



УКРАЇНА

(19) UA (11) 26426 (13) U
(51) МПК (2006)
A61K 35/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ЗАСТОСУВАННЯ ЕТАПЕРАЗИНУ-ПРОЛОНГ ІН'ЄКЦІЙНОГО ЯК РЕЧОВИНИ З ПРОТИБЛЮВОТНИМИ ВЛАСТИВОСТЯМИ

1

2

(21) u200703176

(22) 26.03.2007

(24) 25.09.2007

(46) 25.09.2007, Бюл. № 15, 2007 р.

(72) Ананько Світлана Яківна

(73) ХАРКІВСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ
УНІВЕРСИТЕТ

(57) Застосування етаперазину-пролонг ін'єкційно-
го як речовини з протиблювотними властивостями.

Корисна модель відноситься до медицини, а саме до клінічної фармакології, і може бути використаною в медичних технологіях, які потребують нейролептиків фенотіазинового ряду.

В спектр фармакологічної дії нейролептиків цієї групи входить дія на умовні рефлекси, вплив на локомоторну функцію, антисептична та седативна дія, протиблювотний ефект та здатність усувати гикавку, виражена м'язово-послаблююча дія, потенціювання дії снодійних, наркотичних та інших речовин, які впливають на центральну нервову систему, здатність обмеження абстинентного синдрому при протиалкогольному лікуванні [Авруцкий Г.Я., Недува А.А. Лечение психических больных. - М.: Медицина, 1981. - 496 с; Гамбург А.Л., Аранович А.Г., Вольфсон В.Л. Дифференцированное лечение больных хроническим алкоголизмом современными психотропными средствами // Журн. невропатологии и психиатрии им. С.С. Корсакова. - 1978. - Т. 78, №2. - С. 269-273.].

Відомо, що один із найбільш сильних протиблювотних ефектів має аміназин, який є одним із основних представників нейролептиків [Машковский М.Д. Пособие по фармакотерапии для врачей. - М.: Медицина, 1985. - С. 49-50.; Райский В.А. Психотропные средства в клинике внутренних болезней. - М.: Медицина, 1988. - 256 с].

Теперішнього часу в якості протиблювотного засобу використовують етаперазин в пігулках, протиблювотна дія якого в 20 разів перевершує дію аміназина [Райский В.А. Психотропные средства в клинике внутренних болезней. - М.: Медицина, 1988. - 256 с.] і який є представником нейролептиків.

Етаперазин є одним із небагатьох засобів, які використовують для усунення невимовної блювоти

та гикавки різного генезу. Він швидко ліквідує психічні явища, купірує нудоту та блювоту при хірургічних втручаннях на черевній порожнині, при променевій хворобі, при хіміотерапії новоутворень, тощо [Машковский М.Д. Пособие по фармакотерапии для врачей. - М.: Медицина, 1985.].

Даний засіб є найбільш близьким до того, що заявляється по технічній суті та результату, який може бути досягнутим, тому його обрано в якості прототипу.

Головним недоліком прототипу є необхідність декілька разового в перебігу доби прийому пігулок, що може поглиблювати блювотний та нудотний рефлекс.

У зв'язку з вищевикладеним, в основу корисної моделі покладено задачу підвищення лікувального ефекту та подовження лікувальної дії засобу.

Задачу, яку покладено в основу корисної моделі, вирішують тим, що в якості протиблювотної речовини використовують етаперазин-пролонг ін'єкційний.

Етаперазин-пролонг ін'єкційний (ЕПІ) використовують у режимі 1 раз в 3 доби [Кожухова Т.В. Исследование возможности получения пролонгированного раствора этаперазина // МРЖ. - 1979. - р. 22. - №10. - Деп. в ВНИИМИ Д-2317, публикация 1498; Кожухова Т.В. Получение и исследование лекарственных форм этаперазина для инъекций: Автореф. дис.... канд. фарм. наук. - М., 1983. - 20 с]. Це дозволяє досягнути більш високого і подовженого лікувального ефекту в порівнянні не тільки до пігулок цього засобу, а й в порівнянні з іншими засобами, що мають протиблювотну дію.

Протиблювотна дія етаперазин-пролонг ін'єкційного вивчалася на моделі апоморфінової блювоти з порівнянням цієї ж дії з етаперазином-

(19) UA (11) 26426 (13) U

субстанцією. Після введення апоморфіну гідрохлориду через 5-7хв. у 100% тварин контрольної групи (ізотонічний розчин хлориду натрію) з'являлися мимовільні плювальні рухи, що імітували у щурів блювоту. При введенні етаперазина-субстанції протиблювотна дія спостерігалася про-

тягом 6 годин після введення. У тварин, що одержували навіть однократно етаперазин-пролонг ін'єкційний, щоденне введення апоморфіну гідрохлориду викликало аналогічну "блювотну" реакцію тільки через 72 години. Описані вище дані представлені в таблиці 1.

Таблиця 1

Протиблювотна активність ЕПІ (порівняльно з етаперазином-субстанцією) у щурів на моделі апоморфінової блювоти

Умови досліджу	Кількість спостер.	Поява блювоти, викликані апоморфіном гідрохлоридом у тварин в % через:			
		5-7 хв.	6 годин	48 годин	72 години
Ізотонічний розчин хлориду натрію	10	100	100	100	100
Етаперазин-субстанція	10	0 P<0,05	100	100	100
Етаперазин-пролонг ін'єкційний	10	0 P<0,05	0 P<0,05	0 P<0,05	100

Протиблювотна активність етаперазин-пролонг ін'єкційного у порівнянні з етаперазином-субстанцією вивчалася також на моделі променевої хвороби.

Променева хвороба в щурів виявлялася млявістю, адинамією, гнобленням харчової активності.

Тварини ставали неохайними, шерсть втрачала блиск. У 100% випадків виникала "блювота" у виді мимовільних плювальних рухів. При цьому в периферичній крові різко зменшувалася кількість лейкоцитів. Результати експерименту представлені в таблиці 2.

Таблиця 2

Протиблювотна активність ЕПІ (порівняльно з етаперазином-субстанцією) у щурів на моделі променевої хвороби

Умови досліджу	Кількість спостер.	Поява блювоти, викликані опроміненням у тварин в % через:			
		5-7 хв.	6 годин	48 годин	72 години
Ізотонічний розчин хлориду натрію	10	100	100	100	100
Етаперазин-субстанція	10	0 P<0,05	100	100	100
Етаперазин-пролонг ін'єкційний	10	0 P<0,05	0 P<0,05	100	100

В цій моделі етаперазин-пролонг ін'єкційний повністю попереджує у щурів появу блювоти, при цьому дія етаперазин-пролонг ін'єкційного зберігається в перебігу 48 годин. Під впливом етаперазина-субстанції захисна протиблювотна дія зберігається тільки протягом перших 6 годин експерименту.

Таким чином, етаперазин-пролонг ін'єкційного властива протиблювотна активність, яка викликана гнобленням блювотного центра центральної нервової системи, що проявляється на фоні блювоти, викликані променевим пошкодженням та апоморфіном гідрохлориду та яка перевищує аналогічну активність етаперазина-субстанції.