



Республика Таджикистан

(19) **TJ** (11) **532**

(51) **МПК(2011.01) А 61 Р**
33/10

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(12) **Описание изобретения**

К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

(21) 1200717

(22) 10.04.2012

(46) Бюл. 78, 2012

(71) Турдиев Ш.А. (ТJ)

(72) Сатторӣ И. (ТJ); Турдиев Ш.А. (ТJ); Сатторов Н.Р. (ТJ); Зухуров А.Н. (ТJ); Юсупов М.М. (ТJ).

(73) Сатторӣ И. (ТJ).

(54) **АЛЬБЕНДАЗОЛ - ММ, АНТИГЕЛЬМИНТИК ШИРОКОГО СПЕКТРА ДЕЙСТВИЯ.**

(варианты)

(56) 1. Кузьмин А.А. // Антигельминтики в ветеринарной медицине. - М.: «АКВАРИУМ ЛТД». 2001-144с.

2. Машковский М. Д., // Лекарственные средства В 2т. Т.1., Т.2.-М -: ООО «Издательства новая волна» -2004г. —С. 540 и 608.

3. Веретенникова Н.Л. Действие альбендазола на мышечной стадии экспериментального трихинеллеза. Материалы докладов научной конферен

ции "Ассоциативные паразитарные болезни, проблемы экологии и терапии", Москва, 5-6 декабря 1995.

(57) Изобретение относится к ветеринарии, а именно к профилактике и лечению гельминтозов животных.

Целью изобретения является изыскание безопасных, новых и более эффективных средств, проявляющих широкую антигельминтную активность.

Поставленная цель достигается тремя вариантами изготовления.

После приемки и контроля качества сырья компоненты, входящие в состав гранул, таблетки и суспензии Альбендазол – ММ, взвешивают, затем компоненты смешивают в специальной мельнице, увлажняют смесь дистиллированной водой и пропускают через гранулирующую сетку, высушивают в сушильном шкафу при 30⁰С. в течение трёх часов.

Изобретение относится к ветеринарии, а именно к профилактике и лечению гельминтозов животных.

Аналогом комплексного противопаразитарного препарата является антигельминтный препарат мебенвет - 10%-ный гранулят, в состав которого действующим началом включен мебендазол. В химическом соотношении это 5-бензоил-бензимидазол-2ил метиловый эфир карбоминовой кислоты или метил-5-(6)-бензоил-2-бензимидазол карбамат. Физико-химические свойства: мелкий желтоватый порошок без вкуса и запаха. Не растворяется в воде, спирте и хлороформе. Хорошо растворяется в муравьиной кислоте, стабилен при хранении. В лекарственной форме мебенвет - 10%-ный гранулят, назначают собакам и кошкам из расчета 60-100 мг/кг массы тела по действующего вещества (ДВ), однократно при нематодозах и цестодозах животных [1]. Недостатком этого препарата является низкая антигельминтная активность при гельминтозах сельскохозяйственных животных.

Известны препараты для профилактики и лечения гельминтозов животных - гексихол, битионол, четыреххлористый углерод, фенасал, нилверм, фасциолин и др.[2]. Однако известные препараты не обладают широким спектром действия, многие из них обладают побочным действием.

Наиболее близким аналогом является антигельминтный препарат содержащий из альбендазол в форме гранул (20% ДВ альбендазола) [1, 3].

Недостатком этого препарата является слабая антигельминтная активность по отношению к цестодам и другим желудочно-кишечным гельминтам при однократном применении. Для активного действия надо использовать их несколько раз, но при многократном использовании оказывает токсическое действие на организм животных.

Целью изобретения является изыскание безопасных, новых и более эффективных средств, проявляющих широкую антигельминтную активность.

Поставленная цель достигается следующими вариантами изготовления.

Вариант 1. Для производства альбендазола-ММ в форме гранул применяют следующее сырье: Альбендазол - 22%, крахмал - 20%, поливиниловый спирт - 2%, сахароза - 33%, силикат алюминий с примесью магния, кальция – остальное.

После приемки и контроля качества сырья компоненты, входящие в состав гранул Альбендазол – ММ, взвешивают. Затем компоненты смешивают в специальной мельнице, увлажняют смесь дистиллированной водой и пропускают через гранулирующую сетку, высушивают в сушильном шкафу при 30⁰С. в течение трёх часов.

