



УКРАЇНА

(19) UA (11) 47105 (13) U  
(51) МПК (2009)  
A61K 9/20МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ПАТЕНТУ  
НА КОРИСНУ МОДЕЛЬвидається під  
відповідальність  
власника  
патенту(54) ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ У ФОРМІ ТАБЛЕТКИ З ПРОТИЗАПАЛЬНОЮ, АНАЛЬГЕТИЧНОЮ ТА ХОНДРО-  
ПРОТЕКТОРНОЮ ДІЄЮ

1

2

(21) u200909777

(22) 24.09.2009

(24) 11.01.2010

(46) 11.01.2010, Бюл.№ 1, 2010 р.

(72) БУЙНОВА ВІКТОРІЯ АНАТОЛІЇВНА

(73) МОВІ ХЕЛС ГМБХ, СН

(57) 1. Лікарський засіб у формі таблетки з проти-  
запальною, анальгетичною та хондропротектор-  
ною дією, що містить діючі речовини - диклофенак  
і глюкозамін, та допоміжні речовини - мікрокриста-  
лічну целюлозу, натрію кроскармелозу, тальк, маг-  
нію стеарат, який **відрізняється** тим, що як діючі  
речовини використовують диклофенак калію, глю-  
козаміну сульфат натрію хлорид та додатково хо-  
ндрітину сульфат натрію, а як додаткові допомі-  
жні речовини використовують кремнію діоксид  
колоїдний безводний, натрію крохмальгліколят,  
гіпромелозу, макрогол, титану діоксид, барвник  
жовтий захід FCF, повідон, у наступному співвід-  
ношенні компонентів, мас. %:

диклофенак калію	3,0-5,0
глюкозаміну сульфат натрію хло- рид	35,0-50,0
хондрітину сульфат натрію	22,0-32,0
кремнію діоксид колоїдний без- водний	0,5-1,5
мікрокристалічна целюлоза	12,0-18,0
натрію кроскармелоза	1,0-5,0
натрію крохмальгліколят	1,0-5,0
гіпромелоза	0,5-3,0
макрогол	0,1-1,0
титану діоксид	0,1-0,4
тальк	1,0-3,0
барвник жовтий захід FCF	0,02-1,5
повідон	0,2-1,0
магнію стеарат	0,2-1,0.

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

Корисна модель належить до галузі медицини,  
зокрема до фармакології, а саме, до фармацевти-  
чних композицій з протизапальною, анальгетичною  
та хондропротекторною дією, і може бути викорис-  
тана для комплексного лікування запальних про-  
цесів, що супроводжують захворювання опорно-  
рухового апарату з ознаками запалення, болям,  
дегенеративно-дистрофічними змінами хрящової  
тканини суглобів і хребта, зменшенням рухливості  
суглобів, остеоартритів, периартритів, остеоартро-  
зу (у тому числі артрозу колінного, кульшового  
суглобів, міжпозвонокового остеохондрозу, спонди-  
лоартрозу), ревматоїдного артрити, переломів і  
травм (для прискорення утворення кісткового мо-  
золю), посттравматичного запалення м'яких тка-  
нин і опорно-рухового апарату (розтягнень, ушиб-  
ів).

Відомо фармацевтичну композицію з протиза-  
пальною, анальгетичною та хондропротекторною  
дією, що містить диклофенак натрію, глюкозаміну  
гідрохлорид та допоміжні речовини - лактозу або  
цукрозу, або таблетозу, мікрокристалічну целюло-  
зу, аеросил або силікс, крохмаль або кроскарме-

лозу, колідон, тальк, кальцію стеарат або магнію  
стеарат [UA №56750, A61K9/20, 2002].

Зазначена фармацевтична композиція має  
недостатню протизапальну, анальгетичну та хонд-  
ропротекторну дію. До того ж, диклофенак натрію,  
що використовується у цій фармацевтичній компо-  
зиції, має період досягнення максимуму концент-  
рації в плазмі від 1-2 години і період дії до 12 го-  
дин. Вживання диклофенаку натрію недостатньо  
безпечно через те, що він має негативну побічну  
дію.

В основу корисної моделі поставлено задачу  
створення лікарського засобу у формі таблетки з  
протизапальною, анальгетичною та хондропротек-  
торною дією, який би мав вищий терапевтичний  
ефект та знизив ризик побічних дій.

