

(19)



(10) **LT 2002 109 A**

(12) **PARAIŠKOS APRAŠYMAS**

(21) Paraiškos numeris: **2002 109**

(51) Int. Cl. (2006): **A61K 9/06**

(22) Paraiškos padavimo data: **2002 10 25**

(41) Paraiškos paskelbimo data: **2004 04 26**

(62) Paraiškos, iš kurios dokumentas išskirtas, numeris: —

(86) Tarptautinės paraiškos numeris: —

(86) Tarptautinės paraiškos padavimo data: —

(85) Nacionalinio PCT lygio procedūros pradžios data: —

(30) Prioritetas: —

(71) Pareiškėjas:

Liudas IVANAUSKAS, Perkūno alėja 20, 3000 Kaunas, LT

(72) Išradėjas:

**Liudas IVANAUSKAS, LT
Rima MINKUTĖ, LT**

(74) Patentinis patikėtinis/atstovas:

—

(54) Pavadinimas:

Tepalas žaizdoms ir nudegimams gydyti

(57) Referatas:

Išradimas yra iš farmacijos srities ir pateikia tepalą opų ir žaizdų gydymui. Tepalas susideda iš veikliosios medžiagos ir tepalo pagrindo. Veikliosiomis medžiagomis yra chloramfenikolis ir metiluracilas, o tepalo pagrindą sudaro makrogolis 1500 ir makrogolis 400. Tepalas gydo infekuotas ir įsisenėjusias žaizdas, skatina jų epitelizaciją, gerai rezorbuojasi į audinius ir lengvai nuplaunamas vandeniu.

TEPALAS ŽAIZDOMS IR NUDEGIMAMS GYDYTI

Išradimas priklauso medicinos sričiai, o būtent, farmacijos pramonei, ir susijęs su gydomųjų tepalų opoms ir žaizdoms gydyti gamyba.

Jau seniai yra žinomi įvairūs augalinės ir gyvulinės kilmės tepalai nudegimams ir žaizdoms gydyti, kurie naudojami dažniausiai kaip profilaktinė priemonė (žr. Lietuvos respublikos patentą Nr. 4227, TPK A 61 K 9/06, 1997m.). Kai odos pažeidimai yra dideli, opos įsisenėję arba infekuotos, būtina panaudoti ir antibiotikus.

Taip pat žinomas tepalas opoms, nudegimams ir žaizdoms gydyti pavadinimu "Sintomicino linimentas" (žr. Maškovskij M. D. Liekarstviennyje sriedstva, - M. Medicina, 1993, d. 2, p. 303-304. - Rus.), sudarytas iš veikliosios medžiagos – sintomicino (antibiotiko) – ir tepalo pagrindo – ricinos aliejaus, emulsiklio, sorbo rūgšties ir natrio karboksimetilceliuliozės. Jį gamina Kauno AB "Bakteriniai preparatai" ir vartoja lengvoms šiam vaistui jautrių bakterijų sukeltoms odos ligoms gydyti. Tepalu padengia pažeistą vietą kasdien arba kas antrą dieną.

Vaistus vartojant ilgai gali pasireikšti organizmo padidėjusio jautrumo reakcija, pažeidimo vietoje įsivyrėti sintomicinui atsparios bakterijos ir grybeliai, kurie labai apsunkina žaizdų ir opų gydymą. Jeigu infekcija išplinta į giliau esančius audinius ar po visą organizmą, lokalaus gydymo šiuo tepalu nepakanka – reikia papildomai vartoti sisteminio poveikio antimikrobinių vaistų. Vartojant kelis medikamentus vienu metu, gali susilpnėti vieno iš jų (arba abiejų) gydomasis poveikis arba sustiprėti šalutinis poveikis. Be to, žinomo tepalo pagrindas yra sunkiai nuvalomi nuo odos paviršiaus riebalai (nenuplaunami vandeniui).

Išradimo tikslas – padidinti gydymo efektyvumą.

Išradimo esmė yra ta, kad į tepalo žaizdoms ir nudegimams gydyti sudėtį papildomai įvesta veiklioji medžiaga metiluracilas, tepalo pagrindas yra makrogolis 1500 ir makrogolis 400, o tepalo sudėtis yra, g :

Veikliosios medžiagos :	chloramfenikolis	0,76
	metiluracilas	4,0
Tepalo pagrindas :	makrogolis 1500	19,04
	makrogolis 400	76,2

Chloramfenikolis (levomicetinas) ($C_{11}H_{12}Cl_2N_2O_5$) yra antibiotikas, naudojamas

kaip priešmikrobinė priemonė. Vaistas prasiskverbia per bakterijos ląstelės membraną ir slopina citoplazmos baltymų sintezę. Jį vartojant reikia reguliariai kontroliuoti kraujo sudėtį, nes gali sutrikti hemoglobino gamyba. Taip pat galimos alerginės reakcijos, kepenų funkcijos sutrikimai, pakenkimas nėštumui.

Metiluracilas ($C_5H_6N_2O_2$) skatina audinių epitelizaciją, turi priešuždegiminių savybių bei mažina žaizdų gijimo trukmę.

