



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 4366

(13) U

(51) 7 A61K9/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС

ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ
НА КОРИСНУ МОДЕЛЬвидається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ВАГІНАЛЬНИЙ ГЕЛЬ ДЛЯ МІСЦЕВОЇ ТЕРАПІЇ ТРИХОМОНІАЗУ

1

2

(21) 2004042440

(22) 01.04.2004

(24) 17.01.2005

(46) 17.01.2005, Бюл. №1, 2005р.

(72) Головкін Володимир В'ячеславович

(73) Головкін Володимир В'ячеславович

(57) Вагінальний гель для місцевої терапії трихомоніазу, що містить антимікробну речовину, динатрієву сіль етилендіамінтетраоцтової кислоти, пропіленгліколь та гелеутворювальну речовину, який відрізняється тим, що як антимікробну речо-

вину гель містить полігексаметиленгуанідину фосфат, як гелеутворювальну - проксанол-268 та додатково - ефірну олію чайного дерева і твін-80 при такому співвідношенні компонентів, мас. %:

полігексаметиленгуанідину фосфат	0,25-0,35
ефірна олія чайного дерева	0,25-0,50
динатрієва сіль етилендіамінтетраоцтової кислоти	0,05-0,15
твін-80	1,5-3,0
пропіленгліколь	20,0-30,0
проксанол-268	до 100,0.

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

Трихомоніаз є одним із найбільш поширених запальних захворювань нижнього відділу статевих шляхів, які викликаються піхвовими трихомонадами. У значній кількості хворих спостерігаються латентні або стерті форми трихомоніазу, часто, особливо у жінок, зовсім відсутні скарги і клінічні прояви захворювання, що свідчить про важливе епідеміологічне значення проблеми. У зв'язку із зростанням питомої ваги штамів *Trichomonas vaginalis*, які є резистентними до відомих лікарських препаратів, виникає потреба у розширенні асортименту засобів для лікування цього захворювання.

Відомий засіб у вигляді розчину, який містить метронідазол, розчинник та буферну систему (Патент РФ №2032402, МПК6 А61К31/41 // Изобретения - 1995.-№10 -С.107)

Але цей засіб недостатньо ефективний, тому що проведення місцевої терапії розчином не є зручним, введення розчинів до піхви не забезпечує тривалого утримування лікарської форми на ураженій слизовій оболонці. Короткочасний контакт з вогнищем запалення не створює необхідної терапевтичної концентрації діючого чинника.

Найбільш близьким до корисної моделі за складом і дією є гель метронідазолу, який містить метронідазол, пропіленгліколь, етанол, динатрієву сіль етилендіамінтетраоцтової кислоти, метилок-

сибензоат, пропілоксисбензоат, карбоксиполім етилен 940, триетаноламін та воду (РЛС-Доктор: Регистр лекарственных средств России.-М. ООО "ЗДС-2003", 2003.-Вып. 6.-С.531).

Спільною суттєвою ознакою прототипу та корисної моделі, що пропонується, є наявність у складі засобів:

- антимікробної речовини,
- динатрієвої солі етилендіамінтетраоцтової кислоти,
- пропіленгліколю,
- гелеутворюючої речовини.

Однак, метронідазол як антимікробний засіб не забезпечує достатньо широкого спектру і ефективності дії. Значна частина мікроорганізмів дуже швидко адаптується до метронідазолу, і на цей час з'явилися штами *Trichomonas vaginalis* та інших мікроорганізмів, стійких до цього засобу. Тому сумнівною є дієвість такого засобу при мікстинфекціях, викликаних поєднанням патогенних грибів і трихомонад, бактерій, хламідій тощо.

Склад засобу переважаний допоміжними речовинами, наприклад, консервантами етанолом, метилоксисбензоатом і пропілоксисбензоатом, які можуть спричинювати небажану побічну дію та викликати подразнення.

В основу корисної моделі поставлено задачу удосконалення вагінального гелю для місцевої терапії трихомоніазу шляхом зміни його складу, що підвищить ефективність засобу.

