



УКРАЇНА

(19) UA (11) 56426 (13) A

(51) 7 A61K31/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ**ОПИС**  
**ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ**  
**НА ВИНАХІД**Видається під  
відповідальність  
власника  
патенту**(54) ЗАСІБ ДЛЯ ТИМЧАСОВОГО ПІДВИЩЕННЯ ПРАЦЕЗДАТНОСТІ**

1

2

(21) 2002043253

(22) 19 04 2002

(24) 15 05 2003

(46) 15 05 2003, Бюл. №5, 2003 р.

(72) Мороз Василь Максимович, Липницький Тарас  
Миколайович, Козловський Вадим Олександрович,  
Кутняк Віктор Павлович, Бандурка Наталя Мико-  
лаївна(73) ВІННИЦЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІ-  
ВЕРСИТЕТ ІМ. М. І. ПИРОГОВА

(57) Засіб для тимчасового підвищення працездатності, який включає D-глюконову кислоту, L-карнітин, АТФ-ЛОНГ та рибоксин в такому співвідношенні компонентів, мас. %

D-глюконова кислота	30
L-карнітин	20
АТФ-ЛОНГ	20
Рибоксин	30

Винахід відноситься до медицини, зокрема до фармакології, і стосується актопротекторних препаратів.

З метою підвищення фізичної та розумової працездатності, витривалості, а також профілактики перевтомлення використовуються як природні тонізуючі засоби (жень-шень та ін.), так і синтетичні психостимулюючі препарати. Найбільш ефективними вважаються фенілалкіламіни та їх аналоги. Основним препаратом групи фенілалкіламінів є фенамін, який за хімічною структурою та фармакологічними властивостями наближується до адреналіну. Препарат відрізняється стійкістю в організмі та довготривалістю фармакологічних ефектів, які проявляються стимуляцією центральної нервової системи та вираженою адреноміметичною активністю. При застосуванні раціональних доз фенамін підвищує процеси збудження, які проявляються відчуттям бадьорості та підвищеної працездатності. За сучасними уявленнями, фармакологічні ефекти фенаміну пов'язані з гіперпродукцією норадреналіну та дофаміну, в зв'язку з чим навіть незначне підвищення дози може проявлятися або парадоксальними реакціями (апатія, зниження працездатності), або ознобом, тахікардією, аритміями серця та іншими негативними наслідками (в тому числі і смертельними), оскільки значне підвищення працездатності при прийомі фенаміну та його аналогів досягається шляхом різкої активації катаболічних процесів на тлі виснаження функціональних та метаболічних резервів. Використання фенаміну та його аналогів в

якості стимуляторів для спортсменів категорично заборонено.

Прототип запропонованого рішення невідомий.

В основу винаходу «Засіб для тимчасового підвищення працездатності» покладено завдання створити медикаментозний засіб для підвищення працездатності, основу якого складають натуральні субстрати енергетичного обміну, а не синтетичні речовини з можливим негативним впливом на функцію інших органів і систем. Необхідно також, щоб медикаментозний засіб проявляв ефект підвищення працездатності в короткий проміжок часу від моменту застосування і на тривалий термін. Для цього до складу фармакологічного засобу введені D-глюконова кислота, L-карнітин, АТФ-ЛОНГ та рибоксин в такому співвідношенні компонентів, мас. %

D-глюконова кислота	30
L-карнітин	20
АТФ-ЛОНГ	20
Рибоксин	30

Включення до засобу АТФ-ЛОНГ переслідує за мету вплив на пуринергічні рецептори судин м'язів, що спричинює їх розширення та покращує перфузію, а також притік - відтік субстратів та метаболітів. Препарат оптимізує роботу серця у відповідності до енергетичних потреб організму і функції ЦНС, що проявляється нейропротекторною та нейромедіаторною дією, внаслідок модулюючого впливу на аденілатциклазну систему, що призводить до оптимізації метаболічних процесів

(13) A

(11) 56426

(19) UA

Окрім того, модулюється дія інших медіаторних систем (адренергічної та ацетилхолінової), що проявляється метаболічними змінами в клітинах. Продукти послідовної деградації АТФ проникають в клітину і, включаючись *de novo* в метаболічні шляхи, активізують їх, проявляючи, таким чином, тривалу дію.

