



УКРАЇНА

(19) UA (11) 28488 (13) U
(51) МПК (2006)
A61K 31/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС
ДО ПАТЕНТУ
НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ЗАСТОСУВАННЯ КОРВІТИНУ ЯК ЗАСОБУ ДЛЯ ПРОФІЛАКТИКИ ГАСТРОПАТІЇ, ІНДУКОВАНОЇ АЦЕТИЛСАЛІЦИЛОВОЮ КИСЛОТОЮ

1

2

(21) u200709131

(22) 09.08.2007

(24) 10.12.2007

(72) СТЕПАНЮК НАТАЛІЯ ГЕОРГІЇВНА, UA,
СТАНІСЛАВЧУК МИКОЛА АДАМОВИЧ, UA,
СТЕПАНЮК ГЕОРГІЙ ІВАНОВИЧ, UA, ШАЛАМАЙ
АНАТОЛІЙ СЕВАСТЯНОВИЧ, UA

(73) ВІННИЦЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ МЕДИЧНИЙ
УНІВЕРСИТЕТ ІМ.М.І.ПИРОГОВА, UA

(56)

(57) Застосування корвітину як засобу для
профілактики гастропатії, індукованої
ацетилсаліциловою кислотою.

Корисна модель відноситься до медицини, а саме до фармакології, гастроентерології та ревматології і стосується застосування лікувальних засобів для профілактики уражень слизової оболонки шлунка (гастропатії), викликаной дією ацетилсаліцилової кислоти (аспірином).

Відомий спосіб профілактики аспірин-індукованої гастропатії полягає у використанні лікарських засобів з гастропротекторним ефектом: блокатори протонної помпи (омепразол та ін.), блокатори H₂-гістамінових рецепторів (фамотидин, ранітидин та ін.), синтетичний аналог простагландину E₁-мізопростол, а також де-нол [А.С. Свинцицкий, Н.И. Хомченкова, О.Г. Пузанова. Ингибиторы ЦОГ-2: панацея от побочных эффектов нестероидных противовоспалительных средств или новые проблемы? // Сучасна гастроентерологія. - 2003. - №1(11). - с.11-15; И.В. Маев, Е.С. Вьючкова, И.В. Стасева. Сравнительная оценка различных схем терапии гастропатий, вызванных нестероидными противовоспалительными препаратами// Сучасна гастроентерологія. - 2004. - №5(19). - с.63-66]. Однак, широке застосування цих препаратів обмежене через недостатню ефективність, або виникнення побічних ефектів, які нерідко спонукають до відміни препарату [А.Е. Каратеев, Ю.В. Муравьев. Омепразол и мизопростол при НПВП - индуцированных гастропатиях: сравнительная эффективность короткого курса лечения// Клиническая медицина. - 2001. - №5. - с.48-51; В.А. Исаков Гастропатия, связанная с приемом нестероидных противовоспалительных препаратов: патогенез, лечение и профилактика//

Клиническая фармакология и терапия. - 2005. - №14(2). - С.34-38].

Прототип корисної моделі не відомий. В основу корисної моделі «Спосіб профілактики гастропатії, індукованої ацетилсаліциловою кислотою» поставлено завдання шляхом застосування корвітину, як практично нетоксичного лікарського засобу з політропними фармакологічними властивостями підвищити ефективність та безпечність фармакопрофілактики аспіринової гастропатії.

Більш безпечними в плані виникнення побічних ефектів можуть бути лікарські препарати, що містять флавоноїди. До числа таких препаратів відноситься корвітин - розчинна лікарська форма кверцетину. Ота ньому притаманний широкий спектр фармакологічних властивостей - проти ішемічна, антиоксидантна, протизапальна, антитромботична, імуномодельюча, репаративна, тощо - [М.Т. Ватутін, Т.С. Гончаренко, О.В. Склянна, С. Закмаха. Флавоноід кверцетин: фармакологічні властивості та клінічне використання// Ліки. - 2005. - №3-4. - с.19-27], які добре співставляються з патогенезом гастропатій, індукованих НПЗЗ.

