



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **77842** (13) **U**
(51) МПК (2013.01)

A61P 31/00

A61K 31/79 (2006.01)

A61K 9/12 (2006.01)

A61K 35/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2012 10814**
(22) Дата подання заявки: **17.09.2012**
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: **25.02.2013**
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: **25.02.2013, Бюл.№ 4**

(72) Винахідник(и):
Петрик Андрій Романович (UA),
Федін Роман Михайлович (UA),
Струбіцький Іван Володимирович (UA),
Огоновський Роман Зіновійович (UA),
Пастернак Юрій Богданович (UA)
(73) Власник(и):
Петрик Андрій Романович,
вул. Лепкого, 11, кв. 5, м. Львів, 79007 (UA),
Федін Роман Михайлович,
вул. Мечнікова, 10, кв. 17, м. Львів, 79014 (UA),
Струбіцький Іван Володимирович,
вул. Поповича, 6-а, кв. 4-а, м. Львів, 79005 (UA),
Огоновський Роман Зіновійович,
вул. Сахарова, 60, кв. 58, м. Львів, 79044 (UA),
Пастернак Юрій Богданович,
вул. Городоцька, 243, кв. 17, м. Львів, 79022 (UA)

(54) АНТИМІКРОБНИЙ, ЗНЕБОЛЮЮЧИЙ, РЕГЕНЕРУЮЧИЙ ЗАСІБ У ФОРМІ СПРЕЮ ДЛЯ ТЕРАПІЇ РАН, ОПІКІВ, ГНІЙНО-ВИРАЗКОВИХ УШКОДЖЕНЬ СЛИЗОВОЇ ОБОЛОНКИ РОТА ТА ШКІРИ

(57) Реферат:

Антимікробний, знеболюючий, регенеруючий засіб для терапії ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота та шкіри містить воду очищену та композиційну суміш на основі похідних γ -кетонолактону та карнозину, тримекаїн, полівінілпіролідон, олію м'яти перцевої і етанол 96 %.

UA 77842 U

Корисна модель належить до медицини, а саме хірургії та фармації, і може використовуватися як антимікробний, знеболюючий, регенеруючий засіб для терапії ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота та шкіри.

Відомий засіб "Аерозоль мірамістину" для лікування інфікованих ран різної локалізації та етіології, опіків II-IIIА ступенів – найближчий аналог [Реєстраційне посвідчення №94/266/1; завод-виробник - ДЗ ДНЦЛЗ Україна], містить у своєму складі (в одному аерозольному балоні на 60,0 г) мірамістин (0,25 г), трилон Б (0,25 г), проксанол-268 (12,75 г), 1,2-пропіленгліколь (20,8 г), воду очищену (15,95 г), хладон-12 (10,0 г).

Недоліком вказаного засобу є відсутність у його складі дієвих знеболюючих компонентів, що важливо для терапії ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота та шкіри. Окрім того, до складу аерозолю входить фторвуглеводневий пропелент хладон-12, який потребує спеціальних умов зберігання (уникнення ударів, прямих сонячних променів, високої температури у зв'язку з вибухонебезпечністю), шкідливий в екологічному аспекті (забруднює навколишнє середовище) і тому у багатьох країнах світу його використання заборонене, а натомість впроваджуються аерозольні контейнери без пропелентів - спреї.

В основу корисної моделі поставлена задача розробити такий засіб для терапії ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота та шкіри, який, завдяки удосконаленню складу та поліпшенню подачі лікарського засобу забезпечуватиме антимікробну, знеболюючу, регенеруючу, протинабрякову активність, захищатиме рану від подальшого інфікування за рахунок утворення захисної, антибактеріальної плівки на ушкодженій ділянці слизової оболонки та шкіри.

Поставлена задача вирішується тим, що антимікробний, знеболюючий, регенеруючий засіб для терапії ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота та шкіри, який містить воду очищену, згідно з корисною моделлю, засіб поміщений у скляний балончик з нагвинчуваним механічним розпилювачем насосного типу та додатково містить композиційну суміш на основі похідних γ -кротонолактону та карнозину, тримекаїн, полівінілпіролідон, олію м'яти перцевої і етанол 96 % за наступного співвідношення інгредієнтів, мас. %:

суміш на основі похідних γ -кротонолактону та карнозину	1,6-2,4
тримекаїн	1,6-2,4
полівінілпіролідон	2,5-3,5
олія м'яти перцевої	0,08-0,12
етанол 96 %	45,0-55,0
вода очищена	до 100,0.