Поставлену задачу вирішують тим, що у лікар-  
ському засобі у формі таблетки з протизапальною,  
анальгетичною та хондропротекторною дією, що  
містить діючі речовини - диклофенак і глюкозамін  
та допоміжні речовини - мікрокристалічну целюло-  
зу, натрію кроскармелозу, тальк, магнію стеарат,  
згідно з корисною моделлю, що як діючі речовини  
використано диклофенак калію, глюкозаміну су-

(13) U

(11) 47105

(19) UA

льфат натрію хлорид та додатково хондроїтину сульфат натрію, а як додаткові допоміжні речовини додатково використано кремнію діоксин колоїдний безводний, натрію крохмальгліколят, гіпромелозу, макрогол, титану діоксин, барвник жовтий захід FCF, повідон, у наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

диклофенак калію	3,0-5,0
глюкозаміну сульфат натрію	35,0-50,0
хлорид	
хондроїтину сульфат натрію	22,0-32,0
кремнію діоксин колоїдний безводний	0,5-1,5
мікрокристалічна целюлоза	12,0-18,0
натрію кроскармелозу	1,0-5,0
натрію крохмальгліколят	1,0-5,0
гіпромелоза	0,5-3,0
макрогол	0,1-1,0
титану діоксин	0,1-0,4
тальк	1,0-3,0
барвник жовтий захід FCF	0,02-1,5
повідон	0,2-1,0
магнію стеарат	0,2-1,0.
Таблетку вкрито оболонкою.	

Диклофенак калію - це нестероїдний протизапальний засіб з анагетичною, протизапальною і антипіретичною активністю, має швидкий початок дії, яка особливо підходить для лікування гострої болі в умовах запалення. В основі механізму дії - інгібіція синтезу простагландинів, які відіграють головну роль у розвитку запалення, болю і лихоманки. Протизапальні, анагетичні і антипіретичні властивості нестероїдних протизапальних засобів пов'язані з їх властивістю інгібувати синтез простагландинів через блокування синтезу ферменту циклооксигенази. Диклофенак калію пригнічує переважно фазу ексудації, меншою мірою проліферації, зменшуючи синтез колагену і пов'язане з цим склерозування тканин.

Диклофенак калію в порівнянні з диклофенаком натрію, який використовують у прототипі, має менший період досягнення максимуму концентрації - 40 хв., що обумовлює швидше зняття болювого синдрому та період дії близько 6 годин. Крім того, диклофенак калію не кумулюється.

Вживання диклофенаку калію безпечніше порівняно з диклофенаком натрію через те, що у достовірно меншого числа пацієнтів виникають гострі медикаментозні ерозії шлунку і дванадцятипалої кишки.

Глюкозаміну сульфат натрію хлорид є субстратом побудови суглобного хряща, що стимулює регенерацію хрящової тканини. Він входить до складу ендогенних глюкозаміногліканів хрящової тканини, стимулює вироблення протеогліканів і збільшує поглинання сульфату суглобним хрящем. Таким чином, глюкозаміну сульфат натрію поповнює ендогенний дефіцит. Бере участь у біосинтезі протеогліканів і гіалуринової кислоти, чим протидіє прогресуванню дегенеративних процесів у суглобах.

Хондроїтину сульфат натрію є високомолекулярним мукополісахаридом, який впливає на фосфорно-кальцієвий обмін у хрящовій тканині, уповільнює резорбцію кісткової тканини і знижує втрату кальцію, уповільнює процеси дегенерації хрящової тканини, чинить хондропротекторну дію, стимулює регенерацію хрящової тканини, виявляє протизапальну, анагетичну дію, забезпечує хондропротекцію в нормальних умовах і в умовах деградації хрящової тканини.

Присутність мікрокристалічної целюлози сприяє підвищенню пресованості таблетної маси і сприяє швидкому розпаданню таблеток у шлунково-кишковому тракті.

Натрію кроскармелоза є наповнювачем.

Гіпромелоза має змащувальну та пом'якшуючу дію.

Макрогол (PEG 6000), є високомолекулярною речовиною, що являє собою довгі лінійні полімери, які за допомогою водневих зв'язків можуть утримувати молекули води.

Тальк очищений відіграє у композиції роль волого регулятора, підвищує плинність таблетної маси та є ковзною речовиною.

Магнію стеарат відіграє роль ковзної і змащувальної речовини, що зменшує силу виштовхування запресованої таблетки з матриці.

Таблетка, що вкрита оболонкою, сприяє більш спрямованому терапевтичному ефекту.

Корисна модель пояснюється прикладом.

Приклад

Склад лікарського засобу у формі таблетки з протизапальною, анагетичною та хондропротекторною дією, мас. %:

диклофенак калію	3,46
глюкозаміну сульфат натрію	44,11
хондроїтину сульфат натрію	27,57
кремнію діоксин колоїдний безводний	0,74
мікрокристалічна целюлоза	15,52
натрію кроскармелозу	2,91
натрію крохмальгліколят	2,84
гіпромелоза	1,01
макрогол	0,14
титану діоксин	0,14
тальк	0,73
барвник жовтий захід FCF	0,07
повідон	0,33
магнію стеарат	0,43
Маса таблетки становить 1480 мг $\pm$ 5 %.	

Лікарський засіб у формі таблетки з протизапальною, анагетичною та хондропротекторною дією 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 з протизапальною, анагетичною та хондропротекторною відповідає всім вимогам Державної фармакопеї України.

