



УКРАЇНА

(19) UA (11) 25538 (13) C2

(51) 7 A61K9/10, A61K7/40,
A61P17/04МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ПРОТИПАРАЗИТАРНИЙ ТА АНТИМІКРОБНИЙ ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ ДЛЯ МІСЦЕВОГО ЗАСТОСУВАННЯ

(21) 97052350

(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, Кутасевич Яніна Францевна, Маштакова Ірина Олександрівна, Нікітіна Наталія Серпівна, Долейко Наталія Вікторівна, Толстикова Оксана Олександрівна
(73) ДЕРЖАВНИЙ НАУКОВИЙ ЦЕНТР ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

(56) Машковский М.Д. Лекарственные средства Ч. II – Вильнюс, 1974 С. 347–348

(57) 1 Противопаразитарное и антимикробное лекарственное средство для местного применения,

содержащее бензилбензоат, поверхностно-активное вещество и воду очищенную, отличающееся тем, что оно дополнительно содержит глицерин, а в качестве поверхностно-активного вещества эмульгатор N 1 при следующем соотношении компонентов, мас. %

Бензилбензоат	10,0 - 40,0
Эмульгатор N	11,0-4,0
Глицерин	1,0 - 9,0
Вода очищенная	Остальное

2 Противопаразитарное и антимикробное лекарственное средство для местного применения по п. 1, отличающееся тем, что эмульгатор N 1 представляет собой сплавленную смесь спиртов синтетических первичных высших жирных фракций C₁₆-C₂₀ с натриевой солью сульфозифированных спиртов при соотношении 25/1

Изобретение относится к медицине и химико-фармацевтической промышленности, в частности, к созданию и производству противопаразитарных и антимикробных средств в виде эмульсий

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

Известно средство для лечения чесотки – 60% водный раствор натрия тиосульфата, применяемый наружно по методу М.П. Демьяновича, основанному на способности натрия тиосульфата распадаться в кислой среде, выделяя серу и сернистый ангидрид, оказывающие противопаразитарное действие (2)

Наиболее близким к заявляемому является средство для лечения чесотки – 20% водно-мыльная эмульсия бензилбензоата, содержащая в своем составе 2 г мыла (зеленого или хозяйственного), которое разводят в 78 мл теплой воды, после чего добавляют 20 мл бензилбензоата (3)

К недостаткам прототипа и аналогов следует отнести то, что средства, содержащие серу, противопоказаны детям, больным с атопическими дерматозами и другими осложнениями, например, вто-

ричной инфекцией чесотки, экзематизацией, пиодермальными явлениями. Известные средства с бензилбензоатом содержат в своем составе от 30 до 50% этого дорогостоящего активного вещества. В средстве-прототипе необходимый терапевтический эффект достигается при 20% содержании бензилбензоата, однако сама лекарственная форма нестабильна: за 2–3 суток разлагается водно-мыльная фаза, разлагая при этом бензилбензоат. Это снижает эффективность средства, делает более частыми рецидивы заболевания и возможные осложнения.

В основу изобретения поставлена задача создания противопаразитарного и антимикробного лекарственного средства для местного применения путем такого подбора компонентов, который бы обеспечил комплексное воздействие на пораженные участки тела больного, в результате чего достигается высокая специфическая активность, снижение и исключение побочных явлений, расширение спектра действия, стабильность при хранении и применении лекарственного средства.

Поставленная задача решается тем, что противопаразитарное и антимикробное средство для местного применения, содержащее бензилбензоат, поверхностно-активное вещество и воду

очищенную, в соответствии с изобретением дополнительно содержит глицерин, а в качестве поверхностно-активного вещества – эмульгатор № 1 при следующем соотношении компонентов, мас %

Бензилбензоат	10,0–40,0
Эмульгатор № 1	1,0–4,0
Глицерин	1,0–9,0
Вода очищенная	Остальное

причем эмульгатор № 1 представляет собой смесь сплавленную смесь спиртов синтетических первичных высших жирных фракций C_{16} – C_{20} с натриевой солью сульфосэфиров таких же спиртов при соотношении 25/1

Технический результат, достигаемый в результате осуществления изобретения, заключается в повышении специфической активности, расширении спектра действия, снижении и исключении побочных явлений, возникновении рецидивов заболеваний

Приводим конкретные примеры осуществления изобретения

Пример 1. Заявляемое средство – эмульсия бензилбензоата, получают путем смешивания в воде очищенной эмульгатора № 1, глицерина и бензилбензоата. Полученную водную фазу нагревают до расплавления эмульгатора № 1. В полученный расплав вводят бензилбензоат, после чего проводят эмульгирование в замкнутом цикле в течение 20–30 минут. Затем при перемешивании в течение 60–90 минут осуществляют охлаждение полученной эмульсии до 25°C. Готовую эмульсию фасуют во флаконы

Заявляемое средство имеет следующее соотношение компонентов, мас %

Бензилбензоат	25,0
Эмульгатор № 1	2,5
Глицерин	5,0
Вода очищенная	Остальное

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

Бензилбензоат	40,0
Эмульгатор № 1	4,0
Глицерин	9,0
Вода очищенная	Остальное

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

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

Пример 4. На лечение находилось 30 больных чесоткой и 11 больных демодекозом, которым была назначена 25% эмульсия бензилбензоата

При лечении демодекоза эмульсию наносили тонким слоем на кожу лица 3–5 раз в сутки, оберегая глаза от попадания препарата. Продолжительность лечения определялась динамикой очищения кожи, снятием воспалительного процесса, прекращением зуда

При лечении чесотки эмульсией смачивали марлевый или ватный тампон и втирали в кожу. Сначала обрабатывали левую и правую руки, за-

тем ноги и туловище. После обработки руки не надо мыть в течение 3 часов. Применяли препарат один раз в сутки

У больных демодекозом клиническая ремиссия была достигнута в 91% случаев, у больных чесоткой – в 100% случаев, причем в 15 случаях достаточно было 1–2 кратной обработки больных для достижения полного акарицидного эффекта. У больных, которые ранее имели аллергические реакции на 20% водно-мыльную эмульсию бензилбензоата, при лечении заявляемым средством этих реакций не наблюдалось

Качественный и количественный состав заявляемого средства полностью решает поставленную в изобретении задачу по созданию высокоэффективного 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 ВОЗ за 1995 г", а также "Перелік лікарських препаратів, що необхідні населенню України в 1995 році". Количественное содержание бензилбензоата в заявляемом составе (10,0–40,0%) 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 нежелательное 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

Глицерин, являясь гидрофильным растворителем, одновременно оказывает увлажняющее и смягчающее кожу действие, тем самым устраняя пересушивающее и местнораздражающее действие бензилбензоата. При меньших количествах глицерина не осуществляется его целевое назначение, большие количества – нецелесообразны и приводят к дестабилизации структуры эмульсии

Состав заявляемого средства обеспечивает не только физическую стабильность эмульсии при хранении, но и 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 высокоэффективным средством для лечения чесотки, разноцветного лишая, коросты, жирной себореи, педикулеза, красных угрей, демодекоза. В заявляемой форме средство является стабильным в течение всего срока хранения и применения, удобно в употреблении, не вызывает аллергизирующего и местнораздражающего действия на кожные покровы и общее состояние больных при длительном применении

Литература

1 Шинский Г Э и др Сравнительная характеристика некоторых современных методов лечения чесотки // Вест дерматол и венерол – 1973 – № 8 – С 70–73

2 Машковский М Д Лекарственные средства М , Медицина, 1977 Ч II, С 120

3 Машковский М Д Лекарственные средства Вильнюс, 1974 Ч II, 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
