



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 97061

(13) U

(51) МПК

A61K 9/06 (2006.01)

A61K 36/268 (2006.01)

A61K 36/537 (2006.01)

A61K 36/61 (2006.01)

A61P 11/10 (2006.01)

A61P 11/12 (2006.01)

A61P 11/14 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2014 10763**

(22) Дата подання заявки: **02.10.2014**

(24) Дата, з якої є чинними
права на корисну
модель: **25.02.2015**

(46) Публікація відомостей
про видачу патенту: **25.02.2015, Бюл.№ 4**

(72) Винахідник(и):

**Баранова Інна Іванівна (UA),
Пуль Вікторія Вікторівна (UA),
Крижна Світлана Іванівна (UA),
Малашенко Тетяна Олександрівна (UA)**

(73) Власник(и):

**Баранова Інна Іванівна,
Салтівське шосе, 242 А, кв. 100, м. Харків,
61147 (UA),
Пуль Вікторія Вікторівна,
вул. Корчагінців, 13, кв. 406, м. Харків,
61178 (UA)**

(74) Представник:

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

(54) ГЕЛЬ "ІМБИРОЛ" ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЗАХВОРЮВАНЬ ВЕРХНІХ ДИХАЛЬНИХ ШЛЯХІВ

(57) Реферат:

Гель для лікування захворювань верхніх дихальних шляхів містить діючі речовини рослинного походження у вигляді ефірних олій біологічно активних рослин - імбиру, шавлії мускатної, майорану, чайного дерева та допоміжні речовини - карбомер, триметамол, поліетиленгліколь-40 гідрогенізовану рицинову олію, консервант, етанол 96 % та воду очищену.

UA 97061 U

Корисна модель належить до хіміко-фармацевтичної промисловості, а саме до створення гелів для застосування в комплексному лікуванні захворювань верхніх дихальних шляхів, зокрема ринітів.

Одним з важливих напрямів сучасної медицини та фармації є розробка нових і удосконалення існуючих на фармацевтичному ринку медикаментозних лікарських засобів, направлених на відновлення функціональної активності різних тканин та органів, порушених в результаті запальних процесів.

Особливої актуальності у цьому напрямку набувають різноманітні запалення органів дихання, зростання кількості яких в сучасних умовах не тільки негативно впливає на якість життя людини, але і в цілому знижує працездатність населення на тривалий термін чи стає причиною інвалідизації.

На сьогодні для лікуванні захворювань верхніх дихальних шляхів використовують пероральні лікарські засоби (сиropи, таблетки тощо). Також попитом користуються м'які лікарські засоби (мазі, креми, лініменти, бальзами та гелі). Вони представляють собою складні гетерогенні дисперсні системи, якість, ефективність і безпечність яких залежить від типу і складу основи носія, дисперсного стану лікарських речовин, доцільності і правильного підбору введення допоміжних речовин, ефективності консервантів, умов виробництва та зберігання тощо. Тому забезпечення необхідної фармакологічної дії при розробці м'якої лікарської форми може здійснюватись тільки при умові правильного підбору діючих і допоміжних речовин, раціональної технології, термінів та умов зберігання.

До переваг м'яких лікарських засобів можна віднести простоту у застосуванні, можливість поєднувати в одній лікарській формі декілька діючих речовин різноспрямованої дії, а також здатність забезпечувати тривалу концентрацію діючих речовин безпосередньо у місці нанесення препарату та ін. Гелева форма, безпечна для шкіри, зручна у застосуванні та гігієнічна. Також гелеві основи рівномірно розподіляються на поверхні шкіри або на слизовій оболонці, утворюючи захисну плівку, і не перешкоджають вивільненню лікарських речовин. Чинять охолоджувальну дію при нанесенні на шкіру за рахунок випаровування води.

Аналіз асортименту препаратів для лікування захворювань верхніх дихальних шляхів на фармацевтичному ринку України складає 114 торгівельних найменувань. Основними засобами є традиційні препарати у формі сиропу, спрею, капель, на відміну від засобів у формі гелів, які складають лише 4,1 %. Препарати у формі гелю мають додаткову зволожуючу дію на шкіру та слизову оболонку носа, а повільна дифузія активної речовини в тканині дозволяє досягти пролонгованого ефекту препарату. Тому розробка препарату у формі гелю є раціональними.

