



УКРАЇНА

(19) UA (11) 90241 (13) C2

(51) МПК (2009)

A61K 9/06

A61K 31/728 (2006.01)

A61K 31/60

A61K 36/28 (2006.01)

A61P 29/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ПРОТИЗАПАЛЬНА І БОЛЕЗАСПОКІЙЛИВА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ МІСЦЕВОГО ЗАСТОСУВАННЯ В ДІЛЯНЦІ ОПОРНО-РУХОВОЇ СИСТЕМИ ТВАРИН

1

2

(21) а200912711

(22) 28.05.2007

(24) 12.04.2010

(86) РСТ/ЕР2007/004713, 28.05.2007

(46) 12.04.2010, Бюл.№ 7, 2010 р.

(72) ЛОМБАРДО ВІНЦЕНЦО МАССІМО, ІТ, МОЛІ-
НАРІ АЛЬБЕРТО АНТОНІО, ІТ, ФЕРРАІОЛО РУГ-
ГЕРО, ІТ(73) ЛОМБАРДО ВІНЦЕНЦО МАССІМО, ІТ, МОЛІ-
НАРІ АЛЬБЕРТО АНТОНІО, ІТ, ФЕРРАІОЛО РУГ-
ГЕРО, ІТ

(56) ЕР 1 710 257 А, 11.10.2006

ЕР 0 695 187 А, 07.02.1996

US 2005/147570 А1, 07.07.2005

WO 91/00083 А, 10.01.1991

ЕР 0 307 277 А, 15.03.1989

WO 00/45796 А, 10.08.2000

(57) 1. Протизапальна і болезаспокійлива компо-
зиція для застосування в ділянці опорно-рухової
системи тварин, що містить як активні інгредієнти
нестероїдний протизапальний засіб і гіалуронову
кислоту та арніку, змішані з одержанням продукту,
пристосованого для проникнення активних інгреді-
єнтів, яка відрізняється тим, що композиція являє
собой суміш солі гіалуронової кислоти, гліколево-
го екстракту арніки та розчинного в гідрогелі не-стероїдного протизапального засобу і гідрогелю як
носія активних інгредієнтів.2. Композиція за п.1, яка відрізняється тим, що
містить (% мас.):

натрію гіалуронат	від 0,01 до 3,0
гліколевий екстракт арніки	від 0,5 до 7,0
будь-який розчинний в гідрогелі	
нестероїдний протизапальний	
засіб	від 2 до 10
гідрогель	від 70 до 95
воду очищену	0,2.

3. Композиція за пп.1 і 2, яка відрізняється тим,
що розчинний в гідрогелі нестероїдний протизапа-
льний засіб являє собою метилсаліцилат.4. Протизапальна і болезаспокійлива композиція
для застосування в ділянці опорно-рухової систе-
ми тварин, що містить як активні інгредієнти не-
стероїдний протизапальний засіб і гіалуронову
кислоту та арніку, змішані з одержанням продукту,
пристосованого для проникнення активних інгреді-
єнтів, яка відрізняється тим, що композиція міс-
тить (% мас.):

натрію гіалуронат	0,2
воду очищену	0,2
гліколевий екстракт арніки	2
метилсаліцилат	5
гідрогель	92,6.

Даний винахід стосується протизапальної і
болезаспокійливої композиції для застосування на
ділянці епідермісу, де відчувається біль від м'язів,
суглобів, сухожиль і зв'язків, що спричинений па-
тологічними процесами, ушибами і травмами.

Рівень техніки включає цілий ряд композицій у
формі мазі, крему, спрею або піни, які можуть за-
спокійти біль наведених вище типів і лікувати його
причину незначною або значною мірою. Як прик-
лади, наводяться комерційні продукти, присутні на

ринку під назвами Вольтарен (Voltaren®), Альге-
сал (Algesal®), Лазоніл (Lasonil®), Артросілен
(Artrosilene®), де активні інгредієнти, відповідно,
являють собою диклофенак діетиламоній, діети-
ламіносаліцилат, кетопрофен, лізинову сіль кето-
профену, тоді як існує цілий ряд інших продуктів, які
застосовують з такою ж метою, де використовую-
ються інші активні інгредієнти, включені до фарма-
копеї для вказаних цілей. Також документ відомий
JP 11279 065, де розкритий протизапальний про-

(13) C2

(11) 90241

(19) UA

дукт у формі розчину для місцевого застосування, що складається з двох розчинних у воді протизапальних засобів, один стероїдного типу та інший нестероїдного типу, і гіалуронової кислоти.

