



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **88450** (13) **U**
(51) МПК (2014.01)
A61C 17/00

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: u 2013 13413	(72) Винахідник(и): Давтян Лена Левонівна (UA), Ващук Валентина Анатоліївна (UA), Малецька Зоряна Володимирівна (UA), Мотовиловець Марина Василівна (UA)
(22) Дата подання заявки: 18.11.2013	
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: 11.03.2014	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 11.03.2014, Бюл.№ 5	(73) Власник(и): Давтян Лена Левонівна, вул. Автозаводська, 25-в, кв. 20, м. Київ, 04114 (UA)
	(74) Представник: Лерантович Еліна Томашівна, реєстр. №285

(54) СТОМАТОЛОГІЧНИЙ ГЕЛЬ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЗАПАЛЬНИХ ЗАХВОРЮВАНЬ ПОРОЖНИНИ РОТА

(57) Реферат:

Гель для лікування запальних захворювань порожнини рота включає діючу речовину метронідазол і як допоміжні речовини гліцерин, триетаноламін, карбопол та очищену воду. Додатково, як діючі речовини містить CO₂ екстракти ромашки та шавлії і як допоміжні речовини містить гуарову та ксантанову камеді, ПЕГ-37, ДМСО, анестезин.

UA 88450 U

Корисна модель належить до галузі медицини та фармації і може знайти застосування в стоматологічній практиці для лікування захворювань порожнини рота.

Захворювання порожнини рота стійко утримують лідерство за поширеністю серед хвороб століття. Значна поширеність даного захворювання серед населення, зокрема втрата зубів у пацієнтів, несприятливий вплив вогнища пародонтальної інфекції на організм тощо - все це визначає як медичну, так і соціальну значимість даної проблеми.

Відомий засіб для профілактики і лікування карієсу, стоматиту, парадонтиту, пародонтозу, гінгівіту, галітозу "Біодент Гель" [Сертифікат відповідності No РОСС. RU. ПР14. В12222, ТУ9158-003-71623124-2003] містить у своєму складі наступні інгредієнти, мас. %: гідроксіапатиткальцію, хлоргексидину біглюконат, екстракт кореня аїру, гідроксиметилцелюлозу, сорбітол, воду очищену. Недоліком вказаного засобу є наявність у його складі хлоргексидинубіглюконату - катіонного антисептика, який застосовують у стоматології більше 30 років.

Попри високу антибактерійну активність хлоргексидин має низку негативних властивостей - подразнюючу і алергізуючу дію, зафарбовування зубів, пломб і язика, неприємний присмак, і може викликати розлад смакової чутливості, десквамацію епітелію порожнини рота, тому використання даного засобу протягом тривалого часу недоцільно.

Відома гелева композиція для лікування стоматологічних захворювань, що включає метронідазолу бензоат, хлоргексидину глюконат, мукоадгезивний реагент, гелеутворюючий агент, розчинник (пат. RU32242963, 19.06.2002 г.). Недоліком композиції є те, що вона недостатньо: зменшує глибину ясневого карману, очищає зубний наліт.

Відомий препарат для лікування захворювань пародонта "Метрагіл-Дента" ("Юнік Фармасьютікал Лабораторіз", Індія), до складу якого входять метронідазолу бензоат, 20 % розчин хлоргексидину диглюконату та допоміжні речовини: пропіленгліколь, карбомер-940, динатрію едетат, натрію сахаринат, левоментол, натрію гідроксид, вода.

До недоліків слід віднести значну вартість препарату.

Найбільш близьким аналогом є склад для лікування захворювань пародонта з вмістом спирту етилового, ефіру діетилового, метронідазолу, прополісу, ефірного масла чайного дерева та обліпихового масла (Патент UA, № 36575, 15.01.2002, бюл. № 1, А61К 9/06).

До недоліків слід віднести те, що до його складу входить прополіс, який може викликати алергічні реакції.

В основу корисної моделі поставлено задачу удосконалити стоматологічний гель для лікування запальних захворювань порожнини рота, за рахунок оптимального підбору якісного та кількісного складу компонентів. Дане буде забезпечувати оптимальну антимікробну та протизапальну дію, сприяти зниженню вірогідності алергічних реакцій, унеможливити виникнення токсичної та подразнюючої дії на організм.

