



УКРАЇНА

(19) UA (11) 45286 (13) U

(51) МПК (2009)

A61K 9/20

A61K 31/685 (2009.01)

A61K 31/375

A61K 31/59

A61K 33/06

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ
НА КОРИСНУ МОДЕЛЬвидається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ТАБЛЕТКИ НА ОСНОВІ КАЛЬЦІЮ ЦИТРАТУ

1

2

(21) u200810566

(22) 21.08.2008

(24) 10.11.2009

(46) 10.11.2009, Бюл.№ 21, 2009 р.

(72) ГРОШОВИЙ ТАРАС АНДРІЙОВИЧ, БЕЛЕЙ
НАТАЛІЯ МИКОЛАЇВНА, ЛЕВИЦЬКИЙ АНАТОЛІЙ
ПАВЛОВИЧ(73) ТЕРНОПІЛЬСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ
УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ І.Я.ГОРБАЧЕВСЬКОГО(57) Таблетки на основі кальцію цитрату, лецитину
і вітаміну D₃, які додатково містять кислоту аскор-
бінову, лактози моногідрат, метилцелюлозу мікро-
кристалічну марки МКЦ 12, полімерний субстратна основі полівідону марки Kollidon 17 pF, кальцію
стеарат, аспартам, ароматизатор банановий при
наступному співвідношенні інгредієнтів, мас. %:

кальцію цитрат	60,24
лецитин	24,10
кислота аскорбінова	6,02
вітамін D ₃	0,08
лактози моногідрат	3,67
МКЦ 12	1,93
Kollidon 17 pF	1,45
аспартам	1,00
ароматизатор банановий	1,00
кальцію стеарат	0,51.

Корисна модель відноситься до медицини, зо-
крема фармакології, а саме до лікарських засобів з
остеотропною активністю.

Відомі таблетки на основі кальцію цитрату,
лецитину і вітаміну D₃ [1]. Відомі таблетки «Лецитин-
D₃» використовуються для оптимізації процесу
остеогенезу та інших регенеративних процесів у
кістковій тканині [2, 3].

Недоліком даного препарату є недостатня ак-
тивність фармакологічної дії, що впливає з відсу-
тності кислоти аскорбінової, яка є необхідною для
створення та регенерації кісткової тканини [4, 5].
Крім того допоміжні речовини, що входять до
складу препарату «Лецитин-D₃», не дозволяють
отримати в промислових умовах лікарську форму,
яка відповідала б фармакопейним показникам
якості [6], а саме стійкості до роздавлення, сти-
раності, однорідності маси, також допоміжний
інгредієнт у препараті - крохмаль є середовищем
розвитку мікроорганізмів, що в свою чергу впливає
на зниження терміну придатності препарату.

В основу корисної моделі поставлено завдан-
ня створити лікарський засіб, спрямований на оп-
тимізації профілактики і лікування первинного та
вторинного дефіциту кальцію в організмі людини, у

формі таблеток для розжовування із покращеними
органолептичними властивостями і відповідними
показниками якості.

Поставлене завдання вирішують тим, що таб-
летки на основі кальцію цитрату, лецитину і віта-
міну D₃ додатково містять кислоту аскорбінову,
лактози моногідрат, метилцелюлозу мікрокриста-
лічну марки МКЦ 12, полімерний субстрат на ос-
нові полівідону марки Kollidon 17 pF, кальцію стеа-
рат, аспартам, ароматизатор банановий при
наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

Кальцію цитрат	60,24%
Лецитин	24,10%
Кислота аскорбінова	6,02%
Вітамін D ₃	0,08%
Лактози моногідрат	3,67%
МКЦ 12	1,93%
Kollidon 17 pF	1,45%
Аспартам	1,00%
Ароматизатор банановий	1,00%
Кальцію стеарат	0,51%

Таблетки на основі кальцію цитрату виготов-
лені наступним чином.

У змішувач вносять лецитин і кальцію цитрат з
розрахунку на одну таблетку 0,2г і 0,5г. Ретельно

(13) U

(11) 45286

(19) UA

перемішують до однорідності. Окремо готують суміш вітаміну D₃ з розрахунку на одну таблетку 0,00066г і МКЦ 12 змішуванням. Отримані суміші об'єднують, додають до них кислоту аскорбінову з розрахунку на одну таблетку 0,05г. Ретельно перемішують до однорідної суміші, до якої додають допоміжні речовини у наступній послідовності: лактози моногідрат, Kollidon 17 рF, кальцію стеарат і коригенти: аспартам і ароматизатор банановий. Отриману масу пресують на таблетній машині.

Одержаний продукт - таблетки для жування із середньою масою 0,83г, діаметром 13мм, кремового кольору, кисло-солодкого смаку із специфічним присмаком соняшника і приємним запахом. Стійкість до роздавлювання не менше 45 ньютон, втрата в масі при стираності не перевищує 1%, відхилення від середньої маси не перевищує 2%.

