

Изобретение относится к медицине, в частности, к фармации и косметологии, и может быть использовано для получения гелевой основы лекарственных и косметических средств.

Известна основа для геля с высокой скоростью высвобождения активного вещества, содержащая 1 - 5%, бензилового спирта, 2,5 - 35% наполнителя, а в качестве гелеобразующего средства 1 - 30% цетилстеарилового спирта приблизительно с 30 молями этиленоксида или 1 - 5% полиакриловой, полиметакриловой и/или их солей (1).

Известна основа для геля, содержащая  $5 \pm 0,01$ г карбоксивинилового полимера,  $5 + 0,05$ г триэтиламина,  $5 + 0,1$ г глицерина,  $0,5 \pm 0,01$ г ментола,  $0,3 + 0,001$ г трихлороксифеноксibenзола и  $0,1 \pm 0,01$ г хлорофилла (2).

Известна гелеобразная основа для локального наружного применения, содержащая карбоксивиниловый полимер, многоатомные спирты, низшие спирты, нейтрализующее средство, оксипропилцеллюлозу, пропиленкарбонат и воду (3).

Наиболее близким к заявляемому является состав основы, содержащий 95% этиловый спирт 30,0г; пропиленгликоль 10,0г; 4% водный раствор редкоштитого синилакрилового полимера (карбопола 940) 25,0г; органическое основание в качестве нейтрализующего агента (триэтиламин) 1,5г; воды до 100,0г а также ментол (4).

К недостаткам прототипа и аналогов следует отнести то, что их качественный и количественный состав не позволяет достигнуть заданного и регулируемого уровня специфической активности лекарственных средств на этих основах с одновременным пролонгированием действия и обеспечением лечебно-косметологического эффекта самих основ. Кроме того, в процессе производства лекарственных средств на указанных основах необходимо введение стадий нагревания (например, до  $80 - 70^{\circ}\text{C}$ ) с целью обеспечения растворимости веществ или охлаждения (до  $5 - 10^{\circ}\text{C}$ ) с целью их стабилизации.

В основу изобретения положена задача создания основы для гелей путем такого подбора компонентов, которые обеспечили бы максимальный уровень специфической активности лекарственных средств на этих основах с одновременным обеспечением пролонгирования действия и лечебно-косметологического эффекта самих основ.

Поставленная задача решается тем, что основа для гелей, содержащая сополимер акриловой кислоты, гидрофильный растворитель, спирт этиловый, нейтрализующий агент и воду, в соответствии с изобретением дополнительно содержит формальдегид, в качестве гидрофильного растворителя содержит пропиленгликоль и/или глицерин, а в качестве нейтрализующего агента - 15 - 25% водный раствор аммиака при следующем соотношении компонентов, мас.%,:

сополимер акриловой кислоты	0,60 - 1,70
пропиленгликоль и/или глицерин	4,50 - 9,00
спирт этиловый	5,00 - 10,00
15 - 25% водный раствор аммиака	0,25 - 0,85
формальдегид	0,08 - 0,12
вода очищенная или питьевая	остальное

Поставленная задача решается также тем, что в качестве сополимера акриловой кислоты используют карбопол, или сакап, или акмид, или аксам.

Поставленная задача решается также тем, что основа для гелей может дополнительно содержать отдушку в количестве до 0,1% и/или краситель тропеолин, или кислотный красный, или индигокармин в количестве до 0,01%, а также экстракты лекарственных растений, выбранных из группы, включающей зверобой, полынь, ромашку, череду, мелиссу, девясил, чистотел, ликоподий, алоэ, шиповник, лаванду, мяту перечную, шалфей в количестве до 0,6%.

Технический результат, получаемый при осуществлении изобретения, выражается в усилении трансдермального проникновения действующих веществ на заявляемой основе, пролонгировании действия и проявлении лечебно-косметологического эффекта самой основы.

В фармацевтических и косметологических композициях, создаваемых на заявляемой основе, можно использовать достаточно широкий спектр физиологически активных веществ или их комбинаций, например, диклофенак натрия, клофелин, гепарин, L-лизина эсцинат, форидон, экстракты лекарственных растений и др. Кроме того, сам состав основы используется в качестве косметологического средства, например, для ухода за кожей рук, лица, укладки волос и т.д.

Приводим конкретные примеры осуществления изобретения.

Пример 1. Основа для гелей имеет следующее соотношение компонентов, мас.%,:

карбопол	1,00
пропиленгликоль	7,50
глицерин	8,00
спирт этиловый	8,00
15% водный раствор аммиака	0,60
формальдегид	0,10
вода очищенная	остальное

Основу для гелей получают путем растворения карбопола в воде очищенной при перемешивании с последующим добавлением раствора аммиака, после чего в полученную прозрачную массу последовательно добавляют пропиленгликоль, спирт этиловый и формальдегид и перемешивают до получения однородной массы.

На этой основе возможно изготовление лекарственных средств, с диклофенаком натрия, клофелином и их комбинациями с L-лизина зоцинатом, нитросорбидом, ментолом и др.

Пример 2. Основа для гелей имеет следующее соотношение компонентов, мас.%,:

акмид	0,80
-------	------

пропиленгликоль	9,00
глицерин	4,50
спирт этиловый	7,50
15% водный раствор аммиака	0,58
формальдегид	0,10
вода очищенная	остальное

Основу для гелей получают аналогично примеру 1.

