



УКРАЇНА

(19) UA (11) 96059 (13) C2
(51) МПК
A61K 31/385 (2006.01)
A61P 17/02 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ЗАСТОСУВАННЯ ЛІПІНУ ЯК ЗАСОБУ ФРИГОПРОТЕКТОРНОЇ ДІЇ

1

(21) а201001837
(22) 19.02.2010
(24) 26.09.2011
(46) 26.09.2011, Бюл.№ 18, 2011 р.
(72) ДОМАР НІНА АНАТОЛІЇВНА, ШТРИГОЛЬ
СЕРГІЙ ЮРІЙОВИЧ, ПІМІНОВ ОЛЕКСАНДР ФО-
МИЧ, БОНДАРЄВ ЄВГЕН ВІКТОРОВИЧ
(73) НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІ-
ВЕРСИТЕТ
(56) RU C2 2270013, 20.02.2006.
RU C2 2194498, 20.12.2008.
RU C2 2213570, 10.10.2003.
RU C2 2304975, 27.08.2007.
UA U 25268, 10.08.2007.
UA U 40072, 25.03.2009.
Лецитин, Компендиум. Лекарственные препараты.
В двух томах. - 2004 г., Киев.
Лецитин-стандарт, Компендиум. Лекарственные
препараты. В двух томах. - 2004 г., Киев.

2

Г. А. Игнатенко, И. В. Мухин Влияние липосомаль-
ных препаратов на альвеолярно-капиллярную
проницаемость при коморбидной ренопульмона-
льной патологии, Украинский пульмонологичний
журнал. 2009, № 4, стор. 50-53.
Липин, Компендиум. Лекарственные препараты. В
двух томах. - 2004 г., Киев.
Ігнатенко Г.А., Мухін І.В., Подляскіна В.Е., Родін
І.М., Вплив різних терапевтичних режимів на мор-
фофункціональні показники міокарду лівого шлу-
ночка при персистуючій фібриляції передсердь і
супутньому хронічному обструктивного захворю-
ванні легенів, Питання експериментальної та клі-
нічної медицини, ЗБІРНИК СТАТЕЙ, 2009, ВИ-
ПУСК 13, ТОМ 1., стор. 12-14.
(57) Застосування ліпіну як засобу фригопротекто-
рної дії.

Винахід належить до фармації і медицини, а
саме до засобів із фригопротекторною дією, зок-
рема до застосування ліпіну як засобу фригопро-
текторної дії.

Профілактика та лікування холодкових травм є
однією з актуальних проблем сучасної медицини,
оскільки, незважаючи на відносно м'які кліматичні
умови в Україні, загальні та місцеві ураження на-
селення низькими температурами є частими для
осінньо-зимового періоду. Як правило, як фригопро-
текторні засоби застосовують препарати, що
впливають на основні ланки патогенезу відморо-
ження, з протизапальною, жарознижуючою, зне-
болюючою, антикоагулянтною, ранозагоювальною
дією тощо. На сьогодні специфічні препарати для
лікування холодкових травм відсутні. Таким чином,
існує значна потреба у специфічних лікарських
препаратах, що захищають організм від переохоло-
дження, підвищують його стійкість до дії низьких
температур та можуть бути застосовані для про-
філактики і лікування холодкових травм [1].

Відомим препаратом з групи актопротекторів,
який застосовується в терапії холодкових травм, є
бемітил [2], що сприяє утворенню ферментів енер-
гетичного обміну, глюконеогенезу і антиоксидант-

ного захисту. Він підвищує стійкість організму до
гіпоксії і працездатність при фізичних навантажен-
нях, чинить імуностимулюючу та помірну психос-
тимулюючу дії. Недоліком препарату є ризик вини-
кнення нудоти, рідко блювання, неприємних
відчуттів в області шлунку, головного болю, гіпе-
ремії обличчя. Препарат протипоказаний до за-
стосування при гіпоглікемії, порушенні функції пе-
чінки, вагітності, епілепсії, артеріальній гіпертензії,
глаукомі, ішемічній хворобі серця, аритмії тощо [3].

Відомим препаратом з групи нестероїдних
протизапальних засобів, який використовують в
терапії холодкових травм, є ацетилсаліцилова кис-
лота, яка гальмує синтез простагландинів, що
приводить до зменшення запалення уражених
ділянок шкіри; до зниження їх чутливості до медіа-
торів болю, що в свою чергу, призводить до по-
ліпшення стану постраждалих [1].

Однак цей препарат має небезпечні побічні
ефекти з боку серцево-судинної системи і крові
(тромбоцитопенія, анемія, лейкопенія), органів
шлунково-кишкового тракту (печія, нудота і блю-
вання, важкі кровотечі в шлунково-кишковому тра-
кті), викликає порушення функції печінки та нирок,
а також алергічні реакції (бронхоспазм, набряк

(13) C2

(11) 96059

(19) UA

гортані і кропивниця) тощо [3].

Задачею винаходу є розширення арсеналу ефективних лікарських засобів фригопротекторної дії для поліпшення якості профілактики та лікування холодкових травм.

Поставлена задача вирішується шляхом застосування ліпіну як засобу фригопротекторної дії.

Дотепер ліпін використовувався у складі комплексної терапії в пульмонології, кардіології, акушерстві, гастроентерології, нефрології як антигіпоксичний, антиоксидантний, мембранопротекторний засіб [4].

Фригопротекторна дія ліпіну не відома з джерел інформації.

Винахід ілюструється наступним прикладом.

