



Республика Таджикистан

(19) **TJ** (11) **489**

(51) **МПК(2011.01) А 61 К**
31/167; А 61 К 31/375; А 61 Р 29/00

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(12) **Описание изобретения**

К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

1

2

(21) 1100678

(22) 16.11.2011

(46) Бюл.68, 2011

(71) Исупов С.Дж. (ТJ), Султонов А.Ю. (ТJ), Султонов Ж.Ю. (ТJ).

(72) Исупов С.Дж. (ТJ), Султонов А.Ю. (ТJ), Султонов Ж.Ю. (ТJ).

(73) Исупов С.Дж. (ТJ), Султонов А.Ю. (ТJ), Султонов Ж.Ю. (ТJ).

**(54) ЛЕКАРСТВЕННЫЙ ПРЕПАРАТ
«КОЛДЕНД С»**

(56) Машковский М.Д. Пособие для врачей – «Лекарственные средства», четырнадцатое издание, том 1, стр. 162.

(57) Изобретение относится к медицине, а именно к фармацевтике и применяется как жаропонижающее, болеутоляющее и противовоспалительное

средство для лечения и устранения симптомов инфекционно-воспалительных заболеваний: гриппа, ОРВИ (острой респираторной вирусной инфекции) и простуды. Снижает высокую температуру, устраняет озноб, лихорадку, головную и мышечную боль, заложенность носа и насморк. Содержит парацетамола - 0,500 г, фенилэфрин гидрохлорида - 0,010 г, хлорфенирамин малеата - 0,002 г, кислоту аскорбиновую - 0,100 г.

Способ применения и дозы (для взрослых и детей старше 12 лет): содержимое одного пакета растворяют в стакане (150-200 мл) горячей воды и принимают в горячем виде до 4 раз в сутки, с интервалом 4 часа, в течение 3-х дней. По вкусу можно добавит сахар, мёд, лимонный сок и фруктовое варенье.

Изобретение относится к медицине, а именно к фармацевтике и применяется как жаропонижающее, болеутоляющее и противовоспалительное средство для лечения и устранения симптомов инфекционно-воспалительных заболеваний: гриппа, ОРВИ (острой респираторной вирусной инфекции) и простуды.

Наиболее близким аналогом объекта изобретения является зарубежный препарат «КОЛДРЕКС® ХотРем». Это препарат имеет близкий состав ингредиентов и так же применяется как жаропонижающее, противовоспалительное и болеутоляющее средство (М.Д. Машковский. Пособие для врачей - «Лекарственные средства», четырнадцатое издание, том 1, страница 162).

Состав прототипа:

Парацетамола	0,750 г
Фенилэфрина гидрохлорида	0,010 г
Кислоты аскорбиновой	0,060 г

Недостатком препарата Колдрекс® ХотРем, является высокая доза основного действующего компонента – парацетамола, который содержится в количестве 750 мг, что значительно превышает

Состав:

в 1 пакетике в граммах:

Парацетамола	0,500 г
Фенилэфрина гидрохлорида	0,010 г
Хлорфенирамина малеата	0,002 г
Кислоты аскорбиновой	0,100 г

Характеристика ингредиентов:

Парацетамол:

(лат. Paracetamolum, англ. Paracetamol, также ацетаминофен) — белый или белый с кремовым или розовым оттенком кристаллический порошок. Легко растворим в спирте, нерастворим в воде. Лекарственное средство, оказывающее жаропонижающее и обезболивающее действие. Является широко распространённым ненаркотическим анальгетиком, обладает довольно слабыми противовоспалительными свойствами (и поэтому не имеет связанных с ними побочных эффектов, характерных для НПВП). Вместе с тем, может служить причиной нарушений работы печени, кровеносной системы и почек [3]. Риск нарушений данных органов и систем увеличивается при одновременном принятии спиртного, поэтому лицам, употребляющим алкоголь, рекомендуют употреблять пониженную дозу парацетамола.

Парацетамол является основным метаболитом фенаcetина с химически близкими ему свойствами. При приёме фенаcetина быстро образуется в организме и обуславливает анальгетический эффект последнего. По болеутоляющей активности парацетамол существенно не отличается от фенаcetина, подобно ему, он обладает слабой противовоспалительной активностью. Основными преимуществами парацетамола являются малая токсичность и меньшая способность вызывать образование метгемоглобина. Вместе с тем, этот пре-

рекомендуемую на один прием дозу. Государственная Фармакопея X издания утвердил высшую разовую дозу для парацетамола в количестве 500 мг, хотя в последнее время в некоторых литературных источниках встречаются прописи с более высокими дозами. По нашему мнению, естественно такая большая доза значительно может увеличить в первую очередь гепатотоксичность и нефротоксичность препарата, а так же отрицательное влияние на других органов и метаболические процессы.

