



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **84761** (13) **U**  
(51) МПК (2013.01)  
**A61K 36/00**

## (12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: <b>u 2013 07127</b>	(72) Винахідник(и): <b>Загорій Гліб Володимирович (UA)</b>
(22) Дата подання заявки: <b>05.06.2013</b>	(73) Власник(и): <b>Загорій Гліб Володимирович,</b> вул. Прорізна, 10, кв. 19, м. Київ, 01034 (UA)
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: <b>25.10.2013</b>	(74) Представник: <b>Пікалова Алла Олегівна, реєстр. №91</b>
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: <b>25.10.2013, Бюл.№ 20</b>	

## (54) ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ ВИГОТОВЛЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ПРЕПАРАТІВ СЕДАТИВНОЇ, ЛЕГКОЇ СНОТВОРНОЇ ТА ЗНЕБОЛЮЮЧОЇ ДІЇ

### (57) Реферат:

Фармацевтична композиція для виготовлення лікарських препаратів седативної, легкої снотворної та знеболюючої дії у формі крапель, розчинів, сиропів або суспензій, таблеток, капсул, що містить рослинні компоненти відрізняється тим, що містить шоломник (*Scutellaria lateriflora*), глід (*Crataegus monogyna*), білокудреник чорний (*Ballota nigra*), вербену (*Verben*a), калину (*Viburnum opulus*), повитицю (*Cuscuta*), кріп (*Foeniculum*), м'ятне масло (що виробляється з м'яти польової), а для рідких лікарських форм та/або воду, та/або етиловий спирт, при цьому рослинні компоненти (глід, шоломник, білокудреник, вербена, калина, повитиця, кріп) використано з сухих або рідких екстрактів.

UA 84761 U



Корисна модель, що заявляється, належить до фармації, а саме, до виробництва лікарських препаратів седативної дії і може бути використана при виробництві фармацевтичних препаратів.

Відомі препарати седативної дії на основі фенобарбіталу та етилового ефіру  $\alpha$ -бромізовалеріанової кислоти, що випускається у вигляді крапель або капсул, діючим подібно екстрактам валеріани, при цьому фенобарбітал-натрій в дозах, що надходять в організм при прийомі цього лікарського засобу в звичайних дозах (20 крапель містять близько 0,0075 г = 7,5 мг фенобарбіталу), виявляє легку седативну та судинорозширювальну дію без помітного снодійного ефекту, м'ятна олія надає рефлекторний судинорозширювальний та спазмолітичний ефект.

Препарат містить етиловий ефір  $\alpha$ -бромізовалеріанової кислоти в перерахуванні на 100 % Речовини -20 мг, фенобарбіталу-18, 26, м'яти олії - 1, 42 мг, Допоміжні Речовини: стабілізатор, етанол (96 %), вода очищена. Недоліком вказаного препарату є те, що фенобарбітал викликає звикання та медикаментозну залежність. Довготривале та постійне застосування може викликати залежність, абстинентний синдром, психомоторне збудження. Раптове припинення застосування може спричинити синдром відміни.(виявляється приблизно через 2 тижні лікування) (інструкція, затверджена наказом МОЗ №791 від 12.10.2012; додаток 1).

Одним з відомих препаратів седативної дії є лікарський препарат, який вибрано за найближчий аналог, фармацевтична композиція якого містить рослинні компоненти пустирник, хміль, овес, глід, мелісу або м'яту, коріандр, буркун при наступному співвідношенні компонентів, в мас. % :

хміль	15-25
пустирник	15-25
овес	20-30
глід	5-15
меліса або м'ята	10-20
коріандр	3-7
буркун	3-7.

В цій фармакологічній композиції обґрунтованим є застосування пустирника разом з солями магнію і піридоксину (вітаміном В6). Магній є найважливішим елементом, який регулює передачу нервових імпульсів синапсах. Його недолік може спостерігатися при поганому харчуванні, підвищеному розумовому навантаженні, стресі застосуванні діуретиків. Піридоксин бере участь у процесах обміну, полегшує абсорбцію магнію, регулює метаболізм нервової системи.

Для хмелю характерні три напрямки дії. Перш за все він збуджує апетит, яке забезпечують дубильні речовини і гіркоти. Далі, хміль заспокійливо діє при збудженні, безсонні і в депресіях. І, нарешті, хміль, як кажуть, надає стимулюючу дію на менструальний цикл. Це належить як до шишки хмелю, так і до його лускок. Популярний хміль і як тонізуюча добавка, входячи разом з іншими діючими речовинами до складу дуже багатьох лікарських препаратів. В гомеопатії застосовують комбінації хмелю з іншими рослинами (наприклад, ячменем), причому хміль найчастіше стоїть на другому місці.

