



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **61990** (13) **U**
(51) МПК
A61K 31/145 (2006.01)МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ**ОПИС**
ДО ПАТЕНТУ
НА КОРИСНУ МОДЕЛЬвидається під
відповідальність
власника
патенту**(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ПРОТИАЛКОГОЛЬНОГО ТА ПРОТИНАРКОТИЧНОГО ЗАСОБУ ДЛЯ ІН'ЄКЦІЙ "НАЛТРЕКСОН"**

1

2

(21) u201015939

(22) 30.12.2010

(24) 10.08.2011

(46) 10.08.2011, Бюл.№ 15, 2011 р.

(72) СОБЕТОВ БОРИС ГЕОРГІЙОВИЧ, НОВІКОВ ВОЛОДИМИР ПАВЛОВИЧ, ШИЯНЕНКО ОЛЕКСАНДР ЄВГЕНОВИЧ, ЗАЯРНЮК НАТАЛІЯ ЛЕОНІДІВНА, ГАСС ВІКТОРІЯ БОРИСІВНА, ГАСС РОМАН СТАНІСЛАВОВИЧ, БАБІЙ СВІТЛАНА ВОЛОДИМИРІВНА

(73) СОБЕТОВ БОРИС ГЕОРГІЙОВИЧ, НОВІКОВ ВОЛОДИМИР ПАВЛОВИЧ, ШИЯНЕНКО ОЛЕКСАНДР ЄВГЕНОВИЧ, ЗАЯРНЮК НАТАЛІЯ ЛЕОНІДІВНА, ГАСС ВІКТОРІЯ БОРИСІВНА, ГАСС РОМАН СТАНІСЛАВОВИЧ, БАБІЙ СВІТЛАНА ВОЛОДИМИРІВНА

(57) 1. Спосіб одержання протиалкогольного та протинаркотичного засобу для ін'єкцій, що включає приготування розчину лікарської форми шляхом розчинення дисульфіраму в 100%-вому диметилсульфоксиді з подальшим фільтруванням та ампулюванням, який **відрізняється** тим, що перед фільтруванням в розчин додатково вносять суспензію налтрексону та полівінілпіролідону в диметилсульфоксиді, і суспензію налтрексону та полівінілового спирту в диметилсульфоксиді, при співвідношенні (1,0-3,0):(0,5-1,5):(0,5-1,5), отримують розчин при наступному співвідношенні складових інгредієнтів, % мас.:

налтрексон 8,0-12,0

дисульфірам 10,0-15,0
полівінілпіролідон 0,25-1,25
полівініловий спирт 0,25-1,25
диметилсульфоксид решта.2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що суспензію налтрексону та полівінілпіролідону в диметилсульфоксиді готують шляхом додавання до диметилсульфоксиду спочатку полівінілпіролідону, перемішування, нагрівання до 30-50°C, витримування до повного розчинення, потім налтрексону при постійному перемішуванні і температурі 30-50°C, отримують суспензію при наступному співвідношенні складових інгредієнтів, % мас.:налтрексон 16,0-24,0
полівінілпіролідон 1,0-5,0
диметилсульфоксид решта.3. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що суспензію налтрексону та полівінілового спирту в диметилсульфоксиді готують шляхом додавання до диметилсульфоксиду спочатку полівінілового спирту, перемішування, нагрівання до 30-50°C, витримування до повного розчинення, потім налтрексону при постійному перемішуванні і температурі 30-50°C, отримують суспензію при наступному співвідношенні складових інгредієнтів, % мас.:налтрексон 16,0-24,0
полівініловий спирт 1,0-5,0
диметилсульфоксид решта.

Корисна модель відноситься до медицини, а саме до наркології та може бути використана як сенсibilізуючий до алкоголю та до наркотиків засіб пролонгованої дії при лікуванні алкогольної та наркотичної залежності.

Відомі способи одержання протиалкогольних засобів для ін'єкцій на основі дисульфіраму шляхом змішування його з придатною для ін'єкцій речовиною.

Відомий спосіб одержання протиалкогольного засобу для ін'єкцій шляхом розчинення дисульфі-

раму в 100%-вому параальдегіді при співвідношенні 1:8 (патент UA 25842 C2).

Відомий спосіб одержання протиалкогольного засобу для ін'єкцій, що включає змішування дисульфіраму з кісточковою олією до одержання 7%-вого розчину з подальшою фільтрацією та ампулюванням (авт. свідоцтво №390811). Готовий продукт, отриманий за даним способом, не має пролонгованої дії, курс лікування складає 13-15 ін'єкцій.

