



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **78378** (13) **U**

(51) МПК (2013.01)

A61K 9/02 (2006.01)

A61K 35/64 (2006.01)

A61K 36/00

A61P 13/00

A61P 15/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2012 13082**

(22) Дата подання заявки: **16.11.2012**

(24) Дата, з якої є чинними
права на корисну
модель: **11.03.2013**

(46) Публікація відомостей **11.03.2013, Бюл.№ 5**
про видачу патенту:

(72) Винахідник(и):

**Сорока Микола Павлович (UA),
Кордюм Віталій Арнольдович (UA),
Пальшин Геннадій Інокентійович (UA),
Іродов Дмитро Михайлович (UA)**

(73) Власник(и):

**Сорока Микола Павлович,
вул. Заболотного, 76, кв. 188, м. Київ, 03187
(UA),
Кордюм Віталій Арнольдович,
вул. Артема, 53, кв. 25, м. Київ, 04053 (UA)**

(54) КОМПЛЕКСНИЙ СУПОЗИТОРІЙ НА ОСНОВІ НАТУРАЛЬНИХ БДЖОЛИНИХ ТА РОСЛИННИХ КОМПОНЕНТІВ

(57) Реферат:

Комплексний супозиторій на основі натуральних бджолиних, рослинних компонентів та допоміжних речовин. При цьому як активні компоненти містить суміш водно-спиртових екстрактів прополісу, чорної тополі, живокосту лікарського та звіробю.

UA 78378 U

Пропонована корисна модель належить до профілактичного засобу природного походження, а більш конкретно до комплексного супозиторію на основі натуральних бджолиних та рослинних компонентів, який може бути використаний як гігієнічно-профілактичний засіб для підтримки належного стану органів малого тазу.

Відомі супозиторії ректальні з прополісом, що містять прополіс, димексид та моногліцериди дистильовані, вітепсол (Патент РФ № 2207138, опубліковано: 27.06.2003, МПК⁷ А61К 35/64, А61К 9/02). Однак, вони не вирішують проблему хронічного та не достатньо швидкого проходження гострого запалення.

Відомі супозиторії ректальні (вагінальні) озонових олій, що містять основу - жир твердий, а як активну речовину містять рослинну олію озоновану (зародків пшениці, насіння вівса, виноградних кісточок, плодів шипшини або обліпихи) у наступному співвідношенні компонентів, мас. %: рослинна олія озонована 10,00-30,00; жир твердий - 70,00-90,00. (Патент України № 60084, Бюл. № 11 від 10.06.2011 р., МПК: (2011.01) А61К 8/02 (2006.01), А61К 9/02, А23D 9/00).

Проте, дані супозиторії не призначені для профілактичних дій при запальних процесах органів малого тазу.

Найбільш близьким до пропонованої корисної моделі за сукупністю суттєвих ознак є комплексно-складовий супозиторій на основі натуральних бджолиних компонентів, що містить препарат прополісу та допоміжні речовини [Патент України № 93582, МПК: (2011.01) А61К 35/64 (2006.01), А61К 9/02, А61Р 1/00, А61Р 13/08 (2006.01); опубл. 25.02.2011 р., Бюл. № 4]. Згаданий препарат - лікувально-профілактичний засіб у формі ректальних супозиторіїв з вмістом фенольного гідрофобного препарату прополісу та допоміжних речовин, виконаний на гідрофобній основі, який містить ліпофільний екстракт пилку квіткового, причому відношення фенольного гідрофобного препарату прополісу до ліпофільного екстракту пилку квіткового дорівнює 2:1, а їх сумарний вміст у складі засобу становить не менше 2,25 мас. %.

Даний супозиторій містить фенольно-гідрофобний препарат прополісу та ліпофільний екстракт обніжжя бджолиного, яке екстрагується газом дихлордифторметаном. Тому препарат не завжди може бути засвоєний організмом людини, зокрема, ослабленим хворобою. Окрім того, дані супозиторії не проявляють достатню профілактичну дію при запаленнях органів малого тазу.

В основу пропонованої корисної моделі поставлено задачу створення такого комплексного супозиторія на основі натуральних бджолиних та рослинних компонентів, який би мав підвищену профілактичну дію при запаленнях органів малого тазу, а також засвоювався б ослабленим хворобою організмом людини.

