



УКРАЇНА

(19) UA (11) 60112 (13) A

(51) 7 A61K33/44, A61K33/06, A61K33/10

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ

## ОПИС

ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ  
НА ВИНАХІДвидається під  
відповідальність  
власника  
патенту

## (54) ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ

1

2

(21) 2003010805

(22) 30 01 2003

(24) 15 09 2003

(46) 15 09 2003, Бюл. № 9, 2003 р.

(72) Трихліб Володимир Андрійович

(73) Трихліб Володимир Андрійович

(57) 1 Лікарський засіб, що включає активоване вугілля на основі полімерної, тваринної чи рослинної сировини, який відрізняється тим, що він додатково містить сполуку з антацидною дією при такому співвідношенні компонентів, мас. %

вугілля активоване 10-90

сполука з антацидною дією решта

2 Лікарський засіб за п. 1, який відрізняється тим, що як сполуку з антацидною дією застосовують  $\text{NaHCO}_3$ ,  $\text{MgO}$ ,  $\text{Mg}(\text{OH})_2$ ,  $\text{MgCO}_3$ ,  $m\text{MgCO}_3 \cdot n\text{Mg}(\text{OH})_2 \cdot p\text{H}_2\text{O}$ ,  $\text{CaCO}_3$ ,  $\text{Al}(\text{OH})_3 \cdot n\text{H}_2\text{O}$ , де  $m = 1 - 5$ ,  $n = 1 - 6$ , або суміш із цих сполук

3 Лікарський засіб за пп. 1, 2, який відрізняється тим, що при його виготовленні у формі таблеток, суспензії або мазі до суміші компонентів додатково додають метилцелюлозу розчинну або натрій-карбоксиметилцелюлозу у достатній кількості

Винахід має відношення до медицини й ветеринарії, зокрема, до лікарських засобів, що включають активоване вугілля.

Активоване вугілля на основі полімерної, тваринної чи рослинної сировини належить до лікарських засобів широкого вжитку. Воно має високу пористість і поверхню, здатну адсорбувати токсичні речовини різної природи. Його застосовують у вигляді таблеток при диспепсії, харчових інтоксикаціях, метеоризмі, підвищеній кислотності та інших захворюваннях. При підвищеній кислотності призначають таблетки активованого вугілля у середню по 1-2 г (у воді) 3-4 рази в день, термін лікування 7-14 днів [1].

Активоване вугілля медичної чистоти відноситься до антацидних препаратів із дуже низькою активністю по кислоті [2]. За вимогами фармакопеї [4] його лужність або адсорбційна активність по кислоті не повинна перевищувати  $0,4 \text{ см}^3$  0,1 мол розчину соляної кислоти на один грам сорбенту.

Використане нами активоване вугілля різних марок задовольняє зазначеним фармакопейним вимогам. На титрування 1 г активованого вугілля ZL-302 витрачається  $0,04 \text{ см}^3$  0,1 мол  $\text{HCl}$  або  $0,008 \text{ см}^3$  0,5 мол  $\text{HCl}$  (табл. 1). Аналогічні результати, отримані при титруванні кислотою активованого вугілля інших марок.

В основу винаходу поставлено задачу створення нового лікарського засобу, що включає активоване вугілля на основі полімерної, тваринної чи рослинної сировини, який має подвійну медико-

біологічну дію адсорбуючої й антацидної спрямованості.