Враховуючи малу кількість вітчизняних комбінованих гелів для місцевого застосування для лікування захворювань верхніх дихальних шляхів, розробка і впровадження у виробництво нових лікарських засобів у формі гелю є актуальною задачею медицини і фармації.

На даний час попитом користуються препарати місцевого застосування для лікування захворювань верхніх дихальних шляхів з ефірними оліями. Завдяки комплексу властивостей препарат має виражену лікувальну дію, та не має звикання.

Існує Мазь "бальзам "Здоровье"» (balsam "health"), що містить ментол, камфору, олію перцевої м'яти, евкаліптову олію, гвоздичну олію, коричну олію і метилсу-ліцілат.

Відомий "бальзам "Золотая Звезда"" (Balsam "Golden Star", "Stella auraria"), ця мазь містить ментол, камфору, олію перцевої м'яти, евкаліптову олію, гвоздичну олію, коричну олію і метилсу-ліцілат (<http://www.med74.ru/infoitem2388.html>).

Як найближчий аналог взято мазь для зовнішнього застосування "Піносол" (Словенія, Зентива) (<http://www.eurolab.ua/drugs/medicine/18407>), що містить олії сосни та евкаліпту, ментол, тимол, токоферолу ацетат; а як допоміжні речовини: бутилгідроксіанізол, лабрафіл М, вазелін білий, віск білий.

В основу корисної моделі поставлена задача удосконалення гелю для зовнішнього застосування, в якому за рахунок оптимального підбору компонентів та їх співвідношень буде досягнута найбільш ефективна дія препарату для лікування захворювань верхніх дихальних шляхів, а також довгострокове збереження позитивного ефекту по закінченню лікування.

Поставлена задача вирішується тим, щогель для лікування захворювань верхніх дихальних шляхів, містить діючі речовини рослинного походження у вигляді ефірних олій біологічно активних рослин та допоміжні речовини, згідно з корисною моделлю, як ефірні олії біологічно активних рослин, а саме ефірні олії імбиру, шавлії мускатної, майорану, чайного дерева, а як допоміжні речовини - карбомер, трометамол, поліетиленгліколь-40 гідрогенізована рицинову олію, консервант, етанол 96 % та воду очищену при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

ефірна олія імбиру

0,5-2,5

ефірна олія шавлії мускатної	0,5-2,5
ефірна олія майорану	0,1-0,5
ефірна олія чайного дерева	0,1-0,5
карбомер	0,5-2,5
триметамол	0,5-2,5
поліетиленгліколь-40	
гідрогенізована рицинова олія	0,5-2,0
консервант	0,05-0,2
етанол 96 %	3,0-6,0
вода очищена	решта.

Як консервант використовують комплекс ніпагіну з натрієм бензоатом.

Гель для лікування захворювань верхніх дихальних шляхів представляє собою антимікробний, протизапальний та жарознижувальний засіб для місцевого лікування захворювань верхніх дихальних шляхів. Ефірна олія імбиру (*Olei Zingiber officinale*) має широкий спектр дії, а саме: протизапальну, зігріваючу, антисептичну. Оскільки ефірне масло має ще й потогінну дію, воно допомагає знизити високу температуру. Ефірна олія майорану (*Olei Majorana hortensis*) має антибактеріальні, протигрибкові та антисептичні властивості. Вона добре допомагає при риніті, запаленні пазух носа та інших. Ефірна олія шавлії мускатної (*Olei Salvia sclarea*) - це сильний анальгетик, має виражену бактерицидну, антивірусну та протизапальну дії. Ефірна олія чайного дерева (*Olei Melaleuca alternifolia*) - потужний антисептик, має сильну протівірусну та протизапальну дії. Також надає ранозагоювальну дію.