Makrogolis 1500 (polietilenoksidas 1500) yra kietas baltos spalvos hidroskopiškas sintetinis polimeras naudojamas kaip tepalo pagrindas gaminant vaistus.

Makrogolis 400 (polietilenoksidas 400) yra bespalvis klampus hidroskopiškas skystas sintetinis polimeras naudojamas kaip pagrindas gaminant vaistus.

Sintomicinas yra antibiotikas, kurio cheminė sudėtis analogiška levomicetinui. Tai – balti arba žalsvai gelsvi kartūs milteliai netirpstantys vandenyje.

Tepalo gamybos pavyzdys

Pasveria 19,04 g kieto makrogolio 1500 tepalo pagrindui ir išlydo jį ant vandens vonios 60° C temperatūroje. Po to pasveria 76,2 g makrogolio 400 tepalo pagrindui, iš kurio 10 g nupila į atskirą indą, kur skystame makrogolyje disperguoja 4 g veikliosios medžiagos metiluracilo. Išlydytą makrogolį 1500 sumaišo su likusiu 72,2 g skystu makrogoliu 400 ir gautame mišinyje ištirpina 0,76 g veikliosios medžiagos chloramfenikolio (antibiotiko). Visus komponentus supila į vieną indą maišo, kol pasidaro vienalytė masė, kurią atvėsina iki 35°C temperatūros ir gautą tepalą fasuoja į aliuminio tūbeles, kurias laiko tamsioje sausoje ir vėsioje vietoje. Tinkamumo trukmė - 2 metai. Tepalą vartoja išoriškai kaip priešmikrobinį ir priešuždegiminį vaistą žaizdoms ir nudegimams gydyti 3 – 4 kartus per dieną. Prieš tepant pažeistą vietą reikia nuplauti vandeniu ir leisti jai nudžiūti.

Analogiškai aprašytam tepalo gamybos pavyzdžiui buvo sudaryti keturi tepalų variantai su skirtingomis tepalo pagrindo komponentų masėmis (žr. 1 lentelę) ir keturi – su skirtingomis veikliųjų medžiagų komponentų masėmis (žr. 2 lentelę). Bendra komponentų masė kiekviename tepalo variante buvo 100 g. Atlikus 4 tyrimus su skirtingomis tepalo pagrindo komponentų masėmis (žr. 1 lentelę) paaiškėjo, kad :

1. Tepalo konsistencija per skysta, todėl ilgiau laikant išsisluoksniuoja (1 variantas).
2. Tepalo konsistencija per kieta naudojimui (2 variantas).
3. Tepalas neišsisluoksniuoja, tačiau truputį per skystas (3 variantas).

4. Tepalo konsistencija išlieka optimali visą laiką (4 variantas).

1 LENTELĖ

Variantų Nr.	Tepalo pagrindo komponentai, g :		Išvados :
	makrogolis 1500	makrogolis 400	
1.	18	77,24	Tepalo pagrindo konsistencija per skysta.
2.	20	75,24	Tepalo pagrindo konsistencija per kieta.
3.	19	76,24	Truputį per skysta.
4.	19,04	76,2	Tepalo konsistencija gera.

2 LENTELĖ

Variantų Nr.	Tepalo veikliųjų medžiagų komponentai, g		Išvados :
	chloramfenikolis	metiluracilas	
1.	1	3,76	Pablogėjo savijauta.
2.	0,26	4,50	Žaizda negijo.
3.	0,50	4,26	Per mažas antimikrobinis poveikis.
4.	0.76	4,0	Optimalus.

Ištirtos trys grupės žmonių per vieną savaitę (žr. 2 lentelę). I – oji grupė vartojo tepalą, kuriame buvo 1 g antibiotiko chloramfenikolio ir 3,76 g metiluracilo (1 variantas). Vienam ligoniui pradėjo svaigti galva dėl pablogėjusio hemoglobino. Kitiems silpnai gijo žaizdos dėl per lėtos audinių epitelizacijos. II – os grupės žmonėms, kurie gydėsi daugiau metiluracilo ir mažiau antibiotiko turinčiu tepalu (2 ir 3 variantai) dėl per mažo antimikrobinio poveikio žaizdos gijo silpnai. III – ioji grupė, kuri tepėsi gerai subalansuotu tepalu pagal išradimo apibrėžtį (4 variantas), jau po savaitės pajuto pagerėjimą.

Pareiškiamas tepalas žaizdoms ir nudegimams gydyti, palyginus jį su žinomu sintomicino tepalu, yra efektyvesnis, nes greičiau ir veiksmingiau gydo infekuotas, įsisenėjusias opas, gerai rezorbuojasi į audinius, lengvai nuplaunamas vandeniu, o opos greičiau epitelizuojasi.

IŠRADIMO APIBRĖŽTIS

Tepalas žaizdoms ir nudegimams gydyti, susidedantis iš veikliosios medžiagos ir tepalo pagrindo, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jo komponentai yra, g :

Veikliosios medžiagos :	chloramfenikolis	0,76
	metiluracilas	4,0
Tepalo pagrindas :	makrogolis 1500	19,04
	makrogolis 400	76,2