



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 103 993** ⁽¹³⁾ **C1**
(51) МПК⁶ **A 61 K 9/06//A 61 K 31/18**

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 96110661/14, 05.06.1996

(46) Дата публикации: 10.02.1998

(56) Ссылки: 1. Фармакопейная статья ВФС 42-519-76. Линимент стрептоцида 5%. Регламент на производство линимента стрептоцида 5%. Горьковский государственный химико-фармацевтический завод, 1976. 2. Машковский М.Д. Лекарственные средства. - М.: Медицина, 1984, с. 276.

(71) Заявитель:

Акционерное общество открытого типа
"Нижегородский химико-фармацевтический завод"

(72) Изобретатель: Николаенко Н.С.,
Эльнатанова М.И., Тарасенко В.П.

(73) Патентообладатель:

Акционерное общество открытого типа
"Нижегородский химико-фармацевтический завод"

(54) ЛИНИМЕНТ РАСТВОРИМОГО СТРЕПТОЦИДА 5%-НОГО

(57) Реферат:

Линимент растворимого стрептоцида 5%-ного предназначен для местного лечения инфицированных ран различной этиологии, поверхностных пиодермий, фолликулитов, фурункулов и других гнойно-воспалительных процессов. Состав линимента, мас. %:

стрептоцид растворимый 5, эмульгатор N 1 8-12, глицерин дистиллированный в качестве стабилизатора 25-35, вода дистиллированная - остальное. Новый линимент характеризуется термостабильностью при сохранении лечебных свойств. 1 табл.

RU 2 103 993 C1

RU 2 103 993 C1



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 103 993** ⁽¹³⁾ **C1**
(51) Int. Cl.⁶ **A 61 K 9/06//A 61 K 31/18**

RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: 96110661/14, 05.06.1996

(46) Date of publication: 10.02.1998

(71) Applicant:
Aksionernoe obshchestvo otkrytogo tipa
"Nizhegorodskij khimiko-farmatsevticheskij zavod"

(72) Inventor: Nikolaenko N.S.,
Ehl'natanova M.I., Tarasenko V.P.

(73) Proprietor:
Aksionernoe obshchestvo otkrytogo tipa
"Nizhegorodskij khimiko-farmatsevticheskij zavod"

(54) **LINIMENT OF 5-% SOLUBLE STREPTOCID**

(57) Abstract:

FIELD: pharmacy. SUBSTANCE: new liniment has the following components, wt.-%: soluble streptocid, 5; emulsifier N 1, 8-12; distilled glycerol as stabilizing agent, 25-35; and distilled water, the

balance. Liniment is used for local treatment of infected wounds, suppurative-inflammatory processes and other skin lesions. EFFECT: enhanced effectiveness of liniment, retained curative property. 1 tbl

RU 2 103 993 C1

RU 2 103 993 C1

Изобретение относится к фармацевтической промышленности и касается лекарственного средства, а именно, линимента растворимого стрептоцида 5%-ного. Линимент растворимого стрептоцида 5%-ного применяется при местном лечении инфицированных ран различной этиологии, поверхностных пиодермий, фолликулитов, фурункулов и других гнойно-воспалительных процессов.

Известен линимент стрептоцида 5%-ного, содержащий стрептоцид, эмульгатор N 1, рыбий и кашалотовый жир, бутилоксианизол, твин-80 или натрий карбоксиметилцеллюлозу (NaKMC) и воду дистиллированную при следующем содержании компонентов, мас. %: стрептоцид 5; эмульгатор N 1 5-6; рыбий жир или кашалотовый жир 34; бутилоксианизол 0,02; твин-80 или NaKMC 1,68; вода дистиллированная остальное [1].

Однако в известном линименте стрептоцид используется в виде пасты, которую предварительно готовят путем перемешивания стрептоцида с рыбьим жиром, что усложняет технологический процесс его получения. Кроме того, использование в данной композиции такого дефицитного сырья как рыбий жир значительно повышает себестоимость готового лекарственного средства.

Известен линимент растворимого стрептоцида 5%-ного, содержащий стрептоцид растворимый (пара-сульфамидобензоламинометан-сульфат натрия) 5 г, рыбий жир 34 г, эмульгатор, стабилизатор и вода дистиллированная до 100 [2].

Использование растворимого стрептоцида в данном линименте позволяет исключить предварительную стадию получения стрептоцидовой пасты, что упрощает технологический процесс.

Однако использование в данном препарате такого дефицитного сырья как рыбий жир тресковый, поставка которого с каждым годом затрудняется, приводит к высокой себестоимости готового препарата, что делает его производство экономически невыгодным.

Кроме того, использование в линименте, например, таких широко известных стабилизаторов, как твин-80 или натрий карбоксиметилцеллюлозы не обеспечивает сохранение качества препарата как при низких, так и при высоких температурах, а также при длительном хранении. Так, при замораживании препарата при минус 20°C и последующем оттаивании линимент расслаивается, и его однородная консистенция не восстанавливается, а при хранении даже в течение 6 мес на поверхности линимента образуется оранжевая окисная пленка, которую необходимо удалять при его использовании.