Поставлена задача вирішується пропонованим комплексним супозиторієм на основі натуральних бджолиних та рослинних компонентів, та допоміжних речовин, а згідно з корисною моделлю, як активні компоненти містить суміш водно-спиртових екстрактів прополісу, чорної тополі, живокосту лікарського, звіробою при наступному їх співвідношенні, у об'ємн. %:

водно-спиртовий екстракт прополісу	2-20
водно-спиртовий екстракт чорної тополі	2-15
водно-спиртовий екстракт живокосту лікарського	2-15
водно-спиртовий екстракт звіробою	2-15
допоміжні речовини	до 100.

Як допоміжні речовини препарат містить: віск бджолиний, твердий жир, диметилсульфоксид (ДМСО), поліетиленоксид, твін-80 (полісорбат). Вирішальним є органічне поєднання у пропонованому засобі компонентів бджолиного і рослинного походження, оптимальне співвідношення яких знайдено експериментально. Як активні діючі компоненти вибрано фармацевтично прийнятні стандартизовані лікарські субстанції. Проте, саме їх співвідношення і кількісний вміст дозволяє досягти ефекту розширення гігієнічно-профілактичних можливостей запропонованих супозиторіїв при мінімізації вмісту активних діючих компонентів внаслідок синергізму їх дії.

Активні компоненти комплексно-складових супозиторіїв на основі натуральних бджолиних та рослинних компонентів:

Водно-спиртовий екстракт чорної тополі, водно-спиртовий екстракт живокосту лікарського, водно-спиртовий екстракт звіробою лікарського.

Допоміжні компоненти:
твердий жир

диметилсульфоксид (ДМСО)
 поліетиленоксид
 віск бджолиний натуральний,
 твін-80 (полісорбат).

5 Всі активні компоненти запропонованого супозиторія мають відому профілактичну дію:

Водно-спиртовий екстракт прополісу характеризується різноманітними властивостями: антимікробними, антимікотичними, антивірусними, антиоксидантними, андрогенними, репаративними, протизапальними, імуномодуючими, радіопротекторними, спазмолітичними, цитостатичними, адаптогенними.

10 Прополіс не є токсичним для організму людини, не викликає резистентності у мікробів, не пригнічує кишкову мікрофлору. Людський організм не звикає до дії прополісу. Ліпіди прополісу запобігають виникненню тромбів в кровоносних судинах, покращують мікроциркуляцію, нормалізують склад крові, виводять холестерин із стінок судин. Прополіс посилює імунологічну реактивність організму, затримує розвиток ракових клітин передміхурової залози, запобігає злоякісному переродженню аденоми, завдячуючи флавоноїдам кампфериду ерманіну та інших.

15 Стимулює функцію ендокринних залоз, в тому числі тимуса наднирників, статевих та щитоподібних залоз, прискорює клітковий обмін, очищує мембрани клітин, відновлює уражену тканину, збільшує зростання фібробластів, що веде до пом'якшення рубців.

В прополісі виявлено 284 різних сполук. 111 із них відомі сполуки. Більше 40 з яких належать до флавоноїдів (флавону (а) і флавону (б)), що знаходяться у вільному стані. Флавоноїди прополісу викликають спазмолітичну дію та збільшують прилив крові до хворого місця, забезпечують регенерацію клітин передміхурової залози, зменшують крихкість капілярів. Найбільшу кількість із мінеральних речовин становить цинк і марганець. Цинк запобігає зменшенню розмірів передміхурової залози, зменшує запальний процес в передміхуровій залозі і взагалі в органах сечостатевої системи. В прополісі виявлено більше 20 амінокислот, ненасичені жирні кислоти (особливо 10-гідрокси-2-деценева кислота), нікотинава пантатенова кислоти. Фенольні сполуки (яких багато в прополісі) виконують активну дію в окислювально-відновлювальних процесах. Таким чином прополіс є чудовим засобом при застосуванні в урології та проктології і взагалі для відновлення утрачених функції організму людини.

30 Водно-спиртовий екстракт чорної тополі містить велику кількість саліцилових сполук, які зменшують вміст сечової кислоти в крові. А флавоноїди прополісу активізують ці саліцилові сполуки. Вміст в екстракті глікозиду популіну активує регенерацію клітин слизових оболонок сечового міхура, уретри, передміхурової залози та слизової прямої кишки. Даний екстракт є сильним антисептиком, безпечним та протипухлинним засобом. Водно-спиртовий екстракт живокосту лікарського різко зменшує і призупиняє запальні процеси, має знеболюючу, протимікробну та протипухлинну дії. Надає в'язучий, пом'якшувальний та обволікаючий ефект на слизові оболонки сечового міхура, передміхурової залози, уретри, слизової прямої кишки. Алантоїн - сполука, що міститься в корені живокосту, поліпшує регенерацію пошкоджених тканин. Це продукт окислення сечової кислоти, який пом'якшує тканину (що дуже важливо при лікуванні циститу, простатиту та аденоми простати) та виводить відмерлі клітини. Цинк, який міститься у корені живокосту, зменшує запальні процеси.