Приклад

Вивчення фригопротекторної дії ліпіну проводили у співвідношенні з препаратами порівняння - ацетилсаліциловою кислотою у дозі 250 мг/кг [1] та бемітилом у дозі 50 мг/кг [5] на білих мишах-самцях масою 16-21 г на моделі загального охолодження, для відтворення якої експериментальних тварин вміщували до морозильної камери з постійною температурою -18 °C [6].

Досліджуваний препарат вводили внутрішньоочеревинно (дослідним групам 2 та 3) та у шлунок через зонд (дослідній групі 4) одноразово у вигляді

ліпосомальної емульсії.

Препарати порівняння вводили внутрішньоочеревинно одноразово у профілактичному режимі за 30 хв до охолодження дослідним групам 5 та 6.

Контрольні тварини (група 1) отримували відповідний об'єм 0,9 % розчину натрію хлориду.

Лабораторних тварин розподілили на групи відповідно до препарату, що вони одержували, та його дози:

1. Контрольна група, n=14;
2. Ліпін внутрішньоочеревинно, 200 мг/кг (за лецитином), n=5;
3. Ліпін внутрішньоочеревинно, 367 мг/кг (за лецитином), n=7;
4. Ліпін у шлунок, 367 мг/кг (за лецитином), n=7;
5. Ацетилсаліцилова кислота, 250 мг/кг, n=7;
6. Бемітил, 50 мг/кг, n=10.

Фригопротекторну дію ліпіну, ацетилсаліцилової кислоти та бемітилу оцінювали за часом виживання тварин в умовах холоду. Активність препаратів розраховували як відсоток збільшення часу життя в морозильній камері. Статистичну достовірність відмінностей розраховували за критерієм Ст'юдента. Результати дослідження наведені в таблиці.

Таблиця

Вплив ліпіну, ацетилсаліцилової кислоти та бемітилу на час виживання мишей під час гострого охолодження в камері при -18 °C

Група тварин	Час виживання, хв.	Фригопротекторна активність, %
1. Контроль, n=14	49,8±3,11	-
2. Ліпін, 200 мг/кг (за лецитином), n=5	70,4±4,17 ^{1/2/3}	41,4
3. Ліпін 367 мг/кг (за лецитином), n=7	79,3±6,56 ^{4/5/6}	59,2
4. Ліпін, 367 мг/кг (за лецитином), n=7	66,9±7,04 ^{7/8}	34,3
5. Ацетилсаліцилова кислота, n=7	46,6±9,42	-6,4
6. Бемітил, n=10	48,3±2,80	-3,0

Примітка: ¹ - достовірно до контрольної групи (p<0,01); ² - достовірно до дослідної групи, що отримувала препарат порівняння бемітил (p<0,001); ³ - достовірно до дослідної групи, що отримувала препарат порівняння ацетилсаліциловою кислотою (p<0,05); ⁴ - достовірно до контрольної групи (p<0,001); ⁵ - достовірно до дослідної групи, що отримувала препарат порівняння бемітил (p<0,001); ⁶ - достовірно до дослідної групи, що отримувала препарат порівняння ацетилсаліциловою кислотою (p<0,05); ⁷ - достовірно до контрольної групи (p<0,05); ⁸ - достовірно до дослідної групи, що отримувала препарат порівняння ацетилсаліциловою кислотою (p<0,05).

Аналіз наведених в таблиці даних свідчить про те, що ліпін сприяв достовірному збільшенню часу життя експериментальних тварин порівняно з контрольною групою та препаратами порівняння. Причому препарат ефективний як при внутрішньоочеревинному, так і при внутрішньошлунковому введенні. Бемітил і ацетилсаліцилова кислота при одноразовому введенні за умов гострого загального охолодження виявилися неефективними.

Таким чином, ліпін чинить виражену фригопротекторну дію, яка значно переважає дію ацетилсаліцилової кислоти та бемітилу, і може бути рекомендований для застосування у медичній практиці для лікування та профілактики тяжких наслідків холодкових травм.

Джерела інформації:

1. Назаренко Н. А. Эффективность нестероидных противовоспалительных средств для профилактики и лечения холодовой травмы // Автореф. дис. д. мед. наук: 05.26.02, 14.00.25 / Северный гос. мед. университет МЗ РФ. - Архангельск, 2001. - 38 с.
2. Новиков В. С., Шустов Е. Б., Горанчук В. В. Фармакологическая коррекция гипертермии и гипотермии // ЦЭМПИНОФОРМ. - 2001. - № 4 (46). - С. 15-16.
3. Машковский М. Д. Лекарственные средства. - 15-е изд., перераб., испр. и доп. - М.: РИА "Новая Волна": Издатель Умеренков, 2007. - С. 124-125, 164-166.
4. Шве́ц В. И., Краснопо́льский Ю. М. Липосомы в фармации. Продукты нанобиотехнологии

(продолжение) // Провизор. - 2008. - № 6. - С. 34-37.

5. Квітчатa Г. І. Вестибулопротекторна активність і механізм дії бемітилу і етоксibenзолу // Автореф. дис. к. мед. наук: 14.03.05 / Інститут фармакології і токсикології АМН України. - Київ, 2001.- 23 с.

6. Увеличение продолжительности жизни мышцей при остром охлаждении под воздействием препарата, выделенного из *Laminaria sacchara* / Дрозд Ю. В., Бондаренко С. В., Яснецов В. В. и др. // Биол. эксперим. биол. и мед. - 1991. - Т. 111, № 4. - С. 383-384.