



УКРАЇНА

(19) UA (11) 95206 (13) C2

(51) МПК

A61K 8/34 (2006.01)  
A61K 9/08 (2006.01)  
A61K 31/505 (2006.01)  
A61K 36/534 (2006.01)  
A61K 36/61 (2006.01)  
A61K 36/534 (2006.01)  
A61K 36/752 (2006.01)  
A61K 36/23 (2006.01)  
A61K 36/752 (2006.01)  
A61P 1/02 (2006.01)  
A61P 1/02 (2006.01)  
A61P 11/04 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ

## ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЗАХВОРЮВАНЬ ПОРОЖНИНИ РОТА ТА ГОРЛА ТА СПОСІБ ЇЇ ОТРИМАННЯ

(21) a201010777

(22) 06.09.2010

(24) 11.07.2011

(46) 11.07.2011, Бюл.№ 13, 2011 р.

(72) ДОРОВСЬКИЙ ОЛЕКСАНДР ВІКТОРОВИЧ,  
ХОРУНЖИЙ ГЕНАДІЙ ГЕНАДІЙОВИЧ

(73) ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДА-  
ЛЬНІСТЮ "ФАРМАЦЕВТИЧНА ГРУПА "ЗДОРОВ'Я"

(56) UA 52576 U, 25.08.2010

UA 45392 U, 10.11.2009

(57) 1. Композиція для лікування захворювань по-  
рожнини рота та горла, що включає активні рече-  
вини: гексетидин, холіну саліцилат та хлорбутано-  
лу гемігідрат, та допоміжні речовини, яка  
**відрізняється** тим, що містить допоміжну речови-  
ну, яка являє собою олію м'яти перцевої.

2. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  
допоміжні речовини вибрані з групи, що містить  
сахарин натрію, полісорбат, кислоту пропіонову,  
етанол, олію лимонну, олію анісову, ментол, евка-  
ліптол, метилсаліцилат, вода очищена.

3. Композиція за будь-яким з пп. 1, 2, яка **відрізн-  
яється** тим, що включає активні та допоміжні  
речовини у наступному співвідношенні компонен-  
тів, мас. %:

гексетидин	0,08-0,12
холіну саліцилат	0,4-0,6
хлорбутанолу гемігідрат	0,2-0,3
сахарин натрію	0,12-0,18
полісорбат	0,4-0,6
кислота пропіонова	0,06-0,09
етанол	39,02-58,53
олія лимонна	0,016-0,024

олія анісова	0,008-0,012
ментол	0,016-0,024
олія м'яти перцевої	0,008-0,012
евкаліптол	0,008-0,012
метилсаліцилат	0,004-0,006
вода очищена	решта.

4. Композиція за п. 3, яка **відрізняється** тим, що  
включає активні та допоміжні речовини у наступ-  
ному співвідношенні компонентів, мас. %:

гексетидин	0,1
холіну саліцилат	0,5
хлорбутанолу гемігідрат	0,25
сахарин натрію	0,15
полісорбат	0,5
кислота пропіонова	0,075
етанол	48,78
олія лимонна	0,02
олія анісова	0,01
ментол	0,02
олія м'яти перцевої	0,01
евкаліптол	0,01
метилсаліцилат	0,005
вода очищена	решта.

5. Композиція за будь-яким з пп. 1-4, яка **відрізня-  
ється** тим, що являє собою розчин для полоскан-  
ня.

6. Композиція за будь-яким з пп. 1-4, яка **відрізня-  
ється** тим, що являє собою спрей.

7. Спосіб отримання композиції для лікування за-  
хворювань порожнини рота та горла, що включає  
послідовне змішування активних речовин: гексе-  
тидин, холіну саліцилат та хлорбутанолу гемігід-  
рат, та допоміжних речовин, який **відрізняється**

(13) C2  
(11) 95206  
(19) UA

тим, що до складу композиції додають допоміжну речовину, яка являє собою олію м'яти перцевої.

