РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ

ПАТЕНТНО ВЕДОМСТВО

(19) BG

ОПИСАНИЕ КЪМ ПАТЕНТ

ЗА

ИЗОБРЕТЕНИЕ

(11) 65576 B1

(51) Int. Cl.

A 61 K 31/4152 (2006.01)
A 61 K 31/52 (2006.01)
A 61 K 31/60 (2006.01)
A 61 P 25/06 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)

(21) Заявителски № 106619
(22) Заявено на 17.04.2002
(24) Начало на действие на патента от:

Приоритетни данни

(31) (32) (33)

(41) Публикувана заявка в бюлетин № 11 на 28.11.2003
(45) Отпечатано на 30.01.2009
(46) Публикувано в бюлетин № 1 на 30.01.2009
(56) Информационни източници:
WO 2000/030715; EP 0908177
(62) Разделена заявка от заяв. №

(73), (72) Патентопритежател(и) и изобретател(и):
РУМЯНА АНГЕЛОВА ХРИСТОСКОВА
1000 СОФИЯ, УЛ. "Г. С. РАКОВСКИ" 152, ВХ. А, АП. 17

(74) Представител по индустриална собственост:
Любов Стефанова Ненчева,
1463 София, ул. "Доспат" 44

(86) № и дата на РСТ заявка:

(87) № и дата на РСТ публикация:

(54) СЪСТАВ НА БОЛКОУСПОКОЯВАЩО СРЕДСТВО, ПО-СПЕЦИАЛНО ПРИ ГЛАВОБОЛИЕ И МИГРЕНА

(57) Изобретението се отнася до фармацевтичен състав на болкоуспокоявящо средство, което по-специално е подходящо за успокояване на болката при главоболие и мигрена. Съставът е комбинация от метамизолум натрикум от 400 до 800 mg, дротаверин от 10 до 20 mg и бромазепам от 1 до 3 mg, които действат в синергизъм взаимосвързано и увеличават ефекта от успокояване на болката при главоболие и мигрена до нейното по-бързо и пълно отзвучаване, както и отшумяване на съпътстващите болката явления.

3 претенции

BG 65576 B1

(54) СЪСТАВ НА БОЛКОУСПОКОЯВАЩО СРЕДСТВО, ПО-СПЕЦИАЛНО ПРИ ГЛАВОБОЛИЕ И МИГРЕНА

Област на техниката

Изобретението се отнася до фармацевтичен състав на болкоуспокояващо средство и по-специално до средство за успокояване на болката при главоболие и при мигрена. Фармацевтичният състав съгласно изобретението е комбинация от познати компоненти, които действат в синергизъм взаимосвързано и увеличават ефекта от успокояване на болката при главоболие и мигрена до нейното по-бързо и по-пълно отзвучаване.

Предшестващо състояние на техниката

Известно е, че около 50% от хората страдат малко или много от главоболие, независимо от тяхната възраст, пол или народност. Главоболието в повечето случаи е симптом на болест, а не болест, като причините за неговото появяване са изключително разнообразни. Различни видове дразнения въздействат на болковите рецептори в тъканите на главата и предизвикват главоболие като например: механични, термични, химични, а също патологични изменения, възникващи при нарушения в обмяната на веществата, при заболяване на вътрешни органи, ендокринни жлези, органи на слуха или зрението, при изменения на кръвното налягане, при органични и функционални заболявания на нервната система, както и при стрес, безсъние и др. подобни (Проф. д-р Леонид Улицки "Победете главоболието" изд. Хомо футурус, 2001, София). Съгласно същия източник основната част от болките в главата се дължат на функционални причини (около 90%), около 8% се дължат на проблеми в съдовата система и само около 2% са органични. Друг известен изследовател В. Н. Щок е предложил класификация на болките в главата по патогенен принцип в зависимост от механизма на развитие на болестта и нейните симптоми. И от тази патогенна класификация на болките в главата може да се направи също извода, че главоболието е твърде разнообразно по произход и проявление. Поради тази причина използваните лекарствени средства са голям брой и с различно действие, използват се съдоактивни препарати като анаприлин, резерпин, пироксан, папаверин, нифедипин, стугерон, агапурин, троксевазин, пикамилон и др. подобни. При главоболие от мускулно напрежение се използват аналгетици и психотропни вещества като ацетилсалицилова киселина, аналгин, парацетамол, фенацетин, морфин, фентанил, кофеин и др. подобни. Проблем при тези средства са страничните ефекти и сравнително ограниченото им въздействие.

