



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **60086** (13) **U**
(51) МПК
A61K 31/195 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під
відповідальність
власника
патенту

(54) СПОСІБ ЗБІЛЬШЕННЯ БОЛЬОВОГО ПОРОГА

1

(21) u201013789

(22) 19.11.2010

(24) 10.06.2011

(46) 10.06.2011, Бюл.№ 11, 2011 р.

(72) ГАММА ТЕТЯНА ВІКТОРІВНА, КОРЕНЮК
ІВАН ІВАНОВИЧ, КУР'ЯНОВ ВОЛОДИМИР ОЛЕ-
ГОВИЧ, ХУСАІНОВ ДЕНИС РАШИДОВИЧ, ЧУПА-
ХІНА ТЕТЯНА ОЛЕКСАНДРІВНА, ШАПОВАЛОВА
ГАННА ОЛЕКСАНДРІВНА

2

(73) ТАВРІЙСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИ-
ТЕТ ІМ. В.І. ВЕРНАДСЬКОГО

(57) Спосіб збільшення больового порога, що
включає внутрішньочеревне введення в організм
тварин аналгетичної речовини, викликання болю
електричною стимуляцією, вимір сили струму, при
якій виникає больова реакція, який **відрізняється**
тим, що вводять N-[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-О-
ацетил-β-D-глюкопіранозилокси)-бензоїл]-гліцин
об'ємом 0,2-0,25 мол у дозах 25-50 мг/кг.

Корисна модель відноситься до області фізіоло-
гії й фармакології, однієї із проблем яких є ви-
вчення й вплив біологічно активних речовин на
болючу чутливість.

Найближчим аналогом корисної моделі вибран-
ий спосіб підвищення больового порога (БП) ана-
льгіном [Машковский М. Д. Лікарські засоби: В 2-х
т. - М: Медицина, 2000. - Т. 1. - 624с.; Вейн А.М.,
Авруцкий М.Я. Біль і знеболювання // М.: Медици-
на. - 1997. - 280с.], який містить виклик болю елек-
тричною стимуляцією, внутрішньочеревне введен-
ня анальгину й вимір сили струму, при якій виникає
больова реакція.

Основним недоліком цього способу є відносно
мала ефективність.

В основу корисної моделі поставлене завдан-
ня вдосконалити спосіб збільшення больового
порога (БП) шляхом введення в організм тварин
N-[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-О-ацетил-β-D-
глюкопіранозилокси)-бензоїл]-гліцин.

Поставлене завдання вирішується тим, що в
способі збільшення больового порога, що включає
внутрішньочеревне введення в організм тварин
аналгетичної речовини, виклик болю електричною
стимуляцією, вимір сили струму, при якій виникає
больова реакція, згідно з корисною моделлю, уво-
дять N-[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-О-ацетил-β-D-
Глюкопіранозилокси)-бензоїл]-гліцин об'ємом 0,2-
0,25 мол у дозах 25-50 мг/кг, що забезпечує під-
вищення БП, яке перевершує по силі анальгін.

Спосіб реалізується таким чином.

Контрольній й дослідній групам щурів-самців
(вагою 200-250 г) однократно за 30 хв. до початку
тестування вводили відповідно фізіологічний роз-
чин, анальгін (міжнародна й хімічна назви: мета-
мизол натрію, metamizole sodium; [(1,5-диметил-3-
оксо-2-феніл-2,3-дігідро-1H-піразол-4-іл)-N-
метиламіно]-метансульфонату - 5 мг/кг) і розчин N-
[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-О-ацетил-β-D-
глюкопіранозилокси)-бензоїл]-гліцину в дозах 25,
50 і 100 мг/кг. Усі розчини речовин вводили внут-
рішньочеревно об'ємом 0,2-0,25 мол. Визначення
наявності аналгетичних властивостей сполуки
здійснювалося з використанням тесту "Електрос-
тимуляція". Через 30 хвилин тварин по одній роз-
міщали в експериментальній установці й починали
вимір сили струму, яка обумовлювала больову
реакцію. Ефективність аналгетичної дії визначала-
ся класично: за зростанням показника сили стру-
му.

Порівняння аналгетичної дії фармпрепарату
анальгину й різних доз N-[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-
О-ацетил-β-D-глюкопіранозилокси)-бензоїл]-
гліцину на БП тварин у тесті «Електростимуляція»
наведене на фіг., на якому жирною лінією позна-
чений рівень контролю, пунктирною - значення БП
при ін'єкції анальгину (Примітка: * - $p < 0,05$; ** - $p < 0,01$, p - рівень вірогідності відносно контролю. # -
 $p < 0,05$ - рівень вірогідності відносно анальгину).

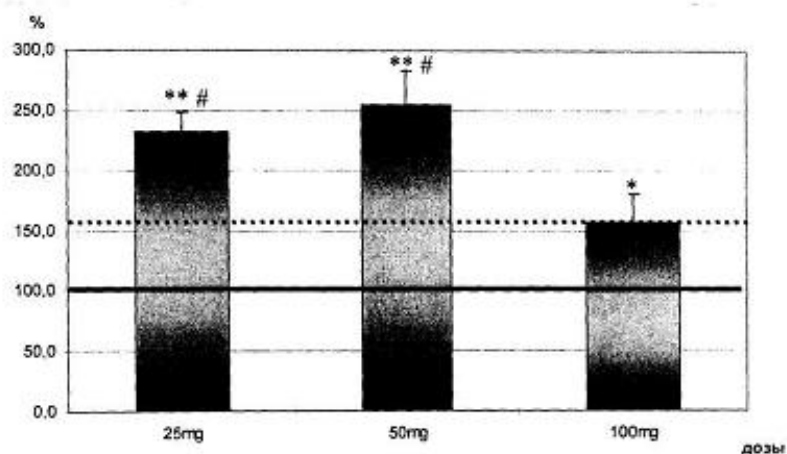
Після ін'єкції N-[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-О-
ацетил-β-D-глюкопіранозилокси)-бензоїл]-гліцину
у дозі 25 мг/кг відбувалося різке збільшення рівня
БП у середньому на 130 % ($p < 0,01$) відносно кон-

(13) **U**
(11) **60086**
(19) **UA**

трольної групи й на 60-70 % - відносно анальгін. У дозі 50 мг/кг дія N-[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-О-ацетил-β-D-глюкопіранозилокси)-бензоїл]-гліцину була максимальною у порівнянні із застосовуваними дозами, тобто, при даній дозі речовини рівень БП збільшувався в 2,5 рази відносно контролю й в 1,5-2 рази перевищував такий при ін'єкції анальгін. Зі збільшенням дози до 100 мг/кг відбувається "ослаблення" аналгетичних властивостей

N-[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-О-ацетил-β-D-глюкопіранозилокси)-бензоїл]-гліцину, тобто значення БП при дії речовини в цій дозі не перевищували анальгін.

Таким чином, N-[2-(2-ацетамідо-3,4,6-три-О-ацетил-β-D-глюкопіранозилокси)-бензоїл]-гліцин при системному введенні в дозах 25 - 50 мг/кг надає більш вираженої аналгетичної дії ніж анальгін і забезпечує більшу ефективність способу.



Фіг.