



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **103464** (13) **U**  
(51) МПК (2015.01)  
**A61K 31/00**  
**A61P 9/10** (2006.01)  
**A61P 39/06** (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ**

<b>(21)</b> Номер заявки: <b>а 2013 10537</b>	<b>(74)</b> Представник: <b>Михайлюк Валентин Іванович, реєстр. №1</b>
<b>(22)</b> Дата подання заявки: <b>30.08.2013</b>	
<b>(24)</b> Дата, з якої є чинними права на корисну модель: <b>25.12.2015</b>	<b>(56)</b> Перелік документів, взятих до уваги експертизою: UA 67300 U, 10.02.2012 UA 96239 C2, 10.10.2011 Местная переносимость препаратов альфа-липоевой кислоты при внутривенном введении: сравнение различных лекарственных форм [Интернет-публікація], URL: <a href="http://medstrana.com/articles/2656/">http://medstrana.com/articles/2656/</a> (збережено Way Back Machine 11.10.2011, знайдено 26.12.2014) Корпачев В.В. Лекарственные формы тиоктовой кислоты / В.В. Корпачев, М.И Борщевская // Проблемы эндокринной патологии. – 2006. - №1 [Интернет-публікація], URL: <a href="http://farmak.ua/publication/338?print=1">http://farmak.ua/publication/338?print=1</a> (знайдено 26.12.2014) Алмакаєва Л.Г. Розробка складу парентерального препарату на основі тіоктової кислоти / Л.Г. Алмакаєва, Л.Г. Науменок, Н.В. Бегунова // Фармацевтичний журнал. – 2011. - № 4. – С. 67-72 EP 0318891 A1, 07.06.1989 RU 2419416 C1, 27.05.2011 UA 73341 C2, 15.07.2005 UA 3198 U, 15.10.2004 Коваленко С.М. Дослідження деяких властивостей субстанцій таурину та тіоктової кислоти з метою створення комбінованого препарату для лікування діабетичних ускладнень/ С. М. Коваленко // Актуальні питання медичної науки та практики. – 2012. – № 2 (9). – С. 33-36 CN 1827093 A, 06.09.2006
<b>(41)</b> Публікація відомостей про заявку: <b>12.05.2014, Бюл.№ 9</b>	
<b>(46)</b> Публікація відомостей про видачу патенту: <b>25.12.2015, Бюл.№ 24</b>	
<b>(72)</b> Винахідник(и): <b>Доровський Олександр Вікторович (UA), Хорунжий Геннадій Генадійович (UA)</b>	
<b>(73)</b> Власник(и): <b>ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "ФАРМАЦЕВТИЧНА ГРУПА "ЗДОРОВ'Я",</b> вул. Шевченка, 22, м. Харків, 61013, Україна (UA)	

**(54) ЛІКАРСЬКА ФОРМА ДЛЯ ПАРЕНТЕРАЛЬНОГО ВВЕДЕННЯ НА ОСНОВІ АЛЬФА-ЛІПОЄВОЇ КИСЛОТИ ТА ТАУРИНУ****(57) Реферат:**

Лікарська форма для парентерального введення, яка включає альфа-ліпоєву кислоту та таурин як діючі речовини, а також трометамол та воду як допоміжні речовини, яка додатково включає поліетиленгліколь 400 та спирт бензиловий.

**UA 103464 U**



Корисна модель належить до галузі фармацевтичної промисловості, а саме до лікарських форм для парентерального введення на основі альфа-ліпоєвої кислоти та таурину, що можуть бути використані для профілактики та лікування діабетичної та алкогольної поліневропатії, коронарного атеросклерозу, захворювань печінки, інтоксикації.

Цукровий діабет є захворюванням, при якому ускладнення хвороби виходять на перший план, заподіюючи основні страждання хворим. Серйозні ушкодження нервових закінчень (невропатія), капілярів (ангіопатія) служать основною причиною інвалідизації і смерті у таких хворих. Дистальна поліневропатія й автономна невропатія є причинами низької якості життя, порушення працездатності та інвалідизації у великій кількості хворих цукровим діабетом. У той же час згідно із даними ВООЗ смертність від алкоголізму та його ускладнень займає третє місце після серцево-судинних та онкологічних захворювань, при цьому найбільш постійним та таким, що часто зустрічається, ураженням нервової системи при алкоголізмі є поліневропатія. Таким чином, дуже важливо вчасно діагностувати ускладнення та прийняти відповідні максимально ефективні заходи для його лікування. Відомі препарати на основі альфа-ліпоєвої кислоти, спрямовані на лікування діабетичної та алкогольної поліневропатії. Також відомі лікарські засоби для лікування цукрового діабету та його ускладнень на основі альфа-ліпоєвої кислоти і таурину. Таким чином актуальною є проблема розробки лікарських форм на основі альфа-ліпоєвої кислоти і таурину, що забезпечують максимальний терапевтичний ефект поряд зі зниженням небажаних побічних ефектів.

Найближчим аналогом лікарської форми, що заявляється, обраним як найближчий аналог, є лікарський засіб у вигляді розчину для інфузій, описаний в патенті України № 67300, опублікованому 10.02.2012 р. Зазначений засіб містить діючі речовини таурин та тіоктову кислоту, а також допоміжні речовини трометамол та воду при наступному співвідношенні компонентів, мас./г:

тіоктова кислота	0,5-0,8,
таурин	5,0-10,0,
трометамол	0,584-0,784,
вода	до 100 мл.

Недоліком описаного лікарського засобу є низька стабільність лікарської форми за рахунок відсутності в її складі будь-яких стабілізаторів. Відсутність консерванту в складі лікарської форми препарату збільшує ризик його мікробної контамінації під час виробництва, а також, відповідно до вимог ДФУ, вимагає обов'язкової термічної стерилізації розфасованого розчину, що може викликати стрімке зростання сторонніх домішок - продуктів термічної деградації діючих речовин, що можуть викликати негативні побічні реакції.

