



УКРАЇНА

(19) UA (11) 60948 (13) A

(51) 7 A61K9/06, A61K31/125, A61K31/56,
A61K31/715, A61K35/78, A61K47/44МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ
НА ВИНАХІДВидається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ПРОТИЗАПАЛЬНИЙ ЗАСІБ "АРТРАЛ"

1

2

(21) 2003076479

(22) 11 07 2003

(24) 15 10 2003

(46) 15 10 2003, Бюл. № 10, 2003 р.

(72) Кучер Валентина Григорівна, Пивоваров Ігор
Дмитрович(73) Кучер Валентина Григорівна, Пивоваров Ігор
Дмитрович(57) Протизапальний засіб, що містить диклофенак
натрію і воду очищену, який відрізняється тим,
що додатково містить ланолін, вазелін, віск бджо-
линий, ментол, камфору, олію ефірну евкалиптову,скипидар, спирт етиловий, при такому співвідно-
шенні інгредієнтів, мас. %

ланолін	20,0-48,0
вазелін	20,0-48,0
віск бджолиний	2,0-5,0
диклофенак натрію	1,0-5,0
ментол	0,5-3,0
камфора	1,0-6,0
спирт етиловий	10,0-17,0
вода очищена	0,5-2,5
ефірна олія евкалиптова	0,5-3,0
скипидар	1,0-8,0

Винахід стосується фармакології, зокрема складів для місцевого лікування дегенеративних захворювань суглобів, ревматичних уражень м'яких тканин, порушень функцій опорно-рухового апарату у разі травм.

Найближчим аналогом винаходу є протизапальний засіб "ДИКЛАК ГЕЛЬ" (Інструкція для медичного застосування препарату "ДИКЛАК ГЕЛЬ" виробництва фірми "ГЕКСАЛ АГ", Німеччина), який використовують місцево. Протизапальний засіб "ДИКЛАК ГЕЛЬ" містить диклофенак натрію та допоміжні речовини - гіпромелозу, макрогол-7-гліцерилу кокоат, спирт ізопропіловий, воду очищену, ароматизатор.

Ознаками найближчого аналогу, що співпадають з суттєвими ознаками винаходу, є наявність у протизапальному засобі диклофенаку натрію і води очищеної.

Технічним результатом винаходу є багатофункціональність засобу, розширення можливостей його використання та підвищення ефективності лікування ним за рахунок поєднання протизапальних і подразнюючих речовин.

Причинами, що перешкоджають досягненню технічного результату при використанні найближчого аналогу, є такі. Застосування диклофенаку натрію у вигляді гелю не дозволяє використовувати

його, наприклад для масажу, при фонофорезі. Диклофенак натрію у складі за найближчим аналогом повільно та неповністю всмоктується з поверхні шкіри. Дія гелю обмежена лише протизапальними та анальгезуючими властивостями диклофенаку натрію.

У основу винаходу поставлена технічна задача створення досконалого протизапального засобу "АРТРАЛ", технічний результат при використанні якого досягається за рахунок вмісту у засобі багатьох речовин, таких, що подразнюють вразливість нервів, що відволікають, що є антисептиками, та за рахунок створення засобу у вигляді мазі, бальзаму.

Поставлена технічна задача вирішується тим, що протизапальний засіб "АРТРАЛ", який містить диклофенак натрію і воду очищену, згідно винаходу додатково містить ланолін, вазелін, віск бджолиний, ментол, камфору, олію ефірну евкалиптову, скипидар, спирт етиловий, при такому співвідношенні інгредієнтів, мас. %

ланолін	20,0-48,0
вазелін	20,0-48,0
віск бджолиний	2,0-5,0
диклофенак натрію	1,0-5,0
ментол	0,5-3,0
камфора	1,0-6,0

(13) A

(11) 60948

(19) UA

спирт етиловий	10,0-17,0
вода очищена	0,5-2,5
ефірна олія евкаліптова	0,5-3,0
скипидар	1,0-6,0

Між сукупністю суттєвих ознак винаходу і технічним результатом, що досягається, існує такий причинно-наслідковий зв'язок

Диклофенак натрію або ортофен - натрієва сіль амінофенилоцтової кислоти - нестероїдний протизапальний, анальгезуючий та жарознижуючий препарат. Граничні значення 1-5% обрані з огляду місцевої зазначеної вище дії у складі протизапального засобу "АРТРАЛ".

Ефірні олії - загальна назва сумішей самих різноманітних найрідших органічних речовин рослинного походження, що знаходяться в рослинах переважно у вільному стані. Ефірна олія евкаліптова має прекрасні болезаспокійливі, протизапальні, антибактеріальні, антигрибкові і такі, що регенерують тканини, властивості. У її склад входять цинеол, мірцен, лимонен, пинокарвон, феландрен, пиперитон і ряд інших речовин. Граничні значення ефірної олії евкаліптової обрані з урахуванням її болезаспокійливої і протизапальної дії. Зменшення нижче 0,5% вмісту ефірної олії не забезпечить належного, зазначеного вище її ефекту. Перевищення вмісту вище 3,0% призведе до перевитрати цінної сировини, якою є ефірна олія евкаліптова.

