



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **88315**

(13) **U**

(51) МПК

**A61K 31/47** (2006.01)

**A61K 31/505** (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ**

<b>(21)</b> Номер заявки: <b>u 2013 11746</b>	<b>(72)</b> Винахідник(и): <b>Соколов Юрій Вікентійович (UA)</b>
<b>(22)</b> Дата подання заявки: <b>04.10.2013</b>	<b>(73)</b> Власник(и): <b>ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "АТ БІОФАРМ",</b> пров. Театральний, 5, кв. 1-А, м. Харків, 61057 (UA)
<b>(24)</b> Дата, з якої є чинними права на корисну модель: <b>11.03.2014</b>	<b>(74)</b> Представник: <b>Михайлюк Валентин Іванович, реєстр. №1</b>
<b>(46)</b> Публікація відомостей про видачу патенту: <b>11.03.2014, Бюл.№ 5</b>	

**(54) ПРОТИМІКРОБНА КОМПОЗИЦІЯ**

**(57) Реферат:**

Протимікробна композиція для застосування у ветеринарній медицині містить триметоприм та/або щонайменше один фторхінолон або щонайменше одну фармацевтично прийнятну сіль фторхінолону, щонайменше один макролідний антибіотик або щонайменше одну фармацевтично прийнятну сіль макролідного антибіотика, щонайменше одну органічну кислоту та допоміжні речовини. Як одну з допоміжних речовин містить наповнювач для твердої лікарської форми.

**UA 88315 U**



Корисна модель належить до ветеринарної медицини, зокрема, до препаратів, призначених для профілактики та лікування захворювань, викликаних граммпозитивними та грамнегативними мікроорганізмами, найпростішими, наприклад, збудниками сальмонельозу, колібактеріозу, пастерельозу, мікоплазмозу та інших захворювань.

5 Найбільш близьким аналогом корисної моделі, яка заявляється, є протимікробна композиція, описана в патенті України № 94177, опублікованому 11.04.2011 р. Заявлена композиція містить триметоприм та/або щонайменше один фторхінолон або щонайменше одну фармацевтично прийнятну сіль фторхінолону, один макролідний антибіотик або щонайменше одну фармацевтично прийнятну сіль макролідного антибіотика, щонайменше одну органічну

10 кислоту, допоміжні речовини та фармацевтично прийнятний розчинник. Композиція має лікарську форму для орального введення.

Недоліками вищеописаної композиції є недостатня стабільність при зберіганні та відносно висока собівартість.

15 Задачею корисної моделі є забезпечення протимікробної фармацевтичної композиції, яка є стабільною при зберіганні, у тому числі при несприятливих умовах зовнішнього середовища, та має відносно малу собівартість.

Поставлена задача вирішується тим, що розроблена протимікробна композиція для застосування у ветеринарній медицині, яка містить триметоприм та/або щонайменше один фторхінолон або щонайменше одну фармацевтично прийнятну сіль фторхінолону, щонайменше один макролідний антибіотик або щонайменше одну фармацевтично прийнятну сіль макролідного антибіотика, щонайменше одну органічну кислоту та допоміжні речовини, згідно з корисною моделлю, як одну з допоміжних речовин містить наповнювач для твердої

20 лікарської форми.

Згідно з корисною моделлю протимікробна композиція має лікарську форму водорозчинного порошку. При цьому як наповнювачі можуть виступати такі водорозчинні речовини як маніт, сорбіт, глюкоза, фруктоза, сахароза тощо. Тверді лікарські форми, зокрема порошки, є більш стабільними при тривалому зберіганні за рідкі лікарські форми, більш точно дозуються, а також характеризуються порівняно низькою собівартістю.

25 Згідно з корисною моделлю, протимікробна композиція має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

макролідний антибіотик або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-50
триметоприм	0,1-30
органічна кислота	0,1-90
допоміжні речовини	решта.

30 Поєднання макролідного антибіотика або його фармацевтично прийнятної солі з триметопримом дозволяють забезпечити створення комплексного лікарського препарату, що має широкий спектр антимікробної дії. Зазначений кількісний вміст компонентів композиції є достатнім для виявлення терапевтично ефективного впливу при стані, що попереджають або лікують, а також для здійснення профілактичного впливу задля запобігання можливого

35 захворювання у птахів і ссавців. Також зазначений кількісний вміст елементів є оптимальним з точки зору безпеки використання протимікробної композиції та дозволяє уникнути можливих побічних ефектів під час лікування за допомогою композиції, яку заявляють. Терапевтично ефективна кількість компонентів композиції буде варіюватися залежно від специфічного стану, що лікують, фізичного стану суб'єктів, що піддаються лікуванню, тяжкості стану, що піддається лікуванню/попередженню, тривалості лікування, природи одночасної терапії, сполуки або композиції, що специфічно застосовують, певного фармацевтично прийнятного допоміжного засобу, що використовується, та подібних факторів.