Поставлена задача вирішується тим, що лікарський засіб, що включає активоване вугілля на основі полімерної, тваринної чи рослинної сировини, додатково містить сполуку з антацидною дією при такому співвідношенні компонентів, мас. %

Вугілля активоване 10-90

Сполука з антацидною дією решта

При розгляді технічного завдання було взято до уваги те, що  $\text{NaHCO}_3$ ,  $\text{MgO}$ ,  $\text{Mg}(\text{OH})_2$ ,  $\text{MgCO}_3$ ,  $m\text{MgCO}_3 \cdot n\text{Mg}(\text{OH})_2 \cdot p\text{H}_2\text{O}$ ,  $\text{CaCO}_3$ ,  $\text{Al}(\text{OH})_3 \cdot n\text{H}_2\text{O}$ , де  $m=1-5$ ,  $n=1-6$ , або суміш цих сполук застосовують у якості антацидних препаратів у медицині й ветеринарії для зменшення підвищеної кислотності шлункового соку (при гіперацидних гастритах, виразковій хворобі шлунка і дванадцятипечної кишки), при інфекціях й інтоксикаціях і таке інше [1, 2, 5, 7].

При розгляді технічного завдання також було узятो до уваги той факт, що при виготовленні деяких лікарських форм (таблетки, суспензії, мазі) у якості загусників, стабілізаторів і формоутворювачів використовують допоміжні сполуки - метилцелюлозу розчинну або натрій-карбоксиметилцелюлозу, які беруть у достатній кількості [6].

Нами встановлено, що при зазначених співвідношеннях компонентів у суміші активоване вугілля й речовини з антацидною дією зберігають свої індивідуальні властивості. Таким чином, роз-

(13) A  
(11) 60112  
(19) UA

роблений лікарський засіб має подвійну медико-біологічну дію адсорбуючої й антацидної спрямованості

Для доказу цього були використані відомі фізико-хімічні методи. Зокрема, визначення адсорбційної активності лікарського засобу проводилось по метиленовому блакитному згідно з ГОСТ 4453-74, визначення антацидної активності - титруванням лікарського засобу титруванням розчином соляної кислоти [3]

Лікарський засіб зазначеного складу одержують при змішуванні взятих компонентів із використанням змішувачів любого типу, що використовуються у хіміко-фармацевтичній промисловості

Лікарський засіб, що заявляється, призначено для використання при ацидозі, при отруєннях кислотами й речовинами кислого характеру, при гострій інфекції шлунково-кишкового тракту і таке інше. Він також може використовуватись у ветеринарії при гіперацидозі, гострій інфекції шлунково-кишкового тракту

Нижче приведені конкретні приклади виконан-

ня винаходу, що заявляється

#### Приклад 1

Порошок активованого вугілля ZL-302 (Китай) змішують із  $\text{NaHCO}_3$  (сода харчова, ГОСТ 2158-76) при різних співвідношеннях компонентів до одержання однорідної суміші

В табл. 1 представлено склад лікарського засобу (співвідношення компонентів), його адсорбційну активність по метиленовому блакитному, антацидну активність (об'єм розчину 0,5 мол.  $\text{HCl}$ , що пішов на титрування 1 г лікарського засобу) та pH 5%-ної суспензії у воді

З наведених даних видно, що запропонований лікарський засіб на основі натрію вуглекислого кислого й активованого вугілля характеризується вираженою ефективністю адсорбуючої й антацидної дії. Ефективність лікарського засобу ( $E=A_1 \cdot A_2$ ), або спільна дія обох складових компонентів у суміші, максимальна при співвідношенні компонентів рівному 50/50. При співвідношенні компонентів 10/90 (90/10) вона складає від максимального значення 39 (36)%, відповідно

Таблиця 1

Лікарський засіб

Співвідношення компонентів (активоване вугілля натрій вуглекислий кислий), мас. %	Адсорбційна активність по метиленовому блакитному ( $A_1$ ), мг/г	Антацидна активність ( $A_2$ ), об'єм розчину 0,5 мол. $\text{HCl}$ , що пішов на титрування 1 г лікарського засобу, см <sup>3</sup>	Ефективність ( $E=A_1 \cdot A_2$ )	pH 5%-ної суспензії
0/100	0	23,8	0	8,5
10/90	37	21,4	792	8,5
20/80	62	19,0	1178	8,5
30/70	103	16,6	1710	8,5
40/60	133	14,3	1902	8,4
50/50	172	11,9	2047	8,4
60/40	202	9,5	1919	8,3
70/30	238	7,1	1690	8,3
80/20	274	4,8	1315	8,1
90/10	306	2,4	734	7,8
100/0	370	0,008	3	6,5