Включення до засобу рибоксину (інозину) дозволяє продовжити дію АТФ на рецептори як через механізм інгібування її деградації, оскільки знижується активність аденозіндезамінази, так і через модулюючу дію на пуринергічні рецептори, що нами встановлено вперше. Окрім того, рибоксин деградує до іпноксантину і проникаючи в клітини, призводить до швидкого (в середньому через 4-5 хвилин у людей) зростання концентрації 2,3-дифосфогліцеринової кислоти в еритроцитах, що призводить до зменшення спорідненості гемоглобіну до кисню та покращенню його утилізації для окислення субстратів. При цих же умовах відбувається підвищення артеріо-венозної різниці за киснем, що відображує антиіпноксичні властивості препарату. Проникаючи в клітини, рибоксин включається в синтез циклічних нуклеотидів *de novo*, активуючи на тривалий час метаболізм клітин. При цьому знижується рівень лактату, який є індикатором стомлення.

D-глюконова кислота являється важливим субстратом пентозофосфатного шляху окислення глюкози. Фосфорилюючись вона активує ряд основних ферментів перетворення енергії (гексокінази, фосфофруктокінази), проявляючи модулюючий вплив на енергетичний фонд клітин, що проявляється стабілізацією мембранних компонентів та підвищенням активності АТФаз. Вперше встановлений нами факт підвищення працездатності глюконою кислотою став приводом для включення її до даного засобу.

L-карнітин виконує функцію переносника жирних кислот через мітохондріальні мембрани, сприяючи таким чином їх повному окисленню. М'язи для скорочення використовують, в основному, енергію окислення вуглеводів, але при зниженні їх резервів (як це трапляється при стомленні) відбувається інтенсифікація окислення жирів, що до-

зволяє тривалий час виконувати роботу. Оскільки для окислення жирних кислот потрібно більше кисню, а ніж для окислення вуглеводів, включення до засобу АТФ та рибоксину теж носить синергічний характер за вище описаною фармакодинамікою. Окрім того, L-карнітин являється антиоксидантом і зменшує пероксидацію в мембранах, покращуючи тим самим їх функціонування.

Застосування запропонованого засобу в широкому діапазоні доз дає приріст працездатності, який оцінювався за часом утримання на воді білих беспородних щурів-самців з прикріпленим вантажем вагою 10% від маси тварини по відношенню до контролю. В групі контрольних тварин цей час склав  $4,1 \pm 0,3$  хв. В досліджуваних групах (в залежності від доз) час утримання на воді коливався від  $6,5 \pm 0,3$  хв до  $11,3 \pm 0,3$  хв, що склало приріст від 150% до 280%. Оптимальними були наступні дози: D-глюконова кислота 100 мг/кг, L-карнітин - 100 мг/кг, АТФ-ЛОНГ - 30 мг/кг, рибоксин 100 мг/кг.

Засіб для підвищення працездатності застосовувався наступним чином: D-глюконова кислота та L-карнітин вводились внутрішньоочередно за 20 хв до плавальної проби, а АТФ-ЛОНГ та рибоксин таким же чином за 3 хв до проби.

Приклад. Щуру вагою 100 г внутрішньоочередно вводили суміш D-глюконової кислоти та L-карнітину в дозі по 100 мг/кг. Через 17 хв таким же шляхом вводилась суміш АТФ-ЛОНГ та рибоксину в дозах 30 мг/кг та 100 мг/кг відповідно, після чого через 3 хв прикріплювали до хвоста вантаж масою 10 г та опускали його в ємкість з шаром води більше 60 см при  $t = 30^{\circ}\text{C}$ . Цей момент вважали початком фізичного навантаження. Закінчували дослід після завмирання щура на дні ємкості з водою, тобто в момент смерті тварини. Експериментальна тварина протрималась на поверхні води 11,3 хв, що дорівнює 275,6% в порівнянні з контрольною групою щурів.

Використання запропонованого засобу сприяє підвищенню працездатності, модулюючи природну реакцію організму, оскільки всі його компоненти є натуральними субстратами енергетичного обміну. Спосіб рекомендується для клінічної апробації.