

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО**(12) Описание изобретения**
К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

1

(21) 2301887

(22) 05.07.2023

(46) Бюл. 204, 2024

(71)(72) Раджабзода Фаридуни Кишвар (TJ);

Рахимова Малика Халимовна (TJ)

(73) Раджабзода Фаридуни Кишвар (TJ); Рахимова
Малика Халимовна (TJ); Каримов Фирдавс
Убайдуллоевич (TJ); Лукманова Шоира Шухратовна
(TJ); Бобоёрзода Кудратуллои Рахматулло (TJ);
Сулохова Заррина Сулохиддиновна (TJ)**(54) СРЕДСТВО ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ЗАБОЛЕВА-**
НИЙ ПОЛОСТИ РТА(56) 1. Патент РФ №2295967, A61K 36/739,
14.11.20051. <https://planetazdorovo.ru/catalog/lekarstva-i-bad/prostuda-i-gripp/kashel/shalfej-tab-dlya-29309/>2. <https://www.rlsnet.ru/drugs/salfei-3474>3. Ходжиматов, М. Дикорастущие лекарственные
растения Таджикистана /М.Ходжиматов -Душанбе:
Ирфон, 1989. –364с.4. Халифаев Д. Р. Создание лекарственных форм на
основе бентонитовых глин и эфирных масел: дисс. д-
ра фарм наук/ Д. Р. Халифаев. – г. Душанбе, 2004 –
175 с.(57) Изобретение относится к медицине, а именно к
фармацевтической промышленности, и касается
средств для лечения заболеваний полости рта в виде
таблеток, содержащих экстракты и эфирное масло

2

растительных трав с вспомогательными веществами.

Технической задачей настоящего изобретения
является расширение арсенала средств растительного
происхождения, применяемых для лечения заболева-
ний полости рта.Поставленная задача реализуется предлагаемым
средством для лечения заболеваний полости рта в виде
рассасывающихся таблеток, содержащее в качестве
активных веществ сухие экстракты и эфирные масла
растительного сырья, в качестве вспомогательных ве-
ществ - магния стеарат, отличающееся тем, что в каче-
стве активных веществ содержит сухой экстракт герани
сибирской, сухой экстракт шалфея мускатного и
эфирное масло шалфея мускатного, в качестве вспомо-
гательных веществ дополнительно содержит бентонит
и микрокристаллическую целлюлозу (МКЦ) 102 при
следующем содержании компонентов, масс %:

Сухой экстракт герани сибирской	- 3 %
Сухой экстракт шалфея Мускатного	- 1 %
Эфирное масло шалфея мускатного	- 2%
Бентонит	- 18%
Микрокристаллическая целлюлоза (МКЦ) 102	- 75 %
Магния стеарат	- 1 %.

Изобретение относится к медицине, а именно к фармацевтической промышленности, и касается средств для лечения заболеваний полости рта в виде таблеток, содержащих экстракты и эфирное масло растительных трав с вспомогательными веществами.

Известно средство для лечения и профилактики воспалительных заболеваний полости рта, которое представляет собой водный экстракт травы зверобоя продырявленного, корневища кровохлебки лекарственной, плодов можжевельника обыкновенного и листьев мать-и-мачехи, взятых в равных соотношениях. Средство обладает противовоспалительным, антибактериальным и разжижающим действием при сохранении естественной микрофлоры полости рта [1]. Недостатком данного лекарственного средства является то, что рекомендуется водный экстракт, но у водных извлечений ограниченный срок годности.

Известен препарат в форме таблеток «Шалфей» (производитель: Патент-фарм, Фармпродукт, Россия), применяемый при лечении заболеваний верхних дыхательных путей и полости рта, содержащий: экстракт листьев шалфея, аскорбиновую кислоту, масло эфирное листьев шалфея, сорбит, аэросил, стеарат кальция, пищевой краситель R 160 [2].