От публикацията на Ханс-Кристоф Динер "Ефикасна помощ при мигрена", изд. "Хермес" Пловдив 2001, е известно, че мигрената представлява появяващи се на пристъпи и повтарящи се на определени интервали от време пулсиращи и силно тупкащи болки в главата, които са едностранни, но понякога се проявяват и двустранно. Болките в главата се съпътстват с гадене и повръщане, свръхчувствителност към светлина, шум, миризми. Известни са основно три форми на мигрената: обикновена мигрена без аура, при която пулсиращото главоболие е придружено с вегетативни съпътстващи явления, липса на апетит, гадене, повръщане, разстройство; класическа мигрена с аура, при която главоболието се предхожда от неврологични нарушения, например нарушения в зрението; комплицирана мигрена, при която главоболието се предхожда и съпътства с неврологични смущения като смущения в зрението, осезанието, парализа. Съгласно цитирания източник за лечение на акутните мигренозни атаки се прилагат изброените по-горе препарати за лечение на главоболие, а при силна мигрена те се съчетават с ерготамин или с ерготамин и кофеин. При много силна мигрена известните лекарства за главоболие се съчетават с алкалоидите на моравото рогче като суматриптан, золмитриптан, нератриптан, ризатриптан и елетриптан.

От WO 2000/030715/02.06.2000 е известен фармацевтичен състав, който съдържа комбинация от аналгетичен компонент от типа на морфин, аминофеназон, аналгин, ацетил салицилова киселина, индометацин, ибупрофен, дихлофенак или кодеин; и от компонент - съединение с ксантинова структура като например теобромин, 3-метилксантин и др. Съотношението на двата компонента е (1-20) : 1. Допълнително

може да бъде добавен спазмолитик на гладката мускулатура от типа на дротаверин. Фармацевтичният състав проявява по-дълготрайно въздействие върху централната нервна система (в сравнение с морфина) с по-малко странични ефекти.

От ЕР 0908177/14.04.1999 е известна фармацевтична композиция, която като активен компонент съдържа бромазепам. Бромазепамът намалява чувството за напрегнатост и безпокойство в малки дози, а при по-високи дози проявява седативен и миорелаксиращ ефект. Употребява се при емоционални разстройства, нервно напрежение, безсъние, функционални смущения в дейността на сърдечносъдовата и дихателната система, в стомашно-чревния и урогенния тракт и други психосоматични нарушения.

От Фармакопеята е известно, че дротаверинът е производен на изохинолина и притежава спазмолитичен ефект, който действа на гладката мускулатура, а аналгинът (метамизол натрий) притежава болкоуспокояващо и температуропонижаващо действие.

От посоченото в описанието по-горе става известно, че поради многообразният характер на източниците на главоболие и неизясненият характер на мигренозните болки във фармацията и на пазара са известни и се търсят все нови и нови средства за успокояване на болката при главоболие и мигрена, което да се постига по-бързо и с по-голям ефект, както и с по-малко странични ефекти.

Техническа същност на изобретението

Проблемът за обогатяване на техниката с нови фармацевтични средства и състави, които да са по-ефективни от известните за успокояване на главоболието и мигрената се решава с настоящото изобретение. То представлява състав на болкоуспокояващо средство по-специално при главоболие и мигрена, състоящо се от комбинация на познати компоненти, а именно метамизолум натрикум, дротаверин (дротаверинум хидрохлорикум) и бромазепам в следното съотношение в части: метамизолум натрикум към дротаверин към бромазепам се отнася както (400 ÷ 800) : (10 ÷ 20): (1 ÷ 3). За предпочитане метамизолум натрикума, дротаверина и бромазепама в състава са в следните количествени съотношения: метамизолум натрикум от 400 до 800 mg, дротаверин от 10 до 20 mg и бромазепам от 1 до 3 mg.

При главоболие за предпочитане се препоръчва болкоуспокояващото средство, съгласно изобретението, да се прилага в следните съотношения: метамизолум натрикум от 400 до 600 mg, дротаверин от 10 до 15 mg и бромазепам от 1 до 2 mg.

При мигренозни болки, преди и по време на мигренозния пристъп за предпочитане се препоръчва болкоуспокояващото средство, съгласно изобретението, да се прилага в следните съотношения: метамизолум натрикум от 600 до 800 mg, дротаверин от 10 до 20 mg и бромазепам от 2 до 3 mg.

Желателно е съставът да се приема в течна или прахообразна форма с цел да се ускори действието му, но не се изключва прилагането му и под формата на драже.