Засіб у вигляді спрею являє собою розчин, яким наповнюють скляний балончик з нагвинчуваним механічним розпилювачем насосного типу, що не містить пропеленту і позбавлений недоліків притаманних найближчому аналогу - "Аерозоль мірамістину".

Суміш на основі похідних γ -кротонолактону та карнозину сприяє регенерації інфікованих ран сполучних тканин, проявляючи антисептичну, протинабрякову та некролітичну активність.

Тримекаїн забезпечує швидку, глибоку і тривалу місцевознечулюючу активність. Він відносно малотоксичний, не проявляє подразнювальної та алергізуючої дії.

Полівінілпіролідон виявляє добрі склеюючі властивості і при висиханні водно-спиртового розчину утворює еластичну плівку. Він також забезпечує пролонгований ефект суміші на основі похідних γ -кротонолактону та карнозину і тримекаїну, утворюючи з ними тимчасові комплекси.

Олія м'яти перцевої проявляє слабкі антисептичні властивості, створює охолоджуючий ефект та зменшує больові відчуття при інфікованих ранах, опіках, гнійно-запальних процесах.

Етанол 96 %, як зовнішній антисептик, служить також консервантом для розчину, сприяє швидкому утворенню плівки на ушкодженій ділянці шкіри після розбризкування спрею, оскільки він легко випаровується.

Вода очищена разом з етанолом забезпечує відповідну рідку консистенцію засобу.

Антимікробний, знеболюючий, регенеруючий засіб у формі спрею для терапії ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота та шкіри готують таким чином. Розраховану кількість полівінілпіролідону розчиняють у воді, очищеній при температурі 95-100 °С. До напівохолодженого розчину додають при перемішуванні тримекаїн, суміш на основі похідних γ -кротонолактону та карнозину. Олію м'яти перцевої розчиняють в етанолі 96 %, додають до охолодженого водного розчину, енергійно збовтують 2-3 хвилини і фільтрують. Одержаний розчин заливають у скляний балончик з нагвинчуваним механічним розпилювачем насосного типу.

Спрей являє собою прозору рідину, жовто-коричневого кольору із запахом м'яти перцевої. Вміст етанолу в ньому становить 48-50 %, значення рН середовища не перевищує 6,0.

Приклад 1

Засіб у формі спрею готують, як вказано вище, при мінімальному співвідношенні інгредієнтів, мас. %:

суміш на основі похідних γ -котонолактону та карнозину	1,6
тримекаїн	1,6
полівінілпіролідон	2,5
олія м'яти перцевої	0,08
етанол 96 %	45,0
вода очищена	до 100,0.

Приклад 2

5 Засіб у формі спрею готують, як вказано вище, при максимальному співвідношенні інгредієнтів, мас. %:

суміш на основі похідних γ -котонолактону та карнозину	2,4
тримекаїн	2,4
полівінілпіролідон	3,5
олія м'яти перцевої	0,12
етанол 96 %	55,0
вода очищена	до 100,0.

Приклад 3

Засіб у формі спрею готують, як вказано вище, при оптимальному співвідношенні інгредієнтів, мас. %:

суміш на основі похідних γ -котонолактону та карнозину	2,0
тримекаїн	2,0
полівінілпіролідон	3,0
олія м'яти перцевої	0,1
етанол 96 %	50,0
вода очищена	до 100,0.

10 Засіб застосовують зовнішньо шляхом розпилення на інфіковані та опікові рани м'яких тканин і гнійно-виразкові ушкодження слизової оболонки рота або шкіри.

Однією з важливих вимог до ранозагоювальних засобів для терапії ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота та шкіри є попередження вторинного інфікування, тому вони повинні мати помірковані антисептичні властивості до широкого спектра мікрофлори. Порівняльне вивчення антимікробної активності запропонованого спрею і аерозолу "Аерозоль мірамістину" – найближчого аналога, проводили методом дифузії в агаровий гель з еталонними штамами грампозитивних та грамнегативних мікроорганізмів (табл. 1).

