



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **69447**

(13) **U**

(51) МПК

A61K 31/64 (2006.01)

A61K 47/26 (2006.01)

A61K 47/38 (2006.01)

A61K 9/22 (2006.01)

A61P 3/10 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2011 13011**

(22) Дата подання заявки: **04.11.2011**

(24) Дата, з якої є чинними
права на корисну
модель: **25.04.2012**

(46) Публікація відомостей **25.04.2012, Бюл.№ 8**
про видачу патенту:

(72) Винахідник(и):

**Жебровська Філя Іванівна (UA),
Костюк Григорій Вікторович (UA),
Гурєва Світлана Миколаївна (UA)**

(73) Власник(и):

**Жебровська Філя Іванівна,
вул. Старицького, 6, м. Київ, 04078 (UA),
Костюк Григорій Вікторович,
вул. Старицького, 6, м. Київ, 04078 (UA),
Гурєва Світлана Миколаївна,
вул. Малиновського, 3-б, кв. 317, м. Київ,
04212 (UA)**

(54) МАТРИЧНА ТАБЛЕТКА ГЛІКЛАЗИДУ ПРОЛОНГОВАНОЇ ДІЇ

(57) Реферат:

Матрична таблетка гліклазиду пролонгованої дії містить гліклазид, гіпромелозу, коповідон, лактози моногідрат, аеросил та магнію стеарат.

UA 69447 U

Корисна модель належить до фармацевтичної промисловості, зокрема протидіабетичних засобів, які забезпечують постійний рівень гліклазиду в крові і використовуються для лікування діабету другого типу.

- 5 Відомий винахід, патент України на винахід № 81040, від 19.12.2005, опубл. 26.11.2007 на "Матрична таблетка гліклазиду тривалого вивільнення та спосіб її виготовлення", де гліклазид, гідроксипропілметилцелюлоза, коповідон, лактоза, аеросил, магнію або кальцію стеарат містяться в наступному співвідношенні інгредієнтів, мас. %:

гліклазид	20
гіпромелоза	18-25
коповідон	1-5
лактоза	45-60
аеросил	0,1-0,8
магнію або кальцію стеарат	0,1-1,0

У найближчому аналозі таблетка гліклазиду містить 30 мг діючої речовини гліклазиду і найчастіше призначається двічі на добу.

- 10 В основу корисної моделі поставлена задача - розробити препарат для перорального прийому, який може вживатися один раз на добу і з можливістю підтримання постійного вмісту гліклазиду в крові протягом доби.

- 15 Поставлена задача вирішується тим, що матрична таблетка пролонгованої дії містить гліклазиду 60 мг, що складає 20 % від середньої маси таблетки. Полімер від 10 до 30 %, який може бути представлений похідними целюлози високої та низької в'язкості (гідроксипропілцелюлоза, гідроксietилцелюлоза, метилцелюлоза, гіпромелоза).

Наприклад, полімер може бути представлений як однією гіпромелозою з в'язкістю 4000 сП, так і сумішшю гіпромелоз із в'язкістю 4000 сП та 100 сП, причому гіпромелоза із в'язкістю 4000 сП складає 10-25 % від загальної маси вказаної таблетки, а із в'язкістю 100 сП - 3-10 %.

- 20 Солюбілізатор від 3 до 9 %, який може бути представлений різними видами повідонів з різними молекулярними масами (повідон 17, повідон 25, повідон 30, коповідон).

Наприклад, може бути використаний коповідон від 3 до 9 % від загальної маси вказаної таблетки, причому коповідон виступає в ролі солюбілізатора і пролонгатора.

- 25 Як наповнювач в кількості 50-65 % використовують різні загальноприйняті допоміжні речовини (лактози моногідрат, кальцію гідрофосфат водний та безводний, натрію гідрокарбонат, натрію карбонат, кальцію карбонат, мікрокристалічна целюлоза та ін.).

Як ковзну речовину використовують діоксид кремнію колоїдний, що складає від 0,2 до 0,8 % від загальної маси таблетки.

- 30 Як лубрикант використовують магнію стеарат, кальцію стеарат, стеаринову кислоту, тальк, який складає від 0,5 до 1,5 %.

Матричну таблетку виготовляють методом прямого пресування, який складається із наступних стадій: зважування і просіювання сировини, змішування гліклазиду, коповідону та лактози моногідрату, обпудрювання суміші стеаратом магнію та колоїдним діоксидом кремнію, пресування таблеток, упаковка по 10 таблеток в блістери, після чого по 3 або 6 блістерів у

- 35 пачку.

Приклад 1.