Известно е действието на всеки от компонентите като:

Метамизолум натрикум проявява болкоуспокояващо, температуропонижаващо действие.

Дротаверинът е производен на изохинолина и има спазмолитичен ефект, който действа директно върху гладката мускулатура. Ефективен е в случаите на спазъм на гладката мускулатура, както от нервен, така и от мускулен произход. Спазмолитичното действие е еднакво върху гладката мускулатура на гастроинтестиналната, билиарната, урогениталната и васкуларната система. Благодарение на съдоразширяващото му действие се увеличава кръвоснабдяването на тъканите.

Бромазепамът в малки дози селективно намалява чувството за напрегнатост и безпокойство. При високи дози проявява седативен и миорелаксиращ ефект. Употребява се при емоционални разстройства, състояния на безпокойства и напрегнатост, нервно напрежение, възбуда и безсъние и при функционални смущения в дейността на сърдечносъдовата и дихателната система; функционални смущения в дейността на стомашно-чревния тракт; функционални смущения в дейността на урогениталния тракт и други психосоматични нарушения.

Комбинирането на трите известни компонента в състава на болкоуспокояващото средство съгласно изобретението води до засилен (синергичен) ефект на въздействие при главоболие и особено при мигрена, като се достига много бързо затихване и изчезване на болката; намалява и изчезва свръхчувствителността към светлина, шум и миризми; изчезват и съпътстващите вегетативни явления - липса на апетит, гадене, повръщане. След приемане на средство-

то от лицето, до 60 min, изчезват болката и съпътстващите я явления и лицето се възвръща към нормалното си състояние.

Компонентите, съставни части на средството, съгласно изобретението, могат да се приемат последователно или едновременно. След приемането им, много бързо настъпва облекчаване на страничните съпътстващи смущения без странични явления.

Примерни изпълнения на изобретението

Следващите примери изясняват по-подробно изобретението, без да го ограничават.

Пример 1.

При главоболие, например при хора с високо кръвно налягане, след приемане на медикамента за понижаване на кръвното налягане се препоръчва следния състав на средството в количествено съотношение:

- метамизолум натрикум, например с наименование Аналгин - 400 mg,
- Дротаверин (дротаверинум хидрохлорикум) - 10 mg,
- Бромазепам - 1 mg.

След около 15-20 min главоболието изчезва.

Пример 2.

При усещането, че започва мигренозна атака, чийто предвестник е напрегнатост и главоболие, се препоръчва следния състав в количествено съотношение:

- метамизолум натрикум, например с наименование Аналгин - 600 mg,
- Дротаверин (дротаверинум хидрохлорикум) - 10 mg,
- Бромазепам - 2 mg.

Болката и съпътстващата напрегнатост изчезват за около 20 min.

Пример 3.

При мигренозна атака се взима за предпочитане следния състав в количествено съотношение:

- метамизолум натрикум, например с наименование Аналгин - 800 mg,
- Дротаверин (дротаверинум хидрохлорикум) - 20 mg,
- Бромазепам - 2 mg.

Болката и съпътстващите явления изчезват за около 20 min.

Пример 4.

При много силна мигрена се препоръчва състав със следното количествено съотношение:

- метамизолум натрикум, например с наименование Аналгин - 800 mg,
- Дротаверин (дротаверинум хидрохлорикум) - 20 mg,
- Бромазепам - 3 mg.

Болката и съпътстващите явления изчезват за около 30 min.

Патентни претенции

1. Състав на болкоуспокояващо средство, по-специално при главоболие и мигрена, характеризиращ се с това, че е съставен от комбинацията на метамизолум натрикум, дротаверин и бромазепам в следните количествени съотношения: метамизолум натрикум от 400 до 800 mg, дротаверин (дротаверинум хидрохлорикум) от 10 до 20 mg и бромазегам от 1 до 3 mg.

2. Състав съгласно претенция 1, характеризиращ се с това, че съставът при главоболие за предпочитане е със следните количествени съотношения: метамизолум натрикум от 400 до 600 mg, дротаверин от 10 до 15 mg и бромазепам от 1 до 2 mg.

3. Състав съгласно претенция 1, характеризиращ се с това, че съставът при мигрена за предпочитане е със следните количествени съотношения: метамизолум натрикум от 600 до 800 mg, дротаверин от 10 до 20 mg и бромазепам от 2 до 3 mg.

Издание на Патентното ведомство на Република България
1797 София, бул. "Д-р Г. М. Димитров" 52-Б

Експерт: А. Колева

Пор. № 65373

Тираж: 40 ВК