



УКРАЇНА

(19) UA (11) 25539 (13) C2

(51) 7 A61K9/10, 7/40, A61P17/04

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД(54) ЕМУЛЬСІЯ ДЛЯ МІСЦЕВОГО ЗАСТОСУВАННЯ, ЩО МАЄ ПРОТИПАРАЗИТАРНУ ТА АНТИМІКРОБ-
НУ ДІЮ

(21) 97052349

(22) 22 05 1997

(24) 15 10 2001

(46) 15 10 2001, Бюл. № 9, 2001 р

(72) Ляпунов Микола Олександрович, Безугла
Олена Петрівна, Лисокобилка Олексій Андрійович,
Георгієвський Віктор Петрович, Піотровська Алла
Григорівна, Хованська Наталія Петрівна, Кугасе-
вич Яніна Францевна, Маштакова Ірина Олексів-
на, Нікітіна Наталія Сергіївна, Долейко Наталія
Вікторівна, Толстикова Оксана Олександрівна
(73) Державний науковий центр лікарських засобів(56) Машковский М.Д. Лекарственные средства
Ч. II – Вильнюс, 1994 – С. 347–348(57) 1 Эмульсия для местного применения, обла-
дающая противопаразитарным и антимикробным

действием, содержащая бензилбензоат, поверх-
ностно-активное вещество и воду очищенную, **от-
личающаяся** тем, что в качестве поверхностно-
активного вещества она содержит эмульгатор № 1
при следующем соотношении компонентов,
мас. %

Бензилбензоат	10,0–30,0
Эмульгатор № 1	1,0–3,0
Вода очищенная	Остальное

2 Эмульсия для местного применения, обладаю-
щая противопаразитарным и антимикробным дей-
ствием по п. 1, **отличающаяся** тем, что эмульга-
тор № 1 представляет собой смесь спиртов син-
тетических первичных высших жирных фракций
C₁₆–C₂₀ с натриевой солью сульфозифированных та-
ких же спиртов при соотношении 25/1

Изобретение относится к медицине и хими-
ко-фармацевтической промышленности, в част-
ности, к созданию и производству противопарази-
тарных и антимикробных средств в виде эмуль-
сий

Известно средство для лечения чесотки –
сера осажденная, входящая в состав ряда мазей и
присыпок и оказывающая противопаразитарное и
противомикробное действие (1)

Известно средство – деготь березовый, при-
меняемый наружно для лечения кожных заболева-
ний (экземы, чешуйчатого лишая, чесотки и др.) в
виде 10–30% мазей, линиментов. Деготь березо-
вый является продуктом сухой перегонки наруж-
ной части коры березы, содержит фенол, толуол,
ксилол, смолы и другие вещества. Оказывает де-
зинфицирующее, инсектицидное и местнораздра-
жающее действие (2)

Наиболее близким к заявляемому является
средство для лечения чесотки – 20% водно-мыль-
ная эмульсия бензилбензоата, содержащая в сво-
ем составе 2 г мыла (зеленого или хозяйственно-
го), которое разводят в 78 мл тепловой воды, по-
сле чего добавляют 20 мл бензилбензоата (3)

К недостаткам прототипа и аналогов сле-
дует отнести то, что средства, содержащие серу,
противопоказаны детям, больным с атопическим дерматитом,

тозами, а при повторном лечении ими возможны
осложнения в виде медикаментозного фоллику-
лярного дерматита, экзематизаций, пиодермал-
ных явлений. Средства, содержащие бензилбен-
зоат, не имеют противопоказаний для взрослых и
детей, однако имеющиеся прописи содержат от 30
до 50% этого дорогостоящего активного вещества.
Средство-прототип, содержащее 20% бензилбен-
зоата, достаточно эффективно при этой дозе, но
имеет следующие отрицательные факторы приго-
товления основы – мыльной воды, трудоемко, к
тому же мыльная вода даже без контакта с бен-
зилбензоатом разлагается за 2–3 суток, в свою
очередь разлагая сам бензилбензоат. Использо-
вание такой нестабильной формы препарата сни-
жает его эффективность, делает более частыми
как рецидивы заболевания, так и возможные ос-
ложнения

В основу изобретения поставлена задача
создания эмульсии для местного применения, об-
ладающей противопаразитарным и антимикроб-
ным действием, путем такого подбора компонен-
тов, который бы обеспечил комплексное воздей-
ствие на пораженные участки тела больного, в ре-
зультате чего достигается высокая специфическая
активность, снижение и исключение побочных

эффектов, стабильность препарата в процессе его хранения и применения

Поставленная задача решается тем, что эмульсия для местного применения, обладающая противопаразитарным и антимикробным действием, содержащая бензилбензоат, поверхностно-активное вещество и воду очищенную, в соответствии с изобретением в качестве поверхностно-активного вещества содержит эмульгатор № 1 при следующем соотношении компонентов, мас %

Бензилбензоат	10,0–30,0
Эмульгатор № 1	1,0–3,0
Вода очищенная	Остальное

причем эмульгатор № 1 представляет собой сплавленную смесь спиртов синтетических первичных высших жирных фракций C_{18} – C_{20} с натриевой солью сульфозэфиров таких же спиртов при соотношении 25/1

