



Республика Таджикистан

(19) **TJ** (11) **1023**
(51) **МПК** A61K31/00, A61K 36/00

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(12) **Описание изобретения** К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

(21) 1901271

(22) 15.01.2019

(46) Бюл.152, 2019

(71) Институт химии имени В.И. Никитина
Академия наука Республики Таджикистан (TJ)

(72)(73) Усманова С.Р. (TJ); Мухидинов З.К.
(TJ); Усманов У.Р. (TJ); Усманов Р. (TJ); Муминов
М.О. (TJ); Тураев Р.А. (TJ); Муминов А., (TJ);
Раджабали Музаффар, (TJ); Кармишов Б.Д., (TJ);
Сахимов М.Р. (TJ)

(54) **СРЕДСТВО ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ
ГЕЛЬМИНТОЗОВ ЖИВОТНЫХ**

(56) 1. Шувалова Е.П. Инфекционные
болезни. - М.: Медицина, 2001. - 1225 с.

2. Сидоркин В.А., Нефедова Н.С.,
Панфилова М.Н. Опыт применения альвета-
суспензии для терапии гельминтозов кошек //

Российский паразитологический журнал. -
2013. - №1. - С. 92-94

(57) Изобретение относится к
ветеринарии и может быть использовано при
лечении гельминтозов животных.

Целью заявляемого изобретения является
расширение арсенала противопаразитарных
средств и способов лечения гельминтозов
жвачных животных.

Поставленная цель достигается средством
для лечения гельминтозов животных,
включающий албендазол и дополнительно
содержит плоды (створки и семена) Гледичия
(*Gleditsia atriacanthos*), при следующем
соотношении компонентов, мас.ч.: албендазол:
плоды Гледичия - 1:5-15.

Изобретение относится к ветеринарии и может быть использовано при лечении гельминтозов животных.

Гельминтозы животных распространены от арктических широт до экватора и опасны тем, что могут заразить и человека [1]. Гельминтами заражено более миллиарда человек. По числу больных заражение кишечными гельминтами занимает третье место в мире. По данным ВОЗ, общее число заболеваний и смертей от кишечных гельминтозов выше, чем от бактериальных, вирусных инфекций и других паразитарных болезней, вместе взятых. Около 2% населения России заражено кишечными гельминтозами, в южных районах страны зараженность достигает 7-10%. В ряде случаев лечение при паразитарных болезнях недостаточно эффективно и приводит к тяжелым последствиям - истощению иммунной системы и возникновению вторичного иммунодефицита, нарушениям механизмов гомеостаза, возникновению аритмий, нарушениям психики, образованиям опухолей, в том числе злокачественных. Поэтому профилактика и лечение гельминтозов - одна из наиболее актуальных задач современной медицины и ветеринарии.

Известны противопаразитарные препараты на основе албендазола, такие как альвет, альбен С, вальбазен, бровальзен, атазол, вермитан 20% гранулят, клозальбен, албендазол ультра 10%.

Наиболее близким по своей технической сущности является препарат Альвет-суспензия, содержащий в качестве действующего вещества албендазол по 25 или 100 мг в 1 мл (соответственно 2,5 или 10%), загустители, консерванты и воду. Этот препарат широкого спектра действия, активен в отношении имаго и личинок нематод, трематод, а также имаго цестод. Механизм действия препарата заключается в нарушении процессов транспорта глюкозы, микротубулярной функции и снижении активности фумарат-редуктазы у гельминтов, что приводит к их гибели. Альвет-суспензия при пероральном введении всасывается в желудочно-кишечном тракте и проникает в органы и ткани; из организма быстро выводится в основном с мочой и фекалиями. Препарат относится к низкотоксичным для теплокровных животных: ЛД₅₀ при пероральном введении белым мышам составляет более 3000 мг/кг, в рекомендуемых дозах хорошо переносится животными, не обладает гепатотоксическим и сенсибилизирующим действием [2].

Недостатком данного препарата является относительно узкая область применения, обусловленная невозможностью проведения комплексной терапии осложнений на фоне гельминтозной инвазии, а также пероральный способ введения препарата.

Целью заявляемого изобретения является расширение арсенала противопаразитарных средств и способов лечения гельминтозов жвачных животных.

Поставленная цель достигается тем, что средством для лечения гельминтозов животных, включающий албендазол, дополнительно содержит плоды (створки и семена) Гледичия (*Gleditsia triacanthos*), при следующем соотношении компонентов, мас.ч.: албендазол:плоды Гледичия - 1:5-15.

Плоды (Створки и семена) деревьев Гледичия (*Gleditsia triacanthos*) имеет следующий состав, масс. %:

алкалоиды - 0.3;

углеводы - 50.5 (в том числе до 29.0% сахар);

дубильные и слизистые вещества - 47.0;

флавоны и сапонины - 2.0;

Витамин С и К - до 278 мг %.

Отличительной особенностью заявленного изобретения являются то, что на находящихся в среде желудочно-кишечного тракта млекопитающих паразитов фармакологический эффект оказывают не свободные молекулы албендазола, а его комплексы с углеводами, дубильными и слизистыми веществами, флавонами и сапонинами содержащиеся в плодах дерева Гледичия. Именно они оказывают повышенное фармакологическое действие средства, позволяющее значительно понизить действующую лекарственную дозу албендазола и его острую токсичность.

В примерах реализации изобретения показано, что именно межмолекулярные комплексы албендазола с плодами дерева Гледичия обладает 92%-ной антигельминтной активностью (против нематод и цестод) при сокращении дозировки албендазола в 10 раз.

