



УКРАЇНА

(19) UA (11) 93515 (13) C2

(51) МПК (2011.01)

A61K 9/20

A61K 31/7048 (2006.01)

A61K 31/194 (2006.01)

A61K 31/341

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

(54) МЕДИКАМЕНТОЗНИЙ ЗАСІБ НА ОСНОВІ РУТИНУ

1

(21) a200802875

(22) 05.03.2008

(24) 25.02.2011

(46) 25.02.2011, Бюл.№ 4, 2011 р.

(72) ЛЕЛЕКА МАРІЯ ВАСИЛІВНА, ВРОНСЬКА
ЛЮДМИЛА ВІКТОРІВНА, ПІДРУЧНА СВІТЛАНА
РОМАНІВНА, СВИСТУН НАТАЛЯ ПЕТРІВНА(73) ТЕРНОПІЛЬСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ
УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ І.Я. ГОРБАЧЕВСЬКОГО(56) ЕА 011489 В1, 28.04.2009 & RU 200617016 А,
10.12.2007

RU 2262868 С2, 27.10.2005

KZ 12318 А, 17.12.2001

RU 2003102863 А, 20.08.2004

RU 2164764 С1, 10.04.2001

RU 2004135668 А, 20.05.2006

Активал, Активал Кид / Компендиум. – под ред.
Коваленко В.М., Викторова А.П. – Киев: МОРИОН.
–2007. – С.Л-39-Л40Аэровит // Современные лекарственные препара-
ты. – Авторы-сост. Крыжановский С.А., Витинова
М.Б. – М.: «РИПОЛ КЛАССИК». – 2000. – С.421

2

Аскорутин // Современные лекарственные препара-
ты. – Авторы-сост. Крыжановский С.А., Витино-
ва М.Б. – М.: «РИПОЛ КЛАССИК». – 2000. – С.405
Янтарная кислота, 10 таблеток [online] [Знайдений
03.02.2010] Знайдений у Internet
<[http://www.narmed.ru/apteka/bad/nerv/tonus?a=item
&id=2253](http://www.narmed.ru/apteka/bad/nerv/tonus?a=item&id=2253)> Збережена копія 30.10.2007

JP 5201858 А, 10.08.1993

BY 11634 С1, 28.02.2009

Михеев С.В., Коваленко А.Л. / Янтарная кислота:
фармакологическая активность и лекарственные
формы // Вет. практ. – 2001. - №2. – С.16-20 (ре-
ферат)(57) Медикаментозний засіб на основі рутину, що
містить кислоту аскорбінову, який відрізняється
тим, що до його складу додатково вводять кислоту
бурштинову, причому суміш готують у вигляді таб-
летованої лікарської форми при такому співвідно-
шенні інгредієнтів:

кислоти бурштинової - 0,05 г

кислоти аскорбінової - 0,10 г

рутину - 0,05 г

допоміжних речовин до одержання таблетки ма-
сою 0,35 г.

Винахід стосується медицини, зокрема, фар-
мації, і може бути використаний у фармацевтичній
промисловості при виготовленні медикаментозних
засобів на основі кислоти бурштинової та рутину.

Відомий медикаментозний засіб на основі ру-
тину (таблетки „Аскорутин“), що містить кислоту
аскорбінову. [1]. Завдяки поєднанню рутину з кис-
лотою аскорбіною забезпечується капілярозміц-
нююча дія препарату (зниження проникності та
ламокості капілярів, зміцнення клітинної стінки).

Недоліком відомого засобу є недостатня ліку-
вальна ефективність, що проявляється обмеже-
ним впливом на процеси адаптації до підвищення
навантажень на органи і системи організму. Крім
цього, область застосування препарату обмежу-
ється захворюваннями з Р-вітамінною недостатні-

стю. Вказаний засіб характеризується слабо вира-
женою адаптогенною дією.

В основу винаходу поставлено завдання вдос-
коналити відомий засіб, у якому шляхом введення
додаткового інгредієнта, дія якого спрямована на
мобілізацію ендogenous макроергічних сполук до-
сягають інтенсифікації загального метаболічного
процесу, підвищення фармакологічної активності
відомого засобу, а отже, лікувальної ефективності
препарату в цілому.

