



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **77795** (13) **U**
(51) МПК

A61K 31/495 (2006.01)

A61K 31/4965 (2006.01)

A61P 37/08 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: u 2012 10333	(72) Винахідник(и): Загорій Гліб Володимирович (UA)
(22) Дата подання заявки: 31.08.2012	(73) Власник(и): Загорій Гліб Володимирович, вул. Прорізна, 10, кв. 19, м. Київ, 01034 (UA)
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: 25.02.2013	(74) Представник: Пікалова Алла Олегівна, реєстр. №91
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 25.02.2013, Бюл.№ 4	

(54) ЗАСТОСУВАННЯ КОМПОЗИЦІЇ ЯК ПРОТИАЛЕРГІЙНОГО ЗАСОБУ

(57) Реферат:

Застосування композиції, що містить левоцетиризин або його фармацевтично прийнятні солі і фенілефрин з пролонгованим виділенням та допоміжні речовини, як протиалергійного засобу.

UA 77795 U

Корисна модель належить до медицини і хіміко-фармацевтичної промисловості, зокрема виробництва і використання композицій для лікування алергічних станів, де алергічний стан являє собою сезонний алергічний стан, викликаний, наприклад, цвітінням амброзії, тополіним пухом тощо. Об'єктом корисної моделі є застосування композиції, що містить левоцетиризин або його фармацевтично прийнятні солі і фенілефрин та допоміжні речовини, як протиалергічного засобу.

Алергія є глобальною проблемою медицини. Існує тенденція росту захворювань цією хворобою. Алергія - це підвищена чутливість організму до якого-небудь алергену - речовини, що викликає алергію. Алергія - це досить широке поняття. А якщо бути точніше, мова йде не про одне захворювання, а про групу патологічних станів, що мають до деякої міри загальні механізми розвитку, але зовсім різні прояви.

Алергія як захворювання була завжди, але із середини XX століття й кількість алергіків, і спектр можливих алергенів почали стрімко зростати. Сьогодні різними формами алергії страждають до 60 % населення. При цьому захворюваність алергією ще не досягла максимуму: тільки за останні три десятиліття кожні десять років захворюваність алергією подвоювалася.

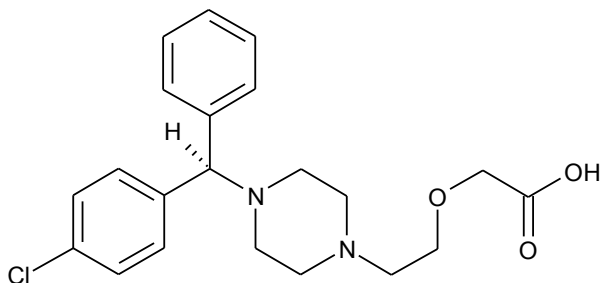
Існує багато протиалергічних препаратів.

Останніми роками особливо великий інтерес серед лікарських засобів з протиалергічними властивостями викликає левоцетиризин, який попереджає розвиток та полегшує протікання алергічних реакцій.

Цетиризин або {2-[4-((4-хлорфеніл)фенілметил)-1-піперазиніл]етокси}оцтова кислота, є неседативним активним інгредієнтом антигістамінового типу, для лікування алергії. Дія цетиризину заснована на його виборчій взаємодії з гістаміновими рецепторами H_1 , що інгібують вивільнення гістаміну.

Цетиризин є рацемічною сполукою, яка сама по собі придатна для терапії. З рівня техніки відомо, що введення лівообертаючого енантіомеру (-)-цетиризину є фармакологічно сприятливим, оскільки при введенні (-)-цетиризину виявляють менше побічних дій. (-)-Цетиризин є індивідуальним активним фармацевтичним інгредієнтом, відомим під міжнародною непатентованою назвою левоцетиризин. Способи його отримання та сама сполука широко відома.

Структурна формула левоцетиризину має такий вигляд



2-[2-[4-[(R)-(4-хлорфеніл)фенілметил]піперазин-1-іл]етокси]оцтова кислота.

Левоцетиризин - останній протиалергічний препарат 3 покоління, H_1 -антигістамінний препарат, який показав високу ефективність при лікуванні різних алергічних станів і добру переносимість.

