



(51) МПК  
**461K 31/167 (2006.01)**  
**461K 31/55 (2006.01)**  
**461K 31/045 (2006.01)**  
**461K 31/05 (2006.01)**  
**461P 23/02 (2006.01)**

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
 ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

**(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ**

Статус: не действует (последнее изменение статуса: 26.11.2020)  
 Пошлина: учтена за 13 год с 24.11.2016 по 23.11.2017

(21)(22) Заявка: **2004134196/15**, **23.11.2004**  
 (24) Дата начала отсчета срока действия патента:  
**23.11.2004**  
 (43) Дата публикации заявки: **10.05.2006** Бюл. № 13  
 (45) Опубликовано: **10.05.2008** Бюл. № 13  
 (56) Список документов, цитированных в отчете о  
 поиске: **RU 2198647 C2, 20.02.2003.**  
**МАШКОВСКИЙ М.Д. Лекарственные**  
**средства. Ч.1. - М.: Медицина, 1977, с.311.**  
**МАШКОВСКИЙ М.Д. Лекарственные**  
**средства. Ч.1. - М.: Медицина, 1977, с.349.**  
 Адрес для переписки:  
**129226, Москва, пр-кт Мира, 171, кв.19,**  
**Н.Ф.Давиденко**

(72) Автор(ы):  
**Полосин Алексей Викторович (RU)**  
 (73) Патентообладатель(и):  
**Общество с ограниченной**  
**ответственностью "Биоген Эстейт" (RU)**

**(54) МЕСТНОАНЕСТЕЗИРУЮЩЕЕ И АНТИСЕПТИЧЕСКОЕ СРЕДСТВО**

(57) Реферат:

Изобретение относится к лекарственным средствам, обладающим местно-анестезирующими, антисептическими и дезинфицирующими свойствами. Местно-анестезирующее и антисептическое средство содержит лидокаина гидрохлорид, ментол, воду очищенную, хлоргексидина биглюконат 20%, пропиленгликоль, гидроксид натрия и спирт этиловый при определенном соотношении компонентов. Изобретение обеспечивает повышение степени местного обезболивания и обеззараживания, а также расширение области применения и повышение удобства использования.

Изобретение относится к лекарственным средствам, обладающим антисептическими, местно-анестезирующими и дезинфицирующими свойствами.

Областью применения заявленного средства может являться стоматология, оториноларингология, акушерство, гинекология, урология, дерматовенерология, косметология. Кроме того, это средство может найти применение при операциях на кожных покровах и проведении рентгенографических исследований.

Известны многочисленные средства, обладающие антисептическим и местным анестезирующим действием. Например, к ним можно отнести средства обезболивания для осуществления способа по авторскому свидетельству СССР №1498496, включающему введение калипсола в сочетании с анемизирующими средствами и клофелин в сочетании с баралгином. Указанные средства используют преимущественно в послеоперационный период.

Известно лекарственное средство по авторскому свидетельству СССР №1502032, включающее пиритрамид в сочетании с адреноблокаторами и дополнительным введением тиопентал натрия и баралгина. Однако это средство применяется для общей анестезии.

Наиболее близким к заявленному является состав для местной анестезии в виде геля, содержащий гидрохлорид лидокаина, воду, ментол, метилцеллюлозу, глицерин, нипагин, нипазол (см. патент России №2198647). Это средство имеет анестезирующий эффект и бактерицидные свойства. Однако его нельзя признать полностью удовлетворяющим современным требованиям местной анестезии и антисептики. При его использовании отмечено ослабление болевых ощущений и снижение тричного инфицирования ран, однако нельзя говорить о полном обезболивании и отсутствии послеоперационных воспалений. Не обеспечивается обеззараживание точки укола перед местной анестезией. При инструментальном и эндоскопическом исследованиях перед введением зонда через рот или нос, при уретрокопии, интрахеальном наркозе, после проведения трахеотомии и в случае смены канюль не реализуется местное обеззараживание. При рентгенографическом исследовании введение зонда в желудок ведет к появлению рвотного рефлекса. При проведении хирургического вмешательства в ларингологии не обеспечивается одновременная местная анестезия и обеззараживание операционного поля. Затруднено местное обеззараживание в случае небольших хирургических вмешательств на влагалище и шейке матки. Подобные затруднения можно констатировать при анестезии слизистой и перед промыванием гайморовых пазух в оториноларингологии и стоматологии.