Приклад 1

У змішувач внесли 200г лецитину і 500г кальцію цитрату і одержали однорідну масу шляхом перемішування впродовж 10 хвилин. В окремий змішувач внесли 0,66г вітаміну D₃ і 16г МКЦ 12, перемішали впродовж 15 хвилин. До однорідної суміші кальцію цитрату і лецитину порціями при перемішуванні ввели суміш вітаміну D₃ і МКЦ 12, перемішували впродовж 5 хвилин і додали 50г кислоти аскорбінової. Отриману масу перемішували впродовж 10 хвилин. Після цього додали допоміжні речовини у такій послідовності: 30,5г лактози моногідрату, 1,2г Kollidon 17 рF, 0,42г кальцію стеарату, 0,83г аспарту і 0,83г ароматизатора бананового. Суміш перемішували не менше 5хв після додавання кожної допоміжної речовини.

Таблетну масу спресували на лабораторній таблетній машині ударного типу. Одержані таблетки - середньої маси 0,83254г у діаметрі 13мм з кисло-солодким смаком і приємним запахом. Стійкість до роздавлювання 50 ньютон, втрата в масі при стираності 0,19%, відхилення від середньої маси 0,69%.

Одержані таблетки досліджували в лабораторних умовах.

Остеотропна активність таблеток на основі кальцію цитрату доведена на експериментальних тваринах - білих щурах, яким була здійснена оваріектомія. Всього в експерименті було використано 20 білих щурів — самок у віці 4-4,5 місяці, середньою масою 200г. Досліджений засіб у дозі 250мг/кг маси тварини застосовували методом щоденного введення у шлунок натщесерце, починаючи з наступної доби після здійсненої оваріектомії. Через 30 днів виконували розрахунок балансу кальцію, методом визначення його концентрації в кормі, сечі та калі. Після евтаназії дослідних тварин у них виділяли стегнову кістку і визначали щільність кісткової тканини за методом Ходакова. Результати дослідження наведені в таблиці.

З наведених у таблиці даних видно, що застосування всередину запропонованого таблетованого засобу супроводжується зменшенням екскреції кальцію з одночасним накопиченням його в кістковій тканині лабораторних тварин, яким була здійснена оваріектомія. Так, порівняно з тваринами, яким було видалено яєчники, екскреція кальцію у досліджуваній групі зменшилася в двічі, досягаючи рівня 0,072 проти 0,171мг.

Таблиця

Показники остеотропної активності таблеток на основі кальцію цитрату

Група лабораторних тварин	Маса кальцію, що піддається екскреції, мг	Щільність стегнової кістки щурів, мг/мм ³
Контроль (1)	0,039	1,57
Тварини після оваріектомії (контроль 2)	0,171	1,43
Тварини після оваріектомії із застосуванням запропонованих таблеток	0,072	1,52

Зазначена закономірність підтверджується показником щільності стегнової кістки щурів, так у дослідній групі щільність складає 1,52 проти 1,43мг/мм³ у тварин на фоні оваріектомії.

Отже, запропоновані таблетки на основі кальцію цитрату забезпечують більш високий рівень фармакологічної активності, спрямованої на оптимізацію кальцієвого обміну, порівняно з прототипом, і можуть бути використані як дієвий лікувальний-профілактичний засіб.

Джерела інформації, які слід взяти до уваги:

1. Коваленко В. Профилактика и лечение остеопороза при ревматических заболеваниях суставов с использованием препаратов кальция / Коваленко В., Галицкая А., Клубова А. [и др.] // Ліки України. - 2003. - №1. - С. 21-23.

2. Левицький А.П., Макаренко О.А. БАДы в профилактике остеопороза // Створення, виробництво, стандартизація, фармако-економічні дослідження лікарських засобів та біологічних добавок: Матеріали II Міжнародної науково-практичної конференції / Левицький А.П., Макаренко О.А. - Харків: НФаУ, 2006. - С.400-401.

3. Деклараційний патент на винахід №68907А 61Р 19/00. Засіб для стимулювання остеогенезу / А.П. Левицький, О.А. Макаренко, О.П. Розуменко [та ін.] - Опубл. 16.08.04, Бюл. №8.

4. Спиричев В.Б. Витамины и минеральные вещества в комплексной профилактике и лечении остеопороза / Спиричев В. Б. // Вопросы питания. - 2003 - №1. - С.34-43.

5. Торбенко В.П., Касавина Б.С. Функциональная биохимия костной ткани. - М.: Медицина, 1977 - 272с.

6. Державна Фармакопея України / Державне підприємство «Науково-експертний фармакопейний центр». - 1-е вид. - Харків: РІРЕГ, 2001. - 556с.