Корвітин рекомендований в якості кардіозахисного засобу в комплексній терапії гострих порушень коронарного кровообігу та інфаркту міокарда, для лікування та профілактики репер фузійного синдрому.

Вказане завдання досягається шляхом застосування корвітину за новим призначенням, як лікарського засобу для профілактики гастропатії, індукованої ацетилсаліциловою кислотою. Запропонований засіб - корвітин має вигляд сухої

(19) UA (11) 28488 (13) U

пористої маси світло-жовтого з зеленуватим відтінком кольору, зі слабким специфічним запахом. Добре розчинний у воді. Форма випуску: ліофілізований порошок у флаконі по 0,5г корвітину, який є комплексом кверцетину з полівінілпіролідом. Препарат виробляється на НВЦ "Боцагівський ХФЗ".

Спосіб здійснюється таким чином. Гастропатія моделюється у статевозрілих щурів шляхом внутрішньо шлункового введення ацетилсаліцилової кислоти в дозі 150мг/кг маси тіла 1 раз на день протягом 5 днів [С.М. Калугіна. Оцінка антиульцерової дії калефлону при моделюванні субхронічних ерозивно-виразкових уражень гастродуоденальної ділянки// Ліки. - 2001. - №3-4. - С.88-91]. Корвітин вводили в ті ж дні за 60хв до ацетилсаліцилової кислоти в терапевтично ефективній дозі 5мг/кг внутрішньом'язево [І.І. Заморський, О.М. Горошко. Корвітин як засіб фармакологічної корекції гострої ниркової недостатності// Досягнення та перспективи розвитку фармацевтичної галузі України. Мат. VI Нац. з'їзду фармацевтів України. - Харків, 2005. - С.517-518]. Ефективність фармакопрофілактики гастропатії оцінювали за динамікою показника кількості деструкцій (виразки, ерозії, петехії) на слизовій оболонці шлунка щурів і порівнювали з дією омепразолу (50мг/кг внутрішньошлунково), фамотидину (50мг/кг внутрішньошлунково), мізопростолу (0,05мг/кг внутрішньошлунково) та де-нолу (50мг/кг внутрішньошлунково). Контрольні щурі (гастропатія без корекції) отримували таким же чином еквівалентну кількість 0,9% розчину NaCl внутрішньошлунково. Референт-препарати використовували в терапевтично ефективних дозах, запозичених з літератури і вводили в ті ж самі терміни експерименту, як і корвітин.

Дослідження проведено на 42 нелійнійних щурах-самцях з масою тіла 200-240г, які знаходились в науково-експериментальній клініці Вінницького національного медичного університету ім. М.І. Пирогова. Тварини були розбиті на 6 груп по 7 особин в кожній: I-гастропатія біз корекції (контроль), II-гастропатія на тлі корвітину, III-VI-гастропатія на тлі окремо омепразолу, фамотидину, Мізопростолу та де-нолу.

В результаті проведених дослідів встановлено, що превентивне введення щурам корвітину так само, як і омепразолу, фамотидину, мізопростолу та де-нолу послаблює прояви ульцерової ацетилсаліцилової кислоти, на що вказувало вірогідне зменшення кількості деструкцій на СОШ. За величиною гальмівного впливу на ульцерову дію ацетилсаліцилової кислоти досліджувані препарати розташувались в такій послідовності: омепразол>фамотидин>корвітин>мізопростол>де-нол.

Таким чином, проведене дослідження показало, що превентивне застосування корвітину викликає достатньо виразну гастропротекторну дію в умовах експериментальної аспіринової гастропатії. За величиною зазначеного ефекту корвітин практично співставляється з

омепразолом, фамотидином, мізопростолом та де-нолом. Оскільки кверцетин, який входить до складу корвітину, спроможний не тільки попереджувати виникнення гастропатій, індукованих НПЗЗ, але й підсилювати лікувальну дію препаратів цієї групи [Загородній М.І. Вплив кверцетину на НПЗЗ-гастропатії, викликані диклофенаком натрію, у хворих на остеоартроз.// Ліки. - 2003. - №3-4. - с.135-138] є підстави рекомендувати поєднання корвітину з ацетилсаліциловою кислотою в клінічних умовах.