



УКРАЇНА

(19) UA (11) 94805 (13) C2

(51) МПК (2011.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/137 (2006.01)
A61K 31/198 (2006.01)
A61P 11/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ У ФОРМІ ТАБЛЕТКИ З МУКОЛІТИЧНИМИ ТА ВІДХАРКУВАЛЬНИМИ ВЛАСТИВОСТЯМИ НА ОСНОВІ АМБРОКСОЛУ ТА АЦЕТИЛЦИСТЕЇНУ

1

2

(21) a200910860

(22) 27.10.2009

(24) 10.06.2011

(46) 10.06.2011, Бюл.№ 11, 2011 р.

(72) БУЙНОВА ВІКТОРІЯ АНАТОЛІЇВНА

(73) МОВІ ХЕЛС ГМБХ, СН

(56) UA 81969 C2, 25.02.2008

EA 004044 B1, 25.12.2003

JP 363072 A, 18.12.2002

(57) 1. Лікарський засіб у формі таблетки з муколітичними та відхаркувальними властивостями, що включає ацетилцистеїн як діючу речовину та допоміжні речовини - мікрокристалічну целюлозу, лактози моногідрат, магнію стеарат, який **відрізняється** 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,

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

ацетилцистеїн	55,0-90,02
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.

2. Лікарський засіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що таблетку вкрито оболонкою.

Винахід належить до галузі медицини, зокрема до фармакології, а саме, до фармацевтичних засобів з муколітичними та відхаркувальними властивостями і може бути використаний 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 трахеостомахом, до і після бронхоскопії.

Відомий лікарський засіб у формі таблетки з муколітичними та відхаркувальними властивостями, що містить ацетилцистеїн-ФС як діючу речовину та як допоміжні речовини - целюлозу мікрокристалічну, 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 винаходу поставлено задачу шляхом поєднання двох діючих речовин при певному співвідношенні у терапевтично ефективних дозах та сполучення з фармацевтично прийнятими допоміжними речовинами створити лікувальний засіб у формі таблетки з муколітичними та відхаркувальними властивостями, який би давав можливість одержати лікувальний ефект при використанні меншої дози діючих речовин препарату і за менший часовий проміжок.

(13) C2

(11) 94805

(19) UA

Поставлену задачу вирішують тим, що лікарський засіб у формі таблетки з муколітичними та відхаркувальними властивостями, який включає ацетилцистеїн, як діючу речовину та допоміжні речовини - мікрокристалічну 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 крохмалгліколят, гіпромелозу, титану діоксид, макрогол, барвник жовтий захід, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

ацетилцистеїн	55,0-90,02
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 крохмалгліколят	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 проти кашльову дію. Стимулює серозні клітини залоз слизової оболонки бронхів, збільшує кількість слизового секрету і, таким чином, змінює порушене співвідношення серозного і слизового 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 легеневи

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

Присутність мікрокристалічної целюлози сприяє підвищенню здатності до пресування 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.

Винахід 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 крохмалгліколят	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.