Ментол або 2-ізопропил-5-метилциклогексанол - кристалічна речовина з сильним запахом м'яти перечної і смаком, що холодить. Ментол отримують з ефірної олії м'яти або синтетичним шляхом. При розтиранні з камфорою утворює етектичні (що розріджуються) суміші. При втиранні у шкіру викликає подразнення нервових закінчень, що супроводжується відчуттям холоду, легкої печії і поколювання, діє місцево знеболюючи. Граничні значення ментолу обрані з урахуванням його зазначеної дії. Зменшення нижче 0,5% вмісту ефірної олії не забезпечить належного, зазначеного вище ефекту. Перевищення вмісту вище 3,0% призведе до надмірної його дії.

Скипидар або олія терпентинова очищена - це ефірна олія, яку отримують перегонкою живиці з сосни. Основна частина скипидару - пдрований вуглевод пінен має характерний запах та пекучий смак. Відволююча дія скипидару пов'язана з його властивістю проникати через епідерміс і викликати подразнення рецепторів шкіри, а також сприяти вивільненню з шкіри біологічно активних речовин. Граничні значення скипидару обрані з урахуванням його дії у складі з іншими інгредієнтами. Зменшення нижче 1,0% вмісту скипидару не забезпечить очікуваної дії. Перевищення вмісту вище 6,0% призведе до незбалансованості засобу.

Камфора, що використовується у медичних цілях, є натуральною камфорою, яву добувають з камфорного дерева або з олії ялиці, чи камфорою рацемічною. Має сильний характерний запах і пряний гіркий смак. При місцевому застосуванні камфора діє як подразливий антисептичний засіб, покращує кровообіг. Зменшення нижче 1,0% вмісту камфори не забезпечить необхідного ефекту. Перевищення вмісту вище 6,0% призведе до незбалансованості дії засобу "АРТРАЛ".

Спирт етиловий 96% використано як розчин-

ник, що має антисептичну, консервуючу дію, його обрані інтервали 10-17% забезпечать оптимальну консистенцію засобу у вигляді мазі (бальзаму).

Віск бджолиний переважно містить міріциоловий ефір пальмітинової кислоти, церотинової кислоти та вуглеводи. Є прекрасним зовнішнім протизапальним засобом. Вміст у його у засобі "АРТРАЛ" менше 2% не буде достатнім для використання корисних властивостей воску. Вміст воску у засобі "АРТРАЛ" більше 5% призведе збільшення в'язкості та до погіршення всмоктування мазі крізь шкіру.

Використання ланоліну - суміш складних ефірів високомолекулярних ефірів і кислот та вільних високомолекулярних спиртів (аліфатичних стеаринових, три терпенових спиртів) як основи мазі забезпечує проникливість всіх інгредієнтів засобу "АРТРАЛ" через шкіру.

Вазелін - продукт останнього погону нафти є сумішшю вуглеводів. Його використання як основи мазі дозволяє приміняти засіб "АРТРАЛ" для лікувального масажу і фонофорезу.

Граничні значення ланоліну, вазеліну і води визначені дослідним шляхом. Застосування менше як по 20% ланоліну і вазеліну та менше 0,5% води не забезпечить складу однорідності і стабільного стану мазі (бальзаму). Застосування понад 48% ланоліну, понад 48% вазеліну та понад 2,5% води розладжує консистенцію засобу.

Подразнення шкіри, підшкірних утворень супроводжується стимуляцією утворення і вивільнення енкефалінів, ендорфінів, динорфінів та інших пептидів, що викликають важливу роль у регуляції больових відчуттів, проникливості судин та інших процесів. Під впливом подразнюючих речовин вивільняються також ендogenous фізіологічно активні сполуки (гістамін, кініни, тощо), що стимулюють імунологічні процеси. При одночасній подразнюючій, відволюючій, болезаспокійливій і протизапальній дії різних інгредієнтів засобу "АРТРАЛ" досягається значний лікувальний ефект. Важливим моментом є можливість проникнення диклофенаку натрію через шкіру при проведенні масажу чи фонофорезу.

Протизапальний засіб готують у такий спосіб:

Готують необхідні кількості усіх інгредієнтів згідно винаходу. Диклофенак натрію змішують зі спиртом етиловим, водою очищеною, наприклад, дистильованою, додають ментол і камфору, перемішують до повного розчинення. Ланолін, вазелін і бджолиний віск розплавляють при температурі 65-70°C, додають до розплаву розчинену суміш диклофенаку у спирт етиловому, воді, з ментолом і камфорою, додають поступово ефірну олію евкаліптову і скипидар, перемішують до охолодження.

Приклад 1. Був приготовлений та випробуваний засіб, що містив у відсотках: ланоліну 40,0, вазеліну 40,0, воску бджолиного 2,0, диклофенаку натрію 1,0, ментолу 0,5, камфори 1,0, спирту етилового 13,5, води очищеної 0,5, ефірної олії евкаліптової 0,5, скипидару 1,0.

Приклад 2. Був приготовлений та випробуваний засіб, що містив у відсотках: ланоліну 26,5, вазеліну 26,5, воску бджолиного 5,0, диклофенаку натрію 5,0, ментолу 3,0, камфори 6,0, спирту ети-

лового 16,5, води очищеної 2,5, ефірної олії евкаліптові 3,0, скипидару 6,0

Приклад 3 Був приготовлений та випробуваний засіб, що містив у відсотках ланоліну 30,0, вазеліну 30,0, воску бджолиного 3,0, диклофенаку натрію 4,0, ментолу 2,0, камфори 5,0, спирту ети-

лового 17,0, води очищеної 1,5, ефірної олії евкаліптові 2,5, скипидару 5,0

Протизапальний засіб за прикладом 3 за результатами випробовувань було визначено оптимальнішим, за ним буде підготовлений до випуску препарат "АРТРАЛ"