Для вирішення поставленої задачі запропоновано стоматологічний гель для лікування запальних захворювань порожнини рота, що містить діючу речовину метронідазол і як допоміжні речовини гліцерин, триетаноламін, карбопол та очищену воду, та згідно з корисною моделлю, додатково як діючі речовини містить CO₂ екстракти ромашки та шавлії і як допоміжні речовини містить гуарову та ксантанову камеді, ПЕГ-37, ДМСО, анестезин, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

гуарова камедь	0,1-0,4
ксантанова камедь	0,6-1,0
карбопол	0,8-1,5
триетаноламін	0,3-0,8
гліцерин	3,0-7,0
ПЕГ-37	1,5-4,5
ДМСО	1,0-3,0
CO ₂ екстракт ромашки	0,1-0,3
CO ₂ екстракт шавлії	0,2-0,6
метронідазол	0,3-0,7
анестезин	0,8-1,5
вода	решта.

В гелі діючі речовини рослинного походження - CO₂ екстракт ромашки та шавлії; синтетичного походження - метронідазол; місцевоанестезуючий засіб - анестезин; гелеутворювач (формоутворюючий компонент) - карбопол; згущувачі гуарова та ксантанова камедь; гідрофільний неводний розчинник, зволожувач - гліцерин, ПЕГ-37; нейтралізатор карбомерних гелів - триетаноламін; розчинники - ДМСО та вода очищена.

Технічний результат, отриманий при здійсненні корисної моделі, виражається у виявленні високого рівня поліфакторної специфічної активності з одночасним зниженням і виключенням негативних побічних явищ.

5 Якісне та кількісне співвідношення діючих та допоміжних речовин, що є оптимальним, обґрунтованим на основі всебічних експериментальних досліджень.

Метронідазол (Ph Eur) синтетичний антимікробний препарат, який є похідним нітроїмідазолу. За довгі роки присутності на вітчизняному ринку метронідазол завоював популярність у споживача завдяки своїй ефективності, безпечності і оптимальному співвідношенню ціна/якість. Субстанція метронідазолу має великий стаж застосування при анаеробних інфекціях, зокрема викликаних бактеріями та пептококами. Механізм дії обумовлений проникненням всередину мікроорганізму молекули препарату, вбудовуванням його нітрогрупи в дихальний ланцюг найпростіших та анаеробів, що порушує дихальні процеси і спричиняє загибель клітин. У деяких видів анаеробів пригнічує синтез ДНК і спричиняє її деградацію (розрив ниток), таким чином, надається виражена бактерицидна дія.

15 CO₂ екстракт з ромашки має багатий хімічний склад, який надає екстракту протизапальні, антисептичні, протиалергічні, тонізуючі і регенеруючі властивості. Із наявності в екстракті апігеніну, апіну, герніарину, бісоболю і ендіциклоєфіру, він також має спазмолітичну і болезаспокійливу дію.

20 CO₂ екстракт шавлії використовується як компонент, який надає бактерицидну, антисептичну, протизапальну, антиоксидантну дію.

Триетаноламін (ТЕА) - регулятор рН в кремах і гелях. За хімічною структурою триетаноламін - низькомолекулярний аміноспирт, безбарвна або світло-жовта в'язка рідина, гігроскопічний. Добре розчиняється у воді, спирті, ацетоні, погано - в ефірі, вуглеводнях. Використовується як емульгатор масел, а також при регулюванні кислотності продукції.

25 Гуарову камідь використовують як згущувач, яка має такі властивості: регулює в'язкість, стабілізує емульсії, надає кремоподібної консистенції, однорідної структури. Біологічна дія гуарової камеді: нормалізує кишкову мікрофлору, детоксикатор.

30 Розчин ксантану стійкий до ферментів. У суміші з іншими камедями ефект загущення вище, ніж для кожного загущувача окремо. Для розчину ксантану характерні високі значення в'язкості та псевдопластичності в діапазоні рН від 2 до 12. Завдяки цим властивостям формує гарну структуру, довгостроково стабілізує продукти і подовжує термін їх зберігання.

35 Карбопол за міжнародною класифікацією "карбомер" застосовується в промисловості як згущувач (гелеутворювач). Він використовується для додаткової стабілізації емульсії, застосовується як регулятор в'язкості в гелях. Широке застосування цього інгредієнту обумовлене відсутністю побічної дії.

Для знеболення слизових оболонок вводять анестезин.

У результаті наукового експерименту встановлено фізико-хімічні, фармако-технологічні властивості гелю, а також "мікробіологічна чистота".

Спосіб приготування стоматологічного гелю.

40 Стадія 1. Необхідну кількість гуарової та ксантанової камедей додають до 1/2 частини води і залишають до повного набухання.