Таким образом, очевидна потребность в местно-анестезирующем и антисептическом средстве, обеспечивающем более высокую степень обезболивания и обеззараживания, более широкую область применения и большее удобство в использовании.

Технический результат, достигаемый при использовании настоящего изобретения, состоит в повышении степени местного обезболивания и обеззараживания, расширении области применения и повышении удобства.

Технический результат достигается за счет того, что в местно-анестезирующее и антисептическое средство, содержащее лидокаина гидрохлорид, ментол, воду очищенную, дополнительно введены хлоргексидина биглюконат 20%, пропиленгликоль, гидроксид натрия и этиловый спирт, при этом компоненты взяты в следующем соотношении, мг:

лидокаина гидрохлорид - 9000-11000;  
 хлоргексидина биглюконат 20% - 45-55;  
 пропиленгликоль - 9333-11407;  
 ментол - 45-55;  
 спирт этиловый 36608-39791;  
 гидроксид натрия - в количестве для обеспечения кислотности pH 5,-7,0;  
 вода очищенная - до 100 мл.

В настоящее время не известен состав с таким качественным и количественным содержанием компонентов.

Проведенные исследования показали, что сбалансированное воздействие заявленного средства с обеспечением указанного технического результата не достигается при механическом смешивании двух указанных основных компонентов: лидокаина гидрохлорида и хлоргексидина биглюконата 20%. Результатом такого рода соединения является получение кислой среды, что недопустимо из-за снижения лечебного эффекта. Установлено, что для лекарственного средства предпочтительна нейтральная среда. Для формирования нейтральной среды нами применялось традиционное средство в виде гидроксида натрия в количестве, необходимом для приведения среды к кислотности pH 5,0-7,0. Для того чтобы средство не растекалось с поверхности кожи и было удобно в использовании, применялась вязкая основа в виде пропиленгликоля, являющегося многоатомным веществом тяжелой воды и спирта. Помимо этого он обладает дополнительным лечебным заживляющим действием. Кроме этого, исследование показало необходимость введения в состав средства ментола. Ментол устраняет горький вкус получаемого состава, что особенно важно в стоматологии, кроме того ментол обеспечивает дополнительную местную анестезию и обладает легкими антисептическими свойствами. В качестве основной части введен ментол, последний не растворяется в воде. Для приведения получаемого средства к требуемым соотношениям при различных условиях среды использовалась вода очищенная. Аналогичным образом эмпирически были установлены диапазоны значений всех других компонентов данного средства. Таким образом, было обеспечено получение синергетического эффекта при применении этого лекарственного средства, а именно: наличие и соотношение всех использованных в нем компонентов обеспечило повышение местно-анестезирующих свойств, расширение области использования и удобство применения.

Характерной особенностью полученного средства является его сбалансированное воздействие на организм. При этом отмечено, что снижение значений составных частей средства ниже указанных в формуле изобретения границ диапазона приводит к снижению его эффективности в качестве местно-анестезирующего и антисептического средства. Превышение указанных верхних границ диапазонов вызывает нежелательные эффекты, обусловленные воздействием передозировки составных частей, а сбалансированное воздействие на организм в этом случае утрачивается.

Производство данного средства возможно в условиях обычного фармацевтического предприятия на стандартном оборудовании с обеспечением соответствующих технических условий и правил безопасности.

Состав получают следующим образом. В реактор из нержавеющей стали, оборудованный пропеллерной мешалкой, последовательно загружают компоненты композиции в указанных количествах и доводят смесь до степени однородности. Полученную массу выстаивают в течение 10 часов. Параметры состава, в частности значение pH, контролируют. Готовый продукт фасуют.