8. Спосіб за п. 7, який **відрізняється** тим, що допоміжні речовини вибирають з групи, що містить сахарин натрію, полісорбат, кислоту пропіонову, етанол, олію лимонну, олію анісову, ментол, евкаліптол, метилсаліцилат, вода очищена.

9. Спосіб за будь-яким з пп. 7, 8, який **відрізняється** тим, що змішування активних та допоміжних речовин композиції здійснюють у наступному порядку: змішують етанол та кислоту пропіонову; додають гексетидин та перемішують; додають холіну саліцилат та перемішують; додають хлорбутанолу гемігідрат та перемішують; додають полісорбат та перемішують; додають олію лимонну, олію анісову, олію м'яти перцевої та перемішують; додають евкаліптол, ментол, метилсаліцилат та перемішують; готують водний розчин сахарину натрію, додають його до отриманого розчину та перемішують.

10. Спосіб за будь-яким з пп. 7-9, який **відрізняється** тим, що змішують активні та допоміжні речовини композиції у наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

гексетидин	0,08-0,12
холіну саліцилат	0,4-0,6
хлорбутанолу гемігідрат	0,2-0,3
сахарин натрію	0,12-0,18
полісорбат	0,4-0,6
кислота пропіонова	0,06-0,09
етанол	39,02-58,53

олія лимонна	0,016-0,024
олія анісова	0,008-0,012
ментол	0,016-0,024
олія м'яти перцевої	0,008-0,012
евкаліптол	0,008-0,012
метилсаліцилат	0,004-0,006
вода очищена	решта.

11. Спосіб за п. 10, який **відрізняється** тим, що змішують активні та допоміжні речовини композиції у наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

гексетидин	0,1
холіну саліцилат	0,5
хлорбутанолу гемігідрат	0,25
сахарин натрію	0,15
полісорбат	0,5
кислота пропіонова	0,075
етанол	48,78
олія лимонна	0,02
олія анісова	0,01
ментол	0,02
олія м'яти перцевої	0,01
евкаліптол	0,01
метилсаліцилат	0,005
вода очищена	решта.

12. Спосіб за будь-яким з пп. 7-11, який **відрізняється** тим, що отримують композицію у формі розчину для полоскання.

13. Спосіб за будь-яким з пп. 7-11, який **відрізняється** тим, що отримують композицію у формі спрею.

Винахід належить до медицини і хіміко-фармацевтичної промисловості, зокрема, до виробництва композицій для лікування захворювань порожнини рота та горла, а саме для місцевого лікування захворювань і запальних процесів порожнини рота та горла; гінгівіти, стоматити; пародонтити; афти та біль при прорізуванні зубів; післяопераційний догляд за ротовою порожниною; ангіни, гострі та хронічні тонзиліти, фарингіти, ларингіти тощо.

Найбільш близькою до винаходу, що заявляється, та вибраною як прототип, є фармацевтична композиція, що включає гексетидин (патент GB146 1557, МПК А61К 31/505, опубл. 30.03.1977), яка містить активні речовини гексетидин, холіну саліцилат та хлорбутанолу гемігідрат та допоміжні речовини.

Недоліком зазначеної композиції є її порівняно низька антисептична дія.

Задачею винаходу, що заявляється, є створення такої композиції для лікування захворювань порожнини рота та горла, в якій за рахунок оптимального підбору якісного та кількісного складу компонентів буде досягнуто найбільш ефективну антибактеріальну, протівірусну та протигрибкову дію при використанні композиції, а також знеболювальний, протизапальний, освіжаючий та антисептичний ефект, підвищення імунітету та опірності організму простудним захворюванням.

Іншою задачею винаходу є розробка способу отримання композиції для лікування захворювань порожнини рота та горла, який завдяки простоті та оптимальному підбору операцій, що здійснюються, дозволить забезпечити отримання композиції для лікування захворювань порожнини рота та горла з перевагами, описаними вище.

