісне співвідношення є новим, не відомим з джерел інформації.

Можливість здійснення технологічного процесу отримання препарату, стабільність окремих компонентів і лікарської форми в цілому також істотно залежать від складу препарату і послідовності технологічних операцій. На підставі проведених досліджень і отриманих експериментальних даних визначені інтервали кількісного вмісту і співвідношення компонентів, при яких досягається оптимальний терапевтичний ефект, фізико-хімічна сумісність компонентів і технологічність процесу виробництва. Запропонований засіб відповідає усім вимогам, що пред'являються до супозиторних лікарських форм: висока біодоступність, термо- і колоїдна стабільність, зручність застосування.

Заявлена фармацевтична композиція може бути одержана з використанням стандартного обладнання за наступною технологічною схемою:

Лоратадину гідрохлорид подрібнюють та розчиняють в 1 краплі 95 % спирту етилового. 30 % масляний розчин α -токоферолу ацетату змішують з підпавленою основою. Отриманий сплав змішують з розчином Лоратадину гідрохлориду та розливають у попередньо змазані мильним спиртом та охолоджені форми, які поміщують в холодильник на 15-20 хвилин. Після охолодження виймають супозиторії, завертають та оформлюють до відпуску. Зберігають у сухому прохолодному місці.

За технологічними та фізико-хімічними властивостями заявлена фармацевтична композиція відповідає всім вимогам Державної фармакопеї України (ДФУ).

Корисна модель ілюструється прикладом.

Приклад. Наведено результати визначення температури плавлення супозиторіїв, виготовлених на різних основах, яка відповідає вимогам ДФУ (не більше 37 °C) та не залежить від введення жодного з компонентів досліджуваних зразків (n=5).

Основа	Чиста основа (дані літератури)	Основа+ Лоратадину гідрохлорид	Основа+30 % масляний розчин α -токоферолу ацетату	Основа +Лоратадину гідрохлорид +30 % масляний розчин α - токоферолу ацетат
Супоцир (Великобританія)	36,6-36,5	36,5 \pm 0,12	36,48 \pm 0,11	36,44 \pm 0,15
Вітепсол (Німеччина)	35,0-35,5	36,46 \pm 0,12	36,52 \pm 0,12	36,46 \pm 0,14
Твердий жир (Чехія)	36,0-36,6	36,46 \pm 0,14	36,48 \pm 0,10	36,52 \pm 0,14

Таким чином, запропонована фармацевтична композиція, завдяки вдалому сполученню речовин має ярко виражені властивості, має антигістамінну, протизапальну дію, активно сприяє лікуванню алергійних захворювань у дітей молодшого віку.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

Фармацевтична композиція у формі супозиторіїв з антигістамінною дією для дітей, що містить як діючу речовину лоратадин гідрохлориду та допоміжні речовини, яка **відрізняється** тим, що додатково містить 30 % масляний розчин α -токоферолу ацетату, як допоміжні речовини супозиторну основу та спирт етиловий 95 %, при наступному співвідношенні компонентів, мас.г:

лоратадин гідрохлориду 0,003-0,01
30% масляний розчин α -токоферолу ацетату 0,0000185-0,000025
супозиторна основа 0,9-1,7
спирт етиловий 95 % 0,010-0,020.

2. Фармацевтична композиція за п.1, яка **відрізняється** тим, що як супозиторну основу містить супоцир або вітепсол, або твердий жир.

Комп'ютерна верстка І. Скворцова

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Урицького, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут промислової власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601