



УКРАЇНА

(19) UA (11) 47106 (13) U  
(51) МПК (2009)  
A61K 9/20

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ

## ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під  
відповідальність  
власника  
патенту

**(54) ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ У ФОРМІ ТАБЛЕТКИ З МУКОЛІТИЧНИМИ ТА ВІДХАРКУВАЛЬНИМИ ВЛАСТИВОСТЯМИ**

1	2
(21) u200909778	ацетилцистеїн 55,0-90,0
(22) 24.09.2009	амброксолу гідрохлорид 5,0-15,0
(24) 11.01.2010	лактози моногідрат 5,0-15,0
(46) 11.01.2010, Бюл.№ 1, 2010 р.	мікрокристалічна целюлоза 2,0-5,0
(72) БУЙНОВА ВІКТОРІЯ АНАТОЛІЙВНА	повідон 1,0-3,0
(73) МОВІ ХЕЛС ГМБХ, СН	метилпарабен 0,13-0,21
(57) 1. Лікарський засіб у формі таблетки з муколiтичними та відхаркувальними властивостями, що включає ацетилцистеїн як діючу речовину та допоміжні речовини - мікрокристалічну целюлозу, лактози моногідрат, магнію стеарат, який <b>відрізняється</b> тим, що містить другу діючу речовину амброксолу гідрохлорид і додатково допоміжні речовини - повідон, метилпарабен, пропілпарабен, кремнію діоксид колоїдний безводний, тальк, натрію крохмальгліколят, гіпромелозу, титану діоксид, макрогол, барвник жовтий захід при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:	магнію стеарат 0,025-0,039
	кремнію діоксид колоїдний безводний до 0,5
	тальк 0,2-3,0
	натрію крохмальгліколят 0,5-1,5
	гіпромелоза 1,0-5,0
	титану діоксид 0,025-0,045
	макрогол 0,02-1,0
	барвник жовтий захід 0,15-0,25.
	2. Лікарський засіб за п. 1, який <b>відрізняється</b> тим, що таблетка вкрита оболонкою.

Корисна модель належить до галузі медицини, зокрема до фармакології, а саме, до фармацевтичних засобів з муколiтичними та відхаркувальними властивостями і може бути використана при лікуванні гострих і хронічних захворювань дихальних шляхів, що супроводжуються порушенням бронхіальної секреції та евакуації секрету - гострому і хронічному бронхіті, хронічному обструктивному бронхіті, бронхопневмонії, бронхоектатичній хворобі, бронхіальній астмі, муковісцидозі, ларингіті, трахеїті, при запальних захворюваннях середнього вуха і синуситах, при синдромі шоків легень у дорослих, для профілактики та лікування ускладнень після оперативних втручань на легенях, при догляді за трахеостомою, до і після бронхоскопії.

Відомо лікарський засіб у формі таблетки з муколiтичними та відхаркувальними властивостями, що містить ацетилцистеїн-ФС як діючу речовину та як допоміжні речовини - целюлозу мікрористалічну, лактозу моногідрат (таблетоза), крохмаль кукурудзяний, магнію стеарат, покриття для нанесення оболонки Opadry II White [«ФАРМА СТАРТ ТОВ» Інструкція для медичного застосування препарату, <http://www.37.com.ua/notes.php?lek=18310>].

Для досягнення лікувального ефекту при використанні зазначеного препарату потрібно застосовувати досить великі дози діючої речовини, причому терапевтичний ефект досягається через 1-3 години після прийому.

В основу корисної моделі поставлено задачу шляхом поєднання двох діючих речовин при певному співвідношенні у терапевтичне ефективних дозах та сполучення з фармацевтичне прийнятими допоміжними речовинами створення лікувального засобу у формі таблетки з муколiтичними та відхаркувальними властивостями, який би давав можливість одержати лікувальний ефект при використанні меншої дози діючих речовин препарату і за менший часовий проміжок.