Цель изобретения: внедрение в производство и в медицинскую практику более эффективного, безопасного и доступного аналога зарубежного препарата «Колдрекс», не уступающего по качеству и конкурентоспособного по ценам.

Сущность изобретения: подробное изучение физико-химических свойств ингредиентов входящих в состав препарата, их фармакокинетики и фармакологического действия и совместимости. Подбор оптимальной и безопасной дозировки каждого ингредиента, обеспечивающий синергизм в действие данного препарата. Разработка технологического регламента производства.

парат при длительном применении, особенно в больших дозах, также может вызывать побочные эффекты, в частности, оказывать нефротоксическое и гепатотоксическое действие. Тем не менее, парацетамол остается безопасным и подходящим выбором анальгетика для детей и включён ВОЗ, наряду с ибупрофеном, в список «наиболее действенных, безопасных и эффективных с точки зрения затрат лекарственных средств».

Фенилэфрина гидрохлорид:

(Phenylephrine) (Мезатон, Mesatonum). 1-(мета-Оксифенил)-2-метиламиноэтанол гидрохлорид. Брутто-формула — $C_9H_{13}NO_2$.

Синонимы: Adrianol, Almeyfrin, Derizene, Idrianol, Isophrin, Neophryn, NeoSynephrine, Phenylephrini hydrochloridum, Phenylephrine hydrochloride, mSympatol, Visadron и др.

Фармакологическая группа

Альфа-адреномиметики Антисконгестанты

Физические свойства

Белый или белый со слегка желтоватым оттенком кристаллический порошок без запаха. Легко растворим в воде и спирте.

Общая информация

Хлорфенирамина малеат:

Это противогистаминное средство. Противогистаминные средства блокируют рецепторы тканей, чувствительные к гистамину. Противогистаминные препараты ослабляют реакцию на гистамин. Выделение свободного гистамина под влия-

нием противогистаминных средств практически не изменяется. Не влияют антигистаминные средства и на синтез гистамина. Существующие гистаминовые рецепторы обладают неодинаковой чувствительностью к противогистаминным веществам разного химического строения. Хлорфенирамин конкурирует с гистамином за участки клеточных рецепторов на эффекторных клетках, в нашем случае преимущественно клетках верхних дыхательных путей.

Идеальное антигистаминное средство должно обладать высокой антигистаминной активностью, иметь минимум побочных эффектов и иметь минимальный риск развития тахифилаксии (привыкания).

Антагонисты H-1 рецепторов очень эффективны при лечении ринореи, чихания и зуда, заложенности носа, сопровождающие простудные заболевания, т.е. они способствуют облегчению носового дыхания.

Новые высокоэффективные антигистаминные препараты (например, фексофенадин и др.), не проходящие через гематоэнцефалический барьер, в какой-либо значимой степени, действуют преимущественно на периферическом уровне. Эти свойства могут быть желанными при лечении кожных или многих периферических аллергических реакций, в патогенезе которых существенную роль играет гистамин, тем более, что они не вызывают побочный седативный эффект.

Однако, антигистаминные препараты 2-го и 3-го поколения менее эффективны в лечении простудных состояний, так как последние имеют в патогенезе, наряду с периферическим, одновременно и центральный гистаминергический компонент.

Антигистаминное средство - Хлорфенирамин проникает через гематоэнцефалический барьер. Учитывая устройство капсулы, можно говорить о медленном и постепенном действии хлорфенирамина на гистаминовые рецепторы в ЦНС и, следовательно, о слабом побочном седативном действии. В плазму хлорфенирамин поступает равномерно с постоянной скоростью. В тоже время Хлорфенирамин влияет и на периферические гистаминовые рецепторы.

Хлорфенирамин может оказывать лечебное действие, вероятно, и при хронических аллергических ринитах (реакция на бытовую пыль и другие аллергены).

Кислота аскорбиновая:

Витаминное средство, оказывает метаболическое действие, не образуется в организме человека, а поступает только с пищей. Участвует в регулировании окислительно-восстановительных процессов, углеводного обмена, свертываемости крови, регенерации тканей; повышает устойчивость организма к инфекциям, уменьшает сосудистую проницаемость, снижает потребность в витаминах B1, B2, A, E, фолиевой кислоте, пантотеновой кислоте.

