



УКРАЇНА

(19) UA (11) 52262 (13) U
(51) МПК (2009)
A61K 36/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ, ЩО ПРОЯВЛЯЄ СПАЗМОЛІТИЧНУ, ЛІТОЛІТИЧНУ, ПРОТИЗАПАЛЬНУ, АНТИ-СЕПТИЧНУ ДІЮ

1

2

(21) u200914015

(22) 31.12.2009

(24) 25.08.2010

(46) 25.08.2010, Бюл.№ 16, 2010 р.

(72) ВРОНСЬКА ЛЮДМИЛА ВІКТОРІВНА, ЧУБКА МАР'ЯНА БОРИСІВНА, ГРОШОВИЙ ТАРАС АНДРІЙОВИЧ, ШАЛАТА ВОЛОДИМИР ЯРОСЛАВОВИЧ, СМАЛЮХ ОКСАНА ГРИГОРІВНА, ГЛУМЕНКО ОЛЕНА МИКОЛАЇВНА

(73) ВІДКРИТЕ АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО "КІЇВМЕДПРЕПАРАТ", ВІДКРИТЕ АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО "ГАЛИЧФАРМ"

(57) 1. Лікарський засіб, що проявляє спазмолітичну, літолітичну, протизапальну, антисептичну дію, що містить моркви дикої плодів екстракт, хмелю шишок екстракт, материнки трави екстракт, м'яти перцевої олію, ялиці олію, який відрізняється тим, що додатково містить допоміжні речовини для створення твердої лікарської форми при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

комплексний густий екстракт, який включає:

моркви дикої плодів екстракт рідкий,
хмелю шишок екстракт рідкий, ма-
теринки трави екстракт рідкий у 2,82-3,83

співвідношенні 1,00:1,44:1,00

м'яти перцевої олія 2,03-2,63

ялиці олія 7,13-9,53

рицинова олія 9,92-13,40

допоміжні речовини решта.

2. Лікарський засіб за п. 1, який відрізняється тим, що як допоміжні речовини містить розріджувачі, адсорбенти, розпушувачі, ковзні речовини.

3. Лікарський засіб за п. 2, який відрізняється тим, що як розріджувачі вибрано речовини, що вибрано з ряду лактоза моногідрат (таблетоза-80), магнію карбонат важкий, магнію алюмометасилікат (неусилін UFL2) та/або їх суміші.

4. Лікарський засіб за п. 2, який відрізняється тим, що як адсорбенти вибрано речовини, що вибрано з ряду магнію алюмометасилікат (неусилін UFL2), магнію карбонат важкий та/або їх суміші.

5. Лікарський засіб за п. 2, який відрізняється тим, що як розпушувачі вибрано речовини, що вибрано з ряду крохмаль картопляний, крохмаль натрію гліколяту та/або їх суміші.

6. Лікарський засіб за п. 2, який відрізняється тим, що як ковзні речовини вибрано речовини, що вибрано з ряду тальк, кислота стеаринова, аеросил та/або їх суміші.

Корисна модель відноситься до галузі медицини та хіміко-фармацевтичної промисловості, а саме фармацевтичних композицій із спазмолітичною, літолітичною, протизапальною, антисептичною активністю відносно жовчних та сечових шляхів і може бути використаний для лікування сечо- та жовчокам'яної хвороби, сечових діатезів, гострих та підгострих калькульозних пієлонефритів і холециститів, дискінезії жовчних шляхів, циститів.

Для профілактики та лікування патологічних станів, при яких порушується скорочувальна функція гладкої мускулатури, яка проявляється у вигляді спазмів, що супроводжуються різкими болями, широко застосовуються різноманітні спазмолітичні препарати, як синтетичні, так і природні. У більшості випадків вживання синтетичних ліків призводить до виникнення тих чи інших побі-

чних ефектів, тому сучасна медицина надає перевагу препаратам рослинного походження, особливо, коли від хвороби потерпає дитячий організм. Сьогодні у розпорядженні медицини є широкий арсенал лікарських форм фітопрепаратів - спиртові настойки, гранули, збори лікарських рослин, водні розчини тощо.

Так, в книзі "Фітотерапія" [Товстуха Є.С., Видавництво "Здоров'я", Київ, 1995, с. 333] описаний збір із 15-ти лікарських рослин, які виявляють спазмолітичну, болевгамовуючу, жовчогінну та седативну дію при різноманітних урологічних захворюваннях - нефриті, уретриті, циститі та ін. Засіб вживається у вигляді настою, виготовленого із запарених рослин, які входять до складу збору. Недоліком цього засобу є його багатоконпонентність, складність визначення кількісного вмісту

UA (11) 52262 (13) U

кожного інгредієнту та низькі мікробіологічні показники виготовленого препарату. Для ефективного лікування необхідне часте приготування свіжого настою та додержання умов його правильного зберігання, що викликає певні незручності.

