



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 201 213** ⁽¹³⁾ **C1**
(51) МПК⁷ **A 61 K 9/08, 38/05, A 61 F 9/00**

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 2001118086/14, 04.07.2001

(24) Дата начала действия патента: 04.07.2001

(46) Дата публикации: 27.03.2003

(56) Ссылки: МАЙЧУК Ю.Ф. и др. Разработка глазных капель карнозина и оценка их эффективности при заболеваниях роговицы. - Вестник офтальмологии, 1997, №6, с.27-31. RU 2071316 C1, 10.01.1997. RU 2115413 C1, 20.07.1998.

(98) Адрес для переписки:
127247, Москва, ул. 800-летия Москвы, 6,
кв.213, И.А.Маклаковой

(71) Заявитель:

Общество с ограниченной ответственностью
"Научно-экспериментальное производство
Микрохирургия глаза"

(72) Изобретатель: Багров С.Н.,
Маклакова И.А., Малышев В.Б., Майчук
Ю.Ф., Кононенко Л.А., Майчук Д.Ю.

(73) Патентообладатель:

Общество с ограниченной ответственностью
"Научно-экспериментальное производство
Микрохирургия глаза"

(54) ГЛАЗНЫЕ КАПЛИ "КАРНОЗИН"

(57) Реферат:

Изобретение относится к медицине, а именно к офтальмологии. Изобретение характеризуется тем, что глазные капли, включающие карнозин, согласно изобретению дополнительно содержат физиологический раствор хлорида натрия в боратном буфере при рН 6,8-7,8 и следующем соотношении компонентов, мас. %: карнозин 0,01-2,0,

физиологический раствор солей натрия в боратном буфере - остальное. Изобретение обеспечивает повышение эффективности глазных капель карнозина за счет сочетанного антибактериального действия, отсутствия раздражающего действия на глазные ткани при физиологических значениях рН, а также пролонгированного действия. 2 з.п. ф-лы.

RU 2 201 213 C1

RU 2 201 213 C1



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 201 213** ⁽¹³⁾ **C1**
(51) Int. Cl.⁷ **A 61 K 9/08, 38/05, A 61 F 9/00**

RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: 2001118086/14 , 04.07.2001

(24) Effective date for property rights: 04.07.2001

(46) Date of publication: 27.03.2003

(98) Mail address:
127247, Moskva, ul. 800-letija Moskvy, 6,
kv.213, I.A.Maklakovoj

(71) Applicant:
Obshchestvo s ogranichennoj otvetstvennost'ju
"Nauchno-ehksperimental'noe proizvodstvo
Mikrokhirurgija glaza"

(72) Inventor: Bagrov S.N.,
Maklakova I.A., Malyshev V.B., Majchuk
Ju.F., Kononenko L.A., Majchuk D.Ju.

(73) Proprietor:
Obshchestvo s ogranichennoj otvetstvennost'ju
"Nauchno-ehksperimental'noe proizvodstvo
Mikrokhirurgija glaza"

(54) **OPHTHALMIC DROP "KARNOSIN"**

(57) Abstract:

FIELD: medicine, ophthalmology, pharmacy.
SUBSTANCE: ophthalmic drops comprising
carnosine involves additionally sodium
chloride solution in borate buffer at pH
6.8-7.8 in the following ratio of
components, wt.-%: carnosine, 0.01-2.0;
physiological solution of sodium salts in

borate buffer, the balance. Invention
enhances the effectiveness of ophthalmic
drops with carnosine due to the combined
antibacterial effect, absence of irritating
effect on ophthalmic tissues at
physiological pH values and prolonged
effect. EFFECT: improved properties,
enhanced effectiveness of drops. 3 cl

RU 2 2 0 1 2 1 3 C 1

RU 2 2 0 1 2 1 3 C 1

Изобретение относится к области медицины, а именно к офтальмологии, и может быть использовано в глазной хирургии после хирургических вмешательств по поводу экстракции катаракты, кератопластики, фоторефрактивных, фототерапевтических операций и операций LASIK на роговице, а также в глазной терапии для лечения заболеваний переднего отрезка глаза.

Известны глазные капли 5%-ного раствора карнозина, обладающие терапевтическим эффектом в лечении заболеваний роговицы, связанных с метаболическими поражениями ее ткани (Майчук Ю.Ф., Формазюк В.Е., Сергиенко В.И. Разработка глазных капель карнозина и оценка их эффективности при заболеваниях роговицы. Вестн. офтальмологии, 1997, 6, с.27-31).

Недостатком таких капель является отсутствие сбалансированности по показателю pH, что является важным обстоятельством, поскольку раствор карнозина имеет выраженную щелочную реакцию (растворы карнозина имеют pH около 8), а это не физиологично для глаза человека. Еще одним недостатком является высокая концентрация карнозина, при которой может проявляться побочное действие, в частности сужение зрачка.

Задачей изобретения является создание глазных капель, содержащих карнозин и имеющих показатель pH в области физиологических значений, а также обладающих антибактериальным и пролонгированным действием.

Техническим результатом является повышение эффективности глазных капель карнозина за счет сочетанного антибактериального действия, отсутствия раздражающего действия на глазные ткани при физиологических значениях pH, а также пролонгированного действия.

