



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **46630** (13) **U**
(51) МПК (2009)
A61K 9/06
A61K 8/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ЕМУЛЬГЕЛЕВА МАЗЕВА ОСНОВА ДЛЯ НАЗАЛЬНИХ ЛІКАРСЬКИХ І КОСМЕТИЧНИХ ФОРМ

1

(21) u200908078

(22) 31.07.2009

(24) 25.12.2009

(46) 25.12.2009, Бюл.№ 24, 2009 р.

(72) СОКОЛОВА ЛЮДМИЛА ВОЛОДИМИРІВНА,
ГАВКАЛЮК МАР'ЯНА ІВАНІВНА, ПАВХ ОЛЬГА
ІГОРІВНА, ГРИЦИК АНДРІЙ РОМАНОВИЧ

(73) СОКОЛОВА ЛЮДМИЛА ВОЛОДИМИРІВНА,
ГАВКАЛЮК МАР'ЯНА ІВАНІВНА, ПАВХ ОЛЬГА
ІГОРІВНА, ГРИЦИК АНДРІЙ РОМАНОВИЧ

2

(57) Емульгелева мазева основа для назальних лікарських і косметичних форм, яка **відрізняється** тим, що містить кукурудзяну олію і має склад (г):

карбопол	0,95-1,05
олія кукурудзяна	9,0-11,0
емульгатор ОС-20	2,5-3,5
цетиловий спирт	2,5-3,5
триетаноламін	0,20-0,30
вода очищена	до 100,0.

Корисна модель стосується фармації і медицини, а саме розробки складу мазевих основ і може бути використана у фармацевтичній промисловості та аптечній практиці при виготовленні назальних лікарських і косметичних засобів.

Основи для виготовлення мазей - це допоміжні речовини, що є носіями лікарських субстанцій, від яких залежить швидкість і повнота терапевтичного ефекту препарату, необхідна частота аплікацій.

Мазеві основи повинні утворювати на шкірі або слизовій оболонці тонку, суцільну, несповзаючу плівку; добре сприймати лікарські речовини в різноманітному агрегатному стані; бути хімічно стійкими; не реагувати з лікарськими речовинами; бути не токсичними та нешкідливими. Крім того основи повинні підтримувати оптимальне значення рН шкіри та слизових оболонок, забезпечувати активне вивільнення лікарських речовин та відповідати лікувальному призначенню препарату [3, 4].

Мазеві основи поділяють на три групи:

- Гідрофільні основи (поліетиленоксидні основи, гелеві, бентонітові основи та ін., основним недоліком яких є те, що вони володіють осмотичними властивостями, не дозволяють вводити речовини, які добре розчинні у оліях і жирах - наприклад вітаміни А, Д, Е та ін.);

- Гідрофобні основи (вазелін, озокерит, нафталанська нафта, природні жири, основним недоліком яких є те, що вони створюють липку плівку, погіршують газообмін шкіри і слизових оболонок,

можуть склеювати війчастий епітелій носу та затруднювати носове дихання, до них можна вводити лише жиророзчинні речовини);

- Дифільні основи (вазелін-ланолінова, емульсійні основи та ін., які дозволяють вводити речовини гідрофобної і гідрофільної природи, проте для досягнення стабільності вимагають використання значної кількості емульгаторів, які зв'язуються із виділеннями шкіри і погіршують обмінні процеси в ній, змінюють рН і природну вологість шкіри й слизових оболонок).

Найбільш близьким до корисної моделі, що заявляється, є основа лікарського засобу, „ВОЛЬТАРЕН емульгель” [5]. Основа препарату має наступний склад: карбопол 974 Р; кетомаркогол 1000; кокоїлу каприлокапрат (цетиол ЛС); спирт ізопропіловий; діетиламін, парафін рідкий, важкий; ароматизатор 45; пропіленгліколь; вода очищена.

Дане рішення обрано найближчим аналогом. Найближчий аналог збігається з корисною моделлю у тому, що містить в якості водної фази карбополовий гель.

Недоліком основи найближчого аналогу є використання лише речовин синтетичного походження, а особливо рідкого парафіну як основного компонента жирової фази. Парафін рідкий має ряд побічних дій, серед яких ефект парафіноутворення у легенях. Крім того, вуглеводні порушують нормальну вологість слизової оболонки, ускладнюють носове дихання і погіршують рух війчастого епіте-

(13) **U**

(11) **46630**

(19) **UA**

лію. При застосуванні на шкірі утворюють плівку, що перешкоджає шкірному газообміну.

В основу корисної моделі поставлено завдання розробити новий склад емульгелевої основи, яка у жировій фазі вміщує кукурудзяну олію, яка найкраще емульгується, більш стабільна і в емульгованому стані здатна легко проникати в шкіру і слизові, забезпечуючи кращу біодоступність діючих речовин, а отже - лікувальний ефект препарату. Основа є емульсійною системою змішаного типу, що вміщує емульгатори першого і другого роду, а в якості водної фази карбополовий гель. Завдяки введенню в емульсійну систему розчину ВМС, досягається належна стабільність при нижчій концентрації емульгаторів, що дозволяє мінімізувати їх побічну дію на організм.