Поставлене завдання вирішується тим, що до
відомого медикаментозного засобу на основі ру-
тину, що містить кислоту аскорбінову, відповідно до
винаходу додатково вводять кислоту бурштинову,
причому суміш готують у вигляді таблетованої
лікарської форми у такому співвідношенні інгреді-
єнтів:

(13) C2

(11) 93515

(19) UA

кислоти бурштинової	0,05г.
кислоти аскорбінової	0,10г.
рутину	0,05г.

допоміжних речовин до одержання таблеток масою 0,35 г. Спосіб конкретно здійснюють наступним чином.

У змішувач вносять кислоту бурштинову, кислоту аскорбінову і рутин. Ретельно перемішують до однорідності. До одержаної суміші додають допоміжні речовини у наступній послідовності: крохмаль картопляний, магнію стеарат, мікрокристалічна целюлоза марки 101 (МКЦ 101). Знову перемішують до однорідної маси. Для зволоження порошкової маси додають 3 % розчин крохмального клейстеру. Кількість зв'язуючого розчину підбирають таким чином, щоб забезпечити гомогенність і пластичність гранулюючої маси. Зволожену масу протирають через сито з діаметром отворів 3 мм, висушують при температурі 60°C до залишкової вологості не більше 1,5%, регранулюють через сито з діаметром отворів 1 мм. Сухі гранули опудрюють змазуючими речовинами.

Грануляти пресують на лабораторній таблетній машині з діаметром пуансонів 9 мм, масою однієї таблетки 0,35 г.

Одержаний продукт - таблетки для внутрішнього вживання із середньою масою 0,35 г, діаметром 9 мм, жовтуватого кольору, кислого смаку. Стійкість до роздавлювання не менше 50 ньютон, втрата в масі при стиранні не перевищує 1 %, розпадаються у воді очищеній.

Приклад 1.

У змішувач внесли з розрахунку на 1000 таблеток 50 г кислоти бурштинової, 100 г кислоти аскорбінової, 50 г рутину і ретельно перемішали до однорідності. Після цього додали допоміжні речовини у наступній послідовності: 72 г крохмалю картопляного, 3,5 г магнію стеарату, 72 г МКЦ 101. Суміш ретельно перемішували впродовж 5 хв після додавання кожної допоміжної речовини. Отриману порошкову масу зволожили 3 % розчином крохмального клейстеру. Кількість зв'язуючого розчину підбирали з розрахунку, необхідного для забезпечення гомогенності і пластичності гранулюючої маси. Зволожену масу протерли через

сито з діаметром отворів 3 мм, висушили при температурі 60°C до залишкової вологості 1,2%, регранулювали через сито з діаметром отворів 1 мм. Сухі гранули опудрили змазуючими речовинами.

Грануляти пресували на лабораторній таблетній машині з діаметром пуансонів 9 мм, масою однієї таблетки 0,35 г. Відхилення від середньої маси становило 1,25 %, стійкість до роздавлювання 101 Н, втрата в масі при стиранні 0,51 %, розпадаються у воді очищеній через 4 хвилини.

Приклад 2.

З метою дослідження технологічних аспектів отримання таблеток на основі кислоти бурштинової, кислоти аскорбінової та рутину було вивчено фармако-технологічні властивості окремих компонентів даних таблеток та їх суміші. Встановлено, що технологічні властивості рутину негативно впливають на фармако-технологічні властивості досліджуваної порошкової суміші і на процес таблетування в цілому, крім цього, спостерігалось розшарування порошкової суміші. Тому, для розробки запропонованих таблеток і був використаний метод вологої грануляції з додаванням до складу порошкової композиції крохмалю картопляного, магнію стеарату та МКЦ 101.

Отже, запропонований медикаментозний засіб адаптогенної дії у формі таблеток на основі кислоти бурштинової та рутину характеризується показниками, що повністю відповідають вимогам фармакопеї [2], а також підвищенням фармакологічної активності та лікувальної ефективності отриманих таблеток, порівняно із засобом-прототипом і може бути використаний у промисловому виробництві таблеток на основі кислоти бурштинової, кислоти аскорбінової та рутину.

Джерела інформації, які слід взяти до уваги:

1. Машковский М.Д. Лекарственные средства: В 2 т. - 14 изд., перераб., испр. и доп. - М.: ООО "Издательство Новая Волна", 2001.-Т. 1.-540 с.-Т. 2. - 608 с.
2. Державна Фармакопея України / Державне підприємство „Науково-експертний фармакопейний центр”. - 1-е вид. -Харків: PIPEГ, 2001. - 556 с.