Поставлена задача вирішується тим, що розроблено композицію для лікування захворювань порожнини рота та горла, що включає активні речовини: гексетидин, холіну саліцилат та хлорбутанолу гемігідрат, та допоміжні речовини. Згідно винаходу композиція містить допоміжну речовину, яка являє собою олію м'яти перцевої.

Переважно допоміжні речовини вибрані з групи, що містить сахарин натрію, полісорбат, кислоту пропіонову, етанол, олію лимонну, олію анісову, ментол евкаліптол, метилсаліцилат, воду очищену.

Також переважно, композиція включає активні та допоміжні речовини у наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

гексетидин	0,08-0,12
холіну саліцилат	0,4-0,6
хлорбутанолу гемігідрат	0,2-0,3
сахарин натрію	0,12-0,18
полісорбат	0,4-0,6
кислота пропіонова	0,06-0,09
етанол	39,02-58,53

олія лимонна	0,016-0,024
олія анісова	0,008-0,012
ментол	0,016-0,024
олія м'яти перцевої	0,008-0,012
евкаліптол	0,008-0,012
метилсаліцилат	0,004-0,006
вода очищена	решта.
Більш переважно у наступному співвідношенні компонентів, мас. %:	
гексетидин	0,1
холіну саліцилат	0,5
хлорбутанолу гемігідрат	0,25
сахарин натрію	0,15
полісорбат	0,5
кислота пропіонова	0,075
етанол	48,78
олія лимонна	0,02
олія анісова	0,01
ментол	0,02
олія м'яти перцевої	0,01
евкаліптол	0,01
метилсаліцилат	0,005
вода очищена	решта.
Переважно композиція являє собою розчин для полоскання або спрею.	

Ще одна задача вирішується тим, що розроблений спосіб отримання композиції для лікування захворювань порожнини рота та горла, що включає послідовне змішування активних речовин гексетидин, холіну саліцилат та хлорбутанолу гемігідрат та допоміжних речовин. Згідно способу, до складу композиції додають допоміжну речовину, яка являє собою олію м'яти перцевої.

Переважно, допоміжні речовини вибирають з групи, що містить сахарин натрію, полісорбат, кислоту пропіонову, етанол, олію лимонну, олію анісову, ментол, евкаліптол, метилсаліцилат, воду очищену.

Переважно, змішування активних та допоміжних речовин композиції здійснюють у наступному порядку: змішують етанол та кислоту пропіонову; додають гексетидин та перемішують; додають холін саліцилат та перемішують; додають хлорбутанолу гемігідрат та перемішують; додають полісорбат та перемішують; додають олію лимонну, олію анісову, олію м'яти перцевої та перемішують; додають евкаліптол, ментол, метилсаліцилат та перемішують; готують водний розчин сахарину натрію, додають його до отриманого розчину та перемішують.

Також переважно, змішують активні та допоміжні речовини композиції у наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

гексетидин	0,08-0,12
холіну саліцилат	0,4-0,6
хлорбутанолу гемігідрат	0,2-0,3
сахарин натрію	0,12-0,18
полісорбат	0,4-0,6
кислота пропіонова	0,06-0,09
етанол	39,02-58,53
олія лимонна	0,016-0,024
олія анісова	0,008-0,012
ментол	0,016-0,024
олія м'яти перцевої	0,008-0,012
евкаліптол	0,008-0,012

метилсаліцилат	0,004-0,006
вода очищена	решта.
Більш переважно у наступному співвідношенні компонентів, мас. %:	
гексетидин	0,1
холіну саліцилат	0,5
хлорбутанолу гемігідрат	0,25
сахарин натрію	0,15
полісорбат	0,5
кислота пропіонова	0,075
етанол	48,78
олія лимонна	0,02
олія анісова	0,01
ментол	0,02
олія м'яти перцевої	0,01
евкаліптол	0,01
метилсаліцилат	0,005
вода очищена	решта.
Переважно, отримують композицію у формі розчину для полоскання або спрею.	