В основу корисної моделі, що заявляється, поставлена задача створення лікарської форми для парентерального введення на основі альфа-ліпоєвої кислоти та таурину, де за рахунок введення допоміжних речовин, а також оптимально підібраної пропорції компонентів будуть виключені зазначені вище недоліки, а також забезпечені підвищена розчинність діючих речовин, а, отже, зменшений обсяг рідини при парентеральному введенні, а також забезпечена необхідна стабільність лікарської форми препарату.

Поставлена задача вирішується тим, що розроблено лікарську форму для парентерального введення, що включає альфа-ліпоєву кислоту та таурин як діючі речовини, а також трометамол та воду як допоміжні речовини, де лікарська форма додатково включає поліетиленгліколь 400 та спирт бензиловий як допоміжні речовини при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

альфа-ліпоєва кислота	3-6
таурин	3-6
трометамол	3-8
поліетиленгліколь 400	2-10
спирт бензиловий	0,1-1
вода	решта.

Альфа-ліпоєва кислота покращує функціонування антиоксидантних систем, знижує інтенсивність "оксидантного стресу", підсилює ендоневральний кровотік та відновлює енергетичний баланс, а також активує фактор росту периферичних нервів.

Таурин інгібує формування активних форм кисню, пероксидацію ліпідів, захищає тканини при виснаженні запасів глутатіону за рахунок запобігання зниження активності глутатіонредуктази. Також таурин дозволяє одержувати більш високу антигіперглікемічну дію, що у свою чергу сприяє відновленню ноцицептивної чутливості.

Застосування трометамолу, що має буферні властивості та є малотоксичним, дозволяє одержати більш фізіологічний для організму пацієнта препарат.

Як відомо, альфа-ліпоева кислота є погано розчинною у воді. У зв'язку з цим необхідним є оптимальний підбір допоміжних речовин, а також послідовність їх змішування для того, щоб була забезпечена достатня розчинність альфа-ліпоевої кислоти і тим самим зменшений обсяг рідини при парентеральному введенні.

5 Застосування поліетиленгліколю 400 у складі заявленої лікарської форми препарату для парентерального введення в зазначених співвідношеннях дозволяє підвищити розчинність діючих речовин за рахунок формування оборотних комплексів з активними субстанціями, а також забезпечує необхідну стабільність лікарської форми, що заявляється. Тому застосування як солюбілізатора і стабілізатора поліетиленгліколю 400 забезпечує оптимальний  
10 терапевтичний ефект, дозволяє зменшити час приготування розчину і знижує небажані побічні ефекти. Також введення до складу лікарської форми поліетиленгліколю 400 як допоміжної речовини дозволяє знизити термічну і світлову чутливість розчину альфа-ліпоевої кислоти. Використання як консерванту бензилового спирту в зазначених співвідношеннях дозволяє знизити ризик мікробної контамінації лікарської форми під час виробництва, дозволяє не  
15 проводити термічну стерилізацію розчину, а використовувати стерилізуючу фільтрацію у комбінації з виробництвом в асептичних умовах, що відповідає сучасним стандартам ДФУ.

Експериментально встановлено, що включення діючих і допоміжних речовин у заявлених кількостях від загальної маси лікарської форми препарату дозволяє забезпечити високий терапевтичний ефект від введення лікарської форми та безпеку лікування лікарською формою,  
20 що заявляється. Діапазон кількості введенного поліетиленгліколю 400 обмежується мінімальною його кількістю, що забезпечує стабільність розчину лікарської форми у процесі збереження.

Переважно лікарська форма являє собою розчин для ін'єкцій або розчин для інфузій.

Діючі речовини лікарської форми, що заявляється, обрані з групи речовин для профілактики або лікування щонайменше діабетичної поліневропатії, алкогольної поліневропатії, коронарного  
25 атеросклерозу, захворювань печінки, інтоксикацій.

Приклад

Нижче наведений склад отриманого розчину для ін'єкцій/концентрату для приготування розчину для інфузій у межах заявленого співвідношення компонентів:

назва компонента:	кількість на 1 мл
альфа-ліпоева кислота	30 мг
таурин	50 мг
триметамол	33,5 мг
поліетиленгліколь 400	25 мг
спирт бензиловий	2 мг
вода для ін'єкцій	до 1 мл.

Таким чином, забезпечена лікарська форма для парентерального введення на основі  
30 альфа-ліпоевої кислоти та таурину, якісний та кількісний склад якої забезпечує підвищену розчинність діючої речовини і необхідну стабільність лікарської форми препарату.

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

35 1. Лікарська форма для парентерального введення, яка включає альфа-ліпоеву кислоту та таурин як діючі речовини, а також триметамол та воду як допоміжні речовини, яка **відрізняється** тим, що додатково включає поліетиленгліколь 400 та спирт бензиловий як допоміжні речовини при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

альфа-ліпоева кислота	3-6
таурин	3-6
триметамол	3-8
поліетиленгліколь 400	2-10
спирт бензиловий	0,1-1
вода	решта.

40 2. Лікарська форма за п. 1, яка **відрізняється** тим, що являє собою розчин для ін'єкцій або розчин для інфузій.

3. Лікарська форма за п. 1, яка **відрізняється** тим, що діючі речовини належать до діючих речовин для профілактики або лікування щонайменше діабетичної поліневропатії, алкогольної поліневропатії, коронарного атеросклерозу, захворювань печінки, інтоксикацій.

---

Комп'ютерна верстка Л. Ціхановська

---

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

---

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601