

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(12)

РЕСПУБЛИКА БЕЛАРУСЬ



НАЦИОНАЛЬНЫЙ ЦЕНТР
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ
СОБСТВЕННОСТИ

(19) ВУ (11) 24138

(13) С1

(46) 2023.12.30

(51) МПК

A 61K 36/15 (2006.01)

A 61K 36/534 (2006.01)

A 61K 36/61 (2006.01)

A 61K 47/06 (2006.01)

A 61P 11/02 (2006.01)

(54)

НАЗАЛЬНЫЙ АГЕНТ

(21) Номер заявки: а 20210343

(22) 2021.12.13

(43) 2023.08.30

(71) Заявитель: Учреждение образования "Белорусский государственный технологический университет" (ВУ)

(72) Авторы: Ламоткин Сергей Александрович; Горжанов Вадим Валерьевич (ВУ)

(73) Патентообладатель: Учреждение образования "Белорусский государственный технологический университет" (ВУ)

(56) Регистр лекарственных средств России РЛС Доктор: Оториноларингология и пульмонология. Под ред. Вышковского Г.Л. Москва: ВЕДАНТА, 2014, 18-й вып., с. 391.

KR 2003-0021698 А.

RU 2220738 С1, 2004.

RU 2288757 С2, 2006.

CN 103054944 В, 2015.

(57)

Назальный агент, содержащий масло растительное или вазелиновое в качестве основы, эфирное масло ели европейской или ели канадской в количестве 20-80 мг/г и масло эвкалипта или мяты перечной в количестве 20-40 мг/г в качестве формирувателя аромата.

Изобретение относится к области медицины и касается средств для лечения заболеваний полости носа.

Для лечения заболеваний полости носа чаще всего используются спреи, капли, мази и гели. Значительная часть из них содержит вещества, оказывающие влияние на тонус носовых сосудов и облегчающие за счет этого дыхание, например капли по [1]. Недостатком данного состава является быстрое привыкание, что ограничивает их применение.

Меньший эффект привыкания демонстрируют назальные агенты на основе ароматических масел, например пахнущий препарат для лечения ринита по [2]. Недостатками данной композиции являются многокомпонентность и, следовательно, трудоемкость изготовления; возможность возникновения аллергических реакций на один или несколько компонентов состава, а также способ применения, в основу которого положено непрерывное вдыхание в носовую полость во время дыхания, что обуславливает их невысокую эффективность.

Наиболее близким к настоящему изобретению является препарат "Пинасол", главным действующим веществом которого является сосновое эфирное масло, содержащееся в количестве 37,52 мг/г. Другие компоненты формируют преимущественно ароматическую

составляющую и регулируют консистенцию [3]. Однако и этот препарат обладает низкой бактерицидной эффективностью.

Задача настоящего изобретения состоит в повышении бактерицидной активности назальных препаратов, содержащих эфирные масла хвойных растений.

Поставленная задача решается тем, что назальный агент содержит масло растительное или вазелиновое в качестве основы, эфирное масло ели европейской или ели канадской в количестве 20-80 мг/г и масло эвкалипта или мяты перечной в количестве 20-40 мг/г в качестве формирователя аромата.

В заявляемой композиции, как и в композиции прототипа, используется в качестве бактерицидного препарата эфирное масло хвойных растений, однако в предлагаемой композиции используется эфирное масло ели европейской (*Picea abies* (L) Karst) или ели канадской (*Picea glauca*), которое обладает повышенной бактерицидной активностью.

Ограничение использования других пород елей обусловлено более низким содержанием эфирных масел по сравнению с елью канадской и елью европейской.

Нижний предел содержания эфирного масла в агенте (20 мг/г) соответствует минимальной подавляющей концентрации, верхний предел (80 мг/г) соответствует предельно допустимой концентрации, при превышении которой могут наблюдаться нежелательные реакции, например жжение.

В заявляемой композиции, как и в композиции прототипа, в качестве формирователей аромата могут быть использованы эфирные масла мяты и эвкалипта.

Содержание в агенте формирователя аромата соответствует принятым в фармакологии значениям и позволяет создать более приятный, чем у чистого масла ели, аромат. Бактерицидная активность этих добавок существенно ниже, чем у масла ели, и может не приниматься во внимание.

В качестве основы может быть использовано масло растительное подсолнечное, масло льняное, масло оливковое, рапсовое, а также масло вазелиновое.

Использование эфирного масла ели обыкновенной или ели канадской обеспечивает более эффективное терапевтическое лечение, а также симптоматическое лечение, профилактику или диагностику состояния.

Настоящее изобретение иллюстрируется примерами 1-5, но не ограничивается ими. При этом примеры 1, 2, 3 характеризуют бактерицидное действие эфирных масел. Пример 1 описывает композицию назального агента с применением эфирного масла ели обыкновенной. Пример 2 описывает назальный агент с применением эфирного масла сосны обыкновенной. Пример 3 описывает назальный агент по прототипу. Для сравнения свойств патентов по заявляемой композиции и прототипу были использованы одинаковые значения содержания эфирного масла, равные его средней величине в прототипе - 37,52 мг/г.

Пример 1.

Композиция назального агента содержит эфирное масло ели обыкновенной в количестве 375,2 мг. Для формирования аромата агент содержит эфирное масло мяты в количестве 150 мг, а также эфирное масло эвкалипта в количестве 150 мг. В качестве основы используется растительное подсолнечное масло до 10 г.

