



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **103886**

(13) **U**

(51) МПК

**A61P 1/04** (2006.01)

**A61K 9/48** (2006.01)

**A61P 31/02** (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

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

(21) Номер заявки: **u 2015 04344**

(22) Дата подання заявки: **05.05.2015**

(24) Дата, з якої є чинними  
права на корисну  
модель: **12.01.2016**

(46) Публікація відомостей  
про видачу патенту: **12.01.2016, Бюл.№ 1**

(72) Винахідник(и):

**Бобрицька Лариса Олександрівна (UA),  
Рамі Фарес (UA),**

**Гончаров Микола Іванович (UA),**

**Назарова Олена Сергіївна (UA),**

**Литвиненко Василь Іванович (UA),**

**Попова Наталія Вячеславівна (UA)**

(73) Власник(и):

**Бобрицька Лариса Олександрівна,**

**пр. Косіора, 71, кв. 49, м. Харків, 61115 (UA)**

**(54) ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ АНТИМІКРОБНОЇ, ПРОТИЗАПАЛЬНОЇ ТА СПАЗМОЛІТИЧНОЇ ДІЇ**

(57) Реферат:

Лікарський засіб антимікробної дії містить ніфуроксазид, крохмаль кукурудзяний, сахарозу, магнію стеарат. Додатково введено плантаглюцид, пектин, повідон 29/32, сахарозу, яка пресується.

**UA 103886 U**



Корисна модель належить до галузі медицини і фармації, зокрема до лікарських засобів, що застосовуються при лікуванні гострих кишкових захворювань.

Гострі кишкові захворювання є найбільш масовим інфекційним захворюванням, які характеризуються розповсюдженням та високою частотою розвитку тяжких форм хронічних гастроентерологічних захворювань. Кожен рік в світі реєструють 1-1.2 млрд. випадків діарейних захворювань. В інфекційній патології дітей раннього віку гострі кишкові інфекції займають провідне місце після гострих інфекційних захворювань. Для більшості гострих кишкових захворювань характерна діарея, яка не дає можливості виявити, яким з множини мікроорганізмів вона була викликана. Лікування такої діареї має два етапи: проведення регідратації та знищення збудника. Після поповнення водного балансу антибактеріальні препарати починають використовувати при наростанні симптомів інтоксикації і наявності діарейного синдрому. Такі препарати повинні мати широкий спектр активності при сприятливому рівні безпеки застосування. Також доцільна терапія лікарськими препаратами з місцевим характером дії, які погано всмоктуються або не всмоктуються зовсім. На даний час для лікування гострих кишкових інфекцій застосовуються лікарські комбінації або комбіновані препарати, до складу яких зазвичай входять два - чотири антимікробні засоби, що набагато підвищує шанси хворого на швидке одужання. Вибір комбінації передбачає:

- потенціювання активності в порівнянні з дією одного препарату в монотерапії;
- розширення спектра дії, включаючи активність і до відносно резистентних штамів до того або іншого компонента;
- можливість зниження частоти розвитку лікарської стійкості до певної групи антимікробних препаратів;
- поліпшення переносимості ліків, зменшення частоти і тяжкості побічних реакцій, в першу чергу за рахунок зниження лікувальних доз препаратів.

Серед антимікробних препаратів, які не всмоктуються в шлунково-кишковому тракті та мають широкий спектр дії і позитивний профіль безпеки, є препарати на основі ніфуроксазиду. Ніфуроксазид - кишковий антисептик, що виявляє активність щодо деяких видів грампозитивних та грамнегативних бактерій, а також впливає на штами-мутанти, які стійкі до інших протимікробних засобів. В терапевтичних дозах, що мають середні показники, ніфуроксазид проявляє бактеріостатичну активність, а в більш високих - бактерицидну.