Поставлену задачу корисної моделі вирішено тим, що емульгелева мазева основа для назальних лікарських і косметичних засобів, яка відрізняється тим, що містить кукурудзяну олію і має склад (г):

Карбопол	0,95-1,05
Олія кукурудзяна	9,0-11,0
емульгатор ОС-20	2,5-3,5
Цетиловий спирт	2,5-3,5
Триетаноламін	0,20-0,30
Вода очищена	до 100,0

Новим у корисній моделі, що заявляється, є використання кукурудзяної олії у складі жирової фази емульгелю.

Конкретно спосіб здійснювали таким чином. В ємкість поміщують 82,75 мл теплої (45 °С) води очищеної, на поверхню якої насилають тонким шаром 1,0 г карбополу. Залишають для набухання на 1-1,5 години при перемішуванні електричною мішалкою. Розчин карбополу змішують з 3,0 г попередньо розтопленим емульгатором ОС-20, при перемішуванні до отримання однорідної водної фази. У фарфоровій чашці розплавляють 3,0 г емульгатора цетилового спирту, до нього додають попередньо приготувані 10,0 г олії кукурудзяної, ретельно змішують до одержання гомогенної олійної фази. До олійної фази при перемішуванні електричною мішалкою додають водну фазу і емульгують до отримання однорідної маси. Потім по краплях додають 0,25 г триетаноламіну і перемішують до отримання маси необхідної консистенції. Зберігають у прохолодному місці в скляних банках.

Основа, яка пропонується - біла кремоподібна маса з ледь помітною гелеподібною структурою, без видимих включень, без запаху, за показниками якості відповідають вимогам ДФУ I вид., зберігає свої властивості протягом двох років [1].

Для дослідження намазування обраних емульгелевої основи визначали її реологічні параметри. Вивчення структурно-механічних властивостей проводили на віскозиметрі BROOKFIELD DV-11 + PRO (США) із циркуляційним ogrівником при температурі 20±1 °С (передбачувана температура зберігання мазі) та 34±1 °С (температура шкіряного покриву людини). На основі отриманих даних будували криві залежності напруги зсуву т від швидкості зсуву D. Емульгелева мазева основа характеризується пластичним типом текучості.

З метою повної і об'єктивної оцінки споживчих властивостей досліджуваної основи, були прове-

дені експерименти по визначенню в'язкості емульгелевої основи D (Пас·сек) при температурі 34 °С (відповідає температурі шкірних покривів) від швидкості зсуву Dg (с⁻¹), при яких моделюється намазування гідрофільних мазей на шкіряний покрив. На основі отриманих даних будували реограми плинності, які показують, що під впливом градієнту швидкості в'язкість системи починає зменшуватися і основа починає текти. Це дає право стверджувати, що дана основа має хороші споживчі характеристики і потребує незначних зусиль для рівномірного розподілу на шкірних покривах.

Для порівняльного вивчення споживчих характеристик експериментальних зразків проводили дослідження на 50 добровольцях, які оцінювали в балах відчуття при нанесенні на шкіру основи за формою, яка представлена в анкеті.

АНКЕТА

Оцінювання якості намазування і розподілення основи на шкірі і слизових оболонках:

1. надзвичайно добре намащування і розподілення;
 2. добре намащування і розподілення;
 3. з відчуттям дискомфорту;
 4. погане намащування і розподілення;
- Чи викликає основа відчуття стягнутості після нанесення? (так чи ні)
- Чи є відчуття липкості? (так чи ні)
- Чи «скочується» основа при намазуванні? (так чи ні)
- Чи є відчуття «жирності» при нанесенні? (так чи ні)

Досліджена емульгелева мазева основа не викликає стягнутості шкіри і добре змивається, має відчуття жирності при нанесенні і не „скочується" при намазуванні.

За результатами проведених досліджень запропоновано базовий емульгель із найкращими реопараметрами, термо- та колоїдною стабільністю, відповідним ступенем намащування на шкірні покриви, до складу якого входили цетиловий спирт (емульгатор II роду) і препарат ОС-20 (емульгатор I роду).

Джерела інформації:

1. Державна Фармакопея України / Державне підприємство «науково-експертний фармакопейний центр». - 1-е вид. - Харків: РІПЕГ, 2001. - 556 с.
2. Перцев И.М., Котенко А.М., Чуешов О.В., Халеева Е.Л. Фармацевтические и биологические аспекты мазей: Монография / Под ред. проф. И.М. Перцева. - Х.: Изд-во НФаУ: Золотые страницы, 2003. - 288 с.
3. Тихонов О.1., Ярних Т.Г. Аптечна технологія ліків: підручник для студентів фармацевтичних факультетів ВМНЗ України III-IV рівнів акредитації / Видання третє/ За редакцією О.1. Тихонова. - Вінниця: НОВА КНИГА, 2007. - 640 с. - С. 337-349.
4. Фармацевтическая технология. Технология лекарственных форм: учебник для студ. высш. учеб. заведений/ Под редакцией И.И. Краснюка, Г.В. Михайловой. - 3-е изд., перераб. и доп. - Москва: Издательский центр „Академия", 2007. - 592 с. - С. 441-465.
5. Фармацевтичні та медико-біологічні аспекти ліків / За ред. І.М. Перцева. - Вінниця: НОВА КНИГА, 2007. - 728 с.