Заявленное средство оказывает местно-анестезирующее и антисептическое действие и вызывает терминальную анестезию. Местно-анестезирующее действие лидокаина гидрохлорида обусловлено угнетением нервной проводимости за счет блокады натриевых каналов в нервных окончаниях. Антисептическое действие хлоргексидина биглюконата проявляется в его активности в отношении большинства грамположительных и грамотрицательных аэробных бактерий, трепонем, гонококков, трихомонад. Действие препарата проявляется через 1 минуту после нанесения на слизистые оболочки или кожу и сохраняется на протяжении 5-15 минут. Местно-анестезирующий эффект и субъективное ощущение онемения прекращаются постепенно примерно за 15-20 минут.

При местном применении на слизистых оболочках степень всасывания лидокаина гидрохлорида различна и зависит от дозы, места применения и кровоснабжения слизистой оболочки.

После нанесения препарата на слизистую оболочку верхних дыхательных путей часть препарата проглатывается с последующей инактивацией в желудочно-кишечном тракте. Значительно меньшее количество лидокаина проникает через слизистую в системный кровоток. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 10-20 минут. Лидокаин метаболизируется в печени с образованием двух фармакологически активных метаболитов. Выводится с мочой в виде метаболитов. Хлоргексидин биглюконат при местном применении практически не всасывается, так как используется в минимальных терапевтических концентрациях, его системное воздействие минимально.

Данное средство применялось в ряде клиник различного профиля и показало хорошие результаты, констатированные медперсоналом и самими пациентами. В частности, успешное применение было отмечено в стоматологической клинике: при местном обезболивании и обеззараживании точки укола перед местной анестезией, в случае вскрытия поверхностных абсцессов, удаления качающихся молочных зубов и осколков костей, при наложении швов на слизистую оболочку, при фиксации коронок и мостов, при лечении воспаления десен, парадонтопатий, при удалении зубного камня, при экстирпации увеличенного межзубного сосочка, при изготовлении оттисков зубного ряда только в случае использования эластичного материала, при рентгенографическом исследовании, для устранения тошноты и глоточного рефлекса.

В отделении оториноларингологии средство использовалось при проведении коагуляции с помощью электрокаутера при лечении носовых кровотечений, при операциях на носовой перегородке и удалении полипов носа, а также с целью устранения глоточного рефлекса и обезболивании и обеззараживания места введения инъекционной иглы перед удалением миндалин, при вскрытии перитонзиллярных абсцессов и перед проколом гайморовой пазухи (только в качестве дополнительной анестезии), для анестезии перед операцией перед промыванием гайморовых пазух. При применении препарата перед операцией на глотке или носоглотке следует учесть, что в результате полного устранения глоточного рефлекса препарат, попадая в гортань и трахею, препятствует кашлевому рефлексу и может вызвать бронхоспазм.

Вследствие этого при удалении миндалин и при аденомотомии не рекомендуется его применение для местного обезболивания у детей до 8 лет из-за учащенного рефлекса глотания.

Средство использовано при инструментальном и эндоскопическом обследовании перед введением зонда через рот или нос (дуоденальное зондирование и дробное исследование желудочной секреции), при ректоскопии, интрахеальном наркозе, после проведения трахеотомии и в случае смены канюли, в акушерстве и гинекологии для обезбоживания промежности в ходе проведения эпизиотомии и обработке разреза. В отделениях общей хирургии, гинекологии, дерматологии успешно использование средства имело место при удалении швов, для обезболивания и дезинфекции поля при небольших операциях на влагалище или шейке матки, при обработке ניתвеного нагноения, для обезболивания и обеззараживания при небольших хирургических вмешательствах на кожных покровах. Имеются многочисленные положительные отзывы специалистов.

Один из примеров: средство использовалось в косметологии при проведении косметологических операций, мануэляций и показало прекрасные результаты. При обработке области губ, губ, и известно, является наиболее болезненной, пациенты вовсе не отмечали болезненных ощущений и при повторных инъекциях просили об обезболивании именно этим средством. Такой же эффект имел место в стоматологии при обработке пораженных десен, при проведении эндоскопических исследований и т.д.

