



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **114270** (13) **U**
(51) МПК (2017.01)

A61K 36/73 (2006.01)

A61K 131/00 (2006.01)

A61P 29/00

A61K 9/20 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2016 07288**

(22) Дата подання заявки: **05.07.2016**

(24) Дата, з якої є чинними
права на корисну
модель: **10.03.2017**

(46) Публікація відомостей
про видачу патенту: **10.03.2017, Бюл.№ 5**

(72) Винахідник(и):

**Гладух Євген Володимирович (UA),
Кисличенко Вікторія Сергіївна (UA),
Ленчик Лариса Володимирівна (UA),
Січкара Антоніна Анатолівна (UA),
Шаповал Ольга Миколаївна (UA)**

(73) Власник(и):

**НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ
УНІВЕРСИТЕТ,
вул. Пушкінська, 53, м. Харків, 61002 (UA)**

(54) ЛІКУВАЛЬНО-ПРОФІЛАКТИЧНИЙ ЗАСІБ У ФОРМІ ТАБЛЕТОК

(57) Реферат:

Лікувально-профілактичний засіб у формі таблеток на основі густого екстракту рослинної сировини та формоутворюючих допоміжних речовин. Як основний діючий компонент використовують густий екстракт плодів черемхи звичайної.

UA 114270 U

Корисна модель належить до галузі фармації та медицини, зокрема до лікувально-профілактичних засобів рослинного походження у формі таблеток, що призначенні для лікування та профілактики запальних захворювань ротової порожнини, а саме пародонтозу.

При захворюваннях пародонта, основою яких є запалення, використовують різні місцеві медикаментозні засоби - антисептичні, протизапальні, серед яких чільне місце займають препарати рослинного походження, які часто використовують для лікування власне гінгівітів, симптоматичних гінгівітів і локалізованого пародонтиту.

Відомим аналогом є протизапальний засіб сік каланхое [1] застосовують у вигляді аплікацій при запально-дистрофічній формі пародонтозу II-III ступеня.

Недоліком аналога є незручність у використанні, адже перед застосуванням сік необхідно підігріти до температури +37 °С.

Відомим аналогом є засіб рослинного походження Фітосепт [2] у формі таблеток для розсмоктування з вмістом натрію уснінату та ментолу, призначений для лікування інфекційно-запальних захворювання глотки і верхніх дихальних шляхів, лікування і профілактики пародонтозу, пошкодження слизової оболонки рота (опіки, виразки та ін.).

До недоліків аналога можна віднести індивідуальну чутливість до компонентів препарату, можливість алергії на ментол, відсутність кровоспинної дії.

Відомим аналогом є засіб рослинного походження шавлія [3] у формі таблеток для розсмоктування з вмістом екстракту шавлії та олії шавлії. Засіб призначений для місцевого лікування стоматитів, гінгівітів, пародонтиту, тонзиліту, фарингіту, ушкодження слизової оболонки порожнини рота.

До недоліків аналога можна віднести можливе виникнення алергічних реакцій.

В основу корисної моделі поставлена задача створення нового лікувально-профілактичного засобу у формі таблеток, який шляхом використання густого екстракту плодів черемхи звичайної і допоміжних формоутворюючих речовин при заданому співвідношенні забезпечує високу фармакологічну активність засобу при лікуванні захворювань запалень ротової порожнини.

Поставлена задача вирішується тим, що лікувально-профілактичний засіб у формі таблеток на основі густого екстракту рослинної сировини та формоутворюючих допоміжних речовин, згідно з корисною моделлю, як основного діючий компонент використовують густий екстракт плодів черемхи звичайної, при наступному співвідношенні компонентів, г:

густий екстракт плодів черемхи	0,040-0,150
наповнювач	та
підсоложувач	0,100-0,450
мікрокристалічна целюлоза	0-0,350
зв'язувальна речовина	0,025-0,050
аеросил	0,005-0,025
лубрикант	0,003-0,006.

Як варіант заявлений лікувально-профілактичний засіб при середній масі таблетки 0,53 г містить компоненти при наступному співвідношенні, г:

густий екстракт черемхи	0,050
лактоза	0,295
мікрокристалічна целюлоза	0,130
ПВП	0,035
аеросил	0,015
стеарат магнію	0,005.

Одержаний засіб практично не має побічної дії та протипоказань.

Як активну діючу речовину композиції вибраний густий екстракт плодів черемхи звичайної, який проявляє протизапальну, мембраностабілізуючу та кровоспинну дію. Кількісний вміст зазначеного екстракту в композиції визначений експериментальним шляхом. Наведений інтервал кількісних значень екстракту 0,040-0,150 г або 0,050 г на таблетку масою 0,5 г забезпечує необхідну терапевтичну дію засобу. Зменшення вмісту екстракту в композиції призводить до зниження активності засобу, а його збільшення не є доцільним, бо викликає погіршення смакових якостей заявленої композиції у формі таблеток, при цьому активність засобу практично не зростає.

Допоміжні формоутворюючі речовини можуть бути вибрані з будь-якого переліку дозволених до використання у фармації речовин, які забезпечують необхідні якості таблетки: достатню міцність, задовільні смакові якості тощо. Як варіант, наповнювачем та підсоложувачем може бути: лактоза, сахароза, сорбітол, манітол, а зв'язувальною речовиною) - полівінілпіролідон,

повідон, крохмаль, желатин, метилцелюлоза. Такий вибір допоміжних речовин забезпечує необхідну якість таблетки, не підвищує суттєво вартість готового засобу, традиційно використовується у виробництві лікарських засобів вітчизняними фармацевтичними підприємствами. Компоненти заявленого лікувально-профілактичного засобу є відомими та дозволеними до використання у фармації та медицині, проте їх якісна та кількісна сукупність є новою, не відомою з джерел інформації.