Таблиця 1

Антимікробна активність запропонованого спрею та аерозолу "Аерозоль мірамістину"
(метод дифузії в агаровий гель in vitro, $M \pm m$, $n=6$)

Препарат	Діаметр зони затримки росту мікроорганізмів, мм					
	St. aureus	Ent. faecalis	E. coli	Ps. aeruginosa	Bac. subtilis	Candida albicans
Пропонований спрей	24,17 \pm 0,31	21,00 \pm 0,37	20,00 \pm 0,57	25,37 \pm 0,30	26,33 \pm 0,34	22,13 \pm 0,61
Аерозоль "Аерозоль мірамістину"	20,64 \pm 0,42	19,53 \pm 0,56	18,5 \pm 0,67	22,42 \pm 0,40	23,48 \pm 0,52	20,75 \pm 0,48

20

Результати досліджень свідчать, що пропонований спрей в усіх випадках має більш виражені антимікробні та протигрибкові властивості порівняно з найближчим аналогом "Аерозоль мірамістину".

25 Ранозагоювальна ефективність терапії досліджуваними лікарськими засобами вивчалася на трьох групах білих нелінійних статевозрілих щурів-самців масою 190-230 г (по 10 щурів у групі), яким наносилася модельована дерматомна рана на спині та проводилася візуальна оцінка

ранового процесу. Щоденне спостереження за усіма тваринами експериментальних груп дозволило встановити середньоарифметичні терміни початку та завершення основних фаз ранового процесу (табл. 2).

Таблиця 2

Порівняльна ранозагоювальна ефективність застосування пропонованого спрею і аерозолу "Аерозоль мірамистину" ($M \pm m$, $n=10$)

Критерії оцінки ранового процесу	Групи тварин (терміни - доба)		
	Контрольна	Пропонований спрей	Аерозоль "Аерозоль мірамистину"
Ліквідація перифокального запалення	6,5 \pm 0,2	2,4 \pm 0,1	3,6 \pm 0,3
Очищення рани	7,8 \pm 0,4	3,7 \pm 0,2	5,2 \pm 0,2
Поява грануляцій	9,4 \pm 0,3	4,8 \pm 0,2	6,5 \pm 0,4
Виповнення грануляціями	12,1 \pm 0,4	6,0 \pm 0,2	7,3 \pm 0,3
Початок красної епітелізації	15,7 \pm 0,2	8,1 \pm 0,3	9,8 \pm 0,3

5

З наведених даних табл. 2 видно, що найкоротші терміни початку та завершення основних фаз ранового процесу відбувалися при застосуванні пропонованого спрею, що вказує на його переважачу ранозагоювальну ефективність, у порівнянні з аерозолем – найближчого аналога і контролем.

10

Дослідження місцевознечулюючої дії пропонованого нами спрею і відомого засобу "Аерозоль мірамистину" проводились за методом Реньє на рогівці очей кролів. В кон'юнктивальний мішок ока шляхом одноразового розпилювання вводили одну дозу пропонованого засобу (0,15 г), другого ока - таку ж кількість засобу-найближчого аналога. Через відповідні проміжки часу рогівки очей подразнювали за допомогою волоска Фрея до зникнення рефлексу змикання вій, що свідчило про настання знечулюючого ефекту. Тривалість місцевознечулюючої дії визначали як час від моменту її настання до повного відновлення чутливості рогівки очей.

15

Результати експерименту підтвердили виражену місцевознечулюючу активність пропонованого спрею та її відсутність у найближчому аналізі.

20

Таким чином, позитивний результат запропонованого засобу досягається завдяки удосконаленню складу, оптимального кількісного співвідношення інгредієнтів та зміні виду лікарської форми, що забезпечує тривалу антимікробну, знеболюючу, протизапальну, протинабрякову активність, скорочення терміну лікування ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота і шкіри, дає можливість підвищити якість терапії, уникнути побічних явищ, шкідливого впливу на навколишнє середовище.

25

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

30

Антимікробний, знеболюючий, регенеруючий засіб для терапії ран, опіків, гнійно-виразкових ушкоджень слизової оболонки рота та шкіри, який містить воду очищену, який **відрізняється** тим, що засіб поміщений у скляний балончик з нагвинчуваним механічним розпилювачем насосного типу та додатково містить композиційну суміш на основі похідних γ -критонолактону та карнозину, тримекаїн, полівінілпіролідон, олію м'яти перцевої і етанол 96 % при наступному співвідношенні інгредієнтів, мас. %:

суміш на основі похідних γ -критонолактону та карнозину	1,6-2,4
тримекаїн	1,6-2,4
полівінілпіролідон	2,5-3,5
олія м'яти перцевої	0,08-0,12
етанол 96 %	45,0-55,0
вода очищена	до 100,0.

Комп'ютерна верстка М. Ломалова

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