Відомим аналогом є антимікробний лікарський засіб Ніфуроксазид-сперко, до складу якого входять, окрім діючої речовини ніфуроксазиду, сахароза, лактоза безводна, крохмаль кукурудзяний, тальк, магнію стеарат. Недоліком цього засобу є наявність допоміжних речовин, шкідливих для малюків, недостатня ефективність при посиленних формах отруєнь [1]/

Найближчим аналогом до корисної моделі є антимікробний лікарський засіб Ентерофурил, який містить ніфуроксазид, крохмаль кукурудзяний, сахарозу, порошок целюлози, магнію стеарат. Недоліком є достатньо висока ціна, і, головне, те, що ентерофурил є монопрепаратом, який має цілеспрямований і вузький спектр дії, тоді як згідно з рекомендаціями лікарів, для ефективного лікування кишкових інфекцій доцільно застосовувати лікарські комбінації з включенням ніфуроксазиду або створювати комбіновані препарати з широким спектром дії [2].

В основу корисної моделі поставлена задача розробка лікарського засобу з широким спектром дії проти різних мікроорганізмів, створення комбінованого препарату з включенням рослинної сировини з імуномодельюючою, протизапальною, спазмолітичною, антимікробною дією.

Поставлена задача вирішується тим, що лікарський засіб антимікробної дії містить ніфуроксазид, крохмаль кукурудзяний, сахарозу, магнію стеарат, додатково введено плантаглюцид, пектин, повідон 29/32, сахарозу, яка пресується, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:

ніфуроксазид	30,65-33,87
плантаглюцид	30,65-33,87
пектин	1,44-1,46
повідон 29/32	0,8-0,81
сахароза, яка пресується	29,03-35,49
крохмаль кукурудзяний	0,47-0,49,
магнію стеарат	0,40-0,57.

До ніфуроксазиду, який є синтетичним препаратом, додано плантаглюцид, сумарний препарат, одержуваний з листя подорожника великого, який містить суміш водорозчинних полісахаридів. Плантаглюцид має спазмолітичну і протизапальну активність, викликає посилення перистальтики кишечника за рахунок збільшення обсягу кишкового вмісту і скорочення часу його транзиту. Нетоксичний при довгому застосуванні. Полісахариди

подорожника великого представлені у вигляді пектинових речовин за вмістом галактуранової кислоти. Для пектинів характерні іонообмінні властивості, високий ступінь сорбуючої активності, чутливість до бактеріальної ферментації в товстій кишці і сприятливий вплив на обмін речовин. Пектини мають пребіотичні властивості, які дозволяють проводити корекцію дисбактеріозу.

5 Полісахариди мають імуномодельючу дію. [3.4]

При розчиненні плантаглюциду у воді утворюється слизивий розчин, який застосовується для лікування виразкової хвороби шлунка та дванадцятипалої кишки при нормальній або зниженій кислотності.

10 Обволікаюча і заспокійлива властивість слизу сприяє утворенню плівки з колоїду, яка захищає чутливі нервові закінчення слизової оболонки шлунка від дії подразнюючих речовин і соляної кислоти.

Флавоноїди, що містяться у вигляді похідних лютеоліну, забезпечують антимікробні властивості плантаглюциду.

15 Лікарську композицію антимікробної, протизапальної та спазмолітичної дії у вигляді капсул готують методом роздільної грануляції у зв'язку з тим, що діючі речовини різні за фізико-хімічними властивостями: ніфуроксазид не розчинний в воді, на відміну від плантаглюциду та пектину. Зважують і відсіюють кожен вид сировини, готують зволожувач 10 % розчин повідону з коефіцієнтом в'язкості 29/32. Спочатку отримують гранулят А з ніфуроксазидом шляхом зволоження 10 % розчином повідону. Для досягнення однорідності гранул зволоження 20 проводять порціонно в декілька прийомів до одержання рівномірно зволоженої маси. Після сушіння вологої маси в сушарці при температурі  $55 \pm 5$  °C проводять суху грануляцію з діаметром сітки 1,0 мм. Шляхом перемішування сахарози, яка пресується, з плантаглюцидом отримують гранулят В. Потім поєднують грануляти А та В, перемішують та для однорідності готової маси проводять просіювання через гранулятор з діаметром сітки 1,0 мм. Далі суху масу 25 опудрюють пектином, крохмалем кукурудзяним, магнію стеаратом. Отриману масу передають для наповнення в капсули. Приклад 1

Компоненти, які відібрані для приготування препарату, мають такі значення, мас. %

ніфуроксазид	32,26
повідон 29/32	0,81
плантаглюцид	32,26
сахароза, яка пресується	33,23
пектин	0,48
крохмаль кукурудзяний	0,48
магнію стеарат	0,48.