Корисну модель виконують наступним чином.

Змішують у необхідних кількостях заздалегідь просіяні наповнювач, мікрокристалічну целюлозу і 1/3 частину просіяного аеросилу. Одержану масу зволожують водним розчином зв'язувальної речовини і густого екстракту черемхи і піддають вологій грануляції. Гранули сушать, калібрують, опудрюють просіяними аеросилом (2/3 частини) і лубрикантом, потім пресують у таблетки.

Приклад 1

Для одержання 1000 таблеток масою 0,53 г змішують заздалегідь просіяні 295 г лактози, 130 г мікрокристалічної целюлози і 5 г (1/3 частина) аеросилу. Одержану масу зволожують водним розчином полівінілпіролідону (ПВП) з 50 г густого екстракту черемхи. Отриману масу піддають вологій грануляції. Гранули сушать, калібрують, опудрюють просіяними аеросилом 10 г (2/3 частини) і 5 г стеарату магнію, потім пресують у таблетки. Одержують 1000 таблеток масою 0,53 г наступного складу, г:

густий екстракт черемхи	0,050
лактоза	0,295
мікрокристалічна целюлоза	0,130
ПВП	0,035
аеросил	0,015
стеарат магнію	0,005.

Даний склад заявленого засобу є оптимальним і відповідає всім вимогам з точки зору фармакологічної дії, технологічних та споживчих якостей.

Приклад 2

Гостру токсичність лікувально-профілактичного засобу у формі таблеток вивчали на щурах обох статей з масою тіла 180-200±20 г при одноразовому внутрішньошлунковому введенні з метою знаходження середньосмертельної дози (ЛД₅₀) [4]. Значення доз вибирали згідно з методичними рекомендаціями ДЕЦ МОЗ України [4] та враховували те, що для внутрішньошлункового введення лімітуючим показником при визначенні гострої токсичності є максимальна доза четвертого класу токсичності (малотоксичні речовини) - 5000 мг/кг, якщо при цьому не спостерігається загибелі, введення більшої дози, як правило, є недоцільним. При проведенні дослідження нами була вибрана доза таблеток з екстрактом черемхи (таблеткова маса) 5000 мг/кг, яку вводили протягом 8 годин внутрішньошлунково щурам самцям та самкам з масою тіла 180-200±20 г. Загибелі тварин не спостерігали, що свідчить про те, що ЛД₅₀ знаходиться за межами 5000 мг/кг, а введення більшої дози є недоцільним [4].

Згідно з токсикологічною класифікацією речовин К.К. Сидорова [4] таблетки з екстрактом плодів черемхи звичайної належать до V класу токсичності - практично нетоксичні речовини.

Таким чином, заявлено лікувально-профілактичний засіб у формі таблеток з протизапальною, мембраностабілізуючою та кровоспинною дією і може бути використаний при лікуванні пародонтозу.

Заявлений засіб є практично нетоксичним, економічним і може бути одержаний за простою технологією на стандартному обладнанні хіміко-фармацевтичних підприємств.

Джерело інформації:

1. Медикаментозне лікування хвороб пародонта. Групи препаратів, механізм їх дії, показання та протипоказання до використання. Частина I. Антисептики рослинного походження. Огляд літератури. /Мельничук Г.М., Завербна Л.В., Мельничук А.С., Катівська Р.С. // Новини стоматології. - 2013. - № 1 - С. 92-97.

2. Фитосепт, таблетки для рассасывания: в упаковке 36 шт. 1 таб. Натрия уснинат 100 мкг ментол 2 мг [Електронний ресурс] - Режим доступу: <http://www.mentalhealth-recovery.com/fitosept-fitosept/>.

3. Шавлія, таблетки для смоктання. Інструкція для застосування препарату. [Електронний ресурс] Режим доступу: <http://mozdocs.kiev.ua/likiview.php?id=20946>.

4. Коваленко В.М. Експериментальне вивчення токсичної дії потенційних лікарських засобів / Доклінічні дослідження лікарських засобів: [метод, рек.] / В.М. Коваленко, О.В. Стефанов, Ю.М. Максимов, І.М. Трахтенберг [за ред.: член-кор. АМН України О.В. Стефанова] - К.: Авіцена, 2001. - С. 74-97.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

- 5 1. Лікувально-профілактичний засіб у формі таблеток на основі густого екстракту рослинної сировини та формоутворюючих допоміжних речовин, який **відрізняється** тим, що як основний діючий компонент використовують густий екстракт плодів черемхи звичайної, при наступному співвідношенні компонентів, г:
- | | |
|---------------------------------|--------------|
| густи́й екстракт плодів черемхи | 0,040-0,150 |
| наповнювач та підсоложувач | 0,100-0,450 |
| мікрокристалічна целюлоза | 0-0,350 |
| зв'язуюча речовина | 0,025-0,050 |
| аеросил | 0,005-0,025 |
| лубрикант | 0,003-0,006. |
2. Лікувально-профілактичний засіб у формі таблеток за п. 1, який **відрізняється** тим, що при середній масі таблетки 0,53 г містить компоненти, при наступному співвідношенні, г:
- | | |
|---------------------------|--------|
| густи́й екстракт черемхи | 0,050 |
| лактоза | 0,295 |
| мікрокристалічна целюлоза | 0,130 |
| ПВП | 0,035 |
| аеросил | 0,015 |
| стеарат магнію | 0,005. |

10

Комп'ютерна верстка М. Мацело

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