Відомий лікарський спазмолітичний засіб у формі сиропу, до складу якого входить уролесан, що містить наступне співвідношення інгредієнтів (г/л):

уролесан	38,70-47,30
твін-80	31,50-38,50
кислота лимонна	0,72-0,88
кислота сорбінова	1,08-1,32
сироп цукровий	679,50-830,50
вода очищена	решта

(Деклараційний патент на корисну модель UA 15931 U, 17.07.2006)

Відомо лікарський засіб «Урохолесан» для лікування сечокам'яної хвороби, гострих та хронічних калькульозних пієлонефритів та холециститів, що містить компоненти у наступних кількостях (г):

Ефірну олію ялиці	3,0-3,5
Ефірну олію насіння моркви дикої	
або	1,0-1,5
Спиртовий екстракт насіння моркви дикої	30,0-15,0
Олію м'яти	0,9-1,0
Спиртовий екстракт шишок хмелю	15,0-17,0
Спиртовий екстракт материнки	10,0-12,0
Льняну олію	5,0-7,0
Трилон Б	0,1-0,15

(Авторське свідоцтво СССР 540638, 1976р.)

За найближчий аналог запропонованої корисної моделі прийнятий лікарський спазмолітичний засіб, до складу якого входить уролесан [Основные и безрецептурные лекарственные препараты. Справочник / Журавель И.А., Коваленко С.Н., Харьков: ФОЛИО, 2005, с.334]. Уролесан в медичній практиці відомий як класичний спазмолітик, що діє на сечові та жовчні шляхи. Склад уролесану затверджений наказом МОЗ №309 від 23.05.2006, (Реєстраційне посвідчення UA/2727/02/01). В 100мл розчину уролесану міститься олії ялиці - 6.76г, олії м'яти перцевої - 1.69г, олії рицинової - 9.295г, плодів моркви дикої екстракту рідкого - 19.435г, шишок хмелю екстракту рідкого - 27.88г, трави материнки екстракту рідкого - 19.295г.

Зазначений аналог, як і всі попередні аналоги, випускається у формі розчину та застосовується як краплі. Проте застосування лікарської форми у вигляді крапель не дозволяє забезпечити точність дозування діючих речовин, не виключає можливість передозування через необачність або в критичних ситуаціях, не забезпечує зручності та комфорту при прийомі препарату, а також його стабільності при зберіганні та застосуванні. Така лікарська форма має неприємні органолептичні властивості, які утруднюють використання препарату в педіатричній та геріатричній практиці.

У зв'язку з тим, що до складу засобу-прототипу входить велика кількість олій та рідких екстрактів, до теперішнього часу не було можливості створити на їхній основі тверду лікарську форму.

В основу корисної моделі поставлено задачу створення за рахунок підбору компонентів та їх

кількості лікарського засобу, що проявляє спазмолітичну, літолітичну, протизапальну, антисептичну дії.

Поставлену задачу вирішують тим, що лікарський засіб, що проявляє спазмолітичну, літолітичну дії містить екстракт насіння моркви дикої, екстракт шишок хмелю, екстракт трави материнки звичайної, та ефірні олії м'яти перцевої та ялиці сибірської та згідно з винаходом рослинні екстракти використовують комплексно у вигляді густого екстракту шляхом згущення їх до вологості 25%. Додатково лікарський засіб містить допоміжні речовини, необхідні для створення твердої лікарської форми, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

комплексний густий екстракт, який включає:	
моркви дикої плодів екстракт рідкий, хмелю шишок екстракт рідкий, материнки трави екстракт рідкий у співвідношенні 1,00:1,44:1,00	2,82-3,83
м'яти перцевої олія	2,03-2,63
ялиці олія	7,13-9,53
рицинова олія	9,92-13,40
допоміжні речовини	решта

Як допоміжні речовини містить розріджувачі, адсорбенти, розпушувачі, ковзні речовини.

Як розріджувачі використано речовини, що вибрано з ряду лактоза моногідрат (таблетоза-80), магнію карбонату важкий, магнію алюмометасилікат (неусилін UFL2).

Як ковзні речовини використано речовини, що вибрано з ряду тальк, кислота стеаринова, аеросил та/або їх суміші.

Як адсорбенти використано речовини, що вибрано з ряду магнію алюмометасилікат (неусилін UFL2), магнію карбонату важкий.

