

UŽITNÝ VZOR

(11) Číslo dokumentu:

14266

(13) Druh dokumentu: **U1**

(51) Int. Cl.⁷:

A 61 K 31/197

A 61 K 31/4174

A 61 K 31/355

A 61 P 11/02

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **2004 - 15113**

(22) Přihlášeno: **24.02.2004**

(47) Zapsáno: **19.04.2004**

(73) Majitel:

Zentiva, a. s., Praha, CZ

(72) Původce:

Buriánová Tereza Ing., Praha, CZ

Hinterbuchner Eugen MUDr., Roztoky u Prahy, CZ

(74) Zástupce:

Jirotková Ivana Ing., Nad Štolou 12, Praha 7, 17000

(54) Název užitého vzoru:

Farmaceutická kompozice určená k ošetření nosní dutiny

CZ 14266 U1

Farmaceutická kompozice určená k ošetření nosní dutinyOblast techniky

Řešení se týká nové kompozice, zejména kapek a spreje, pro ošetření nosní dutiny. Kompozice je využitelná zejména pro ošetření rýmy a akutních nebo chronických zánětů nosní dutiny.

5 Dosavadní stav techniky

K ošetření rýmy a dalších problémů týkajících se nosní dutiny jsou hojně užívány lokální přípravky působící bezprostředně na nosní sliznici. Forma těchto preparátů je především kapková, avšak velmi často může jít o masti, krémy nebo gely.

10 V současné době jsou součástí těchto přípravků buď látky snižující nadměrné překrvení nosní sliznice (dekongesční účinek), podle mechanismu účinku nazývané sympatomimetika, nebo látky s hojivým, protizánětlivým nebo antimikrobiálním účinkem, popřípadě látky bránící vysoušení nosní sliznice. Významný je podíl lokálních antialergických léků.

15 Dekongesční účinek je přitom hlavní příčinou odstranění subjektivních potíží spojených s rýmou. Na Státním ústavu pro kontrolu léčiv (SÚKL) je registrována celá řada látek vhodných pro toto využití.

Sympatomimetika, určená pro nosní aplikace registrovaná na českém SÚKL:

Cyklopentamin

Efedrin

Fenylefrin

20 Oxymetazolin

Tetryzolin

Xylometazolin

Nafazolin

Tramazolin

25 Metizolin

Tuaminoheptan

Fenoxazolin

Tymazolin

Epinefrin (adrenalin).

30 Jedná se bezesporu o nejširší skupinu léčiv pro lokální ošetření nosní dutiny.

Z těchto látek jsou nejužívanější oxymetazolin, tetryzolin, nafazolin a xylometazolin. S těmito léčivými látkami je prodávána řada přípravků pro ošetření rýmy u dospělých i dětí.

35 Nevýhodou přípravků obsahujících tuto skupinu látek je současné podráždění nosní sliznice. Pro běžné přípravky se sympatomimetikem je typické, že po odeznění příznivého dekonogesčního účinku se naopak projeví nepříznivý efekt podráždění a subjektivní problémy se opět zvětší (re-bound efekt).

Jiný typ používaných látek s hojivým efektem, s efektem proti vysoušení má na druhé straně nižší účinek proti subjektivním potížím a nepřináší tedy potřebnou rychlou úlevu v takové míře jako sympatomimetika.

40 Podstata řešení

Předmětem řešení je taková farmaceutická kompozice, která obsahuje jak sympatomimetikum s dekonogesčním účinkem, tak látku, která odstraní nebo alespoň zmírní podráždění nosní sliznice spojené s účinkem prvně jmenované složky. Takovou látkou může být například panthenol, dexpanthenol nebo kyselina pantothenová. Tyto látky, zejména dexpanthenol, snižují toxické půso-

- bení sympatomimetika (oxymetazolinu) a zlepšují růst buněk ciliárního epitelu, snižují suchost sliznice, hojivým účinkem se omezuje zánět a tím i sekrece z nosu. Podstata řešení tedy spočívá ve farmaceutické kompozici určené k ošetření nosní dutiny, která obsahuje látku se sympatomimetickým účinkem v množství 0,005 až 0,2 % hmotn. a alespoň jednu látku zmírňující negativní účinky zvolenou ze skupiny, kterou tvoří kyselina pantothenová, panthenol a dexpanthenol, v množství 1 až 10 % hmotn. vztaženo na celkový objem kompozice.

Farmaceutická kompozice v rámci tohoto technického řešení představuje směs účinných látek s alespoň jednou pomocnou farmaceuticky akceptovatelnou látkou.

