



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **88471** (13) **U**
(51) МПК (2014.01)
A61K 8/18 (2006.01)
A61K 38/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: u 2014 00302	(72) Винахідник(и): Лисицький Андрій Георгійович (UA), Михайличенко Оксана Анатоліївна (UA), Шевченко В'ячеслав Олександрович (UA)
(22) Дата подання заявки: 14.01.2014	
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: 11.03.2014	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 11.03.2014, Бюл.№ 5	(73) Власник(и): Лисицький Андрій Георгійович, бул. Шевченка, 52, кв. 6, м. Донецьк, 83017 (UA), Михайличенко Оксана Анатоліївна, вул. Рози Люксембург, 48-а, кв. 45, м. Донецьк, 83050 (UA)
	(74) Представник: Кобзарук Костянтин Степанович, реєстр. №282

(54) ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ У ФОРМІ ОРАЛЬНОГО РОЗЧИНУ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ХВОРОБ ОРГАНІВ ТРАВЛЕННЯ

(57) Реферат:

Лікарський засіб у формі орального розчину для лікування хвороб органів травлення містить активну речовину L-орнітину-L-аспартат, маніт, сахарин натрію, кислоту лимонну моногідрат, ароматизатор та воду.

UA 88471 U

Корисна модель належить до галузі медицини, зокрема до фармацевтики, а саме до лікарських засобів у формі розчину та може бути застосована для лікування хвороб органів травлення, зокрема може використовуватися як гепатопротекторний лікарський засіб.

Серед захворювань органів травлення одне з перших місць займають хвороби органів гепатобіліарної системи. За даними світової статистики, щорічно спостерігається зростання числа хворих, що страждають різною патологією печінки і жовчовивідних шляхів, в середньому на 15-30 %. Погіршення екологічного середовища, підвищений вміст небажаних домішок в їжі, зростання рівня споживання медикаментів, алкогольна інтоксикація призвели в останнє десятиріччя до збільшення частоти випадків токсичних уражень печінки.

Печінкова енцефалопатія (гепатоцеребральний синдром) - комплекс неврологічних і психічних розладів на тлі важких гострих або хронічних захворювань печінки, що розвиваються через токсичний вплив на центральну нервову систему токсичних продуктів метаболізму азотистих сполук, насамперед одного з найважливіших нейротоксичних метаболітів - вільного аміаку, які у здорових людей інактивуються печінкою.

Враховуючи домінуючу роль гіперамоніємії в патогенезі печінкової енцефалопатії, визнано, що для її ефективної терапії необхідне застосування лікарських засобів, що підсилюють знешкодження вільного аміаку в організмі.

Важливе місце серед препаратів гіпоамоніємічної дії займають препарати, діючою речовиною яких є сіль двох амінокислот (L-орнітину та L-аспартату), а саме L-орнітину-L-аспартат (Кондратенко П.Г., Смирнов Н.Л. L-орнітин-L-аспартат в лечении пациентов с неотложной хирургической абдоминальной патологией // Хирургия. - 2010. - № 3. - С. 112-115).

L-орнітину-L-аспартат спричиняє гіпоазотемічну і дезінтоксикаційну дію, основу, в першу чергу, на прямій фізіологічній стимуляції процесів детоксикації. Поряд з цим, L-орнітин-L-аспартат має гепатозахисні, антиоксидантні та мембраностабілізуючі властивості, тобто, є ефективним гепатопротектором. Специфічні гіпоамоніємічні та аміакнейтралізуючі властивості L-орнітину-L-аспартату обумовлені прямим та опосередкованим впливом L-орнітину-L-аспартату на основні процеси знешкодження аміаку в організмі. L-орнітин активує орнітинкарбамоїлтрансферазу та карбамоїлфосфатсинтетазу - найважливіші ферменти циклу синтезу сечовини (цикл Кребса - Генселейта), через вплив якого в перипортальних гепатоцитах нейтралізується токсичний аміак. Одночасно орнітин та аспартат підвищують потужність циклу сечовини за рахунок субстратної індукції, вступаючи в його реакції як субстрати. Аспартат, поряд з цим, стимулює глутамінсинтетазну реакцію, яка здійснюється в перивенозних гепатоцитах печінки і скелетних м'язах, пов'язуючи аміак в нетоксичний для організму еквівалент - глутамін. Аміакнейтралізуюча дія L-орнітину-L-аспартату здійснюється не тільки на рівні перипортальних і перивенозних гепатоцитів печінки, препарат активно включається у функціонування анаплеротичного шляху - «глутамат/глутамін», знижуючи рівень аміаку в мозку.

Завдяки зазначеним фармакологічними властивостям L-орнітину-L-аспартат зменшує прояви печінкової енцефалопатії, запобігає набряку головного мозку, сприяє відновленню функціонального стану печінки, збільшує синтез протеїнів, зменшує цитолітичний та холестатичний синдроми, пригнічує катаболізм білків у м'язах, нормалізує амінокислотний баланс організму, відновлюючи його вміст у крові, нормалізує портопечінкову гемодинаміку.

Як правило, лікарські форми L-орнітину-L-аспартату обмежуються гранулятами та порошками для перорального застосування, розчинами для ін'єкцій або концентратами для інфузійних розчинів.