Однако следует иметь в виду, что при нанесении средства может ощущаться слабое жжение, которое прекращается после наступления анестезии (в течение 1 мин). Редко могут возникать аллергические реакции (кожная сыпь, зуд, анафилактический шок). Чрезвычайно редко могут наблюдаться побочные реакции со стороны центральной нервной системы, головная боль, головокружение, беспокойство, нарушение зрения, депрессия, а также со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипертония, брадикардия, судороги, тремор. Противопоказаниями для данного средства являются повышенная чувствительность к лидокаину гидрохлориду, хлоргексидина биглюконату или другим компонентам препарата, синдром слабости синусового узла у больных пожилого возраста, атриовентрикулярная блокада II и III степени (за исключением случаев, когда введен зонд для стимуляции желудочков), кардиогенный шок, выраженные нарушения функции печени, тяжелая миастения, наличие в анамнезе эпилептических судорог.

Препарат следует осторожно принимать у больных, которые принимают β-адреноблокаторы (усиление противоритмического действия), блокаторы нейромускулярной передачи (возможное усиление действия последних), седативные препараты (усиления седативного эффекта), прокаиномид (галлюцинации), фенитонин (при его внутривенном введении, возможно угнетение атриовентрикулярной проводимости). Под влиянием ингибиторов моноаминоксидазы вероятно усиление местно-анестезирующего действия лидокаина.

Как ясно следует из вышесказанного, заявленное местно-анестезирующее и антисептическое средство, характеризующееся количеством и качественным составом его компонентов, позволяет получать технический результат, выраженный в повышении местно-анестезирующего эффекта, расширении области применения и повышении удобства использования.

**Формула изобретения**

Местноанестезирующее и антисептическое средство, содержащее лидокаина гидрохлорид, ментол, воду очищенную, пропиленгликоль, гидроксид натрия и спирт этиловый, при этом компоненты взяты в следующем соотношении:

|                              |   |
|------------------------------|---|
| лидокаина гидрохлорид        | 9000-11000 мг                                       |
| хлоргексидина биглюконат 20% | 45-55 мг  |
| пропиленгликоль              | 9333-11407 мг                                       |
| ментол                       | 45-55 мг  |
| спирт этиловый               | 36608-39791 мг                                      |
| гидроксид натрия             | в количестве для обеспечения кислотности pH 5,0-7,0 |
| вода очищенная               | до 100 мл   |

**ИЗВЕЩЕНИЯ**

**MM4A Досрочное прекращение действия патента из-за неуплаты в установленный срок пошлины за поддержание патента в силе**

Дата прекращения действия патента: **24.11.2015**Дата публикации: **27.06.2016****NF4A Восстановление действия патента**Дата, с которой действие патента восстановлено: **10.07.2016**Дата внесения записи в Государственный реестр: **16.06.2016**Дата публикации: **10.07.2016****PC4A Государственная регистрация договора об отчуждении исключительного права**Дата и номер государственной регистрации договора: **25.07.2016 P/0202464**

(73) Патентообладатель(и):

**Открытое акционерное общество Научно-производственный центр "Биоген" (RU)**

Приобретатель исключительного права:

**Открытое акционерное общество Научно-производственный центр "Биоген" (RU)**

Лицо(а), передающее(ие) исключительное право:

**Общество с ограниченной ответственностью "Биоген Эстейт" (RU)**

Адрес для переписки:

**129226, Москва, пр-кт Мира, 171, кв. 19, Н.Ф. Давиденко**Дата внесения записи в Государственный реестр: **25.07.2016**Дата публикации: **10.08.2016**

**MM4A Досрочное прекращение действия патента из-за неуплаты в установленный срок пошлины за поддержание патента в силе**

Дата прекращения действия патента: **24.11.2017**Дата внесения записи в Государственный реестр: **22.08.2018**Дата публикации и номер бюллетеня: **22.08.2018 Бюл. №24**