Недоліком зазначених способів є підвищена токсичність готового продукту.

(13) **U**(11) **61990**(19) **UA**

Відомий спосіб одержання протиалкогольного та протинаркотичного засобу для ін'єкцій, що включає приготування розчину лікарської форми шляхом розчинення дисульфіраму в 100%-вому диметилсульфоксиді з подальшим фільтруванням та ампулюванням (патент RU 2013090 C1).

Готовий продукт, одержаний за зазначеним способом має виражену лікувальну дію при хронічному алкоголізмі та слабку дію при лікуванні опійної наркоманії.

Задачею корисної моделі є одержання протиалкогольного та протинаркотичного засобу для ін'єкцій, в якому за рахунок багатостадійності технологічного процесу досягається синергізм діючих речовин в готовому продукті та забезпечується підвищений лікувальний ефект і висока пролонгована дія при лікуванні хронічного алкоголізму та наявність високого лікувального ефекту при опійній наркоманії.

Поставлена задача вирішується способом одержання протиалкогольного та протинаркотичного засобу для ін'єкцій, що включає приготування розчину лікарської форми шляхом розчинення дисульфіраму в 100%-вому диметилсульфоксиді з подальшим фільтруванням та ампулюванням, в якому згідно корисній моделі, перед фільтруванням в розчин додатково вносять суспензію налтрексону та полівінілпіролідону в диметилсульфоксиді, і суспензію налтрексону та полівінілового спирту в диметилсульфоксиді, при співвідношенні: (1,0-3,0):(0,5-1,5):(0,5-1,5), отримують розчин при наступному співвідношенні складових інгредієнтів, % мас:

налтрексон	8,0-12,0
дисульфірам	10,0-15,0
полівінілпіролідон	0,25-1,25
полівініловий спирт	0,25-1,25
диметилсульфоксид	решта,
суспензію налтрексону та полівінілпіролідону в	

диметилсульфоксиді готують шляхом додавання до диметилсульфоксиду спочатку полівінілпіролідону, перемішування, нагрівання до 30°C-50°C, витримання до повного розчинення, потім налтрексону при постійному перемішуванні і температурі 30°C-50°C, отримують суспензію при наступному співвідношенні складових інгредієнтів, % мас:

налтрексон	16,0-24,0
полівінілпіролідон	1,0-5,0
диметилсульфоксид	решта,
суспензію налтрексону та полівінілового спирту в	

диметилсульфоксиді, готують шляхом додавання до диметилсульфоксиду спочатку полівінілового спирту, перемішування, нагрівання до 30°C-50°C, витримання до повного розчинення, потім налтрексону при постійному перемішуванні і температурі 30°C-50°C, отримують суспензію при наступному співвідношенні складових інгредієнтів, % мас:

налтрексон	16,0-24,0
полівініловий спирт	1,0-5,0
диметилсульфоксид	решта.

Особливістю зазначеного способу є його багатостадійність, завдяки якій сировина і матеріали

перетворюються в готовий продукт з заданими якісними і кількісними параметрами.

Одержаний за наведеним способом засіб містить дві діючі речовини одночасно: дисульфірам та налтрексон, що забезпечує:

- зниження рівня патологічного потягу до психоактивних речовин - алкоголю і наркотикам;
- звільнення від подальшого приймання додаткових снодійних, психотропних речовин, антидепресантів та транквілізаторів;
- формування стійкої терапевтичної ремісії;
- покращення якості життя пацієнтів, які страждають на наркоманію та алкоголізм;
- успішне поєднання засобу з тривалими реабілітаційними програмами.

Наведений спосіб одержання протиалкогольного та протинаркотичного засобу для ін'єкцій, забезпечує синергізм діючих речовин, які входять в засіб, що приводить до високого лікувального ефекту при хронічному алкоголізмі та опійній наркоманії та пролонгованої дії засобу терміном до одного місяця та безпечність у вживанні, тощо.

Спосіб здійснюють в декілька стадій.

Перша стадія включає приготування суспензії налтрексону та полівінілпіролідону в диметилсульфоксиді та приготування суспензії налтрексону та полівінілового спирту в диметилсульфоксиді. Для цього використовують два реактора.