Склад на 1 таблетку:

Найменування сировини	На 1 таблетку, мг	%
Гліклазид	60,0	20,0
Гіпромелоза 4000	20,0	6,67
Лактози моногідрат	190,9	63,63
Аеросил	0,6	0,2
Магнію стеарат	3,0	1,0
Коповідон	25,5	8,5
Всього:	300	100

- 40 Гліклазид, аеросил, магнію стеарат просіюють через сито 0,5 мм.

Гліклазид, гіпромелозу, лактозу моногідрат та коповідон ретельно перемішують. Обпудрюють аеросилом, а потім магнію стеаратом.

Пресують таблетки круглої форми з рискою та фаскою.

- 45 Упаковують по 10 таблеток в контурну чарункову упаковку з плівки полівінілхлоридної безбарвної і фольги алюмінієвої друкарської лакованої.

Приклад 2.

Склад на 1 таблетку:

Найменування сировини	На 1 таблетку, мг	%
Гліклазид	60,0	20,0
Гіпромелоза 4000	53,01	17,67
Кальцію гідрофосфат безводний	168,09	56,03
Аеросил	0,9	0,3
Магнію стеарат	3,0	1,0
Повідон 30	15,0	5,0
Всього:	300	100

5 Гліклазид, аеросил, магнію стеарат просіюють через сито 0,5 мм.

Гліклазид, гіпромелозу, кальцію гідрофосфат безводний та повідон ретельно перемішують. Обпудрюють аеросилом, а потім магнію стеаратом.

Пресують таблетки круглої форми з ризкою та фаскою.

Упаковують по 10 таблеток в контурну чарункову упаковку з плівки полівінілхлоридної безбарвної і фольги алюмінієвої друкарської лакованої.

10

Приклад 3.

Склад на 1 таблетку:

Найменування сировини	На 1 таблетку, мг	%
Гліклазид	60,0	20,0
Гіпромелоза 4000	69,0	23,0
Гіпромелоза 100	21,0	7,0
Мікрокристалічна целюлоза	132,15	44,05
Аеросил	1,35	0,45
Кислота стеаринова	3,0	1,0
Коповідон	13,5	4,5
Всього:	300	100

15

Гліклазид, аеросил, кислоту стеаринову просіюють через сито 0,5 мм.

Гліклазид, гіпромелози, мікрокристалічну целюлозу та коповідон ретельно перемішують. Обпудрюють аеросилом, а потім кислотою стеариною.

Пресують таблетки круглої форми з ризкою та фаскою.

Упаковують по 10 таблеток в контурну чарункову упаковку з плівки полівінілхлоридної безбарвної і фольги алюмінієвої друкарської лакованої.

20

Експериментально доведено, що при вживанні матричної таблетки пролонгованої дії за корисною моделлю, за 12 годин вивільняється не менше 85 % гліклазиду.

Авторами розроблено технічну документацію на серійний випуск, проведено всі підготовчі роботи, закуплено необхідну сировину.

25

Технічний результат - розроблено препарат для перорального прийому, який може вживатися один раз на добу і дає можливість підтримувати постійний вміст гліклазиду у крові протягом доби.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

30

1. Матрична таблетка гліклазиду пролонгованої дії, яка містить гліклазид, гіпромелозу, коповідон, лактози моногідрат, аеросил та магнію стеарат в наступній кількості, мас. %:

гліклазид	20
гіпромелоза	10-30
коповідон	3-9
лактози моногідрат	50-65
діоксид кремнію колоїдний	0,2-0,8
магнію стеарат	0,5-1,5.

2. Матрична таблетка пролонгованої дії за п.1, яка **відрізняється** тим, що вміст гліклазиду на одну таблетку складає 60 мг.

35

3. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що целюлозна полімерна сполука представлена гіпромелозою з в'язкістю 4000 сП та 100 сП.

5. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що целюлозна полімерна сполука представлена сумішшю гіпромелоз.
6. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що вміст целюлозної полімерної сполуки - гіпромелози з в'язкістю 4000 сП і складає від 10 до 25 % від загальної маси вказаної таблетки.
7. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що вміст целюлозної полімерної сполуки - гіпромелози з в'язкістю 100 сП складає від 3 до 10 % від загальної маси вказаної таблетки.
8. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що як солюбілізатор та пролонгатор містить коповідон.
9. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що як наповнювач містить лактози моногідрат.
10. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що як ковзну речовину використовують діоксид кремнію колоїдний.
11. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що як лубрикант використовують магнію стеарат.
12. Матрична таблетка пролонгованої дії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що за 12 годин вивільняється не менше 85 % гліклазиду.

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

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

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