Технический результат достигается тем, что глазные капли, включающие карнозин, согласно изобретению дополнительно содержат физиологический раствор хлорида натрия в боратном буфере при pH 6,8-7,8 и следующем соотношении компонентов, мас. %:

Карнозин - 0,01 - 2,0

Физиологический раствор солей натрия в боратном буфере - Остальное

Глазные капли могут дополнительно содержать пролонгатор в количестве 0,05-5,0% и/или консервант в количестве 0,005-0,05%.

Карнозин - гистидинсодержащий дипептид, биологически активное соединение, находится во многих тканях человека, в том числе и глазных. Является антиоксидантом, стабилизирует клеточные мембраны, способствует их восстановлению при повреждениях, нормализует обменные процессы в поврежденных тканях. Граничные значения концентрации карнозина определяли экспериментально на культуре клеток кератиноцитов человека. При концентрациях карнозина менее 0,01% не выявляли разницы между количеством и состоянием культуры клеток кератиноцитов в контроле (0,9%-ный раствор натрия хлорида) и опыте (раствор карнозина). При концентрациях карнозина 0,01-2,0% количество клеток превышало 130% по сравнению с контролем, а морфология

свидетельствовала об улучшении обменных процессов. При концентрации карнозина выше 2,0% усиления эффекта улучшения состояния клеток культуры кератиноцитов не наблюдали, в то же время отмечали незначительное подавление митотической активности клеток. В эксперименте на кроликах при инстилляцией раствора карнозина с концентрацией выше 2% отмечали сужение зрачка в 20% случаев.

Физиологическим раствором хлорида натрия в боратном буфере является изотонический раствор с pH 6,8-7,8.

Пролонгаторы используют для более длительного нахождения глазных капель на поверхности роговицы и в конъюнктивальной полости глаза за счет обволакивающего действия. В качестве пролонгаторов используют гидрофильные инертные полимеры, например водорастворимые производные целлюлозы, поливиниловый спирт, полиэтиленгликоль, полиакриламид и т.д.

Консервант необходимо вводить в состав глазных капель при объемах расфасовки, превышающих суточную потребность, для предотвращения размножения посторонней микрофлоры в открытой упаковке при использовании. В качестве консерванта используют консерванты для глазных капель, например нипагин, бензалконийхлорид, тиомерсал и т.д.

Глазные капли "Карнозин" получают следующим образом. В физиологическом растворе хлорида натрия в боратном буфере растворяют карнозин в количестве согласно изобретению, при необходимости добавляют пролонгатор и/или консервант. Раствор перемешивают, фильтруют, расфасовывают во флаконы, укупоривают и автоклавируют.

Пример 1.

Больной М. Диагноз: нитчатый кератит правого глаза. Назначены глазные капли Карнозин следующего состава: карнозин 2,0%, физиологический раствор хлорида натрия в боратном буфере - остальное, pH 7,6. На 2-й день после начала лечения исчез синдром раздраженного глаза, явления кератита начали уменьшаться к 4 дню лечения. Инстилляцию капель продолжали в течение последующих 8 дней. К концу лечения отмечали выраженный терапевтический эффект по состоянию роговицы. Аллергических реакций выявлено не было.

Пример 2.

Больная К. Диагноз: синдром сухого глаза обоих глаз, нитчатый кератит, кератоконус. Глазные капли Карнозин назначены с 1-го дня лечения 5 раз в день. Состав применяемых капель: карнозин 0,01%, полиэтиленгликоль 5%, физиологический раствор хлорида натрия в боратном буфере - остальное, pH 7,8. Эпителизация началась со 2-го дня лечения, полное завершение эпителизации наступило на 4-й день. Лечение продолжали в течение последующих трех дней. Заключение: глазные капли Карнозин оказали хороший трофический и репаративный эффект, побочных действий и аллергических реакций на фоне применения капель не отмечалось.

Пример 3.

Больной Ш. Диагноз: кератоконус левого глаза, вторичная катаракта. Глазные капли Карнозин назначены с 1-го дня лечения 6 раз в день.

Состав глазных капель: карнозин 1%, метилцеллюлоза 0,5%, нипагин 0,05%, физиологический раствор хлорида натрия в боратном буфере - остальное, рН 6,8. Начало эпителизации отмечали на 4-й день лечения, завершение эпителизации наступило на 10-й день. Инстилляцию капель продолжали в течение последующих 8 дней. Побочного действия и аллергических реакций на фоне применения Карнозина не выявлено.

Формула изобретения:

1. Глазные капли, содержащие карнозин, отличающиеся тем, что они дополнительно

содержат физиологический раствор хлорида натрия в боратном буфере при рН 6,8-7,8 и следующем соотношении компонентов, мас. %:

- 5 Карнозин - 0,01-2,0
Физиологический раствор хлорида натрия в боратном буфере - Остальное
2. Глазные капли по п. 1, отличающиеся тем, что они дополнительно содержат пролонгатор в количестве 0,05-5%.
- 10 3. Глазные капли по пп. 1 и 2, отличающиеся тем, что они дополнительно содержат консервант в количестве 0,005-0,05%.

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

-4-

RU 2201213 C1

RU 2201213 C1