Біологічно активні речовини, що входять до складу даного засобу, володіють антимікробними, протизапальними, спазмолітичними, заспокійливими, сечогінними, жовчогінними, антисептичними властивостями.

Технічний результат, який досягається при здійсненні корисної моделі, полягає у створенні твердої лікарської форми, що має спазмолітичну, літолітичну, протизапальну, антисептичну активність відносно жовчних та сечових шляхів з таким якісним та кількісним складом компонентів, який забезпечує підвищення рівня специфічної активності, зручність застосування та збільшення терміну застосування.

Цей технічний результат забезпечується властивостями допоміжних речовин, введених до складу засобу.

Так, магнію карбонат важкий застосовували як адсорбент олій, екстракту густого та розріджувач для забезпечення необхідної маси вмісту капсули. Магнію карбонат важкий, крім високої здатності поглинати рідини, має ще здатність поглинати аромати.

Тальк використали в якості ковзної речовини з метою забезпечення необхідної плинності капсульної маси.

Лактозу моногідрат (Таблетоза-80) застосовано як розріджувач для забезпечення необхідної маси вмісту капсули.

Крохмаль картопляний використали як розпушувач для забезпечення необхідного розпадання капсул та як зв'язуючу речовину.

Отже, підбір компонентів та їх кількісного складу, режимів та параметрів технології дозволяє отримати лікарський засіб, що проявляє антимікробну, протизапальну, спазмолітичну, та літолітичну дію у вигляді твердої лікарської форми. Порушення кількісного та якісного складу даного лікарського засобу призведе до зниження рівня та звуження спектру його специфічної активності.

Склад лікарського засобу, що проявляє антимікробну, протизапальну, спазмолітичну, та літолітичну дію у формі капсул з граничними значеннями усіх компонентів, мас. %:

комплексний густий екстракт, який включає моркви дикої плодів екстракт рідкий, хмелю шишок екстракт рідкий, материнки трави екстракт рідкий у співвідношенні 1,00:1,44:1,00	2,82-3,83
м'яти перцевої олія	2,03-2,63
ялиці олія	7,13-9,53
рицинова олія	9,92-13,40
магнію алюмометасилікат (неусилін UFL2)	7,65-10,35
магнію карбонат важкий	36, 93-49,73
тальк	1,7-2,3
лактози моногідрат (таблетоза-80)	14,15-21,00
крохмаль картопляний	1,46-4,45

Корисна модель здійснюється наступним чином.

Спочатку готують комплексний густий екстракт шляхом змішування в апараті моркви дикої плодів екстракт рідкий, хмелю шишок екстракт рідкий та материнки трави екстракт рідкий у співвідношенні 1:1,44:1 після чого проводять упарювання отриманої суміші в апараті для упарювання до вологості суміші 25%. Далі змішують попередньо відважені

магнію карбонат важкий, магнію алюмометасилікат (неусилін UFL2) та крохмаль картопляний. Перемішування компонентів проводять протягом 5хв. Потім у камеру гранулятора почергово додають рідкі компоненти: рицинову олію та комплексний густий екстракт, який включає моркви дикої плодів екстракт, хмелю шишок екстракт, материнки трави екстракт. Масу ретельно перемішують протягом 10хв., після чого зволожують 2%-ним розчином крохмального клейстеру, отримують вологі гранули, які передають на стадію сушіння, яку проводять при температурі $(45 \pm 5)^\circ\text{C}$. Сушіння проводять до досягнення масової частки залишкової вологості у грануляті від 1,5 до 3,0%.

Етап приготування суміші ефірних олій та гранул екстракту проводять наступним чином. Спочатку протягом 5хв. перемішують почергово завантажені магнію карбонат важкий, магнію алюмометасилікат (неусилін UFL2) та лактози моногідрат (таблетоза-80), потім додають однорідну суміш ефірних олій: рицинової олії, м'яти перцевої олію та ялиці олію, - та перемішують масу до рівномірного розподілу олій у масі сухих інгредієнтів, після чого додають сухі гранули суміші екстракту та проводять перемішування компонентів протягом 3хв.

Отриману суміш ефірних олій та гранул екстракту передають на стадію сухої грануляції. Процес опудрювання одержаної капсульної маси проводять протягом 5хв. у суміші для опудрювання, яка складається з лактози моногідрату (таблетоза-80) та аеросилу, до однорідного розподілення компонентів.

Одержаний продукт - капсульна маса жовто-зеленого кольору, із специфічним присмаком та приємним запахом ефірних олій. Далі капсульну масу передають на стадію інкапсулювання у тверді желатинові капсули.