



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **108991** (13) **U**
(51) МПК (2016.01)

A61K 31/19 (2006.01)

A61K 31/192 (2006.01)

A61K 8/20 (2006.01)

A61P 29/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2016 00679**

(22) Дата подання заявки: **28.01.2016**

(24) Дата, з якої є чинними
права на корисну
модель: **10.08.2016**

(46) Публікація відомостей
про видачу патенту: **10.08.2016, Бюл.№ 15**

(72) Винахідник(и):

**Трутаєв Ігор Вікторович (UA),
Трутаєв Сергій Ігорович (UA),
Штриголь Сергій Юрійович (UA)**

(73) Власник(и):

**Трутаєв Ігор Вікторович,
вул. Крилова, 8, м. Харків, 61137 (UA)**

(74) Представник:

**Михайлюк Ганна Валентинівна, реєстр.
№184**

(54) ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ПРОТИЗАПАЛЬНОЇ ТА ПРОТИРЕВМАТИЧНОЇ ДІЇ У ФОРМІ ТАБЛЕТКИ АБО КАПСУЛИ

(57) Реферат:

Фармацевтична композиція протизапальної та протиревматичної дії у формі таблетки або капсули, що включає калію 2,4-дихлорбензоат як діючу речовину, а також допоміжні речовини.

UA 108991 U

Корисна модель належить до галузі фармацевтичної промисловості, а саме до фармацевтичних композицій у формі таблетки або капсули, що мають протизапальну та протиревматичну дію та можуть бути використані при лікуванні хворих з больовим синдромом, обумовленим остеохондрозом хребта, при запальних та дегенеративних формах ревматичних захворювань.

Остеохондроз хребта - один з найбільш частих діагнозів, який озвучується на прийомі у лікаря пацієнтові, що скаржиться на біль у спині. Від цієї недуги страждає кожна третя людина на землі, але звертається до лікаря тільки половина з них.

Лідером можна назвати остеохондроз поперекового відділу хребта, трохи рідше зустрічається захворювання шийного і грудного відділів. Остеохондроз хребта - це хронічне захворювання, при якому відбуваються дегенеративні зміни хребців і хребцевих дисків, які знаходяться між ними. На початку хвороби це, як правило, невеликі хворобливі відчуття в спині, які можуть посилюватися при різких рухах. При розвитку остеохондрозу больовий синдром починає виявлятися частіше, він гостріший, ніж на початковій стадії захворювання, і віддає в ногу. До того ж, в цей період виникають і інші реакції організму на деформацію міжхребцевих дисків - перепади температури тіла, потовиділення, відчуття поколювання й оніміння.

Медикаментозні методи лікування остеохондрозу хребта спрямовані на зняття больового синдрому і включають в себе прийом знеболюючих препаратів, болезаспокійливих блокад, протизапальних та протинабрякових препаратів.

З патенту РФ № 2101011, опублікованого 10.01.1998 р., відомий засіб, що має анальгетичну дію, активною речовиною якого є калію 2,4-дихлорбензоат. Згідно з винаходом, вказана композиція представлена у вигляді таблетки і як допоміжні речовини містить молочний цукор, крохмаль кукурудзяний, кальцію стеарат та полівінілпіролідон.

Найбільш близьким аналогом корисної моделі, яка заявляється, є таблетки пролонгованої дії нестероїдного протизапального засобу анальбену, похідного бензойної кислоти, описаного в статті "Результати фармакокінетичного дослідження нового НПЗЗ анальбен-ретарду", опублікованій в журналі "Вісник фармації" (2007, номер 2), авторами якої є Герасимова О.О., Іванов Л.В., Шаповал О.М., Ріад Абдулрахман Алобід та Пашнєв П.Д. Зазначена лікарська форма містить як активну речовину калію 2,4-дихлорбензоат у кількості 20 мг.

Недоліком вищеописаних композицій є відносно низька швидкість зниження рівня больового синдрому, обумовленого остеохондрозом хребта, при прийомі відповідного лікарського засобу.

Задачею корисної моделі, яка заявляється, є створення фармацевтичної композиції протизапальної та протиревматичної дії у формі таблетки або капсули, якісний та кількісний склад якої забезпечить досягнення технічного результату, який полягає в підвищенні протизапальної та протиревматичної дії, забезпеченні швидкого зменшення рівня больового синдрому при одноразовому введенні і одночасній відсутності посилення побічних реакцій.

Поставлена задача вирішується тим, що розроблено фармацевтичну композицію протизапальної та протиревматичної дії у формі таблетки або капсули, що включає калію 2,4-дихлорбензоат як діючу речовину, а також допоміжні речовини, яка відрізняється тим, що має наступний склад компонентів, мг:

калію 2,4-дихлорбензоат 22,5-52,5
допоміжні речовини решта.

Активною діючою речовиною заявленої фармацевтичної композиції є калієва сіль похідного бензойної кислоти, лікарський засіб із групи НПЗЗ, який проявляє виражену протизапальну, анальгетичну та жарознижуючу дію і на відміну від більшості НПЗЗ вільний від серйозних побічних ефектів, такі як шлунково-кишкові розлади та НПЗЗ-гастропатії.