Індійська народна медицина й досліди англійських вчених свідчать про ефективність вівса при лікуванні звикання до наркотиків і тютюну. Найкращі наслідки отримано при використанні спиртових екстрактів із свіжих молодих рослин. Екстракти із зерна показали трохи нижчі результати. Свіжовіджятий сік вівса призначають вживати при безсонні, нервовому виснаженні, для збудження апетиту. Також овес використовують як зовнішній засіб. Для косметичних масок застосовують борошно й вівсяні пластівці, відвар трави або соломи - для ванн, примочок та обмивань при скрофульозі, рахіті, ревматизмі й гіпергідрозі ніг, обмороженнях і різних шкірних хворобах та для гарячих компресів на ділянку нирок як засіб, що полегшує проходження каменів (при нирковокам'яній хворобі). Овес ще використовують у гомеопатії.

У багатьох сьогодні при слові "глід" відразу виникає асоціація з роботою серця, адже на основі цієї ягоди готують активно діючі і поновлюючі препарати для серцево-судинної системи, а також заспокійливі засоби для нервової системи. Користь глоду для серця відома упродовж віків, його активно використовують при різних захворюваннях, таких як: розлади серцевої діяльності, слабкість серцевого м'яза, перенесений інфаркт міокарда, ангіоневрози, гіпертонія (початкова стадія), гіпертиреоз, тахікардія, безсоння. Речовини, що входять до складу глоду, не лише знижують збудливість нервової системи, вони покращують її роботу, виявляють тонізуючу дію на м'язи серця, покращують кровообіг в судинах серця і мозку, стабілізують скорочувальну роботу серця (аритмії, тахікардії). У народній медицині глід використовується як протиревматичний і протинабрякаючий засіб.

Також висока користь глоду при головних болях, алергії, епілепсії. Ця ягода корисна і при порушеннях роботи щитовидної залози. Люди, що страждають цукровим діабетом, також високо оцінили корисні властивості глоду, як засобу, здатного стабілізувати рівень цукру в крові. Окрім цього глід має жовчогінну дію і покращує роботу печінки. Активізація обміну речовин, поліпшення функцій печінки і кишечника, яке відбувається при вживанні глоду, призводить до схуднення і очищення організму, і в цьому ще одне, поза сумнівом, корисна властивість глоду. Меліса містить ефірну олію (0,05-0,35%), яка складається з цитралу, цитронелалу, ліололу, гераніолу і альдегідів, 4-5 % дубильних речовин, гіркі і слизисті речовини, кавову кислоту, ензими, урсолову кислоту, олеїнову кислоту тощо. Меліса зміцнює нервову систему і діє седативно і спазмолітично. Забезпечує добрий ефект при серцевих неврозах, мігрени, безсонні, нервовій і статевій підвищеній збудливості, неврастенії. Благодійна дія меліси і при серцевих хворобах - зникає втома, припиняється тахікардія, зменшуються болі в ділянці серця.

При внутрішньому прийманні препаратів меліси заспокоюється дихання, зникають порушення ритму і знижується кров'яний тиск. Крім того, меліса виявляє спазмолітичну і газогінну дію при функціональних захворюваннях кишечника заспокоює кольки від затримки газів у кишечнику, затримує блювання, стимулює травлення і виділення жовчного соку, збуджує апетит.

Як лікарську сировину використовують плід коріандру (лат. FructusCoriandri), він входить до складу жовчогінного і шлункового зборів. Він використовується як антисептичний і болезаспокійливий засіб при гастритах, виразковій хворобі шлунка і дванадцятипалої кишки. Ліналоол, виділений з ефірної олії, входить до складу антибактеріальних крапель, що використовуються при катарах верхніх дихальних шляхів, антибактеріальних цукерок. Ефір не масло коріандру є вихідною сировиною для синтезу альдегіду цитралу, застосовуваного в очній практиці при кератитах, кон'юнктивітах, глаукомі. Буркун - медоносна, ефіроолійна і лікарська рослина.

Хімічний склад рослини: трава містить кумарини, ефірну олію, похідні пурину, ліпоїди, білок, органічні кислоти.

