



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **91708** (13) **U**
(51) МПК (2014.01)
A61K 31/00

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: u 2014 01995	(72) Винахідник(и): Соколов Юрій Вікентійович (UA)
(22) Дата подання заявки: 27.02.2014	(73) Власник(и): ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "АТ БІОФАРМ", пров. Театральний, буд. 5, кв. 1-А, м. Харків, 61057, Україна (UA)
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: 10.07.2014	(74) Представник: Михайлюк Ганна Валентинівна, реєстр. №184
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 10.07.2014, Бюл.№ 13	

(54) АНТИБАКТЕРІАЛЬНА КОМПОЗИЦІЯ

(57) Реферат:

Антибактеріальна композиція містить щонайменше один антимікробний засіб групи сульфаніламідів та щонайменше одне похідне діамінопіримідину як діючі речовини, розчинник діючих речовин та пролонгатор, при цьому як пролонгатор містить комбінацію фармацевтично прийнятної солі токоферолу з щонайменше одним її розчинником.

UA 91708 U

Корисна модель належить до галузі ветеринарної медицини, зокрема до комбінованих лікарських засобів у парентеральній формі, призначених для профілактики та лікування захворювань, викликаних мікроорганізмами, чутливими до сульфаметоксазолу та триметоприму.

Інфекційні захворювання реєструються практично всюди у межах ареалу сільськогосподарських та диких тварин. Такі захворювання наносять велику економічну шкоду, яка обумовлена масовою загибеллю тварин, втратою ними продуктивності, витратами на організацію заходів боротьби з хворобою. Ефективним методом запобігання інфекційним захворюванням або щонайменше зменшення кількості зараженого поголів'я є проведення профілактичних щеплень. Широке розповсюдження у ветеринарній практиці у боротьбі з інфекційними захворюваннями тварин знайшли комбіновані антибактеріальні препарати, які містять у своєму складі поряд із сульфаніламидами похідне діамінопіримідину - триметоприм. Активність таких препаратів проявляється по відношенню практично до всіх груп мікроорганізмів.

Відомий комбінований засіб для парентерального застосування, описаний у патенті України № 76665, опублікованому 15.08.2006 р., який містить сульфаметоксазол, триметоприм, натрію гідроксид, пропіленгліколь, динатрію едетат та натрію метабісульфіт як антиоксиданти, сорбіт як стабілізатор та воду для ін'єкцій.

До недоліків вищеописаного аналогу можна віднести включення у склад композиції натрію гідроксиду як солюбілізатора, який призводить до підвищення рН препарату і, як наслідок цього, до появи сильних больових відчуттів у місці ін'єкції.

Найбільш близьким аналогом корисної моделі, яка заявляється, є фармацевтична композиція для парентерального введення, описана у заявці Великобританії № 2066068, опублікованій 08.07.1981 р., яка містить сульфаметоксазол, триметоприм та етилолеат як пролонгатор. Як розчинники можуть бути використані поліетиленгліколь, N,N-диметилацетамід.

До недоліків найближчого аналогу можна віднести достатньо високий ризик окиснення композиції у процесі зберігання, а також її відносно високу собівартість. Використання поліетиленгліколю як розчинника обумовлює підвищену в'язкість композиції, а N, N-диметилацетамід є агресивною речовиною, що вимагає застосування особливих засобів безпеки під час приготування препарату, крім того парентеральне його введення може викликати потужне подразнення у місці ін'єкції.

В основу корисної моделі поставлена задача створення антибактеріальної композиції для парентерального введення на основі сульфаметоксазолу та триметоприму, якісний та кількісний склад якої дозволить досягти високого рівня специфічної активності діючих речовин, забезпечить стабільність лікарської форми та пролонгацію терапевтичного ефекту. Також антибактеріальна композиція, яка заявляється, характеризуватиметься низькою собівартістю, доступністю складових компонентів та простотою технологічного процесу її одержання.

Поставлена задача вирішується тим, що розроблено антибактеріальну композицію, яка містить щонайменше один антимікробний засіб групи сульфаніламідів та щонайменше одне похідне діамінопіримідину як діючі речовини, розчинник діючих речовин та пролонгатор, при цьому як пролонгатор містить комбінацію фармацевтично прийнятної солі токоферолу з щонайменше одним її розчинником.

Розчинена сіль токоферолу забезпечує збільшення часу знаходження лікарського засобу в організмі, тим самим збільшуючи тривалість його дії та знижуючи частоту його введення. Запропонований пролонгатор має відносно низьку собівартість, що відповідно зменшує собівартість лікарського засобу на основі композиції. Поряд з вищезазначеним токоферол сам по собі є антиоксидантом та забезпечує захист від окиснення композиції киснем повітря при її зберіганні.

Переважно композиція, яка заявляється, є істинним розчином.

В переважному варіанті виконання корисної моделі розчинник солі токоферолу вибраний з групи, яка включає 2-піролідон, триацетин, етилбутират, етиллактату, етилкапрат, етилформіат, етилкаприлат та ізопропілмірістат. Дія перелічених речовин заснована на тому, що вони здатні гальмувати звільнення діючих речовин з місця введення засобу. Водночас вказані речовини є розчинниками діючих речовин, що дозволяє отримати при поєднанні компонентів композицію з заявленими властивостями для парентерального застосування.