#### Приклад 2

Порошок препарату "КАРБОЛОНГ-субстанція" (кокосове активоване вугілля, ВФС 42У-161-973-98) змішують із порошком  $\text{NaHCO}_3$  при масовому співвідношенні компонентів 30/70 до одержання однорідної суміші

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному ( $A_1$ ) - 102 мг/г, антацидна активність ( $A_2$ ) - 16,9 см<sup>3</sup> 0,5 мол.  $\text{HCl}$ , pH 5%-ної суспензії - 8,4

#### Приклад 3

Препарат "КАРБОСФЕР" (активоване вугілля з полімерів, ВФС 42У-68-94) змішують із порошком  $\text{NaHCO}_3$  при масовому співвідношенні компонентів 50/50 до одержання однорідної суміші

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 180 мг/г, антацидна активність - 11,6 см<sup>3</sup> 0,5 мол.  $\text{HCl}$ , pH 5%-ної суспензії - 8,4

#### Приклад 4

Порошок ветеринарного препарату "КАУВЕТ"

(активоване вугілля із грецького горіха) змішують із порошком  $\text{NaHCO}_3$  при масовому співвідношенні компонентів 80/20 до одержання однорідної суміші

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 270 мг/г, антацидна активність - 5,0 см<sup>3</sup> 0,5 мол.  $\text{HCl}$ , pH 5%-ної суспензії - 8,3

#### Приклад 5

Порошок активованого вугілля з деревини марки ОУ-А (ГОСТ 4453-74) змішують із порошком  $\text{NaHCO}_3$  при масовому співвідношенні компонентів 60/40 до одержання однорідної суміші

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 162 мг/г, антацидна активність - 9,5 см<sup>3</sup> 0,5 мол.  $\text{HCl}$ , pH 5%-ної суспензії - 8,5

#### Приклад 6

Порошок активованого вугілля ZL-302 (Китай) змішують із  $\text{MgO}$  (Оксид магнезії, ГОСТ 4528-77) при різних співвідношеннях компонентів до одер-

жання однорідної суміші

В табл. 2 представлено склад лікарського засобу (співвідношення-компонентів), його адсорбційну активність по метиленовому блакитному, антацидну активність (об'єм розчину 1мол HCl, що пішов на титрування 1г лікарського засобу)

З наведених даних видно, що запропонований лікарський засіб на основі магнію оксиду й активо-

ваного вугілля характеризується вираженою ефективністю адсорбуючої й антацидної дії. Ефективність лікарського засобу ( $E=A_1 \cdot A_2$ ), або спільна дія обох складових компонентів у суміші, максимальна при співвідношенні компонентів рівному 50/50. При співвідношенні компонентів 10/90 (90/10) вона складає від максимального значення 44 (35)%, відповідно.

Таблиця 2

Лікарський засіб

Співвідношення компонентів (магнію оксид, активоване вугілля), мас. %	Адсорбційна активність по метиленовому блакитному ( $A_1$ ), мг/г	Антацидна активність ( $A_2$ ), об'єм розчину 1мол HCl, що пішов на титрування 1г лікарського засобу, см <sup>3</sup>	Ефективність ( $E=A_1 \cdot A_2$ )
0/100	11	24,3	272
10/90	47	22,3	1050
20/80	85	19,5	1697
30/70	118	17,3	2050
40/60	155	14,8	2308
50/50	180	12,4	2357
60/40	226	9,9	2243
70/30	260	7,4	1935
80/20	298	5,0	1479
90/10	334	2,5	828
100/0	370	0,004	2

#### Приклад 7

Порошок препарату "КАРБОЛОНГ-субстанція" (кокосове активоване вугілля, ВФС 42У-161-973-98) змішують із магнію оксидом при масовому співвідношенні компонентів 30/70 до одержання однорідної суміші.

