



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **65607** (13) **U**
(51) МПК (2011.01)
A61K 31/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під
відповідальність
власника
патенту

(54) СУСПЕНЗІЙНИЙ ГЕЛЬ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ РАНОВИХ ПРОЦЕСІВ "СТРЕПТОМЕР"

1

(21) u201106254

(22) 19.05.2011

(24) 12.12.2011

(46) 12.12.2011, Бюл.№ 23, 2011 р.

(72) ДАВТЯН ЛЕНА ЛЕВОНІВНА, ОЛІФІРОВА ТЕ-
ТЯНА ФЕДОРІВНА, ВЛАСЕНКО ІРИНА ОЛЕКСІЇВ-
НА, ОЛІФІРОВ ОЛЕКСАНДР ОЛЕКСІЙОВИЧ,
ЄРОШЕКО СЕРГІЙ СЕРГІЙОВИЧ, КУЗЬМІН ОЛЕ-
КСАНДР ВОЛОДИМИРОВИЧ, АСЛАНЯН ЛЕВОН
СЕРГЕЄВИЧ

(73) ДАВТЯН ЛЕНА ЛЕВОНІВНА, ОЛІФІРОВА ТЕ-
ТЯНА ФЕДОРІВНА, ВЛАСЕНКО ІРИНА ОЛЕКСІЇВ-
НА, ОЛІФІРОВ ОЛЕКСАНДР ОЛЕКСІЙОВИЧ,
ЄРОШЕКО СЕРГІЙ СЕРГІЙОВИЧ, КУЗЬМІН ОЛЕ-
КСАНДР ВОЛОДИМИРОВИЧ, АСЛАНЯН ЛЕВОН
СЕРГЕЄВИЧ

2

(57) Суспензійний гель для лікування ранових процесів, що містить метилурацил, антибактеріальні компоненти та допоміжні компоненти, який **відрізняється** тим, що як антибактеріальні компоненти він містить стрептоцид та еритроміцин, а як допоміжні - поліетиленоксид 400, карбопол 940, триетаноламін, гліцерин та воду при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

стрептоцид	1,5-3,5
метилурацил	2,0-4,0
еритроміцин	0,8 (8000 ОД/г)-1,3 (13000 ОД/г)
поліетиленоксид 400	5,0-10,0
карбопол 940	0,6-1,5
триетаноламін	0,5-1,0
гліцерин	4,0-6,0
вода очищена	решта.

Корисна модель належить до галузі медицини та фармації і може знайти застосування в хірургічній практиці для лікування ранових процесів II фази при переході у III фазу.

Незважаючи на досягнення в медицині лікування ран в клінічній хірургії залишається актуальною проблемою. Це пов'язано з тим, що рановий процес - складний комплекс біологічних реакцій організму, що розвиваються у відповідь на пошкодження тканин і направлених на їх загоєння. З позиції загальної патології рановий процес є окремим випадком запалення, що виявляється поєднанням місцевих деструктивно-відновних змін і загальних реакцій.

Враховуючи вищевикладене, а також особливості сучасної хірургічної інфекції, очевидно, що сучасна медицина повинна мати у розпорядженні асортимент лікарських препаратів з різними лікарськими речовинами або їх комбінаціями в різних лікарських формах. Медико-біологічні вимоги до цих препаратів повинні бути обумовлені їх призначенням, способом вживання, стадією ранового процесу, характером рани.

Важливе місце при лікуванні ран в хірургічній практиці займає місцева терапія, тобто основними лікарськими формами є мазі, креми, гелі, розчини для зовнішнього застосування.

В даний час на фармацевтичний ринок України мазі для лікування ран поставляють 35 фармацевтичних фірм з 17 країн, у тому числі: Україна (12 фірм), Росія і Польща (по 3 фірми). Для лікування ран і опіків в Україні використовують мазі, що складають 15 % від всього асортименту зареєстрованих м'яких лікарських засобів. З них у першій фазі ранового процесу використовуються 57 %, у другій фазі - 31 %, у третій фазі - 12 %.

При місцевому лікуванні ранових процесів використовують антибіотики та антимікробні препарати. В лікуванні даної патології добре зарекомендували себе еритроміцин та стрептоцид.

Найближчим аналогом є мазь «Метилурацил - Дарниця» на гідрофільній основі, яка містить метилурацил, антибактеріальний компонент - мірамістин та допоміжні речовини, серед яких є консерванти (див. Компендіум, 2009, реєстраційний № UA/1750/01/01 від 30.07.2009 до 30.07.2014).

Недоліком найближчого аналога є наявність у його складі консервантів, що підвищує токсичне навантаження на хворого і обумовлює виникнення в окремих випадках алергічних реакцій.

