



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **107885** (13) **U**
(51) МПК
A61K 31/135 (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

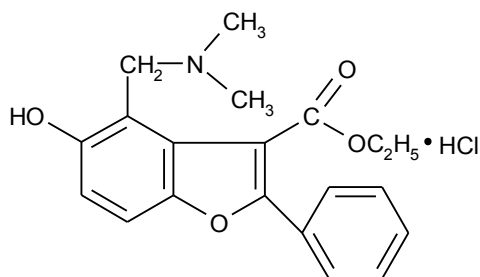
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: u 2015 12623	(72) Винахідник(и): Гладких Федір Володимирович (UA), Степанюк Наталія Георгіївна (UA), Степанюк Георгій Іванович (UA), Сокирко Маргарита Володимирівна (UA)
(22) Дата подання заявки: 21.12.2015	(73) Власник(и): ВІННИЦЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ІМ. М.І. ПИРОГОВА, вул. Пирогова, 56, м. Вінниця, 21018 (UA)
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: 24.06.2016	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 24.06.2016, Бюл.№ 12	

(54) ЗАСТОСУВАННЯ ВІНБОРОНУ ДЛЯ ПРОФІЛАКТИКИ ГАСТРОПАТІЇ, ІНДУКОВАНОЇ ІБУПРОФЕНОМ

(57) Реферат:

Застосування вінборону (2-феніл-3-карбетокси-4-диметиламінометил-5-оксибензофурану гідрохлориду), загальної формули:



як засобу для профілактики гастропатії, індукованої ібупрофеном.

UA 107885 U

Корисна модель належить до галузі медицини, зокрема до фармакології, ревматології, гастроентерології та може бути використана для профілактики ураження слизової оболонки шлунка (гастропатії), викликаної ібупрофеном.

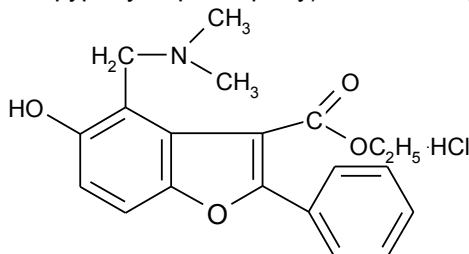
Найближчий аналог до корисної моделі невідомий.

5 Існуючі шляхи послаблення гастротоксичності нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ) зміна тактики застосування, комбінація з гастропротекторними агентами-аналогами простагландинів (мізопростол), H₂-блокаторами рецепторів гістаміну (фамотидин, ранітидин та ін...), інгібіторами протонової помпи (омепразол та ін.), препаратами колоїдного вісмуту (де-нол), лікарськими засобами з антигіпоксантною та антиоксидантною активністю (мексидол, гіпоксен та ін.) спрямовані лише на окремі патогенетичні ланки розвитку НПЗЗ-гастропатій. Крім того, вищезазначені лікарські засоби непозбутні власних побічних ефектів. [Аникин К.С. Гастропротекторные стратегии и НПВП-гастропатии / К.С. Аникин // Theapia. Український медичний вісник. 2011. - №11. - С. 72-75; Ахмедов В.А. Гастропатия, обусловленная нестероидными противовоспалительными препаратами: от понимания механизмов развития к разработке стратегии лечения и профилактики / В.А. Ахмедов, В.А. Винжегина, А.Н. Судакова, Е.И. Розенблит // Терапевтический архив. - 2007. - №5. - С. 81-85; Вікторов О.П. Профілактика та фармакотерапія гастропатій, пов'язаних із застосуванням нестероїдних протизапальних засобів: метод, рекомендації / О.П. Вікторов, Н.В. Марченко, Л.І. Омельченко та ін. - К., 2005. - 30 с].

20 В основу корисної моделі поставлена задача шляхом застосування вінборону як препарату з політропними фармакологічними ефектами, нівелювати гастротоксичність ібупрофену.

Вінборону притаманний комплекс фармакологічних властивостей: спазмолітична, протизапальна, знеболююча (місцева та центральна), протиішемічна, антиоксидантна, антиагрегантна, імуномодельююча, протимікробна, токолітична, кардіопротекторна, церебропротекторна, стимулюючий вплив на мікроциркуляцію [Степанюк Г.І. Вінборон - лікарський засіб з політропними фармакологічними властивостями: монографія / Г.І. Степанюк, О.О. Пентюк, Р.П. Піскун. - Вінниця: "Континент-Прим", 2007. - 243 с.], які добре співставляються з патогенезом НПЗЗ-гастропатії індукованої ібупрофеном [Карасєва Г.А. НПВП-индуцированная гастропатия: от понимания механизмов развития к разработке стратегии профилактики и лечения / Г.А. Карасєва // Медицинские новости. - 2012. - №8. - С. 21-26; Свінціцький А.С. Механізми терапевтичної ефективності та побічної дії нестероїдних протизапальних препаратів / А.С. Свінціцький // Практикуючий лікар. - 2012. - №4. - С. 5-12].

Поставлена задача вирішується тим, що застосовують вінборон (2-феніл-3-карбетокси-4-диметиламінометил-5-оксибензофурану гідрохлориду), загальної формули:



35 як засіб для профілактики гастропатії, індукованої ібупрофеном.