Кількісний склад калію 2,4-дихлорбензоату 22,5-52,5 мг у фармацевтичній композиції, що заявляється, визначено за допомогою проведених доклінічних досліджень та 1 фази клінічних випробувань експериментальним шляхом. При зменшенні кількості калію 2,4-дихлорбензоату знижується фармакологічна активність засобу, що призводить до зменшення протизапальної активності засобу, тому оптимальним є вміст 22,5-52,5 мг калію 2,4-дихлорбензоату в одній таблетці або капсулі.

Переважно композиція за заявкою являє собою таблетку або капсулу.

Переважно як допоміжні речовини використовують лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний або картопляний, натрію кроскармелозу, полівінілпіролідон та кальцію або магнію стеарат, що при спільному їх використанні забезпечує стабільну лікарську форму.

Є можливим варіант реалізації корисної моделі, в якому фармацевтична композиція має наступний склад компонентів, мг:

калію 2,4-дихлорбензоат 22,5-52,5
лактози моногідрат 48,6

крохмаль кукурудзяний або картопляний 68,1-98,1
натрію кроскармелоза 7,2
полівінілпіролідон 1,8
кальцію або магнію стеарат 1,8.

5 Переважним є варіант реалізації корисної моделі, при якому фармацевтична композиція має наступний склад компонентів, мг:

калію 2,4-дихлорбензоат 50,0
лактози моногідрат 48,6
крохмаль кукурудзяний 70,6
10 натрію кроскармелоза 7,2
полівінілпіролідон 1,8
кальцію стеарат 1,8.

Заявлену фармацевтичну композицію у формі таблетки готують в наступний спосіб.

15 До змішувача завантажують попередньо просіяні та зважені калію 2,4-дихлорбензоат, лактози моногідрат та крохмаль кукурудзяний. Сухі компоненти перемішують протягом 5-10 хв., після чого масу зволожують спиртовим розчином ПВП при перемішуванні. Зволожену масу перемішують протягом 5-10 хв., а далі передають на вологу грануляцію, використовуючи гранулятор з діаметром отворів 4 мм. Вологі гранули сушать при температурі 100 °С до залишкової вологості 2,5±0,5 %. При досягненні необхідної вологості висушену масу 20 гранулюють в сухому грануляторі з діаметром отворів 1 мм. Після сухої грануляції масу опудрюють сумішшю натрію кроскармелози та кальцію стеарату. Далі таблеткову масу піддають таблетуванню з отриманням плоско-циліндричних таблеток масою 180 мг.

Заявлену фармацевтичну композицію у формі капсули готують в наступний спосіб.

25 До змішувача завантажують попередньо просіяні та зважені калію 2,4-дихлорбензоат, лактози моногідрат та крохмаль кукурудзяний. Сухі компоненти перемішують протягом 5-10 хв., після чого масу зволожують спиртовим розчином ПВП при перемішуванні. Зволожену масу перемішують протягом 5-10 хв., а далі передають на вологу грануляцію, використовуючи гранулятор з діаметром отворів 4 мм. Вологі гранули сушать при температурі 50 °С до залишкової вологості 2,5±0,5 %. При досягненні необхідної вологості висушену масу 30 гранулюють в сухому грануляторі з діаметром отворів 1 мм. Після сухої грануляції масу опудрюють сумішшю натрію кроскармелози та кальцію стеарату. Отримана капсульна маса подається на стадію наповнення капсул. На виході отримують капсули № 2.

Таким чином, заявлена корисна модель забезпечує фармацевтичну композицію протизапальної та протиревматичної дії у формі таблетки або капсули, якісний та кількісний 35 склад якої забезпечить досягнення технічного результату, який полягає в підвищенні протизапальної та протиревматичної дії, забезпеченні швидкого зменшення рівня больового синдрому при одноразовому введенні і одночасній відсутності посилення побічних реакцій.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

40

1. Фармацевтична композиція протизапальної та протиревматичної дії у формі таблетки або капсули, що включає калію 2,4-дихлорбензоат як діючу речовину, а також допоміжні речовини, яка **відрізняється** тим, що має наступний склад компонентів, мг:

калію 2,4-дихлорбензоат 22,5-52,5
допоміжні речовини решта.

2. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що як допоміжні речовини містить лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний або картопляний, натрію кроскармелозу, полівінілпіролідон 45 та кальцію або магнію стеарат.

3. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що при масі таблетки або капсули 180 мг має наступний склад компонентів, мг:

калію 2,4-дихлорбензоат 22,5-52,5
лактози моногідрат 48,6
крохмаль кукурудзяний або 68,1-98,1
картопляний
натрію кроскармелоза 7,2
полівінілпіролідон 1,8
кальцію або магнію стеарат 1,8.

4. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має наступний склад компонентів, мг:

калію 2,4-дихлорбензоат 50,0
лактози моногідрат 48,6

крохмаль	кукурудзяний	або	70,6
картопляний			
натрію	кроскармелоза		7,2
полівінілпіролідон			1,8
кальцію	або магнію	стеарат	1,8.

Комп'ютерна верстка Л. Бурлак

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

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