Пример 2.

Композиция назального агента аналогична примеру 1 с той лишь разницей, что в качестве бактерицидного средства содержит эфирное масло сосны обыкновенной (*Pinus sylvestris* L.).

Пример 3 (по прототипу).

Композиция назального агента содержит на 10 г: масло эвкалиптовое - 0,05 г, альфа-токоферола ацетат - 0,17 г, тимол - 0,0032 г, масло мяты перечной - 0,1 г, гвайазулен - 0,002 г, масло сосны обыкновенной - 0,3752 г, масло растительное - остальное.

BY 24138 C1 2023.12.30

В качестве критерия эффективности использовали диаметр ингибирования, значения которого (в мм) определяли для нескольких бактериальных культур. Измерения и обработку результатов вели в соответствии с клиническими рекомендациями «Определение чувствительности микроорганизмов к антимикробным препаратам» (версия 2018 г.) Межрегиональной ассоциации по клинической микробиологии и антимикробной химиотерапии. Для каждой из композиций были взяты 4 образца, содержащих эфирные масла, полученные из деревьев, произрастающих на территории Республики Беларусь.

Сравнение бактерицидных свойств по примерам 1-3 представлено в таблице.

Диаметр зоны ингибирования роста (мм) тест-культур бактерий

Композиция назального агента, изготовленная по примеру	№ образца	Тест-культуры бактерий					
		Staphylococcus aureus	Salmonella enterica	Bacillus subtilis	Clostridium sp.	Escherichia coli	Pseudomonas aeruginosa
1	1	24	25	27	29	27	29
	2	25	26	28	29	28	27
	3	21	22	24	27	24	26
	4	21	23	25	27	25	26
2	1	19	20	16	20	22	19
	2	20	21	18	21	20	18
	3	17	20	17	20	19	19
	4	19	18	17	20	19	17
3	1	22	23	21	20	23	22
	2	22	23	22	25	24	23
	3	19	19	17	24	19	18
	4	20	20	18	20	22	19

Результаты испытаний показывают, что масло ели обладает более высокой бактерицидной активностью, чем масло сосны, как при его использовании в заявляемой композиции, так и в композиции по прототипу. Более высокие значения бактерицидной активности при использовании эфирного масла сосны обыкновенной в композиции по прототипу по сравнению с использованием эфирного масла сосны в заявляемой композиции обусловлено, видимо, дополнительными реагентами, входящими в ее состав.

При выполнении исследования по определению минимальной подавляющей концентрации брали стандартизованные тест-культуры для посева на простой агар в чашке Петри в виде газона. Использовали коммерческие готовые питательные среды в чашках Петри. Затем чашки Петри инкубировали в термостате при температуре 37 °С в течение 24 ч. После инкубации определяли минимальную подавляющую концентрацию по отсутствию роста на чашках, содержащих наименьшие концентрации препарата. Значение минимальной подавляющей концентрации для эфирного масла ели обыкновенной и эфирного масла ели канадской составило 20 мг/г.

В Примерах 4, 5 композиция содержит такие количества формирователя аромата, которые выходят за пределы содержания согласно заявляемому способу.

Пример 4.

Композиция назального агента аналогична примеру 1 с той лишь разницей, что в качестве формирователя аромата содержит эфирное масло эвкалипта в количестве 10 мг/г.

Пример 5.

Композиция назального агента аналогична примеру 1 с той лишь разницей, что в качестве формирователя аромата содержит эфирное масло мяты в количестве 50 мг/г.

ВУ 24138 С1 2023.12.30

Композиция по примеру 1 имела приятный, освежающий аромат, оказывающий дополнительное стимулирующее действие при использовании. В композиции по примеру 4 содержание формирователя аромата было недостаточным, что проявлялось в конкурировании ароматов эфирных масел эвкалипта и ели обыкновенной, а также присутствии аромата основы. В композиции по примеру 5 аромат формирователя аромата был преобладающим, резким, вызывающим раздражение.

Из приведенного описания можно заключить, что использование формирователей аромата в количестве меньше (пример 4) и больше (пример 5) значений, находящихся в пределах согласно заявляемой композиции, приводит к ухудшению эксплуатационных (органолептических) характеристик назального агента.

Дополнительно на 10 добровольцах испытывалось лечебное действие предлагаемого назального агента в осенний период 2019 г. (период распространения респираторных заболеваний). Испытуемые не принимали других препаратов, болезнь протекала без повышения температуры, требующей медикаментозного лечения. Половина добровольцев (5 человек) использовали "Пинасол" (композиция по прототипу), 5 человек - новый назальный агент. При лечении традиционным препаратом "Пинасол" облегчение наступало на 4-5 день трехкратного применения, при лечении новым назальным агентом - на 2-4 день аналогичного применения.

Применение данного назального агента позволит сократить период лечения острых респираторных заболеваний при полном отсутствии привыкания к препарату.

Внедрение данной разработки возможно на РУП "Белмедпрепараты" и ОАО "Ламира-Фармакар".

Источники информации:

1. RU 2212235, 2003.
2. CN 108126129A.
3. Регистр лекарственных средств России. РЛС Доктор: Оториноларингология и пульмонология. Под ред. Г.Л. Вышковского. Москва: Веданта, 2014, 18-й вып., с. 391-392.