Задача изобретения - создание нового линимента растворимого стрептоцида 5%-ного при использовании дешевого и доступного сырья с высокой термостабильностью при сохранении лечебных свойств.

Задача решается тем, что линимент растворимого стрептоцида 5%-ного, содержащий стрептоцид растворимый, воду дистиллированную, включающую стабилизатор и эмульгатор, согласно

изобретению он содержит эмульгатор N 1, в качестве стабилизатора - глицерин дистиллированный при следующем соотношении компонентов, мас. %: стрептоцид растворимый 5; глицерин дистиллированный 25-35; эмульгатор N 1 8-12; вода дистиллированная остальное.

При этом используют глицерин дистиллированный по ГОСТ 6824-76, высшего или первого сорта.

Эмульгатор N 1 представляет собой сплавленную смесь высокомолекулярных спиртов кашалотового жира или синтетических жирных спиртов с натриевой солью сульфозэфиров таких же спиртов.

Использование в качестве стабилизатора глицерина дистиллированного позволило исключить из линимента такое дефицитное сырье как рыбий жир тресковый. Кроме того, его использование в композиции в сочетании с эмульгатором N 1 позволяет получать линимент с высокой термостабильностью, при этом отсутствует окисление линимента при длительном хранении (более 4 лет) с сохранением лечебного эффекта.

За счет высокой стабильности глицерина неограниченно смешиваться с водой сократилось время эмульгирования препарата. Весь процесс получения линимента растворимого стрептоцида 5%-ного протекает за 2,5 ч (известный - 6 ч).

Оптимальное содержание глицерина дистиллированного и эмульгатора определяет также качественные показатели линимента как стабильность и морозоустойчивость.

При содержании глицерина ниже 25 мас. % ухудшается морозоустойчивость, при замораживании линимента при температуре минус 20°C и последующем оттаивании препарат расслаивается и консистенция не восстанавливается. Увеличение содержания глицерина более 25 мас. % не приводит к улучшению показателей, а ведет к удорожанию препарата.

При содержании эмульгатор N 1 менее 8 мас. % получают нестабильный линимент, а при содержании более 12 мас. % он превращается в мазь и его намазывающая способность ухудшается.

Именно выбранные количественные соотношения глицерина дистиллированного в сочетании с эмульгатором позволяют получить линимент с высокой термостабильностью, однородной плотной консистенцией с длительным сроком хранения при сохранении лечебных свойств.

В таблице приведены примеры линимента растворимого стрептоцида 5%-ного с различным содержанием компонентов и свойства полученного препарата.

Технологический процесс получения линимента растворимого стрептоцида 5%-ного ведут в реакторе, снабженном рубашкой с паровым обогревом, якорной мешалкой и скоростной мешалкой типа ГАРТ-220.

Предварительно расплавляют эмульгатор N 1 при 85-90°C и тщательно перемешивают. Готовят раствор стрептоцида растворимого в дистиллированной воде путем перемешивания при 23-30 °C до полного его растворения.

В подогретый реактор приготовления линимента подают расплавленный

эмульгатор N 1 с температурой 85-90°C и водный раствор глицерина дистиллированного.

Смесь глицерина и эмульгатора тщательно перемешивают при 73-80°C. К полученной смеси загружают раствор стрептоцида растворимого с температурой 23-25°C и одновременно подают охлаждение в рубашку аппарата. После загрузки раствора стрептоцида растворимого включают скоростную мешалку ГАРТ-220 и эмульгируют смесь в течение 1 ч. Процесс эмульгирования осуществляют в вакууме от 0,02 до 0,06 МПа с целью получения линимента более плотной консистенции. По окончании эмульгирования выключают мешалку, снимают вакуум и определяют рН линимента, который должен быть от 4,5 до 7,5. Линимент с положительным анализом по рН при работающей якорной мешалке под вакуумом охлаждают до 25-30°C и подают на фасовку.

Описание полученного линимента стрептоцида растворимого 5%-ного. Линимент белого или белого с кремоватым оттенком цвета, со специфическим запахом. Срок хранения до 4,5 лет с сохранением микробной чистоты.

Пример 1. Клиническое изучение линимента стрептоцида растворимого 5%-ного на глицерине в 1 и 2 дерматологических отделениях Горьковского научно-исследовательского кожно-венерологического института.

Испытание проводилось на стационарных и амбулаторных больных, всего 93 человека. Возраст больных от 3 до 72 лет. Больные были с импетиго, фурункулами, вторичной пиодермией, экземой, осложненной пиодермией, эпидермофитией, дерматитами, ожогами второй степени от технических причин (уксусная или др. кислоты).