На ефективність болезаспокійливого і проти запального впливу відомих композицій впливає той факт, що такі композиції в більшості випадків містять активний інгредієнт, який сам по собі не переноситься ефективно до пошкодженої ділянки організму. Таким чином, ефективність вказаних композицій може бути короткотривалою і менш поширеною в цільовій ділянці. Крім того, відомі композиції можуть спричиняти небажані ефекти за рахунок легкої або значної гіперестезії по відношенню до одного або більше компонентів, а також алергічних реакцій.

Композиції за винаходом вільні від вищезгаданих обмежень і перешкод та забезпечують переваги, які описані нижче.

Композиція за винаходом включає як активні інгредієнти сіль гіалуронової кислоти, екстракт арніки і нестероїдний протизапальний засіб (FANS - наприклад, такий як метилсаліцилат, диклофенак, лізінова сіль кетопрофену), розчинний в гелі і, як носій активних інгредієнтів, гідрогель такого типу, який використовують в медицині при застосуванні ультразвуку і проведенні електричних імпульсів, тобто тип гелю, який доведено покращує фізичні властивості композицій, і який далі буде позначений як гідрогель.

Гіалуронова кислота як протизапальний і хемотаксичний засіб відома протягом тривалого часу, і загалом успішно використовується в ін'єкційних розчинах для лікування остеоартрозу, гонартрозу, поранень та опіків, в пластичній хірургії і культурі, а також як компонент очних засобів. У композиції за винаходом гіалуронова кислота переважно використовується як натрію гіалуронат, який розчиняють в мінімально необхідній кількості води очищеної перед виготовленням композиції.

Протягом тривалого часу відома ефективність арніки в лікуванні наслідків травм і симптомів, подібних до "посттравматичного стану"; FANS в лікуванні болю та як протизапального засобу; гідрогелю як носія лікарських засобів, які наносять на епідерміс.

Комбінація у композиції за винаходом вказаних трьох активних інгредієнтів і присутності гідрогелю, де всі чотири компоненти присутні в запропонованих пропорціях, дає рідкий продукт для розтирання, який швидко абсорбується епідермі-

сом і є високоефективним з точки зору заспокоєння болю суглобового і кістково-м'язового походження, з точки зору зменшення можливого запалення, а також з точки зору абсорбції можливого серозного виливу або позасудинного крововиливу, спричиненого травмою або контузією.

Така ефективність істотною мірою є наслідком протизапальних і хемотаксичних властивостей, а також значних гідрофільних властивостей гіалуронової кислоти. Остання розширює отвори в базальній мембрані і, при підтримці високої проникності, якій сприяє гідрогель, приводить до швидкого проникнення власне гіалуронової кислоти та двох інших протизапальних і болезаспокійливих компонентів в уражену ділянку. Крім того, у разі тривалого застосування, небажані ефекти та алергічні реакції, спричинені такою композицією, не зареєстровані.

У відповідності до перших рецептур вказаної композиції, які довели свою значну ефективність у випробуваннях, здійснених за участю багатьох осіб, 100г композиції включає (% мас):

- натрію гіалуронат - від 0,01% до 3,00%,
- гліколевий екстракт арніки - від 0,5% до 7,0%,
- будь-який розчинний в гідрогелі нестероїдний протизапальний засіб - від 2% до 10%,
- гідрогель - від 70% до 95%,
- воді очищена - 0,2%,

Як відомо, існує цілий ряд нестероїдних протизапальних засобів, і винахідниками доведено, що кожний з них, за умови розчинності в гідрогелі, може бути використаний в даній композиції в кількості від 2% до 10%, з метою одержання композиції з цільовою ефективністю. Доведено, що найбільш ефективним протизапальним засобом у композиції за винаходом є метилсаліцилат.

У відповідності до рецептури даної композиції, що виявилася найбільш ефективною у випробуваннях, здійснених за участю багатьох осіб та у ряді альтернативних значень відсоткового вмісту для чотирьох компонентів, наступна формула (% мас.) забезпечує цільові показники:

- натрію гіалуронат - приблизно 0,2%,
- вода очищена - приблизно 0,2%,
- гліколевий екстракт арніки - приблизно 2%,
- метилсаліцилат - приблизно 5%,
- гідрогель - приблизно 92,6%.

Слід відзначити, що відсотки, показані в наведеній вище формулі, можуть дещо варіювати без виходу за межі заявленої композиції.