Дослідження проведено на 28 статевозрілих нелінійних щурах-самцях з масою тіла 180-220 г., які знаходились в стандартних умовах віварію Вінницького національного медичного університету ім. М.І. Пирогова. Всі експериментальні дослідження над лабораторними тваринами та їх утримання проводились згідно з Європейською конвенцією про захист хребетних тварин (Страсбург, 1986) та відповідно "Положення про використання тварин в біомедичних дослідках" [Етика лікаря та права людини: положення про використання тварин у біомедичних дослідках // Експер. та клініч. фізіол. біохімія. - 2003. - №2 (22). - С. 108-109; Использование лабораторных животных в токсикологическом эксперименте: методические рекомендации / под редакцией проф., академика РАМН П.И. Сидорова. - Архангельск, 2002. - 15 с.]. Піддослідні тварини були розділені на 4 групи: I - інтактні щури (n=7), II - щури зі змодельованим ад'ювантним артритом (АА) без лікування (контроль), III - щури з АА (n=7), які були ліковані ібупрофеном (218 мг/кг, внутрішньошлунково), IV - щури з АА (n=7) ліковані ібупрофеном внутрішньошлунково (218 мг/кг) в комбінації з вінбороном (11 мг/кг, внутрішньошлунково). Вінборон, розчинений у 0,9 % розчині NaCl, вводився за 60 хв. до введення ібупрофену. Ібупрофен вводили внутрішньошлунково у вигляді завису на 3 % крохмальному слизу двічі на добу (109 мг/кг на один прийом).

Вказані препарати застосовували в середньотерапевтичних дозах для людини, запозичених з літератури [Каратеев А.Е. Применение нестероидных противовоспалительных препаратов. Клинические рекомендации / А.Е. Каратеев, Н.Н. Яхно, Л.Б. Лазебник, М.Л. Кукушкин, В.Н. Дроздов, В.А. Исаков, Е.Л. Насонов. - Москва.: ИМА-ПРЕСС. - 2009. - 168 с.; Чорноіван Н.Г. "Вінборон" - новий вітчизняний спазмолітик з гастропротекторною дією / Н.Г. Степанюк, В.М. Чернобровий, Г.І. Степанюк, А.С. Шаламай, А.Г. Степанюк // Сучасна гастроентерологія. - 2010. - №3 (53). - С. 54-57]. Перерахунок препаратів з дози людини на щурів здійснювали із використанням коефіцієнта видової чутливості за Ю.Р. Рыболовлевим [Рыболовлев Ю.Р. Дозирование веществ для млекопитающих по константам биологической активности / Ю.Р. Рыболовлев, Р.С. Рыболовлев // Доклады Академии Наук СССР. - 1979. - Т.247, № 6. – С. 1513-1516].

АА моделювали шляхом субплантарного введення повного ад'юванту Фрейнда в задню праву лапку з розрахунку 0,1 мл на щура.

Протягом дослідження контролювали динаміку маси тіла та показники летальності щурів в кожній групі. Стан СОШ оцінювали макроскопічно (колір, складчастість, наявність слизу, ерозій, крововиливів, виразкових дефектів та перфоративних виразок) за бальною шкалою Л.В. Яковлевої [Доклінічні дослідження лікарських засобів: метод, рекоменд.; за ред. член-кор. АМН України О.В. Стефанова. - К.: ВД "Авіцена", 2001. - 527 с.]. Для кожної групи досліджуваних тварин розраховували виразковий індекс (ВІ) за формулою: $ВІ = \text{ступінь виразки} \times \% \text{ тварин з виразками} / 100$.

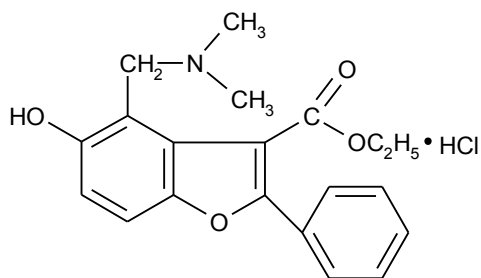
Проведене дослідження показало, що на 28 добу експерименту в групі тварин з АА, лікованих комбінацією ібупрофену з вінбороном, динаміка приросту маси тіла відносно початку експерименту статистично вірогідно перевищувала аналогічний показник при монотерапії ібупрофеном і становила відповідно 9,6 % та 1,3 %, що свідчить про високі захисні властивості вінборону в профілактиці ульцерогенної дії ібупрофену.

В ході проведеного дослідження нами було також зафіксовано 2 випадки летальності на 21 та 22 добу експерименту в групі монотерапії ібупрофеном, внаслідок перфорації виразкових дефектів слизової оболонки шлунка. В групі комбінованого застосування ібупрофену та вінборону загибелі тварин не відмічалось.

Крім того, встановлено, що ВІ для групи ібупрофену майже в 10 разів перевищував даний показник в групі комбінованого застосування ібупрофену з вінбороном та становив відповідно 0,97 та 0,1. Це свідчить про високі захисні властивості вінборону.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

Застосування вінборону (2-феніл-3-карбетокси-4-диметиламінометил-5-оксибензофурану гідрохлориду), загальної формули:



як засобу для профілактики гастропатії, індукованої ібупрофеном.

Комп'ютерна верстка В. Мацело

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601