Прототипом к заявленному изобретению является препарат в форме таблеток «Шалфей» (производитель- компания Херкель Б.В. (Нидерланды), зарегистрированный в России), для лечения воспалительных заболеваний ЛОР-органов, который содержит сухой экстракт шалфея лекарственного, масло эссенциальное, аскорбиновую кислоту, яблочную кислоту, сорбит, аспартам, стеарат магния, кремния диоксид коллоидный, ароматизатор медовый, хинолиновый желтый Е-104, индигокармин Е-132 [3].

Однако, вышеуказанные таблетки имеют высокую себестоимость за счет использования субстанции и большого количества вспомогательных веществ, а также использование синтетических веществ, что может привести к возникновению побочных эффектов.

Технической задачей настоящего изобретения является расширение арсенала средств растительного происхождения, применяемых для лечения заболеваний полости рта.

Поставленная задача реализуется предлагаемым средством для лечения заболеваний полости рта в виде рассасывающихся таблеток, содержащее в качестве активных веществ сухие экстракты и эфирные масла растительного сырья, в качестве вспомогательных веществ - магния стеарат, отличающееся тем, что в качестве активных веществ содержит сухой экстракт герани сибирской, сухой экстракт шалфея мускатного и эфирное масло шалфея мускатного, в качестве вспомогательных веществ дополнительно содержит бентонит и микрокристаллическую целлюлозу (МКЦ) 102 при следующем содержании компонентов, масс %:

Сухой экстракт герани сибирской	- 3 %
Сухой экстракт шалфея мускатного	- 1 %

Эфирное масло шалфея мускатного	- 2 %
Бентонит	- 18 %
Микрокристаллическая целлюлоза (МКЦ) 102	- 75 %
Магния стеарат	- 1 %.

Соотношения компонентов заявленного средства полностью отвечают требованиям, предъявляемым к антимикробным, противогрибковым и противовоспалительным средствам нетоксичного действия и без побочных эффектов.

В качестве вспомогательного вещества для заявленного изобретения используют бентонит (18%) Шаартузского месторождения Республики Таджикистан. Благодаря своим разрыхляющим свойствам, способствует высвобождению действующих веществ из состава таблетки, тем самым улучшая ее терапевтические свойства, а также способствует повышению биодоступности действующих веществ.

Заявленное средство для лечения заболеваний полости рта получают методом прямого прессования и состоит из следующих стадий: в смеситель загружают сухие экстракты травы герани сибирской и листьев шалфея мускатного тщательно смешивают с определенным количеством вспомогательных веществ (бентонит, микрокристаллической целлюлозы (МКЦ) 102, магния стеарата), затем добавляют эфирное масло шалфея мускатного и прессуют смесь на таблеточной машине со средней массой 0,55 г с использованием пуансонов диаметром 12 мм.

Заявленные весовые соотношения определены по содержанию компонентов в составе таблеток массой 0,55 г. Полученные таблетки со средней массой 0,55 г удовлетворяют требованиям на фармацевтическое средство.

При составлении рецептуры таблеточных смесей содержание сухого экстракта травы герани сибирской в одной таблетке составлял- 0,0190 г, сухого экстракта листьев шалфея мускатного - 0,0064 г, эфирного масла шалфея мускатного - 0,011 г, бентонита- 0,099 г, микрокристаллической целлюлозы (МКЦ 102) - 0,4125 г, магния стеарата - 0,0055 г.

Заявленное средство представляет собой - таблетки кремового цвета с единичными коричневыми вкраплениями различной формы, приятные на вкус, со слабым характерным запахом. По фармако-технологическим показателям, заявленное средство соответствует требованиям Государственной фармакопеи: средняя масса таблетки $0,55 \pm 5\%$, устойчивость к раздавлению - не менее 50 Н, истираемость - 0,3%, однородность массы таблеток - 1%, распадаемость - к 15 мин. Стабильность при хранении в течение трех лет.

Показания для применения заявленного лекарственного средства:

- антимикробный, противогрибковый и противовоспалительный действия;
- воспалительные процесс слизистой оболочки глотки (фарингит, тонзиллит острая и хроническая форма);

- воспалительные процессы полости рта (стоматит, гингивит, глосит).