Дія: відхаркувальна, пом'якшувальна, седативна, знеболююча, протизапальна, вітрогінна, антикоагулянтна, протисудомна, кардіотонічна, діуретична. Застосування: настій трави - при стенокардії й тромбозі коронарних судин. Трава входить до складу лікувальних сумішей при бронхіті, туберкульозі легень, болях у шлунку, набряках, ревматизмі, нарівах, пухлинах суглобів тощо. Сировина йде на виготовлення зеленого витяжного пластиру. У народній медицині використовують при кашлі, мігрени, безсонні, гіпертонії, клімактеричних розладах, хворобах яєчників, запаленнях молочних залоз, як засіб, що стимулює виділення молока у матерів-годувальниць. Зовнішньо - для компресів, примочок при фурункулах, герпесі, тріщинах заднього проходу, для пом'якшення та розсмоктування затвердінь, абсцесів; мазь - при простуді і порізах. Молоде листя та суміш сухого листя й суцвіття рекомендовані для вітамінних салатів, супів, окрошок, приправ, компотів. Настій квіток на олії прискорює, дозрівання фурункулів.

Отриманий готовий продукт контролюють по затвердженій аналітично-нормативній документації.

Препарат також може бути використаний в комплексній терапії для лікування та профілактики як засіб, що поліпшує і володіє властивостями.

Форма випуску:

Таблетки, вкриті оболонкою, по 20 мг діючої речовини по 20, 50 або 100 таблеток в упаковці.

Розчин для прийому всередину по 20 мл у флаконі-крапельниці

Недолік даної фармацевтичної композиції лікарського препарату є те, що з огляду на індивідуальні особливості пацієнтів, цей препарат не може охопити всю клінічну гаму призначень препарату.

Також можливі негативні побічні дії, що обмежують коло споживачів а саме: при прийомі препарату за рахунок наявності хмелю може викликати серйозні алергічні реакції(у тому числі свербіж, кропив'янка, шкірний висип, ангіоневротичний набряк, у поодиноких випадках - анафілактичний шок)., небажану стимуляцію менструального циклу, також препарат може викликати небажане підвищення апетиту, також в окремих випадках може спостерігатися подразнення слизової оболонки шлунково-кишкового тракту, диспепсичні явища. (Деклараційний патент України на корисну модель № 22666; заявка № 97063233 від 27.06.1997.; МПК(2006) А61К36/889, А61 К36/533.А61 К36/734. А61 К36/53. А61 К36/534, А61 Р25/00).

В основу корисної моделі поставлена задача отримання лікарського засобу на основі фармацевтичної композиції седативної, легкої снодійної та знеболюючої дії у формі крапель, розчину, сиропу або суспензії для перорального застосування, таблеток або капсул, що

відповідали б всім фармакопейним вимогам. Також, вирішується завдання по розширенні клінічної гами номенклатури лікарських препаратів, що надає можливість призначення лікарського засобу на базі фармацевтичної композиції в залежності від індивідуальних особливостей та вікової приналежності пацієнтів.

5 Поставлена задача вирішується тим, що фармацевтична композиція, згідно з корисною моделлю, містить рослинні компоненти: шоломник (*Scutellaria lateriflora*); глід (*Crataegus monogyna*), білокудреник чорний (*Ballota nigra*), вербена (*Verbena*), калина (*Viburnum opulus*), повитиця (*Cuscuta*), кріп (*Foeniculum*), м'ятне масло (що виробляється з м'яти польової), та/або етиловий спирт, та/або воду, при цьому рослинні компоненти (глід, шоломник, білокудреник, вербена, калина, повитиця, кріп) використано з сухих або рідких екстрактів, етиловий спирт знаходиться в межах від 0 до 50%.

10 Додавання спирту у вказаних межах є звичайно прийнятим для лікарських засобів, що забезпечує розчинення та стабільність діючих речовин в рідких лікарських формах. Використання спирту в більших концентраціях приведе до отримання високотоксичних лікарських засобів та звизить коло споживачів.

15 Компоненти, що входять до складу фармацевтичної композиції мають наступні властивості:

Шоломник є однією з найбільш універсальних рослинних компонентів в традиційній китайській медицині, а також широко використовується в західній медицині, де вона вважається одним з найефективніших природних адаптогенів. Препарати шоломнику мають гіпотензивну і заспокійливу дію. Препарати шоломнику розширюють кровоносні судини, сповільнюють ритм серцевих скорочень, усувають головний біль і безсоння, знижують артеріальний тиск, який поєднується з атеросклерозом, попереджають виникнення судом, загальмовують функціональну активність нервової системи, не надають негативної дії на організм людини навіть при тривалому прийомі.