Стадія 2. До 1/2 частини ПЕГ-37 вводять СО-2 екстракти шавлії та ромашки, перемішують до отримання однорідної гомогенної маси.

45 Стадія 3. до 1/2 частини ПЕГ-37 вводять анестезин, перемішують до отримання однорідної гомогенної маси.

Стадія 4. Метронідазол розчиняють у ДМСО.

Стадія 5. Необхідну кількість карбополу розчиняють у гліцерині.

Стадія 6. Триетаноламін додають до 1/2 частини води і додають карбопол, перемішують до однорідності маси.

50 Стадія 7. До стадії 6 додають стадію 1, перемішують, додають стадію 2, стадію 3, перемішують, додають стадію 4, потім гліцерину, перемішують до однорідності маси.

Стадія 8. Упаковка гелю в туби.

Гель пакують в марковані відповідно до аналітично-нормативної документації туби. Перевіряють комплектність та відповідність друку на пачках.

55 Стадія 9. Пакування пачок в коробки.

Пачки пакують в групову упаковку. В кожну коробку вкладають листок-вкладиш. Перевіряють маркування на груповій етикетці.

Отриманий гель жовто-оранжевого забарвлення, без запаху, однорідний.

60 Вибір лікарської форми та шлях введення препарату в організм мають велике значення для успішного лікування. Гель є найбільш раціональною лікарською формою для місцевої терапії

захворювань порожнини рота, добре розподіляється та всмоктується на слизовій, що обумовлює високу біодоступність активних речовин. Тісний зв'язок гелю зі слизовою оболонкою полегшує проникнення діючих речовин. Відносно повільне розмивання слиною гелю дозволяє зберегти оптимальну концентрацію діючих речовин на локалізованій ділянці ясен.

5 Приклад. Варіанти складу гелю наведені у таблиці.

Гель за варіантом 2 має оптимальні фізико-хімічними показники і має ефективну фармакологічну дію. Кількісний вміст компонентів за варіантами 1 і 3 не відповідає заявленим параметрам. Одержаний за цими варіантами гель має відхилення від технологічних і фармакологічних вимог.

10

Таблиця

Компоненти	Варіант № 1	Варіант № 2	Варіант № 3
	%	%	%
гуарова камедь	0,1	0,2	0,4
ксантанова камедь	0,6	0,8	1,0
карбопол	0,8	1,0	1,5
триетаноламін	0,3	0,65	0,8
гліцерин	3,0	5,0	7,0
ПЕГ-37	1,5	3,0	4,5
ДМСО	1,0	2,0	3,0
CO ₂ екстракт ромашки	0,1	0,4	0,3
CO ₂ екстракт шавлії	0,2	0,5	0,6
метронідазол	0,3	0,5	0,7
анестезин	0,8	1,0	1,5
вода	решта	решта	решта

Таким чином, розроблений стоматологічний гель комплексної дії має перспективи користуватися широким попитом.

15 При виборі формоутворюючого компонента проведені технологічні, фізико-хімічні, структурно-механічні дослідження. Об'єктами дослідження вибрані синтетичні та природні гелеутворювачі: гідроксіетилцелюлозу (ГЕЦ), натрію альгінат та карбопол. За результатами досліджень вибрано оптимальний гелеутворювач - ГЕЦ, як найбільш оптимальний за реологічними та іншими показниками.

20 Як антимікробний компонент використано речовини рослинного походження. Згідно з проведеним аналізом літературних джерел рослинні компоненти повинні мати бактерицидну, антисептичну, протизапальну, анальгезуючу, ранозагоюючу дії. Використовування у складі стоматологічного гелю комплексу CO₂ екстрактів ромашки та шавлії є нововведенням.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

25

Гель для лікування запальних захворювань порожнини рота, що включає діючу речовину метронідазол і як допоміжні речовини гліцерин, триетаноламін, карбопол та очищену воду, який **відрізняється** тим, що додатково як діючі речовини містить CO₂ екстракти ромашки та шавлії і як допоміжні речовини містить гуарову та ксантанову камеді, ПЕГ-37, ДМСО, анестезин, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

30

гуарова камедь	0,1-0,4
ксантанова камедь	0,6-1,0
карбопол	0,8-1,5
триетаноламін	0,3-0,8
гліцерин	3,0-7,0
ПЕГ-37	1,5-4,5
ДМСО	1,0-3,0
CO ₂ екстракт ромашки	0,1-0,3
CO ₂ екстракт шавлії	0,2-0,6
метронідазол	0,3-0,7
анестезин	0,8-1,5
вода	решта.

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