40 Згідно з корисною моделлю, протимікробна композиція має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

макролідний антибіотик або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-50
фторхінолон або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-40
органічна кислота	0,1-90
допоміжні речовини	решта.

Поєднання макролідного антибіотику або його фармацевтично прийнятної солі з фторхінолоном або його фармацевтично прийнятною сіллю також дозволяє забезпечити створення комплексного лікарського препарату, що має широкий спектр антимікробної дії. Зазначений кількісний вміст компонентів композиції є достатнім для виявлення терапевтично ефективного впливу при стані, що попереджають або лікують, а також для здійснення профілактичного впливу задля запобігання можливого захворювання у птахів і ссавців. Також зазначений кількісний вміст елементів є оптимальним з точки зору безпеки використання протимікробної композиції та дозволяє уникнути можливих побічних ефектів під час лікування за допомогою композиції, яку заявляють. Терапевтично ефективна кількість компонентів композиції буде варіюватися залежно від специфічного стану, що лікують, фізичного стану суб'єктів, що піддаються лікуванню, тяжкості стану, що піддається лікуванню/попередженню, тривалості лікування, природи одночасної терапії, сполуки або композиції, що специфічно застосовують, певного фармацевтично прийнятного допоміжного засобу, що використовується, та подібних факторів.

Згідно з корисною моделлю протимікробна композиція має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

макролідний антибіотик або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-50
триметоприм	0,1-30
фторхінолон або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-40
органічна кислота	0,1-90
допоміжні речовини	решта.

Поєднання макролідного антибіотику або його фармацевтично прийнятної солі з триметопримом та фторхінолоном або його фармацевтично прийнятною сіллю дозволяє забезпечити створення комплексного лікарського препарату, що має широкий спектр антимікробної дії. Поєднання щонайменше одного фторхінолону або щонайменше однієї фармацевтично прийнятної солі фторхінолону з триметопримом дозволяє забезпечити синергічний ефект зазначених компонентів композиції. Механізм синергічної дії полягає в тому, що обидва компоненти в мікробів діють на різні ланки того самого процесу - синтезу нуклеїнових кислот, що є умовою для прояву потенціувального синергізму. Це, серед іншого, забезпечує високу терапевтичну ефективність композиції, розширює спектр її дії, дозволяє знизити необхідну для ефективного впливу кількість композиції, що, у свою чергу, буде економічно доцільним і безпечним за рахунок зниження імовірності побічного ефекту компонентів композиції. Зазначений кількісний вміст компонентів композиції є достатнім для виявлення терапевтично ефективного впливу при стані, що попереджають або лікують, а також для здійснення профілактичного впливу задля запобігання можливого захворювання у птахів і ссавців. Також зазначений кількісний вміст елементів є оптимальним з точки зору безпеки використання протимікробної композиції та дозволяє уникнути можливих побічних ефектів під час лікування за допомогою композиції, яку заявляють. Терапевтично ефективна кількість компонентів композиції буде варіюватися залежно від специфічного стану, що лікують, фізичного стану суб'єктів, що піддаються лікуванню, тяжкості стану, що піддається лікуванню/попередженню, тривалості лікування, природи одночасної терапії, сполуки або композиції, що специфічно застосовують, певного фармацевтично прийнятного допоміжного засобу, що використовується, та подібних факторів.

Введення в композицію органічної кислоти дозволяє забезпечити повне розчинення важкорозчинних компонентів композиції макролідів, фторхінолонів і триметоприму при розведенні порошку водою.

Згідно з корисною моделлю, макролідний антибіотик вибраний з групи, яка містить еритроміцин, спіраміцин, мідекаміцин, олеандоміцин, рокситроміцин, джозаміцин, тролеандоміцин, кларитроміцин, азитроміцин, міокаміцин, рокітаміцин, диритроміцин, флуритроміцин, телітроміцин, тилозин, тилмікозин, кітазаміцин, тулатроміцин, гамітроміцин.