На этой основе возможно изготовление лекарственных средств, указанных в примере 1, но с меньшей дозой физиологически активных веществ.

Пример 3. Основа для гелей имеет следующее соотношение компонентов, мас. %:

карбопол	1,50
пропиленгликоль	6,70
спирт этиловый	5,60
25% водный раствор аммиака	0,68
формальдегид	0,10
краситель тропеолин	0,10
вода питьевая	остальное

Основу для гелей получают путем растворения карбопола в воде питьевой при перемешивании с последующим добавлением раствора аммиака, после чего в полученную прозрачную массу последовательно добавляют пропиленгликоль, спирт этиловый, формальдегид и краситель тропеолин и перемешивают до получения однородной массы.

Данный состав - косметический гель "Тасвик", является средством для укладки волос и фиксации прически, которое оказывает благоприятное действие на волосы, делает их шелковистыми, мягкими, эластичными, придает им блеск, предотвращает возникновение педикулеза.

Пример 4. Основа для гелей имеет следующее соотношение компонентов, мас. %:

карбопол	0,80
глицерин	6,70
спирт этиловый	5,60
25% водный раствор аммиака	0,36
формальдегид	0,10
отдушка	0,10
краситель кислотный красный	0,10
вода питьевая	остальное

Основу для гелей получают путем растворения карбопола в воде питьевой при перемешивании с последующим добавлением раствора аммиака, после чего в полученную прозрачную массу последовательно добавляют пропиленгликоль, спирт этиловый, формальдегид, краситель кислотный красный и отдушку и перемешивают до получения однородной массы.

Данный состав - косметический гель "Натель", является средством по уходу за кожей рук и лица, обладает увлажняющим и смягчающим действием, способствует заживлению трещин, ссадин, оказывает эпителизирующее, бактерицидное действие.

Пример 5. Основа для гелей имеет следующее соотношение компонентов, мас. %:

сакап	0,80
пропиленгликоль	5,00
спирт этиловый	5,60
25 % водный раствор аммиака	0,36
формальдегид	0,12
отдушка (масло розовое)	0,10
экстракт зверобоя	0,60
вода очищенная	остальное

Основу для гелей получают путем растворения сакапа в воде очищенной при перемешивании с последующим добавлением раствора аммиака, после чего в полученную прозрачную массу последовательно добавляют пропиленгликоль, спирт этиловый, формальдегид, экстракт зверобоя и отдушку (масло розовое) и перемешивают до получения однородной массы.

Данный состав - косметический гель "Фитогель", является средством по уходу за кожей тела, обладает увлажняющим и смягчающим действием, повышает защитную функцию кожи, оказывает тонизирующее, питательное, противовоспалительное и регенерирующее воздействие.

Качественный и количественный состав заявляемой основы для гелей является необходимым и достаточным, чтобы обеспечить максимальный уровень специфического действия лекарственных веществ на этой основе за счет усиления трансдермального проникновения с одновременным пролонгированием действия этих веществ.

В таблице приводятся результаты исследований противовоспалительной активности диклофенака натрия на заявляемой основе в сравнении с аналогом - эмульгелем вольтарена.

Противовоспалительная активность диклофенака натрия на заявляемой основе в сравнении с эмульгелем вольтарена

Таблица

Исследуемые препараты (на	Симптомы УФ-облучения		Продолжительность действия (час)
	Эритема	Отэк	

заявляемой основе и препарат-аналог)	M ± m, балл	%	M ± m, балл	%	
Контроль	2,8 ± 0,2	100,0 ± 7,0	3,0 ± 0,4	100,0 ± 13,1	-
Диклофенак натрия на заявляемой основе	1,4 ± 0,2	45,0 ± 6,0	0,5 ± 0,3	14,0 ± 6,0	5 - 7
Эмульгель вольтарена	2,0 ± 0,2	72,0 ± 7,0	1,8 ± 0,4	60,0 ± 13,0	3 - 4

Данные, получаемые в процессе создания и производства лекарственных и косметологических средств на заявляемой основе, свидетельствуют о том, что использование количественного содержания компонентов меньше заявляемых значений приводит к нарушению структурно-механических и физико-химических свойств композиции: получается не гель, а мазеобразная, неоднородная масса. При количествах компонентов, взятых больше заявляемых значений, получается не гель, а раствор.

Введение больше заявляемых значений количеств сополимера акриловой кислоты, пропиленгликоля, аммиака, формальдегида, вызывает местнораздражающее, аллергизирующее действие, вплоть до общетоксического действия.

Таким образом, заявляемая основа для гелей, за счет рационального выбора комбинации компонентов, позволяет эффективно влиять на терапевтическую активность физиологически активных веществ, скорость и полноту их высвобождения, продолжительность действия и переносимость с одновременным обеспечением лечебно-косметологического воздействия самой основы.

Литература:

1. Заявка ФРГ N 3244027, кл. А 61 К 31/41, 1984.
2. Заявка Франции N 2555448, кл. А 61 К 9/10, 1985.
3. Заявка Японии N 62-18526, кл. А 61 К 9/00, 1987,
4. Патент США N 4543251, кл 434-81, 1983 (прототип).