Заявленное средство получено следующим образом:

Смесь субстанции албендазола (ВФС 42-3085-98) с плодами дерева Гледичия взятые в весовых соотношениях 1:5, 1:10, 1:15, подвергли обработке ударно-стирающим воздействием в шаровой валковой мельнице в течение 2 часов. Затем 1кг измельченной смеси растворили в 100-200 мл пресной воде при $t = +25^{\circ}\text{C}$ в течение 2 часов до образования тестообразной массы. Из полученной массы раскатали тонкую плёнку, которую нарезали на квадратики 2х2 см и высушили при $t = 105-110^{\circ}\text{C}$ до влажности 3-5%. Высушив их измельчили.

Заявленное средство вводится перорально в дозе 1,0- 2 мг/кг (из расчета 1 грамм на одну голову мелкорогатого скота и 2 грамм на одну голову крупнорогатого скота).

В таблице 1 приведены данные увеличения растворимости албендазола в воде, содержащегося в заявленном средстве. Как видно из таблицы растворимость албендазола в воде увеличивается при массовых соотношениях следующим образом: 1:5 → 1:10 → 1:15.

Таблица 1

Состав	Весовые соотношения	Растворимость албендазола в воде, мг/л	Увеличение растворимости албендазола
Албендазол: плоды Гледичия	1:15	29.0	29.0
Албендазол: плоды Гледичия	1:10	21.0	21.0
Албендазол: плоды Гледичия	1:5	14.0	14.0
Албендазол	1:0	1.0	-

Эффективность заявленного средства на основе албендазола и способ его применения демонстрируется приведенными примерами реализации изобретения.

Заявленное средство было испытано в частном фермерском хозяйстве в селе Моинкач, с/с «Рохати» района Рудаки Республики Таджикистан в период с 20.07.2018 - 20.08. 2018 года на 100 голов малого рогатого скота и 60 голов

крупного рогатого скота разного возраста. Животных разделили на 4 равноценные группы по 25 голов и 15 голов в каждой. Животным первой группы вводили перорально однократно межмолекулярный комплекс состава албендазола и плоды дерева Гледичия 1:10 (препарат №1) в дозе 1,0 мг/кг (из расчета 1 грамм на одну головумалого рогатого скота и 2 грамм на одну голову крупного рогатого скота внутрь в форме капсула) по действующему веществу.

Овцы второй и третьей группы получали базовый препарат - албендазола (субстанция, на основе которой приготовили стандартные лекарственные формы) в дозах 1 и 10 мг/кг, соответственно. Животные четвертой - контрольной группы препарат не получали.

Эффективность препаратов учитывали по результатам копроовоскопических исследований методом флотации и эфир-формалиновым методом до и через 1 и 18 суток после дегельминтизации. Учет эффективности препаратов проводили по типу «контрольный тест» с расчетом среднего количества обнаруженных яиц нематод. Полученные результаты обработали статистически с использованием компьютерной программы Microsoft Excel, что представлены в табл. 2.

Таблица 2

Группа животных	Препараты	Доза по ДВ, мг/кг	Число животных в группе	Из них освобо-дилось от инвазии, голов	Обнаружено яиц нематод в г фекалий, экз.		ЭЭ, %	Снижение количества яиц нематод, %
					До опыта	После лечения		
Подопытная (мал.рог.скот)	АБЗ:ПДГ = 1:10	1,0	25	23	123±16	9±1,6	92.0	92.7
Подопытная КРС		1,0	15	14	138±19	11±1,1	93,3	92,03
Подопытная МРС	АБЗ (Базовый)	1,0	25	0	130±17	112,8±15	0	13,07
Подопытная КРС		1,0	15	0	139±16	125±13	0	10,07
Подопытная МРС	АБЗ (Базовый)	10,0	25	22	133±16	32±0.6	88.0	76,0
Подопытная КРС		10,0	15	12	141±15	36±0.7	80.0	74,5
Контрольная МРС	-		25	0	125±16	131±16	-	-
Контрольная КРС			15	0	132±14	144±16	-	-

Таким образом, в производственных опытах на животных, получена высокая эффективность (в 8,5-10 раз выше таковой базового препарата) заявленного средства.

Пример 3. Исследование острой токсичности заявляемых межмолекулярных комплексов. Параметры острой токсичности препаратов (ЛД₅₀) определяли по методу Литчфилда-Уилкоксона / J.T.Litchfield, F.N.Wilcoxon / на белых мышах при введении исследуемых препаратов в желудок животных. Межмолекулярные комплексы албендазола и плоды дерева Гледичия оказались более чем в 2 раза менее токсичными, чем базовый албендазол (см. табл. 3).

Таблица 3

Препараты	ЛД ₅₀ мг/кг
албендазол и плоды Гледичия в соотношении 1:10 (9% по дейст.вещ-ву)	4890

албендазол (базовый)	2450
----------------------	------

Таким образом, из испытанных межмолекулярных комплексов, высокую эффективность противогельминтным действием (92,08 -92,2 %) показало заявленное средство в соотношении 1:10, что указывает на его широкий спектр антигельминтного действия. Эффективность этой формы, на 36,8% выше против гельминтов по сравнению с базовым препаратом албендазола, который используется в дозе, в 10 раз

превышающей дозу межмолекулярного комплекса (см. табл. 2).

С помощью заявленного нами противопаразитарного средства и способа его применения удастся достичь его высокой противопаразитарной активности, что в 8,5-10 раз ниже такового албендазола.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

Средство для лечения гельминтозов животных, включающий албендазол, отличающийся тем, что дополнительно содержит плоды (створки и семена) Гледичия (Gleditschi

atriacanthos), при следующем соотношении компонентов, мас.ч.: албендазол:плоды Гледичия - 1:5-15.

Компьютерный набор: Ризоева С.

Заказ

Тираж

Подписное

Национальный патентно-информационный центр РТ734042, г. Душанбе,