25 Білокудреник чорний, виявляє седативну, спазмолітичну, гіпотензивну та болезаспокійливу дію. Застосовується при неврастенії гіперстенічного типу, істерії, початкових стадіях гіпертонічної хвороби, хронічному гастриті, холіциститі, клімактеричному синдромі.

Глід виявляє кардіотонічну, гіпотензивну, спазмолітичну, антисклеротичну, заспокійливу, антиаритмічну дію. За рахунок цього рекомендується до застосування при ішемічній хворобі серця, стенокардії, серцево-судинній недостатності, дистрофії міокарда, захворюваннях нервової системи, клімактеричному неврозі, безсонні.

30 Під дією вербени поліпшується мікроциркуляція крові в тканинах (особливо в головному мозку), відновлюється порушений кровообіг, нормалізуються метаболічні процеси на клітинному рівні.

35 Дія вербени триває протягом однієї доби. При тривалому застосуванні препарат не викликає розвитку звикання.

Калина - одне з найбільш корисних рослин. У яскраво-червоних плодах калини в два рази більше аскорбінової кислоти, ніж у цитрусових, а за змістом солей заліза вони перевершують лимони та апельсини. За рахунок цього є ефективним адаптогеном.

40 Повитиця виявляє легку знеболюючу дію.

Кріп виявляє седативну дію, за рахунок якої можна використовувати при безсонні, підвищеній збудженості нервової системи, неврастенії. Також виявляє спазмолітичну дію відносно до коронарних судин. Корисні речовини містяться в усій рослині. Листя кропу багаті на вітаміни С, А, В2, В6, Р, РР. Вони містять мінеральні солі, особливо кальцію, калію, фосфору, заліза, магнію.

45 М'ятна олія має вазоактивну властивість: регулює артеріовенозний тонус. М'ятна олія виявляє легку спазмолітичну, снотворну та седативну дію.

Лікарські засоби у формі крапель, розчинів, сиропів або суспензій виготовляють наступним чином: рослинні компоненти згідно з корисною моделлю, у вигляді екстрактів (сухих або рідких) розчиняють у фармацевтичному розчиннику, наприклад вода, додають при необхідності співрозчинник, наприклад етиловий спирт (до 50 %), компоненти перемішують, доводять об'єм до необхідного тим же самим розчинником, фільтрують через мембранний фільтр та розливають по флаконах та закупорюють.

50 Лікарські засоби у формі таблеток, капсул виготовляють наступним чином: рослинні компоненти згідно з корисною моделлю, у вигляді екстрактів (сухих або рідких) змішують з допоміжними речовинами, а саме наповнювачами, розріджувачами, а також при необхідності дезінтегрантами. Отриману суміш інгредієнтів зволожують, гранулюють та сушать. Отримані гранули таблетують або капсулюють.

60 Завдяки компонентам, що входять до складу запропонованої фармацевтичної композиції, можливо застосовувати лікарські препарати при ішемічній хворобі серця, стенокардії, серцево-

судинній недостатності, дистрофії міокарда, захворюваннях нервової системи, клімактеричному невроті, безсонні, підвищеній збудженості нервової системи, неврастенії, істерії, головному болю, виснаженні нервової системи після тяжких захворювань, фізичній або розумовій перенарузі, депресії як препарати седативної, легкої снотворної та знеболюючої дії.

5

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

1. Фармацевтична композиція для виготовлення лікарських препаратів седативної, легкої снотворної та знеболюючої дії у формі крапель, розчинів, сиропів або суспензій, таблеток, капсул, що містить рослинні компоненти, яка **відрізняється** тим, що містить шоломник (*Scutellaria lateriflora*), глід (*Crataegus monogyna*), білокудреник чорний (*Ballota nigra*), вербену (*Verbena*), калину (*Viburnum opulus*), повитицю (*Cuscuta*), кріп (*Foeniculum*), м'ятне масло (що виробляється з м'яти польової), а для рідких лікарських форм та/або воду, та/або етиловий спирт, при цьому рослинні компоненти (глід, шоломник, білокудреник, вербена, калина, повитиця, кріп) використано з сухих або рідких екстрактів.
2. Фармацевтична композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що містить етиловий спирт від 0 до 50 %.

---

Комп'ютерна верстка С. Чулій

---

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