40 Водно-спиртовий екстракт звіробою має протизапальні, анагетичні властивості, а також використовується для розсмоктування інфільтративних наростів у передміхуровій залозі після перенесених гострих запальних процесів та поліпів прямої кишки. Впливає на біохімічні процеси в органах, уражених пухлинами.

45 Віск бджолиний натуральний має пом'якшувальні та протизапальні властивості. Покращує процеси обміну речовин. Має антиоксидантні властивості. При поєднанні водно-спиртових екстрактів прополісу, чорної тополі, живокосту, звіробою їх лікувальні властивості взаємопосилуються, що впливає на терапевтичні дії в урології та проктології.

50 Допоміжні компоненти;

Тверда гідрофобна основа - суміш твердого жиру і натурального бджолиного воску застосовується у складі комплексного супозиторія, як формуючий елемент, а також забезпечує рівномірний розподіл компонентів у засобі, що сприяє підвищенню їх біодоступності та забезпечує необхідні фізико-хімічні та технологічні показники.

55 Диметилсульфоксид використовується для досягнення максимальної біодоступності складових у комплексному супозиторії. Має добру пенетруючу дію і транспортує лікарські засоби крізь слизові оболонки до хворого місця, та проявляє при цьому протизапальну, антимікробну та безпечну дію.

Поліетиленоксид найкраще вивільнює поліфеноли із екстракту прополісу, є поверхнево активною речовиною, покращує стабільність супозиторних мас комплексного супозиторія. Твін-80 - поверхнево-активна речовина, що забезпечує стабільність супозиторної маси.

Загальні умови приготування супозиторної маси.

5 Для приготування комплексного супозиторія необхідна кількість бджолиного воску нагрівається до 65 °С та змішується з твердим жиром. Суміш охолоджується до 36-38 °С та при постійному перемішуванні по черзі додаються твін-80 (полісорбат), водно-спиртові екстракти прополісу, рослинні екстракти, Диметилсульфоксид (ДМСО) та поліетиленоксид.

10 Суміш перемішується до однорідної консистенції та подається у чарунки при температурі 37 °С. Чарунки запаюються після затвердіння супозиторної маси.

Загальні характеристики препарату

Отримана супозиторна маса може бути від жовтого до коричневого кольору із специфічним запахом, обумовленим запахом прополісу та бруньок тополі. Фізико-технологічні властивості відповідають вимогам до супозиторіїв.

15 Умови зберігання

Завдяки консервуючим властивостям прополісу та натурального бджолиного воску препарат зберігає свою активність за умови зберігання у темному місці при кімнатній температурі щонайменше 24 місяці.

Умови прийому:

20 Застосовують по одному супозиторію на ніч - при запальних процесах. При гострих та хронічних - по 1 супозиторію вранці та 1 на ніч.

Приклад виготовлення пропонованого препарату.

25 Для приготування комплексного супозиторія на основі натуральних бджолиних та рослинних компонентів використовували готові 20 %-ні водно-спиртові екстракти прополісу, живокосту лікарського, тополі чорної, звіробою, натуральний бджолиний віск, та допоміжні речовини - диметилсульфоксид (ДМСО), поліетиленоксид, твін-80 (полісорбат) фармацевтичної чистоти і твердий жир для супозиторіїв. В термостатованому змішувачі розтоплювали 300 г воску, додавали 10 г Твін-80 (полісорбату) і при ретельному перемішуванні поступово додавали 6,490 кг твердого жиру. Отриману однорідну масу охолоджували до 38 °С і при перемішуванні 30 додавали 1000 мл водно-спиртового екстракту прополісу, 650 мл водно-спиртового екстракту живокосту лікарського, 650 мл водно-спиртового екстракту тополі чорної, 550 мл водно-спиртового екстракту звіробою, 200 мл диметилсульфоксиду (ДМСО) і 150 мл поліетиленоксиду. Загальна маса складових становила близько 10 кг. Отриману однорідну масу подавали на автоматичну лінію розливу та отримували комплексний супозиторій масою 2 г наступного складу (в г на супозиторій):

водно-спиртовий екстракт прополісу	0,2
водно-спиртовий екстракт чорної тополі	0,13
водно-спиртовий екстракт живокосту	0,13
водно-спиртовий звіробою	0,11
диметилсульфоксид (ДМСО)	0,04
поліетиленгліколь	0,03
твердий жир,	1,298
віск бджолиний натуральний	0,06
твін-80 (полісорбат)	0,002
загальна вага супозиторія	2.