- V daném případě může tedy jít o vodné roztoky nebo suspenze v aplikační formě kapek nebo sprejů, nebo o tak zvané polotuhé formulace jako jsou masti, krémy nebo gely. Typickými pomocnými látkami pro masti a krémy jsou tukové základy, které často tvoří emulzi s vodným roztokem účinných látek. Gely mohou být vytvořeny na tukovém nebo emulzním základě, nebo na vodném základě.

Volba farmaceutických pomocných látek není pro řešení problému podstatná.

- Kromě základní kombinace dvou látek může kompozice podle předkládaného řešení obsahovat látky s podpůrným efektem. Mohou to být látky, které zabraňují vysušování nosní sliznice, působí antimikrobiálně, mají hojivý účinek nebo mají celkově osvěžující vliv na pacienta.

Jsou to především etherické oleje jako je eukalyptus, pinus sylvestris nebo menthol. Hojivý účinek může být dále podpořen přidávkou vitamínu E.

20 Příklady provedení

Příklad 1

Kapalný nosní přípravek, s výhodou kapky

- Pro přípravu kapalného přípravku byl jako sympatomimetikum použit oxymetazolin hydrochlorid, látka pro zmírnění jeho nežádoucích účinků dexpanthenol, dále směs etherických olejů a vitamin E ve formě acetátu (tokoferol acetát). Konkrétní složení je uvedeno v následující tabulce:

Látka	množství v g / 100 ml
oxymetazolin hydrochlorid	0,05
dexpanthenol	5
pinus sylvestris	0,05
eukalyptový olej	0,02
menthol	0,02
tokoferol acetát	0,1

- Dále byly použity další přísady zlepšující rozpustnost, konzervující přípravek a tak dále. Vše bylo převedeno do vodné suspenze. Podle potřeby byla suspenze plněna do lahviček (nosní kapky) nebo do sprejových aplikátorů.

Příklad 2

Kapalný nosní přípravek, s výhodou spreje

Látka	množství v g / 100 ml
oxymetazolin hydrochlorid	0,05
dexpanthenol	2
pinus sylvestris	0,05
menthol	0,03
tokoferol acetát	0,15

N Á R O K Y N A O C H R A N U

- 5 1. Farmaceutická kompozice určená k ošetření nosní dutiny, **vyznačující se tím**, že obsahuje látku se sympatomimetickým účinkem v množství 0,005 až 0,2 % hmotn. a alespoň jednu látku zmírňující negativní účinky zvolenou ze skupiny, kterou tvoří kyselina pantothenová, panthenol a dexpanthenol, v množství 1 až 10 % hmotn., vztaženo na celkový objem kompozice.
- 10 2. Kompozice podle nároku 1, **vyznačující se tím**, že dále obsahuje etherické oleje vybrané z látek eukalyptus, pinus sylvestris, menthol, popřípadě jejich směs a popřípadě vitamin E.
3. Kompozice podle nároku 1 nebo 2, **vyznačující se tím**, že je látka se sympatomimetickým účinkem zvolena ze skupiny zahrnující oxymetazolin, nafazolin, tetrazylin a xylometazolin.
- 15 4. Kompozice podle nároku 3, **vyznačující se tím**, že je jako sympatomimetická látka zvolen oxymetazolin.
5. Kompozice podle nároku 4, **vyznačující se tím**, že je oxymetazolin obsažen v množství 0,01 až 0,05 % hmotn., vztaženo na celkový objem kompozice.
- 20 6. Kompozice podle kteréhokoli z předchozích nároků, **vyznačující se tím**, že je v ní obsah etherických olejů volen v rozmezí 0,01 až 0,2 % hmotn., vztaženo na celkový objem kompozice.
- 25 7. Kompozice určená k ošetření nosní dutiny, **vyznačující se tím**, že obsahuje 0,01 až 0,075 % hmotn. oxymetazolinu, 2 až 5 % hmotn. dexpanthenolu, 0,02 až 0,1 % hmotn. pinus sylvestris, 0 až 0,05 % hmotn. eukalyptového oleje, 0,005 až 0,05 % hmotn. mentholu a 0,02 až 0,2 % hmotn. vitaminu E ve formě tokoferolu acetátu, vztaženo na celkový objem kompozice.
8. Kompozice podle kteréhokoli z předchozích nároků, **vyznačující se tím**, že je v kapalně formě, aplikovatelná jako kapky nebo spreje.