Поставлену задачу вирішують тим, що лікарський засіб у формі таблетки з муколiтичними та відхаркувальними властивостями, який включає ацетилцистеїн, як діючу речовину та допоміжні речовини ~ мікрористалічну целюлозу, лактози моногідрат, магнію стеарат, згідно з корисною моделлю, містить другу діючу речовину амброксолу гідрохлорид і додатково допоміжні речовини - повідон, метилпарабен, пропілпарабен, кремнію діоксид колоїдний безводний, тальк, натрію крохмальгліколят, гіпромелозу, титану діоксид, макрогол,

(19) UA (11) 47106 (13) U

барвник жовтий захід, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

ацетилцистеїн	55,0-90,0
амброксолу гідрохлорид	5,0-15,0
лактози моногідрат	5,0-15,0
мікрокристалічна целюлоза	2,0-5,0
повідон	1,0-3,0
метилпарабен	0,13-0,21
пропілпарабен	0,025-0,039
магнію стеарат	0,2-1,5
кремнію діоксид колоїдний безводний	до 0,5
тальк	0,2-3,0
натрію крохмальгліколят	0,5-1,5
гіпромелоза	1,0-5,0
титану діоксид	0,025-0,045
макрогол	0,02-1,0
барвник жовтий захід	0,15-0,25

Таблетку вкрито оболонкою.

Ацетилцистеїн за рахунок вільної сульфгідрильної групи розриває бісульфідні зв'язки мукополісахаридів мокротиння, що спричиняє зниження в'язкості бронхіального секрету. Він збільшує мукоциліарний кліренс, має антиоксидантну дію за рахунок властивості зв'язувати вільні радикали, при пероральному прийомі швидко і повністю абсорбується в шлунково-кишковому тракті. Максимальна концентрація досягається через 1-3 години після прийому.

Амброксолу гідрохлорид має протизапальний ефект, антиоксидантні властивості, стимулює місцевий імунітет та поновлення природного шару сурфактанту. Амброксолу гідрохлорид має виражену відхаркувальну, протизапальну, імуномодуючу, антиоксидантну і незначну протикашльову дію. Стимулює серозні клітини залоз слизової оболонки бронхів, збільшує кількість слизистого секрету і, таким чином, змінює порушене співвідношення серозного і слизистого компонентів. Це приводить до нормалізації реологічних показників мокротиння, знижує в'язкість та адгезивні властивості. При пероральному прийомі швидко і повністю абсорбується в шлунково-кишковому тракті. Біодоступність 100%. Добре проникає в легеневу тканину. Максимальна концентрація в плазмі крові досягає через 2 години після прийому препарату і утримується 10-12 годин.

Комбінація ацетилцистеїну та амброксолу гідрохлориду дає можливість одержати лікувальний ефект при використанні меншої дози діючих пре-

паратів і за менший часовий проміжок - приблизно 40 хвилин -2 години.

Присутність мікрокристалічної целюлози сприяє підвищенню пресованості таблетної маси і сприяє швидкому розпаданню таблеток у шлунково-кишковому тракті.

Тальк відіграє у композиції роль волого регулятора, підвищує плинність таблетної маси та є ковзною речовиною.

Магнію стеарат відіграє роль ковзної і змашуючої речовини, що зменшує силу виштовхування запресованої таблетки з матриці.

Макрогол (PEG 6000) є високомолекулярною речовиною, що являє собою довгі лінійні полімери, які за допомогою водневих зв'язків можуть утримувати молекули води.

Гіпромелоза має змашувальну та пом'якшуючу дію.

Таблетка, що вкрита оболонкою, сприяє більш спрямованому терапевтичному ефекту.

Корисна модель пояснюється прикладом.

Приклад.

Склад лікарського засобу у формі таблетки з муколітичними та відхаркувальними властивостями, мас. %:

ацетилцистеїн	70,14
амброксолу гідрохлорид	10,32
лактози моногідрат	8,93
мікрокристалічна целюлоза	4,34
повідон	1,67
метилпарабен	0,17
пропілпарабен	0,033
магнію стеарат	0,33
кремнію діоксид колоїдний безводний	0,33
тальк	0,33
натрію крохмальгліколят	0,84
гіпромелоза	2,0
титану діоксид	0,033
макрогол	0,33
барвник жовтий захід	решта

Таблетки одержують звичайним промисловим способом на стандартному промисловому обладнанні шляхом прямого пресування таблеткової маси.

За технологічними та фізико-хімічними властивостями заявлений лікарський засіб у формі таблетки відповідає всім вимогам Державної фармакопеї України.