В заявці GB 2403655 А розкривається фармацевтична композиція, що містить принаймні один (i) β -2 агоніст адренорецепторів, і (ii), принаймні один антигістамінний інгредієнт. Це комбінований препарат, що підходить як і для одночасного використання цих окремих інгредієнтів, так і послідовного в лікуванні захворювань органів дихання, наприклад, алергічних респіраторних розладів або пов'язаних з цим розладів. Запропонований широкий спектр β -2 агоністів адренорецепторів. З антигістамінних інгредієнтів, переважно, застосовують лоратадин, цетиризин або левоцетиризин, або їх фармацевтично прийнятну сіль, сольват або фізіологічно функціональну похідну.

Але левоцетиризин не повністю усуває набряк слизових оболонок (закладеність носу). В терапії алергічних захворювань рекомендується застосування левоцетиризину разом з судинозвужуючими засобами, так званими деконгестанами.

Як судинозвужуючий засіб в комбінації з протиалергічним препаратом використовують серед інших і псевдоефедрин. Так псевдоефедрин, як судинозвужуючий засіб використовували в комбінації з таким протиалергічним препаратом як цетиризин (RU 2 286 784 C2).

Але псевдоефедрин має ряд побічних дій та є обмеження для його застосування у дітей до 12 років. Крім того, можливість використання його як прекурсору для отримання наркотичних речовин призводить до ускладнень його застосування.

5 Спеціалістам в даній галузі добре відомо, що до комбінацій фармацевтичних речовин варто завжди ставитись з обережністю, оскільки вони можуть викликати непередбачені побічні ефекти. Також в деяких випадках можливо, що терапевтична дія, яку проявляє комбінація фармацевтичних речовин нижча за терапевтичну дію кожної фармацевтичної речовини, взятої окремо.

10 При лікуванні алергічних станів таких як сезонні алергічні стани, викликані цвітінням амброзії, тополіним пухом, варто дотримуватись обережності при поєднанні протиалергічного та судинозвужуючого засобів щоб не тільки підвищити загальний ефект лікування але й уникнути можливих побічних ефектів, таких як головний біль, тошнота, сонливість тощо.

15 У заявці WO 2006/061700 описується резинат цетиризину (левоцетиризину) або його фармацевтично прийнятні солі, спосіб його отримання, а також композиції, що містять резинат цетиризину (левоцетиризину) та додаткові інгредієнти, такі як, псевдоефедрин, парацетамол, сальбутамол, вітаміни, фенілефрин, декстрометорфан тощо.

Але застосування комбінації левоцитиризину з фенілефрином негайного вивільнення неможливо через різну кратність компонентів. Левоцитиризин приймають один раз на добу, а фенілефрин удвічі.

20 Заявлене технічне рішення направлено на усунення такої невідповідності шляхом пролонгації вивільнення фенілефрину, до 6 годин, що дає можливість приймати комбінований препарат 1 раз на добу та забезпечення ефективної дії композиції за рахунок забезпечення взаємного посилення активності компонентів композиції, а також зниження або виключити негативні побічні ефекти, внаслідок чого забезпечити ефективну протиалергічну дію.

25 Поставлена задача вирішується тим, що розроблена композиція для лікування алергічних захворювань, що містить як активнодіючу речовину левоцетиризин (5мг) та фенілефрин 10 мг (25 мг або 20 мг або 40 мг або 30 г), який проявляє судинозвужуючу дію. Запропонована композиція існує у вигляді капсул, що містять пелети левоцетиризину та пелети фенілефрину. До складу капсул крім пелет левоцетиризину та пелети фенілефрину входять також допоміжні речовини такі, як мікрокристалічна целюлоза, кросповідон, магнія/кальція стеарат, тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний.

Композиції цієї корисної моделі одержують з використанням фармацевтично прийнятних носіїв або розріджувачів, а також будь-яких інших відомих ад'ювантів і ексципієнтів, відповідно до традиційних процедур, відомих середньому спеціалісту з рівня техніки.

35 Спосіб отримання композиції полягає в тому, що отримують левоцетиризин та фенілефрин у вигляді пелет. Для отримання пелет левоцетиризину, гранули левоцетиризину покривають оболонкою, що містить допоміжні речовини, такі, як маніт, цукор, крохмаль, повідон. Для отримання пелет фенілефрину з пролонгованим виділенням отримують фенілефрин в гранулах і потім гранули покривають оболонкою, що містить допоміжні речовини, такі, як повідон, крохмаль, тальк, цукор, а також містять допоміжні речовини ацетилфталілцелюлозу і/або метакрилової кислоти-етил акрилат кополімер або етилцелюлозу.