Технический результат, получаемый при осуществлении изобретения, заключается в повышении специфической активности, снижении и исключении побочных эффектов, обеспечения стабильности препарата в процессе хранения и применения

Приводим конкретные примеры осуществления изобретения

Пример 1 Заявляемое средство – эмульсия бензилбензоата, получают путем смешивания эмульгатора № 1 и воды очищенной с последующим нагреванием полученной водной фазы при перемешивании до расплавления эмульгатора № 1. В полученный расплав вводят бензилбензоат, после чего проводят эмульгирование в течение 20–30 минут. Полученную эмульсию охлаждают до 25°C и фасуют во флаконы

Заявляемое средство имеет следующее соотношение компонентов, мас %

Бензилбензоат	20,0
Эмульгатор № 1	2,0
Вода очищенная	Остальное

Пример 2 Заявляемое средство – эмульсию бензилбензоата получают аналогично примеру 1 при следующем соотношении компонентов, мас %

Бензилбензоат	10,0
Эмульгатор № 1	1,0
Вода очищенная	Остальное

Пример 3 Заявляемое средство – эмульсию бензилбензоата получают аналогично примеру 1 при следующем соотношении компонентов, мас %

Бензилбензоат	30,0
Эмульгатор № 1	3,0
Вода очищенная	Остальное

Пример 4 На печени находилось 10 детей в возрасте от 8 до 14 лет и 5 взрослых в возрасте от 24 до 32 лет. У всех больных были ярко выраженные проявления коросты, которая у детей не была осложнена, а у взрослых имело место осложнение коросты пиккокковой инфекцией с длительностью заболевания более двух недель. Эмульсию бензилбензоата 20% при помощи смоченного ею ватно-марлевого тампона втирали в кожу рук, затем туловища и ног. Обработку кожи производили один раз в сутки в течение трех дней, после чего принимали душ и меняли пос-

тельное и нательное белье. По результатам наблюдений за различными группами больных сделан вывод об эффективности эмульсии бензилбензоата при лечении коросты рецидивов заболевания не выявлено ни у одного больного в течение 3-х месяцев, осложнений во время лечения не было

Пример 5 На печени находилось 11 больных чесоткой, 9 больных демодекозом, 3 больных жирной себореей, 4 больных отрубевидным лишаем. При применении эмульсии бензилбензоата 20% побочных явлений в виде аллергических реакций, дерматитов не зарегистрировано, больные хорошо переносили препарат. Извлечение чесотки и отрубевидного лишая наступило у всех больных. При лечении демодекоза клиническая ремиссия отмечена у 4 больных, а значительное улучшение – у 5. У всех больных жирной себореей наступило значительное улучшение

Качественный и количественный состав заявляемого средства полностью решает поставленную в изобретении задачу по созданию эффективного противопаразитарного и антимикробного средства

Активное вещество заявляемого средства – бензилбензоат, выбран как одно из наиболее активных веществ, обладающих вышеуказанным действием. Бензилбензоат включен в "Перечень жизненно важных препаратов", рекомендованных ВОЗ для стран Восточной Европы и развивающихся стран, а также в "Перелік лікарських препаратів, що необхідні населенню України в 1995 році". Количественное содержание бензилбензоата в заявляемом составе (10,0–30,0%) является необходимым и достаточным для проявления его специфической активности на заданном уровне. При меньших количествах бензилбензоата не достигается необходимый лечебный эффект, при больших количествах появляется побочный отрицательный эффект – местнораздражающее действие

Эмульгатор № 1 в заявляемом составе выполняет функции эмульгатора и структурообразователя лекарственной формы – эмульсии. При меньших количествах эмульгатора № 1 эмульсия становится нестабильной, расслаивается, введение больших количеств эмульгатора № 1 нецелесообразно и приводит к излишнему загущению эмульсии, что также является нарушением структуры лекарственной формы

В отличие от прототипа и некоторых аналогов, которые готовятся в экстенпоральных условиях и часто оказывают выраженное местнораздражающее действие на кожу, заявляемый состав обеспечивает не только физическую стабильность эмульсии при хранении, но и создает слабощелочную среду, в которой бензилбензоат не гидролизуются, что, наряду с отсутствием калийного мыла (прототип), позволяет избежать местнораздражающего и аллергизирующего действия

Таким образом, заявляемое лекарственное средство – эмульсия бензилбензоата, является эффективным средством для лечения заболеваний кожи: чесотки, разноцветного лишая, демодекоза, жирной себореи, коросты, педикулеза

В заявляемой форме средство является стабильным в течение всего срока хранения и применения, не вызывает аллергизирующего и

раздражающего действия на кожные покровы даже у детей и больных с аллергическими проявлениями

Литература

1 Шинский Г Э и др Сравнительная характеристика некоторых современных методов лече-

ния чесотки // Вест дерматол и венерол – 1973 – № 8 – С 70–73

2 Машковский М Д Лекарственные средства – Вильнюс, 1994 – Ч II – С 366

3 Машковский М Д Лекарственные средства – Вильнюс, 1994 – Ч I, – С 347–348 (прототип)

Тираж 50 экз

Відкрите акціонерне товариство «Патент»

Україна, 88000, м. Ужгород, вул. Гагаріна, 101

(03122) 3 – 72 – 89 (03122) 2 – 57 – 03