Поставлена задача вирішується тим, що у гелі, який містить антимікробну речовину, динатрієву

(13) U

(11) 4366

(19) UA

сіль етилендіамінтетраоцтової кислоти, пропіленгліколь та гелеутворюючу речовину, новим є те, що як антимікробну речовину гель містить полігексаметиленгуанідину фосфат, як гелеутворюючу - проксанол-268 та додатково - ефірну олію чайного дерева і твін-80 при такому співвідношенні компонентів, мас. %:

полігексаметиленгуанідину фосфат	0,25-0,35
ефірна олія чайного дерева	0,25-0,50
динатрієва сіль етилендіамінтетраоцтової кислоти	0,05-0,15
твін-80	1,5-3,0
Пропіленгліколь	20,0-30,0
проксанол-268	до 100,0.

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

Застосування полігексаметиленгуанідину фосфату (ПГМГ фосфату) як антимікробної речовини дозволяє значно підвищити протимікробну дію засобу, забезпечити йому значний протигрибковий та противірусний ефект, і, внаслідок цього, ще й протизапальну активність. ПГМГ фосфат - це нова полімерна речовина, яка відноситься до практично нетоксичних субстанцій, що не викликають привикання.

Ефірна олія чайного дерева містить у своєму складі понад три десятки цінних біоактивних речовин, які проявляють бактерицидну, антивірусну, протистозидну та протигрибкову активність. Застосовується як протимікробний, протизапальний, епітелізуючий та стимулюючий місцевий імунітет засіб.

Пропіленгліколь і проксанол-268 забезпечують оптимум реологічних властивостей гелю, а отже, комфортність аплікації засобу на слизові оболонки, відсутність подразнюючої та сенсибілізуючої дії, стабільність при зберіганні. Поєднання цих компонентів в якості основи для гелю проявляє додатково бактериостатичну активність та значно підвищує протимікробні властивості ПГМГ фосфату.

Твін-80 відноситься до неіоногенних поверхнево-активних речовин, він спричинює зменшення

поверхневого натягу, а, отже, сприяє кращому розподілу гелю на поверхні слизових оболонок уrogenіталій.

У цілому, склад гелю, що пропонується, надає цьому засобу значних протистозидних, протигрибкових та противірусних властивостей, сприяє підвищенню антимікробної, протизапальної та ранозагоювальної дії. Композиційний склад гелю не проявляє подразнюючих і алергізуючих властивостей, забезпечує оптимальні реологічні властивості та стабільність засобу при застосуванні і зберіганні.

Гель готують таким чином

У чашці на водяній лазні розплавляють відважену кількість проксанолу-268, вносять сюди ж попередньо окремо виготовлений розчин полігексаметиленгуанідину фосфату і динатрієву сіль етилендіамінтетраоцтової кислоти у пропіленгліколі, перемішують. Чашку знімають з нагрівника і, продовжуючи перемішування, вносять розчин олії чайного дерева у твін-80. Перемішують і однорідний гель-розчин розфасовують до флаконів темного скла, закупорюють.

Приклад

Для виробництва 100,0кг гелю до котла з паровим обігрівом та мішалкою завантажують 20,0кг пропіленгліколю, 0,25кг ПГМГ фосфату і 0,05кг динатрієвої солі етилендіамінтетраоцтової кислоти. При підігріванні (60-65°C) і перемішуванні (30-40об/хв) досягають повного розчинення компонентів. Не виключаючи мішалки та обігріву, до котла завантажують 78,0кг проксанолу-268, після повного розплавлення і перемішування підігрів котла виключають. До напівостиглої маси (40-45°C) у котел завантажують попередньо виготовлений розчин 0,25кг олії чайного дерева у 1,5кг твіну-80. Перемішують (30-40об/хв) протягом 30-40 хвилин. Після одержання результатів аналізу фізико-хімічних властивостей виготовленого гелю та їх відповідності аналітично-нормативній документації на продукцію гель передають на розфасовку і упаковку.