Наводимо конкретні приклади здійснення композиції.

Приклад 1.

45 Гранули левоцетиризину покривають оболонкою, що містить допоміжні речовини, такі, як маніт (30-50 %), цукор (15-40 %), крохмаль (5-25 %), повідон (0,5-10 %). Таким чином отримують пелети левоцетиризину.

Гранули фенілефрину покривають оболонкою, що містить допоміжні речовини, такі, як повідон (0,5-10 %), крохмаль (5-25 %), тальк (0,5-10 %), цукор (10-40 %), ацетилфталілцелюлозу і метакрилової кислоти-етил акрилат кополімер до 60 %. Таким чином отримують пелети фенілефрину з пролонгованим виділенням.

Отриманими пелетами наповнюють капсули. Капсули також наповнюють допоміжними речовинами такими, як мікрокристалічна целюлоза (0-40 %), кросповідон (0-15 %), магнію/кальцію стеарат (0-1 %), тальк (0-3 %), кремнію діоксид колоїдний безводний (0-10 %).

Приклад 2.

55 Гранули левоцетиризину покривають оболонкою, що містить допоміжні речовини, такі, як маніт (30-50 %), цукор (15-40 %), крохмаль (5-25 %), повідон (0,5-10 %). Таким чином отримують пелети левоцетиризину.

Гранули фенілефрину покривають оболонкою, що містить допоміжні речовини, такі, як повідон (0,5-10 %), крохмаль (5-25 %), тальк (0,5-10 %), цукор (10-40 %), а також додатково

ацетилфталілцелюлозу і етилцелюлозу (5-50 %). Таким чином отримують пелети фенілефрину з пролонгованим виділенням.

Отриманими пелетами наповнюють капсули. Капсули також наповнюють допоміжними речовинами такими, як мікрокристалічна целюлоза (0-40 %), кросповідон (0-15 %),
5 магнію/кальцію стеарат (0-1 %), тальк (0-3 %), кремнію діоксид колоїдний безводний (0-10 %).

Наведений вище опис розглядається лише як ілюстрація принципів корисної моделі. Більш того, оскільки численні модифікації і зміни будуть очевидні фахівцям у даній області техніки, не бажано обмежувати корисну модель точним тлумаченням і способами, описаними вище.
10 Відповідно, можуть бути здійснені всі придатні модифікації і еквіваленти, що знаходяться в рамках даного корисної моделі, згідно з Формулою корисної моделі.

Таким чином, запропоноване застосування композиції, що містить левоцетиризин або його фармацевтично прийнятні солі і фенілефрин з пролонгованим виділенням дозволить використовувати при лікуванні алергічних станів таких як сезонні алергічні стани, викликані
15 цвітінням амброзії, тополіним пухом, за рахунок поєднання протиалергічного та судинозвужуючого засобів, щоб підвищити загальний ефект лікування, уникнути можливих побічних ефектів.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

- 20 1. Застосування композиції, що містить левоцетиризин або його фармацевтично прийнятні солі і фенілефрин з пролонгованим виділенням та допоміжні речовини, як протиалергічного засобу.
2. Застосування композиції за п. 1, де протиалергічний засіб використовують для лікування алергічних станів.
3. Застосування композиції за п. 2, де алергічним станом є сезонний алергічний стан.
- 25 4. Застосування композиції за п. 3, де сезонний алергічний стан викликаний цвітінням амброзії, тополіним пухом.
5. Застосування композиції за п. 1, де левоцетиризин знаходиться у вигляді пелет, а фенілефрин знаходиться у вигляді пелет з пролонгованим виділенням.
6. Застосування композиції за п. 1, де допоміжними речовинами є такі, як мікрокристалічна
30 целюлоза, кросповідон, магнію/кальцію стеарат, тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний.
7. Застосування композиції за п. 5, де левоцетиризин покритий допоміжними речовинами, якими є маніт, цукор, крохмаль, повідон.
8. Застосування композиції за п. 5, де фенілефрин покритий допоміжними речовинами, якими є повідон, крохмаль, тальк, цукор та ацетилфталілцелюлоза і/або метакрилова кислота-
35 етилакрилат кополімер або етилцелюлоза.
9. Застосування композиції за будь-яким з пп. 1-8, де композиція існує у вигляді капсул.

Комп'ютерна верстка Г. Паяльніков

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