Використання у складі композиції гексетидину дозволяє обумовити антибактеріальну та проти-грибкову дію композиції, що заявляється. Гексетидин виявляє антибактеріальну активність щодо грампозитивних та грамнегативних мікроорганізмів, як аеробів, так і анаеробів. Щодо аеробних мікроорганізмів він виявляє, в основному, бактеріостатичний вплив та слабкий - бактерицидний. На анаеробні мікроорганізми гексетидин виявляє виражений бактерицидний ефект. Механізм дії гексетидину ґрунтується на конкурентному заміщенні тіаміну: структура гексетидину схожа зі структурою тіаміну, який необхідний для росту мікроорганізмів.

Використання у складі композиції холіну саліцилату зумовлює протизапальну дію. Холіну саліцилат належить до групи нестероїдних протизапальних засобів та виявляє анальгезуючий, жарознижувальний та протизапальний ефект.

Використання у складі композиції хлорбутанолу гемігідрату зумовлює знеболювальну дію. Хлорбутанолу гемігідрат є місцевим анестетиком, який застосовують в отоларингології (краплі у ніс, полоскання) та у стоматології (аплікації та зрошення), в основному як знеболювальний засіб.

За рахунок того, що олія м'яти перцевої є сильним антисептиком, додання до складу композиції даного компоненту дозволяє досягти високого антисептичного ефекту. Крім того, додання до складу композиції олії м'яти перцевої зумовлює освіжаючий, знеболювальний, противірусний та антибактеріальний ефект. Також сприяє підвищенню імунітету та опірності організму простудним захворюванням.

Зазначені масові співвідношення компонентів обумовлені необхідним рівнем їх специфічної активності. При введенні компонентів в кількості, меншій, ніж значення, що заявляються, рівень їх вмісту не є достатнім. А введення компонентів в кількості, більшій, ніж вказані значення, що заявляються, не призводить до значного підвищення рівня їх специфічної активності, а також може викликати негативні побічні ефекти, які характерні при передозуванні компонентами.

Приклад здійснення винаходу.

Для отримання 100 мл розчину для полоскання, в реактор завантажують 48,78 г етанолу 96 %. Після чого вносять 0,075 г кислоти пропіонової та перемішують до отримання однорідного прозорого розчину. Наступним у реактор завантажують 0,1 г гексетидину та перемішують. Після повного розчинення гексетидину завантажують 0,5 г холіну саліцилату та перемішують. Наступним в реактор завантажують 0,25 г хлорбутанолу гемігідрату та перемішують. Після повного розчинення хлорбутанолу гемігідрату в реактор завантажують 0,5 г полісорбату 20 та перемішують. Після чого завантажують 0,02 г олії лимонної, 0,01 г олії анісової, 0,01 г олії м'яти перцевої. Розчин перемішують до отримання однорідного прозорого розчину та завантажують 0,01 г евкалипту, 0,02 г ментолу, 0,005 г метилсаліцилату. Розчин перемішують до отримання однорідного прозорого розчину. В процесі

приготування спиртового концентрату контролюють об'єм етанолу 96 %, послідовність та час перемішування компонентів, повноту розчинення компонентів. Після чого готують водний розчин 0,15 г сахарину натрію, вносять його в реактор із спиртовим розчином та перемішують.

Таким чином, композиція для лікування захворювань порожнини рота та горла; дозволяє досягти найбільш ефективної антибактеріальної, протівірусної та протигрибкової дії при її використанні, а також обезболювальний, протизапальний, освіжаючий та антисептичний ефект, підвищення імунітету та опірності організму простудним захворюванням. Спосіб отримання композиції для лікування захворювань порожнини рота та горла, що заявляється, дозволяє забезпечити отримання зазначеної композиції.