Линимент наносился непосредственно на ожоги, поражения под стерильную повязку. Перевязки производились ежедневно. Другого лечения ни общего, ни наружного больные не получали. Переносимость препарата была хорошей, ни у одного больного лечения не вызывало осложнений.

Наилучшие результаты были получены при лечении ожогов - через 3-4 дня отмечается активная эпителизация, быстро снимаются болевые ощущения, срок нетрудоспособности сокращается на 3-4 дня.

При поверхностной пиодермии и стафилодермии увядание процесса наступает через 4-5 дней. При экземе, эпидермофитии, вульгарной пузырьчатке осложненных пиодермией, чувство жжения исчезает на 2-3 день, воспалительные явления - 5-6 день. В те же сроки увядает острое воспаление при дермитах. Лечение трофических язв линиментом, хотя и длительное (до 2 мес), способствует скорейшей эпителизации язвы с образованием гладкого рубца. Очень хороший эффект был достигнут при лечении одного больного хейлитом уже через 3 дня исчезли краснота, шелушение, жжение.

Необходимо отметить, что линимент стрептоцида растворимого 5%-ного на глицерине сохраняет свою стабильность при длительном хранении при комнатной температуре.

Заключение. Линимент стрептоцида растворимого 5%-ного на глицерине является эффективным средством терапии ожогов,

пиодермических процессов на коже, а также хейлитов и трофических язв.

Пример 2. Клиническое изучение линимента стрептоцида растворимого 5%-ного на глицерине в Центральном научно-исследовательском кожно-венерологическом институте (г.Москва) совместно с МСЧ автозавода им.Лихачева и завода им.Ильича.

Препарат был испытан у 340 больных пиодермией. Из указанного числа больных у 40 человек была поверхностная форма пиодермии, у 200 - вскрывшиеся фурункулы и карбункулы, у 60 - вторичная пиодермия, осложнившая течение экземы и эпидермофиты, у 40 - инфицированные раны после оперативного удаления ногтей. Препарат ежедневно наносился 1-2 раза в день на очаг поражения под марлевую повязку.

Сдвиги в клинической картине наблюдались на 2-3 день лечения, проявляющиеся в уменьшении гнойного отделяемого, на 5-10 день наблюдалась эпителизация эрозий. Переносимость лечения была хорошей. Для сравнения лечебных свойств разработанного линимента параллельно было проведено лечение 30 больных линиментом стрептоцида 5%-ного на рыбьем жире.

Результаты показали наличие высоких лечебных свойств линимента стрептоцида растворимого 5%-ного на глицерине. Кроме того, предлагаемый линимент не вызывает раздражения, особенно у астматических больных в связи с отсутствием специфического запаха, присущего рыбьему тресковому жиру.

Заключение. Препарат эффективен и может быть рекомендован для применения в практике здравоохранения для лечения пиодермических процессов.

Таким образом, можно сделать вывод, что в клинической практике доказана эффективность использования предлагаемого линимента стрептоцида растворимого 5%-ного.

Проведение исследования показали, что линимент стрептоцида растворимого 5%-ного следующие технико-экономические преимущества.

Использование в качестве стабилизатора глицерина дистиллированного и эмульгатора N 1 и эффективный подбор их количественного соотношения в составе линимента позволило:

- повысить качество линимента стрептоцида растворимого 5%-ного, а именно, термостабильность, при этом полностью отсутствует его окисление при длительном хранении (более 4-х лет);

- исключить использование дефицитного сырья, такого как рыбий жир тресковый, что позволило снизить себестоимость препарата и сделать его производство экономически выгодным.

Формула изобретения:

Линимент растворимого стрептоцида 5%-ного, содержащий стрептоцид растворимый, воду дистиллированную и основу, включающую стабилизатор и эмульгатор, отличающийся тем, что он содержит эмульгатор N 1, а в качестве стабилизатора глицерин дистиллированный при следующем соотношении компонентов,

мас.

Стрептоцид растворимый 5
Глицерин дистиллированный 25 35

Эмульгатор N 1 8 12

Вода дистиллированная Остальноед

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

RU 2103993 C1

RU 2103993 C1

Таблица

Компонент	Состав линимента, мас. %		
	1	2	3
Стрептоцид растворимый	5	5	5
Глицерин дистиллированный	25	20	35
Эмульгатор № 1	8	10	12
Вода дистиллированная	до 100	до 100	до 100
Термостабильность: + 45 °С (в течение, 6 часов)	в нижнем слое наблюдается незначитель- ное отслаива- ние воды	однородная консистенция; расслоения нет	расслоения нет
- 20 °С с последующим по- степенным оттаиванием	незначительно е замерзание	не замерзает	не замерзает
Внешний вид	эмульсия жид- кая, частично стекает с раны	однородная легко намазы- вается на рану	однородная, текучести не наблюдается, ближе к мази

RU 2103993 C1

RU 2103993 C1