30 При такому співвідношенні компонентів капсульна маса відповідає необхідним вимогам за показниками якості (плинність, густина після усадки), за виключенням показника "час розпадання", що має значення 37-40 хв.

Приклад 2

Компоненти, які відібрані для приготування препарату, мають такі значення, мас. %

ніфуроксазид	32,26
повідон 29/32	0,81
плантаглюцид	32,26
сахароза, яка пресується	16,13
пектин	17,58
крохмаль кукурудзяний	0,48
магнію стеарат	0,48.

35 Для поліпшення розпадання застосовують розпушувальні речовини. При такому співвідношенні компонентів капсульна маса має задовільне значення для тесту розпадання завдяки набухаючій дії пектину та крохмалю кукурудзяного. Проте низьке значення плинності не буде забезпечувати технологічності процесу інкапсулювання.

Приклад 3.

Компоненти, які відібрані для приготування препарату, мають такі значення, мас. %

ніфуроксазид	32,26
повідон 29/32	0,81
плантаглюцид	32,26
сахароза, яка пресується	32,26
пектин	1,45
крохмаль кукурудзяний	0,48
магнію стеарат	0,48.

При такому співвідношенні діючих та допоміжних речовин капсули відповідають вимогам ДФУ за основними показниками якості.

- 5 Перевагою запропонованої фармацевтичної композиції у вигляді капсул є висока ефективність, переносимість та доступність. Препарат має дію на широкий спектр збудників, не викликає резистентності у мікроорганізмів, проявляє свою активність тільки в кишечнику, не маючи системної дії, має доступну ціну та може бути виготовлений в умовах вітчизняних фармацевтичних підприємств.

Джерело інформації:

- 10 1. Справочник "Компендиум 2014 - лекарственные препараты" под редакцией В.Н. Коваленко. Информация для профессионалов здравоохранения [Электронный ресурс]. Режим доступа: [www.morion.ua/books/53/](http://www.morion.ua/books/53/)
- 15 2. Анализ выбора и эффективности применения антимикробных препаратов при острых кишечных инфекциях в практике участкового педиатра г. Хабаровска [Электронный ресурс] /Е.В. Горбачева, И.В. Мизанова, О.В. Шевелева [и др.] //Дальневосточный медицинский журнал. - 2012. - № 2, - Режим доступа: <http://www.fesmu.ru/dmj/20122/2012215.aspx>
3. Олейников Д.Н. Подорожник большой (Plantago Major L.). Химический состав и применение /Д.Н. Олейников, А.В. Samuelsen, Л.М. Танхаева //Химия растительного сырья. - 2007. - № 2. - С. 37-50.
- 20 4. Перспективы использования растительных полисахаридов в качестве лечебных и лечебно-профилактических средств /Н.А. Криштанова, М.Ю. Сафонова, В.Ц. Болотова и др. //Вестник ВГУ. Серия: Химия. Биология. Фармация. - 2005. - № 1. - С. 212-221.

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

- 25 Лікарський засіб антимікробної дії, що містить ніфуроксазид, крохмаль кукурудзяний, сахарозу, магнію стеарат, який **відрізняється** тим, що додатково введено плантаглюцид, пектин, повідон 29/32, сахарозу, яка пресується, при наступному співвідношенні компонентів, мас. %:
- |                          |             |
|--------------------------|-------------|
| ніфуроксазид             | 30,65-33,87 |
| плантаглюцид             | 30,65-33,87 |
| пектин                   | 1,44-1,46   |
| повідон 29/32            | 0,8-0,81    |
| сахароза, яка пресується | 29,03-35,49 |
| крохмаль кукурудзяний    | 0,47-0,49   |
| магнію стеарат           | 0,40-0,57.  |

---

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