Дані лікарської форми не завжди є прийнятними пацієнтам похилого віку, дітям або хворим з проблемами ковтання. Крім того, введення або прийом таких препаратів потребує наявності додаткових засобів, додаткового розведення або додаткового застосування допоміжної рідини.

В основу корисної моделі поставлено задачу створення лікарського засобу у формі орального розчину, який як діючу речовину містить L-орнітину-L-аспартат і забезпечує зручність перорального застосування препарату пацієнтам різного віку без допоміжних засобів та речовин.

Поставлену задачу вирішують тим, що створено лікарський у формі орального розчину для лікування хвороб органів травлення, який складається з L-орнітину-L-аспартату, як діючої речовини, води для ін'єкцій, як розчинника, маніту, сахарину натрію, моногідрату лимонної кислоти, як коректорів смаку, та ароматизатору, при цьому 1 мл розчину містить наступну кількість інгредієнтів:

L-орнітину-L-аспартат	270,0-330,0 мг
маніт	31,5-38,5 мг

сахарин натрію	0,09-1,1 мг
кислота лимонна моногідрат	0,9мг-1,1мг
ароматизатор	0,09-0,11 мг
вода для ін'єкцій	до 1 мл.

Для маскування неприємного смаку активної речовини та надання лікарському засобу більш прийняттого (приємного) смаку застосовують коректори смаку. Як додатковий компонент, що додає приємний смак лікарському засобу, використано ароматизатор, наприклад ароматизатор апельсиновий тощо.

- 5 В результаті, отриманий лікарський засіб має прийнятну форму та приємний смак. Вміщення лікарського засобу до зручної ємності (одноразового контейнера) забезпечує його зручне використання для лікування "проблемних" пацієнтів (діти, люди похилого віку та пацієнти, що мають проблеми щодо ковтання). Одноразовий контейнер з лікарським засобом є дуже зручною ємністю при використанні для пацієнтів і дозволяє приймати лікарський засіб без допоміжних засобів, які необхідні при використанні інших форм лікарського засобу: розводити рідиною (у формі гранулятів, порошків), використання шприців (для ін'єкцій або інфузій). Крім того, використання одноразового контейнера попереджує можливість мікробіологічної контамінації лікарського засобу в процесі його застосування.

- 10 Кількість лікарського засобу необхідного для лікування хвороб органів травлення залежить від багатьох факторів, зокрема стану пацієнта, віку пацієнта, ваги пацієнта тощо. Добова доза лікарського засобу та необхідний курс лікування пацієнтів визначається лікарем.

Лікарський засіб у формі орального розчину отримують наступним чином:

- 20 • до реактора заливають необхідну кількість гарячої води для ін'єкцій;
 • до розчину додають L-орнітину-L-аспартат та знову перемішують розчин;
 • додають маніт, перемішують розчин;
 • розчин охолоджують до кімнатної температури;
 • до розчину додають кислоту лимонну, сахарин натрію та ретельно перемішують розчин;
 • до розчину додають розраховану кількість ароматизатора та перемішують розчин;
 25 • перемішування розчину проводять при додаванні кожного компонента протягом 5-20 хвилин;
 • отриманий розчин фільтрують через мембранні фільтри з розміром пор 0,45 мкм;
 • отриманий розчин розливають в одноразові контейнери на спеціальній установці.

- 30 Переважно для лікарського засобу, що заявляється, використовують контейнери ємністю 10 мл. Контейнери можуть бути виконані у вигляді ампул або флаконів з поліетилену, які відповідають ТУ У 25.2.20390397-001:2007 (наприклад, ампули з поліетилену марки Purrel PE 3020 D виробництва фірми Basell Polyolefine GmbH, Німеччина або фірми Borealis Polymers OY, Фінляндія). Але, зрозуміло, що як матеріал для виготовлення контейнерів може бути використаний й будь-який інший придатний матеріал.

- 35 За технологічними та фізико-хімічними властивостями заявлений лікарський засіб відповідає всім вимогам Державної фармакопеї України.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

- 40 1. Лікарський засіб у формі орального розчину для лікування хвороб органів травлення, що містить активну речовину L-орнітину-L-аспартат, допоміжні речовини та воду для ін'єкцій, при цьому 1 мл розчину вміщує наступну кількість інгредієнтів:

L-орнітину-L-аспартат	270,0-330,0 мг
маніт	31,5-38,5 мг
сахарин натрію	0,09-1,1 мг
кислота лимонна моногідрат	0,9-1,1 мг
ароматизатор	0,09-0,11 мг
вода для ін'єкцій	до 1 мл.

2. Лікарський засіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що як ароматизатор використовується ароматизатор апельсиновий.

- 45 3. Лікарський засіб за п. 1 або 2, який **відрізняється** тим, що вміщується в одноразовий контейнер, виконаний переважно з поліетилену.

4. Лікарський засіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що ємність контейнера складає 10 мл.

5. Лікарський засіб за п. 3 або 4, який **відрізняється** тим, що контейнер може мати форму ампули або флакона.

Комп'ютерна верстка І. Мироненко

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