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному ( $A_1$ ) - 112мг/г, антацидна активність ( $A_2$ ) - 17,0см<sup>3</sup>/1мол HCl.

#### Приклад 8

Порошок ветеринарного препарату "КАУВЕТ" (активоване вугілля із грецького горіха) змішують із магнію оксидом при масовому співвідношенні компонентів 80/20 до одержання однорідної суміші. Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 290мг/г, антацидна активність - 5,0см<sup>3</sup>/1,0мол HCl.

#### Приклад 9

Порошок активованого вугілля з деревини марки ОУ-А (ГОСТ 4453-74) змішують із магнію оксидом при масовому співвідношенні компонентів 60/40 до одержання однорідної суміші.

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 160мг/г, антацидна активність - 9,5см<sup>3</sup>/1,0мол HCl.

#### Приклад 10

Порошок активованого вугілля ZL-302 змішують із порошком  $mMgCO_3 \cdot Mg(OH)_2 \cdot H_2O$  (магнію карбонат основний, ГОСТ 6419-78) при масовому співвідношенні компонентів 50/50 до одержання однорідної суміші.

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 185мг/г, антацидна активність - 10,2см<sup>3</sup>/0,5мол HCl.

#### Приклад 11

Порошок активованого вугілля ZL-302 змішу-

ють із CaO (кальцію карбонат, ГОСТ 4530-76) при масовому співвідношенні компонентів 50/50 до одержання однорідної суміші.

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 185мг/г, антацидна активність - 17,8см<sup>3</sup>/0,5мол HCl.

#### Приклад 12

Порошок активованого вугілля ZL-302 змішують із магнію карбонатом основним, кальцію карбонатом і натрію вуглекислого кислого при масовому співвідношенні компонентів 50/20/15/15 до одержання однорідної суміші.

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 185мг/г, антацидна активність - 13,2см<sup>3</sup>/0,5мол HCl.

#### Приклад 13

Порошок активованого вугілля ZL-302 змішують із магнію карбонатом основним, натрій - КМЦ (ТУ 6-55-39-90, марка 70/450 "С") при масовому співвідношенні компонентів 50/49/1 до одержання однорідної суміші.

Адсорбційна активність лікарського засобу по метиленовому блакитному - 185мг/г, антацидна активність - 10,6см<sup>3</sup>/0,5мол HCl.

Отриману суміш використовують для виготовлення таблеток.

#### Приклад 14

Порошок активованого вугілля ZL-302 змішують з натрію вуглекислим кислим (сода харчова) і натрій - КМЦ (ТУ 6-55-39-90, марка 70/450 "С") при масовому співвідношенні компонентів 50/40/10 до одержання однорідної суміші.

Адсорбційна активність по метиленовому блакитному - 170мг/г, антацидна активність по 0,5мол HCl - 12,4см<sup>3</sup>/г, рН 5%-ної суспензії у воді - 8,3.

Отриману суміш використовують для виготов-

лення 5%-ної водної суспензії

Джерела інформації

1 Машковский М Д Лекарственные средства  
Пособие по фармакотерапии для врачей В 2 ч,  
изд 9 - Мн Беларусь, 1987

2 Тринус Ф П Фармакотерапевтический спра-  
вочник К Здоров'я, 1998

3 Государственная фармакопея, вып XI, т 1,  
2 М Медицина, 1990

4 Государственная фармакопея, вып X, М  
Медицина, 1968

5 Березовський А В Препарати для ветери-  
нарії К Урожай, 1995

6 Технология лекарственных форм Учебник в  
2-х томах, Под ред Т С Кондратьевой - М Ме-  
дицина, 1991

7 Пат США № 5935610, МПК<sup>6</sup> А 61 К 33/32, К  
33/10, 1999