Антибактериальную и противогрибковую активность заявленного средства проверяли методом двукратного серийного разведения в жидкой питательной среде (мясо-пептонный бульон) в условиях *in vitro* согласно Государственной фармакопеи. В опытах использовали стандартизированную суспензию тест-штаммов следующих микроорганизмов: *Bacillus subtilis* ATCC 6633, *Escherichia coli* ATCC 25922, *Staphylococcus aureus* ATCC 6538, *Pseudomonas aeruginosa* ATCC

9027 и *Candida albicans* ATCC 885-653, концентрация клеток в которых составляла 0,5 за McFarland. Исследование проводилось в 10-кратной повторности. Оценку результатов проводили по степени угнетения роста той или иной тест-культуры микроорганизмов исследуемой таблетки.

Таблица 1. Определение антимикробной и противогрибковой активности заявленного средства

Тест-культуры микроорганизмов	Минимальная бактерицидная концентрация, мг/мл	
	Заявленное средство для лечения заболеваний полости рта	
	1	2
<i>S.aureus</i>	12,5	1,65
<i>E.coli</i>	25	3,3
<i>B.subtilis</i>	12,5	3,3
<i>P.aeruginosa</i>	25	3,3
<i>C.albicans</i>	12,5	0,825

Примечание. 1 - антимикробная; 2 - противогрибковая

Полученные результаты показали, что заявленное средство на основе растительных экстрактов и эфирного масла проявляет антимикробную активность а также противогрибковое действие.

Для подтверждения противовоспалительной активности были проведены сравнительные исследования заявленного средства и кверцетина на модели

карагенинового отека стопы у крыс (табл.2). Заявленное средство использовалась в дозе 200 мг/кг.

Таблица 2. Сравнительная оценка противовоспалительной активности заявленного средства для лечения заболеваний полости рта

Исследуемые вещества	Доза мг/кг	Процент, прироста объема стопы на 4 час	Показатель, угнетения воспалительной реакции, %
Контроль	-	142,5±2,1	-
Заявленного средства для лечения заболеваний полости рта	200	112,4±1,9	21,7
Кверцетин		123,1±2,3	-

После введения агента карагенина у животных первой группы (контроля) наблюдали отчетливый отек в области стопы, который постепенно усиливался и был максимальным через 4-5 часов наблюдений. В зоне отека фиксировали цианоз, а животные при перемещении, вследствие боли, избегали наступать на пораженную стопу.

Группа животных, получавших заявленное средство в дозе 200 мг/кг проявляла наибольшую противовоспалительную активность, наблюдаемый отчетливый отек в области стопы постепенно уменьшился по сравнению с кверцетином. Зона отека приобрела нормальный цвет и животные свободно передвигались, наступая на пораженную ранее стопу, причем терапевтический эффект при применении заявленного средства проявлялось без побочного действия.

Таким образом, заявленное средство не проявляет токсичных свойств, соответственно его можно рекомендовать для создания лекарственных средств.

Формула изобретения

Средство для лечения заболеваний полости рта в форме таблетки для рассасывания, содержащее в качестве активных веществ сухие экстракты и эфирные масла из растительного сырья, в качестве вспомогательных веществ - магния стеарат, **отличающееся тем, что** в качестве активных веществ содержит сухой экстракт герани сибирской, сухой экстракт шалфея мускатного и эфирное масло шалфея мускатного, в качестве вспомогательных веществ дополнительно содержит бентонит и микрокристаллическую целлюлозу (МКЦ) 102 при следующем содержании компонентов, масс %:

Сухой экстракт герани сибирской	- 3 %
Сухой экстракт шалфея мускатного	- 1 %
Эфирное масло шалфея мускатного	- 2%
Бентонит	- 18%
Микрокристаллическая целлюлоза (МКЦ) 102	- 75 %
Магния стеарат	- 1 %.

Компьютерный набор: Ризоева С.Р.