В основу корисної моделі поставлено задачу створити такий суспензійний гель для лікування ранових процесів, у якому шляхом зміни якісного і кількісного складу досягається можливість виклю-

(19) **UA** (11) **65607** (13) **U**

чення зі складу консервантів і зменшення концентрації діючої речовини, що зменшує токсичне навантаження на організм хворого і понижує вірогідність виникнення алергічних реакцій.

Для вирішення задачі запропонований суспензійний гель для лікування ранових процесів, що містить метилурацил, антибактеріальні компоненти та допоміжні компоненти, який згідно з корисною моделлю, як антибактеріальні компоненти містить стрептоцид та еритроміцин, а як допоміжні - поліетиленоксид 400, карбопол 940, триетаноламін, гліцерин та воду при наступному співвідношенні компонентів, мас. %: стрептоцид - 1,5-3,5; метилурацил - 2,0-4,0; еритроміцин - 0,8 (8000 ОД/г) - 1,3 (13000 ОД/г); поліетиленоксид 400-5,0-10,0; карбопол 940 - 0,6-1,5; триетаноламін - 0,5-1,0; гліцерин - 4,0-6,0; вода очищена - решта.

Перевагою запропонованого препарату є менша концентрація діючих речовин порівняно з референтними препаратами, що зменшує токсичне навантаження на організм людини. Ще однією перевагою запропонованого гелю є більш швидке вивільнення діючих речовин із основи гелю, що підтверджено кінетичними дослідженнями методом *in vitro*.

Запропонований гель не містить консервантів, що зменшує вірогідність алергічної реакції. Мікробіологічними дослідженнями доведена відповідність опрацьованого гелю за показником «мікробна чистота» при тривалому зберіганні, це обумовлено тим, що в препараті поєднані 2 антимікробних препарати, тому введення консервантів недоцільно.

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

Лікарський засіб виконано як гель, що пояснюється тим, що гелеві основи забезпечують більш швидке вивільнення та глибоке проникнення в рану діючих речовин з основи. Крім того, враховуючи особливості основи при нанесенні на ранову поверхню, створюється плівка, яка забезпечує захист від вторинної інфекції.

Структурно-механічними дослідженнями обґрунтовано склад основи гелю та концентрацію нейтралізатора карбомеру. Експериментальними дослідженнями доведена стабільність суспензійного гелю.

Регулювання мінімальної осмотичної активності лікарського засобу досягнуто за рахунок обґрунтованого введення до основи гідрофільно-неводного розчинника (ГНР)

(гліцерин, поліетиленоксид 400 або суміші вказаних сполук). Дані ГНР також забезпечують пене-трацію діючих речовин. Методами *in vitro* та *in vivo* встановлена доцільність введення діючих речовин у вигляді суспензій.

Мікробіологічними дослідженнями встановлено оптимальна концентрація діючих речовин, що склала 8000-13000 ОД/1 г для еритроміцину та 1,5-3,5 мас. % для стрептоциду відповідно. Зменшення концентрації антимікробних препаратів порівняно з аналогами стала можливою за рахунок поєднання їх дії та технологічного прийому введення діючих речовин до складу основи.

Методами *in vivo* також встановлено оптимальну концентрацію метилурацилу 2-4 мас. %, що теж менше, ніж у аналогів.

Таким чином, встановлено, що оптимальним є такий склад комбінованого емульсійно-суспензійного гелю, мас. % : стрептоцид - 1,5-3,5; метилурацил - 2,0-4,0; еритроміцин 0,8-1,3 (8000-13000 ОД/1 г); поліетиленоксид 400 - 5,0-10,0; карбопол 940 - 0,6-1,5; триетаноламін - 0,5-1,0; гліцерин - 4,0-6,0; вода очищена до 100,0.

Конкретні приклади одержання гелю.

Спосіб приготування гелю. Утворюють гелеву основу з р-ну карбомеру та триетаноламіну. В поліетиленоксид 400 при температурі вводять стрептоцид. В 1/2 частину гелевої основи вводять метилурацил. Отримані дві суспендовані маси гомогенізують. Еритроміцин суспендують з 1/2 частину гліцерину та додають іншу 1/2 частину гелевої основи та вводять 1/2 частину гліцерину та гомогенізують. Отриману суспензію еритроміцину додають до гомогенної отриманої попередньо маси та перемішують до одержання однорідного суспензійного гелю.

Приклад 1.

Для приготування гелю одержали суміш, в мас. % стрептоциду - 2, метилурацилу 3, еритроміцину 0,8, поліетиленоксиду 400 - 10, карбополу 940 - 0,8, триетаноламіну - 0,5, гліцерину - 5 та води 77,9. Все ретельно перемішали до одержання однорідного суспензійного гелю. При використанні гелю проявив високі ранозагоючі властивості на фоні відсутності алергічних реакцій.