Було встановлено, що використання в пропонованих супозиторіях компонентів, які виходили за межі запропонованих у формулі діапазонів, призводило до передозування у випадку перевищення діапазону та до виникнення дефіциту - у випадку меншого вмісту того чи іншого продукту.

40 Приклади конкретного використання:

Приклад 1

Хворий С., 45 років. Хронічне запалення простати. Скарги на часте сечовипускання у нічний час. Інколи з різями.

45 Після 2-х курсів застосування комплексних супозиторіїв на основі натуральних бджолиних та рослинних компонентів (по 1 супозиторію вранці) лікування сечовипускання нормалізувалось. Загальний стан поліпшився.

Приклад 2

Хвора В., 54 роки. Діагноз - запалення слизової прямої кишки, гемороїдальні вузли.
Після 1-го курсу лікування комплексними супозиторіями на основі натуральних бджолиних та рослинних компонентів (один супозиторій на ніч) запальні процеси повністю зникли.

Приклад 3

5 Хворий А., 72 роки. Діагноз - гіперплазія передміхурової залози I-II ступеня. Хронічний простатит. Гостра затримка сечі.

10.11.11

УЗД простати: $V_{\text{прост}} \approx 36 \text{ см}^3$;

Загальний мазок: α - 40-50 у п/зор флора паличкова. Епітелій перехідний, циліндричний.

10 Помірна кількість "ключових клітин". Gp не виявлено. Tr.vag не виявлено.

Секрет простати: α - 60-80 у п/зор. Скупчення до 100 у п/зор. Лецитинові зерна – незначна кількість. Флора паличкова.

Призначення: ципринол 500 мг $\times 2$ рази на день, 14 діб.

Комплексний супозиторій - по 1 супозиторію вранці та на ніч, 21 день.

15 29.11.11

УЗД простати: $V_{\text{прост}} \approx 28 \text{ см}^3$;

Загальний мазок: α - 5-6 у п/зор.

Секрет простати: α - 10-12 у п/зор. Скупчення до 100 у п/зор. Лецитинові зерна - незначна кількість.

20 Хворий відмітив явне покращення вже з 3-4 дня отримання препаратів. Наприкінці курсу скарг у бік простати і прямої кишки не висувалось. Побічна дія не виявлена.

Приклад 4

Хворий А. 41 рік.

Діагноз: Загострення хронічного простатиту.

25 10.11.11

УЗД простати: $V_{\text{прост}} \approx 32 \text{ см}^3$;

Загальний мазок: α - 5-7 у п/зор флора паличкова. Gp не виявлено. Tr. vag не виявлено.

Секрет простати: α - 30-40 у п/зор. Лецитинові зерна - незначна кількість.

Призначення: Комплексний супозиторій - по 1 супозиторію вранці та на ніч. 9 діб

30 21.11.11

УЗД простати: $V_{\text{прост}} \approx 26 \text{ см}^3$;

Загальний мазок: α - 1-2 у п/зор. Флора - незначна кількість, паличкова.

Секрет простати: α - 10-20 у п/зор. Лецитинові зерна - незначна кількість.

Зі слів хворого дизуричні явища, пройшла важкість на 5 добу.

35 Побічна дія не виявлена.

Кожен з пацієнтів відчув значне покращення стану і не потребував подальшого лікування.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

40 Комплексний супозиторій на основі натуральних бджолиних та рослинних компонентів та допоміжних речовин, який **відрізняється** тим, що як активні компоненти містить суміш водно-спиртових екстрактів прополісу, чорної тополі, живокосту лікарського, звіробою при наступному їх співвідношенні, у об'ємн. %:

водно-спиртовий екстракт прополісу	2-20
водно-спиртовий екстракт чорної тополі	2-15
водно-спиртовий екстракт живокосту лікарського	2-15
водно-спиртовий екстракт звіробою	2-15
допоміжні речовини	до 100 л.

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