Співвідношення компонентів засобу підбрані таким чином, щоб забезпечити фармацевтичній композиції необхідні антимікробні, жарознижувальні та протизапальні властивості, а також швидку дію та тривалий ефект при використанні композиції, що заявляється. При введенні в склад засобу ефірних олій майорану, імбиру, шавлії мускатної та чайного дерева досягається потужний антимікробний та антисептичний ефекти, а також жарознижувальні властивості композиції.

При розробці сучасних лікарських препаратів для місцевого застосування широко використовують синтетичний згущувач-співполімер кислоти акрилової, отриманий полімеризацією в органічних розчинниках - "Карбомер" (карбомери, BP: Carbomers, PhEur: Carbomera, USP: Carbomer). Карбомер - синтетичний високомолекулярний рідкозшитий співполімер акрилової кислоти. Карбомер є основою для гелів та крему, який забезпечує оптимальні структурно-механічні властивості, необхідну в'язкість. Гелі карбомеру прозорі, не створюють на поверхні шкіри липкої плівки. Їх можна отримувати в широкому діапазоні pH від 5,0 до 9,0. Вони термічно і мікробіологічно стійкі, стабільні при зберіганні, сумісні з багатьма хімічними (в тому числі лікарськими) речовинами.

Системи з необхідною в'язкістю утворюються при нейтралізації карбомеру триметамолом, який, на відміну від інших амінопохідних, вважається нетоксичною речовиною.

Ефірна олія шавлії мускатної - легка, текуча, безбарвна або світло-жовта рідина з характерним свіжим квітковим і горіхово-трав'яним ароматом із солодко-гірким винним або амбровим відтінком. Основні компоненти: ліналілацетат (63-73 %) і ліналоол (13-17 %). У ньому також містяться ліналоолоксид (до 2 %), каріофілен (до 3 %), гермакрен D (до 4 %), α -терпінеол, цинеол, сальвіолі, геранілацетат, мирцен, оцімен, терпін-4-ол, нерілацетат, геранілацетат, α -кубеба, біциклогермакрен та їх похідні. У лікарських засобах олію шавлії мускатної застосовують як потужний антисептик, та знеболюючу речовину.

Ефірна олія імбиру - легка, текуча, безбарвна або світло-жовта рідина з характерним ароматом. Основні компоненти: зінгібєрен, альфа-куркуми, бета-бісаболєн, бета-сєсквіфєллєндрєн, бєта-карієфілєн, бєта-єлє, альфа-кєпєлє, герєнієлє, нєрєлє, цитронєлєл, камфєн, альфа-і бєта-пінєн, альфа-фєллєндрєн, лїмєнєн, 1,8-цїнєлє, лїналоєл, камфєра, терпінєн-4єл, альфа-терпїнєлє, альфа-гємєлєн. Масло імбиру має протизапальну, протівірусну і антибактеріальну дію.

Ефірна олія майорану - легка, текуча, блідо-жєвтє або бурштинєвє рідина з прєним, почєстї деревним запахом, щє нагадує кардамєн, з камфорним тєнами і прєно-арємєтичним гїрким смаком. У складї вїєвлєнє близькє 60 компонентїв, головними з яких є терпінєн-4-єл, туйєн-4-єл, альфа-терпїнєлє, терпїнєлєн, цїмєн, цїмєл, герєнієлє, лїналоєл, євгєнєл, лїналілацєтєт, герєнілацєтєт, сєбїна, сєбїнєнгїдрєт, лїмєнєн, бєта-фєллєндрєн, бєта-карієфілєн, цитраль. Має антибактерієлєну, прєтигрібкєву та антисєптичну дії.

Ефірна олія чайного дерева - має світло-жєвтїй або блїдо-єлїєвкєвий вїдтїнок і прєний терпкий аромєт з нєтками камфєри та деревини. Ефірна олія чайного дерева у свєємє

непростому хімічному складі має терпенеол, терпен, Сабіна, пінен, цінеол (евкаліптол), лімонен, цимол, рідкісні алігексаноат і вірідіфлорен, сесквітерпінові спирти і величезний перелік інших корисних речовин, з яких близько півсотні - органічні. Ефірна олія чайного дерева має протизапальні, противірусні та бактерицидні властивості. Антисептична дія цього засобу в разі ефективніше дії карболової кислоти і фенолу.

