



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 3465

(13) U

(51) 7 A61K9/02

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ

## ОПИС

ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ  
НА КОРИСНУ МОДЕЛЬвидається під  
відповідальність  
власника  
патенту

(54) ВАГІНАЛЬНИЙ СУПОЗИТОРІЙ ДЛЯ МІСЦЕВОЇ ТЕРАПІЇ КАНДИДОЗНОГО ВУЛЬВОВАГІНІТУ

1

2

(21) 2004031710

(22) 09.03.2004

(24) 15.11.2004

(46) 15.11.2004, Бюл. № 11, 2004 р.

(72) Головкін Володимир В'ячеславович

(73) Головкін Володимир В'ячеславович

(57) Вагінальний супозиторій для місцевої терапії кандидозного вульвовагініту, що містить антисептичну речовину та основу, який відрізняється тим, що він як антисептичну речовину містить

полігексаметиленгуанідину фосфат та додатково - тимол, рекутан та молочну кислоту при такому співвідношенні компонентів, г:

полігексаметиленгуанідину	0,03-0,05
фосфат	
тимол	0,05-0,075
рекутан	0,1-0,15
молочна кислота	0,1-0,15
основа	до 3,0.

Корисна модель стосується фармації та медицини, а саме, гінекології та дерматовенерології і може використовуватися у виробництві і застосуванні м'яких лікарських форм при лікуванні кандидозних вульвовагінітів у жінок.

Актуальність проблеми кандидозних вульвовагінітів обумовлена зростанням частоти реєстрації захворювання, значними ускладненнями, відсутністю ефективних методів терапії. Арсенал лікарських засобів для місцевої терапії, особливо вітчизняного виробництва, вкрай обмежений. Розробка нових ефективних місцевих засобів лікування грибкових уражень геніталій є до теперішнього часу важливою задачею фармації і медицини.

Відомий засіб для місцевого застосування "Вагінальний супозиторій" [Патент України 51679, МПК7 А61К 9/02 //Промислова власність.-2002.-№ 12(1).-С.3.29], який містить лимонну кислоту і як основу - суміш поліетиленгліколю з різною молекулярною масою.

Спільними суттєвими ознаками аналогу та корисної моделі, що пропонується, є наявність у складі речовини, що нормалізує біоценоз у піхві, та основи.

Але одна лимонна кислота не забезпечує достатньої біологічної дії, зокрема, антисептичної, протигрибкової, антибактеріальної.

Водорозчинна поліетиленгліколева основа внаслідок створення концентрованих розчинів з

високим осмотичним тиском викликає при застосуванні відчуття печіння, дискомфорту.

Найбільш близьким до пропонованої корисної моделі за складом і дією є засіб у вигляді супозиторія, який містить декаметоксин та гідрофільну желатино-гліцеринову основу [Патент України № 21025, МПК6 А61К 9/02, А61К 31/14 //Промислова власність.-1998.-№1.-С.3.1.72].

У прототипа і корисної моделі, що заявляється, спільною суттєвою ознакою є наявність в їх складі антисептичної речовини та основи.

Але цей засіб не забезпечує належної терапевтичної дії внаслідок швидкого метаболізму речовини в організмі. Декаметоксин відноситься до солей четвертинних амонійних основ, які подразнюють слизові оболонки та шкіру. Можливі прояви алергізації, висипки, відчуття пекучості. Желатино-гліцеринова основа є нестабільною, нестійкою при технологічній переробці та швидко піддається контамінації. Застосовують таку основу в останній час здебільше для ветеринарних засобів.

В основу корисної моделі поставлено задачу удосконалення вагінального супозиторія для місцевої терапії кандидозного вульвовагініту шляхом зміни його складу, що підвищить ефективність засобу та забезпечить комфортність його застосування.

Поставлена задача вирішується тим, що у супозиторії, який містить антисептичну речовину та основу, новим є те, що він як антисептичну речовину містить полігексаметиленгуанідину фосфат,

(13) U

(11) 3465

(19) UA

та додатково - тимол, рекутан та молочну кислоту при такому співвідношенні компонентів, г:

Полігексаметиленгуанідину фосфат	0,03 - 0,05
Тимол	0,05 - 0,075
Рекутан	0,1-0,15
Молочна кислота	0,1-0,15
Основа	до 3,0

Причинно-наслідковий зв'язок між сукупністю ознак, що заявляються, та технічним результатом полягає у такому.

Додаткове застосування полігексаметиленгуанідину фосфату (ПГМГ фосфату) у складі супозиторія дозволяє значно підвищити протимікробну, протигрибкову та протівірусну дію засобу, і, внаслідок цього, ще й протизапальну активність. ПГМГ фосфат - це нова полімерна речовина, яка відноситься до практично нетоксичних субстанцій, що не викликають привикання.

Тимол - це антисептик рослинного походження. Він потенціює дію ПГМГ фосфату та сприяє швидкому знезараженню можливих вагінальних виділень і відновленню нормоценозу.

Рекутан - це екстракт квітів ромашки, який проявляє протизапальну та антисептичну активність, підвищує місцевий імунітет.

Молочна кислота сприяє підтриманню кислого середовища піхви, при якому забезпечується нормальне функціонування слизової оболонки, пригнічення росту патогенної мікрофлори.

У цілому, склад супозиторію, що пропонується, надає цьому засобу значних протигрибкових та антибактеріальних властивостей, сприяє підвищенню протизапальної та ранозагоювальної дії. Композиційний склад супозиторію не проявляє подразнюючих і алергізуючих властивостей, за-

безпечує комфортність застосування, оптимальні реологічні властивості та стабільність засобу при застосуванні і зберіганні.

Супозиторії готують таким чином.

На водяній лазні при температурі до 50°C розплавляють ліпофільну основу - твердий жир, до напівохолодженого сплаву вносять молочну кислоту, попередньо виготовлений у невеликій кількості води розчин ПГМГ фосфату, рекутан та тимол. Перемішують і напівостиглу масу (40-42°C) розливають до підготовлених супозиторних форм. Форми розміщують на полицях побутового холодильника. Після застигання супозиторії виймають з форми, загортають у пергаментний папір, вкладають до коробочок і оформлюють до відпуску.

Приклад. Для виготовлення 1000 вагінальних супозиторіїв (із врахуванням виробничих втрат) до реактора з паровим або водяним підігрівом і мішалкою (18-20 об/хв.) вносять 2,275 кг ліпофільної основи - твердий жир, розтоплюють її при температурі 45-50°C, включають мішалку і при постійному перемішуванні вносять до основи 0,550 кг тимолу, 0,850 кг 30% водного розчину ПГМГ фосфату (попередньо готують цей розчин) і 0,150 кг молочної кислоти. Мішалкою перемішують масу на протязі 60-90 хвилин до однорідності. Далі знижують температуру маси до 40-42°C (виключивши обігрів реактора) і при перемішуванні вносять до маси 0,150 л рекутану. При постійному перемішуванні через 20-25 хвилин масу розливають у підготовлені супозиторні форми (діаметром 10,0 мм  $\pm$  0,2 мм і висотою 35,0 мм  $\pm$  3,0 мм). Форми із супозиторною масою охолоджують; після повного застигання супозиторії підлягають контролю якості у відповідності з вимогами Державної Фармакопеї України, вил. 1, с. 495 і наступному пакуванню.