Переважно розчинник діючих речовин вибраний з групи, яка включає диметилсульфоксид, N-метил-2-піролідон, диметилацетамід та диметилформамід.

Вибір таких розчинників діючих речовин та солі токоферолу обумовлює порівняно низьку в'язкість композиції, що дозволяє стерилізувати її методом мембранної фільтрації, не застосовуючи теплову стерилізацію або, наприклад, наповнення флаконів в струмі азоту, що

значною мірою спрощує технологічний процес. Вказані розчинники не є агресивними речовинами та відповідають сучасним фармакопейним вимогам. Крім того рН отриманої пропонуваної композиції (близько 8,0) є наближеним до фізіологічних рівнів рН крові та тканин ссавців, завдяки чому не викликає подразнення при введенні.

5 Сульфаніламід переважно вибирають з групи, яка містить сульфадіазин, сульфадиметоксин, сульфадоксин, сульфагуанідин, сульфаметазин, сульфаметоксазол, сульфакіноксалін, сульфанітран, сульфадимідин, сульфатіазол, сульфасалазин та сульфаклорпіридазин.

10 Діамінопіримідин переважно вибрано з групи, яка містить триметоприм, орметоприм, адитоприм та тетроксоприм.

Композиція також може містити додаткові допоміжні речовини, наприклад, антиоксиданти та/або консерванти.

Переважним є варіант реалізації корисної моделі, при якому фармацевтична композиція має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

сульфаметоксазол	0,1-50
триметоприм	0,1-90
диметилсульфоксид	0,1-90
ізопропілмірістат	0,1-50
токоферолу ацетат	0,1-1,0.

15 Ще одним переважним є варіант реалізації корисної моделі, при якому фармацевтична композиція має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

сульфадиметоксин	0,1-50
триметоприм	0,1-90
N-метил-2-піролідон	0,1-50
етилкаприлат	0,1-50
токоферолу ацетат	0,1-1,0
метилпарабен	0,05-1,0
пропілпарабен	0,001-1,0.

Заявлена фармацевтична композиція є ефективною у профілактиці та лікуванні інфекційних захворювань, викликаних мікроорганізмами, чутливими до сульфаніламідів та похідних діамінопіримідину.

20 Спосіб приготування одного з переважних варіантів композиції наведений нижче.

До реактора завантажують диметилсульфоксид, триацетин та токоферолу ацетат, потім вмикають мішалку та перемішують до однорідності. Далі завантажують сульфаметоксазол та триметоприм, після чого здійснюють перемішування до повного розчинення речовин. Отриманий розчин стерилізують за допомогою мембранної фільтрації.

25 Таким чином, корисна модель, яка заявляється, являє собою антибактеріальну композицію для парентерального введення на основі сульфаметоксазолу та триметоприму, якісний та кількісний склад якої дозволяє досягти високого рівня специфічної активності діючих речовин, забезпечує стабільність лікарської форми та пролонгацію терапевтичного ефекту. Також антибактеріальна композиція, яка заявляється, характеризується низькою собівартістю, доступністю складових компонентів та простотою технологічного процесу її одержання.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

35 1. Антибактеріальна композиція, яка містить щонайменше один антимікробний засіб групи сульфаніламідів та щонайменше одне похідне діамінопіримідину як діючі речовини, розчинник діючих речовин та пролонгатор, при цьому як пролонгатор містить комбінацію фармацевтично прийнятної солі токоферолу з щонайменше одним її розчинником.

2. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що є істинним розчином.

40 3. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що розчинник солі токоферолу вибраний з групи, яка включає 2-піролідон, триацетин, етилбутират, етиллактат, етилкаприлат, етилформіат, етилкаприлат, ізопропілмірістат.

4. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що розчинник діючих речовин вибраний з групи, яка включає диметилсульфоксид, N-метил-2-піролідон, диметилацетамід, диметилформамід.

45 5. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що сульфаніламід вибрано з групи, яка містить сульфадіазин, сульфадиметоксин, сульфадоксин, сульфагуанідин, сульфаметазин, сульфаметоксазол, сульфакіноксалін, сульфанітран, сульфадимідин, сульфатіазол, сульфасалазин, сульфаклорпіридазин.

6. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що діамінопіримідин вибрано з групи, яка містить триметоприм, орметоприм, адитоприм, тетроксоприм.

7. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що містить консерванти та/або антиоксиданти.

8. Композиція за будь-яким з пп. 3-7, яка **відрізняється** тим, що має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

сульфаметоксазол	0,1-50
триметоприм	0,1-90
диметилсульфоксид	0,1-90
ізопропілмірістат	0,1-50
токоферолу ацетат	0,1-1,0.

5 9. Композиція за будь-яким з пп. 3-7, яка **відрізняється** тим, що має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

сульфадиметоксин	0,1-50
триметоприм	0,1-90
N-метил-2-піролідон	0,1-50
етилкаприлат	0,1-50
токоферолу ацетат	0,1-1,0
метилпарабен	0,05-1,0
пропілпарабен	0,001-1,0.

10. Композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що є ефективною у профілактиці та лікуванні інфекційних захворювань, викликаних мікроорганізмами, чутливими до сульфаніламідів та похідних діамінопіримідину.

Комп'ютерна верстка Л. Ціхановська

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