В один реактор завантажують диметилсульфоксид, вмикають перемішування, потім завантажують полівінілпіролідон, при постійному перемішуванні отриману масу нагрівають до 30°C-50°C та витримують до повного розчинення. Після розчинення полівінілпіролідону через люк порційно при постійному перемішуванні і температурі 30°C-40°C завантажують налтрексон. Перемішують реакційну масу до отримання однорідної суспензії.

Одночасно в другий реактор завантажують диметилсульфоксид, вмикають перемішування, потім завантажують полівініловий спирт, при постійному перемішуванні отриману масу нагрівають до 30°C-50°C та витримують до повного розчинення. Після розчинення полівінілового спирту через люк порційно при постійному перемішуванні і температурі 30°C-50°C завантажують налтрексон. Перемішують реакційну масу до отримання однорідної суспензії.

Друга стадія включає розчинення дисульфіраму в 100%-вому диметилсульфоксиді. Для цього в третій реактор завантажують диметилсульфоксид, вмикають перемішування, при постійному перемішуванні завантажують дисульфірам, отриману масу нагрівають до 30°C-50°C та витримують до повного розчинення дисульфіраму.

Третя стадія включає приготування розчину лікарської форми шляхом додавання до розчину дисульфіраму в 100%-вому диметилсульфоксиді суспензії налтрексону та полівінілпіролідону в диметилсульфоксиді та суспензії налтрексону та полівінілового спирту в диметилсульфоксиді. Для цього в третій реактор при постійному перемішуванні і температурі 30°C-50°C за допомогою стислого повітря з першого і другого реакторів перетискають підготовлені суспензії і продовжують перемішування до одержання прозорого розчину.

Готовий розчин подають на фільтрацію та ампулювання.

Приклади конкретного виконання.

Приклад 1.

Дисульфідрам в кількості 20г змішують з 80,0мл диметилсульфоксиду, нагрівають при перемішуванні до 40°C-50°C до повного розчинення. До 1,0г полівінілпіролідону додають 34,5мл диметилсульфоксиду, залишають для набухання, нагрівають до 30°C-40°C при постійному перемішуванні до повного розчинення, порційно при постійному перемішуванні додають 8,0г налтрексону до одержання однорідної суспензії. До 1,0г полівінілового спирту додають 34,5мл диметилсульфоксиду, залишають для набухання, нагрівають до 35°C-40°C при постійному перемішуванні до повного розчинення, порційні при постійному перемішуванні додають 8,0г налтрексону до одержання однорідної суспензії. Змішують одержані суміші при постійному перемішуванні, нагрівають при температурі 40°C-45°C до повного розчинення. Одержаний розчин фільтрують та ампулюють.

Приклад 2.

До 325мл димексиду при інтенсивному перемішуванні поступово додають 7,875г полівінілового спирту і 52,5г налтрексону, перемішують при 50°C до утворення однорідної суспензії. До 325мл димексиду при інтенсивному перемішуванні поступово додають 7,875г полівінілпіролідону і 52,5г налтрексону, перемішують при 50°C до утворення однорідної суспензії. Суспензії змішують, додають при перемішуванні 131,25г дисульфідраму, об'єм доводять димексидом до 1050мл і витримують при

50°C до повного розчинення. Фільтрують і розливають в ампули.

Приклад 3.

Відважують 5,625г полівінілового спирту, доводять диметилсульфоксидом до мітки 80мл, залишають для набухання при кімнатній температурі (20°C-25°C), підігрівають до 35°C, перемішують до повного розчинення. Відважують 5,625г полівінілпіролідону, доводять до мітки 80мл, залишають для набухання при кімнатній температурі (20°C-25°C), перемішують до повного розчинення. Відважують 25,5г налтрексону, доводять до мітки 150мл, перемішують при кімнатній температурі. До одержаної суспензії додають розчин полівінілового спирту, перемішують при нагріванні до 30°C-50°C. Відважують 25,5г налтрексону, доводять до мітки 150мл, перемішують при кімнатній температурі. До одержаної суспензії додають розчин полівінілпіролідону, перемішують при нагріванні до 30°C-50°C. Відважують 47,423г дисульфідраму, доводять диметилсульфоксидом до об'єму 200мл нагрівають до 50°C при перемішуванні до повного розчинення. До гарячого розчину дисульфідраму додають суспензії налтрексону. Перемішують до повного розчинення при температурі 50°C. Готовий розчин доводять до мітки 690мл. Охолоджують та передають на фільтрацію та ампулювання.

Таким чином, запропонований спосіб є ефективним для отримання засобу проти рецидивної терапії у хворих на опійну наркоманію і хронічний алкоголізм.