Згідно з корисною моделлю, фторхінолон вибраний з групи, яка містить офлоксацин, ципрофлоксацин, пефлоксацин, еноксацин, темафлоксацин, норфлоксацин, ломефлоксацин, флероксацин, спарфлоксацин, руфлоксацин, грепафлоксацин, левофлоксацин, тровафлоксацин, моксифлоксацин, геміфлоксацин, гатифлоксацин, пруліфлоксацин, пазуфлоксацин, гареноксацин, енрофлоксацин, данофлоксацин, маброфлоксацин, дифлоксацин, орбіфлоксацин, ібафлоксацин, ситафлоксацин, клінафлоксацин.

Згідно з корисною моделлю, органічна кислота вибрана з групи, яка містить аскорбінову, винну, щавлеву, лимонну, малонову, глутарову, яблучну, бурштинову кислоти.

Переважним є використання як допоміжних речовин стабілізаторів та/або консервантів, та/або антиоксидантів. Включення допоміжних речовин дозволяє забезпечити отримання  
5 вибраної лікарської форми композиції, безпечно зберігання та подальше використання композиції у ветеринарній медицині.

Заявлена протимікробна композиція застосовується в ветеринарній медицині для лікування інфекцій, викликаних грампозитивними та грамнегативними мікроорганізмами, а також простішими.

10 Заявлену композицію готують в наступний спосіб.

Глюкозу та інші необхідні допоміжні речовини перемішують до однорідного стану. Додають діючі речовини тилмікозин, триметоприм, енрофлосаксин та винну кислоту і продовжують перемішування до отримання гомогенного порошку. Після одержання позитивних результатів контролю фармацевтичну композицію направляють на лінію дозування й упакування. Отримана  
15 композиція має наступний кількісний і якісний склад компонентів, ваг. %:

тилмікозин	10,0
триметоприм	5,0
енрофлосаксин	10,0
винна кислота	30,0
глюкоза та допоміжні речовини	решта.

Таким чином, заявлена корисна модель забезпечує протимікробну фармацевтичну композицію, яка є стабільною при зберіганні, у тому числі при несприятливих умовах зовнішнього середовища, та має відносно малу собівартість.

20

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

1. Протимікробна композиція для застосування у ветеринарній медицині, що містить триметоприм та/або щонайменше один фторхінолон або щонайменше одну фармацевтично прийнятну сіль фторхінолону, щонайменше один макролідний антибіотик або щонайменше одну  
25 фармацевтично прийнятну сіль макролідного антибіотика, щонайменше одну органічну кислоту та допоміжні речовини, яка **відрізняється** тим, що як одну з допоміжних речовин містить наповнювач для твердої лікарської форми.

2. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має лікарську форму водорозчинного порошку.

30 3. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

макролідний антибіотик або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-50
триметоприм	0,1-30
органічна кислота	0,1-90
допоміжні речовини	решта.

4. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

макролідний антибіотик або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-50
фторхінолон або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-40
органічна кислота	0,1-90
допоміжні речовини	решта.

35 5. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має наступне співвідношення компонентів, мас. %:

макролідний антибіотик або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-50
триметоприм	0,1-30
фторхінолон або його фармацевтично прийнятна сіль	0,1-40
органічна кислота	0,1-90
допоміжні речовини	решта.

6. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що макролідний антибіотик вибраний з групи, яка містить еритроміцин, спіраміцин, мідекаміцин, олеандоміцин, рокситроміцин, джозаміцин, тролеандоміцин, кларитроміцин, азитроміцин, міокаміцин, рокітаміцин, диритроміцин, флуритроміцин, телітроміцин, тилозин, тилмікозин, кітазаміцин, тулатроміцин, гамітроміцин.
7. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що фторхінолон вибраний з групи, яка містить офлоксацин, ципрофлоксацин, пефлоксацин, еноксацин, темафлоксацин, норфлоксацин, ломефлоксацин, флероксацин, спарфлоксацин, руфлоксацин, грепафлоксацин, левофлоксацин, тровафлоксацин, моксифлоксацин, геміфлоксацин, гатифлоксацин, пруліфлоксацин, пазуфлоксацин, гареноксацин, енрофлоксацин, данофлоксацин, маброфлоксацин, дифлоксацин, орбіфлоксацин, ібафлоксацин, ситафлоксацин, клінафлоксацин.
8. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що органічна кислота вибрана з групи, яка містить аскорбінову, винну, щавлеву, лимонну, малонову, глутарову, яблучну, бурштинову кислоти.
9. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що допоміжні речовини містять щонайменше одну речовину, вибрану з групи, що включає стабілізатори, консерванти, антиоксиданти.
10. Протимікробна композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що застосовується для лікування інфекцій, викликаних грампозитивними та грамнегативними мікроорганізмами, а також простішими.

---

Комп'ютерна верстка Л. Литвиненко

---

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