Завдяки науково-обґрунтованому підбору компонентів, гелева основа забезпечує розчинність усіх компонентів, в тому числі й важкорозчинних у воді ліпофільних речовин. Спосіб приготування гелевої основи полягає в наступному технологічному процесі.

Як консервант використовують комплекс ніпагіну з натрієм бензоатом.

Гелева система була приготовлена шляхом диспергування карбомеру у 1/3 частині води очищеної, в якій попередньо розчиняли натрію бензоат з ніпагіном, при кімнатній температурі та постійному перемішуванні. Процес диспергування даного гелеутворювача відбувався протягом 1 год. При цьому виходив однорідний прозорий гель з необхідними реологічними параметрами.

Для нейтралізації карбомеру готували розчин трометамолу для уникнення локального залуження та руйнування структури карбомеру при його внесенні у вигляді порошку.

Внаслідок того, що олії імбиру, шавлії мускатної, майорану та чайного дерева нерозчинні у гідрофільних розчинниках, їх попередньо розчиняли у етанолі 96 % та у ПЕГ - 40 гідрогенізованій рициновій олії (ПЕГ - 40 ГРО) при постійному перемішуванні до отримання однорідного мутного розчину, а потім дану суміш додавали до гелю.

Після приготування гелю проводили гомогенізацію у реакторі з рамною мішалкою на протязі 20 хв з одночасним вакуумуванням для уникнення процесу аерації у гелі.

Після гомогенізації відбирають контрольні проби з різних зон реактора та проводять аналіз проміжного продукту. Після отримання позитивних висновків гель передавали на стадії фасування, маркування та пакування.

У таблиці наведені приклади рецептур гелю. Збільшення чи зменшення кількісної частки компонентів веде до зміни реологічних (структурно-механічних властивостей) та споживчих характеристик гелю.

Готовий гель являє собою однорідну напівпрозору масу білого кольору із запахом, властивим ефірним оліям, які входять до його складу.

Таким чином, запропонований гель, завдяки вдалому сполученню речовин володіє ярко вираженими властивостями. Гель протизапальної, жарознижувальної та антимікробної дії може бути призначений для застосування в медицині.

Таблиця

Компонент	Склад компонентів, мас. %		
	1	2	3
Ефірна олія імбиру	0,5	2,0	2,5
Ефірна олія шавлії мускатної	0,5	2,0	2,5
Ефірна олія майорану	0,1	0,3	0,5
Ефірна олія чайного дерева	0,1	0,3	0,5
Карбомер	0,5	2,0	2,5
Трометамол	0,5	2,0	2,5
Консервант	0,05	0,1	0,2
ПТЕГ - 40 ГРО	0,5	1,0	2,0
Етанол 96 %	3,0	5,0	6,0
Вода очищена	Решта	Решта	Решта

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

Гель для лікування захворювань верхніх дихальних шляхів, що містить діючі речовини рослинного походження у вигляді ефірних олій біологічно активних рослин, та допоміжні речовини, який **відрізняється** тим, що як ефірні олії біологічно активних рослин він містить - ефірні олії імбиру, шавлії мускатної, майорану та чайного дерева, а як допоміжні речовини містить карбомер, трометамол, поліетиленгліколь-40 гідрогенізовану рицинову олію, консервант, етанол 96 % та воду очищену, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

ефірна олія імбиру 0,5-2,5
 ефірна олія шавлії мускатної 0,5-2,5
 ефірна олія майорану 0,1-0,5
 ефірна олія чайного дерева 0,1-0,5

карбомер	0,5-2,5
триметамол	0,5-2,5
поліетиленгліколь-40	0,5-2,0
гідрогенізована рицинова олія	0,05-0,2
консервант	3,0-6,0
етанол 96 %	решта.

2. Гель за п. 1, який **відрізняється** тим, що як консервант використовують комплекс ніпагіну з натрієм бензоатом.

Комп'ютерна верстка І. Мироненко

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