Участвует в метаболизме фенилаланина, тирозина, фолиевой кислоты, норэпинефрина, гистамина, Fe, утилизации углеводов, синтезе липидов, протеинов, карнитина, иммунных реакций, гидроксилировании серотонина, усиливает абсорбцию негеминового Fe. Обладает антиагрегантными и выраженными антиоксидантными свойствами. Регулирует транспорт H⁺ во многих биохимических реакциях, улучшает использование глюкозы в цикле трикарбоновых кислот, участвует в образовании тетрагидрофолиевой кислоты и регенерации тканей, синтезе стероидных гормонов, коллагена, проколлагена. Поддерживает коллоидное состояние межклеточного вещества и нормальную проницаемость капилляров (угнетает гиалуронидазу). Активирует протеолитические ферменты, участвует в обмене ароматических аминокислот, пигментов и холестерина, способствует накоплению в печени гликогена. За счет активации дыхательных ферментов в печени усиливает ее дезинтоксикационную и белковообразовательную функцию, повышает синтез протромбина. Улучшает желчеотделение, восстанавливает внешнесекреторную функцию поджелудочной железы и инкреторную - щитовидной. Регулирует иммунологические реакции (активирует синтез антител, C3-компонента комплемента, интерферона), способствует фагоцитозу, повышает сопротивляемость организма инфекциям. Тормозит высвобождение и ускоряет деградацию гистамина, угнетает образование Pg и др. медиаторов воспаления и аллергических реакций. В низких дозах (150-250 мг/сут внутрь) улучшает комплексообразующую функцию дефероксамина при хронической интоксикации препаратами Fe, что ведет к усилению экскреции последнего.

Показания:

Гипо- и авитаминоз C, а также состояния повышенной потребности в аскорбиновой кислоте - период искусственного вскармливания и интенсивного роста, несбалансированное питание, парентеральное питание, напряженная работа, период реконвалесценции после тяжелых заболеваний, цинга, алкоголизм, ожоговая болезнь, длительное переохлаждение организма, длительная лихорадка, гипертиреоз, хронические инфекции, заболевания ЖКТ (персистирующая диарея, резекция тонкого кишечника, пептическая язва, гастрэктомия), курение, продолжительное стрессовое состояние, послеоперационный период, травмы, туберкулез, беременность (особенно многоплодная, на фоне никотиновой или лекарственной зависимости), период лактации. Хроническая интоксикация препаратами Fe. Идиопатическая метгемоглобинемия. В лабораторной практике: для маркировки эритроцитов (совместно с натрия хроматом Cr51).

Как указано выше, в состав препарата входят ингредиенты, которые в силу своих фармакологических свойств, весьма эффективно улучшает состояние человека, подвергнутого простуде, ОРВИ и гриппу. То есть, все эти компоненты вместе ока-

зывают комбинированное жаропонижающее, альфа-адреностимулирующее, вазоконстрикторное и антигистаминное действие и устраняет симптомы «простуды»:

Парацетамол блокирует ЦОГ преимущественно в ЦНС, воздействуя на центры боли и терморегуляции и тем самым обуславливает жаропонижающий эффект.

Фенилэфрина гидрохлорид — альфа-адреномиметик, суживает сосуды, устраняет отечность и гиперемия слизистой оболочки полости носа, носоглотки и придаточных пазух носа; уменьшает экссудативные проявления.

Хлорфенирамина малеат — блокатор H_1 -гистаминовых рецепторов, подавляет симптомы аллергического ринита: чиханье, ринорею, зуд глаз, носа, горла. Кроме того, хлорфенирамин являясь высокоэффективным антигистаминным препаратом последнего поколения, предупреждает возможные аллергические реакции на другие компоненты препарата.

Кислота аскорбиновая — улучшает обмен веществ и общего состояния больного, повышает иммунитет, усиливая метаболические процессы тем самым снижает нежелательные побочные эффекты других компонентов.

Колденд С снижает высокую температуру, устраняет озноб, лихорадку, головную и мышечную боль, заложенность носа и насморк. Способ применения и дозы (для взрослых и детей старше 12 лет): содержимое одного пакета растворяют в стакане (150-200 мл) горячей воды и принимают в горячем виде до 4 раз в сутки, с интервалом 4 часа, в течение 3-х дней. По вкусу можно добавит сахар, мёд, лимонный сок и фруктовое варенье. Противопоказания: беременность, грудное кормление, портальная гипертензия, аллергия к компонентам препарата и детская возраст до 12 лет. В период лечения не рекомендуется принимать спиртные напитки и управление транспортом и опасными механизмами.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

Лекарственный препарат, содержащий парацетамол, фенилэфрин гидрохлорида и кислоту аскорбиновую, **отличающийся тем, что** дополнительно содержит хлорфенирамин малеата в следующем соотношении компонентов мас. г:

Парацетамол	0,500
Фенилэфрин гидрохлорида	0,010
Хлорфенирамин малеата	0,002
Кислота аскорбиновая	0,100

Компьютерный набор: Назарова Дж.Д.

Заказ

Тираж

Подписное

Национальный патентно-информационный центр РТ
734042, г. Душанбе, ул. Айни, 14а.