Примеры. Для определения безвредности препарат вводят внутрь 4 кроликам из расчета 0,3 г гранулы на 10 кг веса животного и 4 овцам из расчета 1,7 г гранулы на 50 кг веса животного. В течение

10 суток наблюдения у всех животных должны отсутствовать отрицательные явления местного и общего характера.

Исследование по определению токсичности нового антигельминтика проводили в трех сериях на подопытных кроликах породы шиншилла (массой 2,5-2,7кг n=5). В результате опытов установлено, что максимальная переносимая доза (МПД) получаемого состава на кроликов равно ЛД₀₀=1г/кг, ЛД₅₀= 1,7г/кг, ЛД₁₀₀=2,5г/кг.

Внутреннее введение испытуемого препарата кроликам в течение 14 дней в дозе 0,1г/кг живой массы не вызывал каких либо отклонений от физиологической нормы. При патологоанатомическом вскрытии вынужденно убитых животных макроскопических изменений в паренхиматозных органах, мышцах и лимфатических узлах не регистрировано.

Результаты опытов показали, что разработанное соединение безвредно и является малотоксичным. При падеже хотя бы одного животного, наличии местной или общей отрицательной реакции проверку проводят на удвоенном количестве животных.

Определения активность проводили на больных гельминтозами (диктиокаулез, мониезиоз) овцах. С этой целью 4 овцам, вводили препарат в дозе 1,7 г гранулы на 50 кг массы тела. Животным контрольной группы препарат не вводили. Через 10 суток после введения препарата проводили капрологическое исследование на наличие яиц гельминтов. Партию препарата считают активной, если у животных опытных групп по сравнению, с контрольной группой спустя 10 дней не обнаруживают яйца гельминтов или отмечают гельминтоцидное действие препарата спустя 10 дней.

Вариант 2. Для производства альбендазола-ММ в форме таблеток применяют следующее сырье: Альбендазол - 19%, крахмал - 20%, поливиниловый спирт - 2%, сахароза - 33%, стеарат кальция – 1%, силикат алюминий с примесью магния, кальция – остальное.

После приемки и контроля качества сырья компоненты, входящие в состав таблетки Альбендазол – ММ, взвешивают. Затем компоненты смешивают в специальной мельнице, увлажняют смесь дистиллированной водой и пропускают через гранулирующую сетку, высушивают в сушильном шкафу при 30⁰С. в течение трёх часов. Гранулы обрабатывают смазывающим препаратом и таблетуют.

Примеры. Для определения безвредности препарат вводят внутрь 4 кроликам из расчета 0,25г. таблетки на 10 кг веса животного и 4 овцам из расчета одна таблетка 50 кг веса животного. В течение 10 суток наблюдения у всех животных должны отсутствовать отрицательные явления местного и общего характера.

Внутреннее введение испытуемого препарата кроликам в течение 14 дней в дозе 0,1г. таблет-

ки/кг живой массы не вызывал каких либо отклонений от физиологической нормы. При патологоанатомическом вскрытии вынужденно убитых животных макроскопических изменений в паренхиматозных органах, мышцах и лимфатических узлах не зарегистрировано.

Результаты опытов показали, что разработанное соединение безвредно и является малотоксичным. При падеже хотя бы одного животного, наличии местной или общей отрицательной реакции проверку проводят на удвоенном количестве животных.

Определения активность проводили на больных гельминтозами (диктиокаулез, мониезиз) овцах. С этой целью 4 овцам, вводили препарат в дозе 1 таблетка на 50 кг массы тела. Животным контрольной группы препарат не вводили. Через 10 суток после введения препарата проводили капрологическое исследование на наличие яиц гельминтов. Партию препарата считают активной, если у животных опытных групп по сравнению, с контрольной группой спустя 10 дней не обнаруживают яйца гельминтов или отмечают гельминтоцидное действие препарата спустя 10 дней.

Вариант 3. Для производства альбендазола-ММ в форме суспензии применяют следующее сырье: Альбендазол - 5%, поливиниловый спирт - 2%, силикат алюминий с примесью магния, кальция - 5%, полиэтиленгликоль - 10%, глицерин - остальное.

После приемки и контроля качества сырья компоненты, входящие в состав суспензии Альбендазол - ММ, взвешивают. Приготавливают растворы полиэтиленгликоля в глицерине и альбендазола в поливиниловом спирте, которые смешивают. В эту смесь добавляют силикат алюминия с примесью магния, кальция и др. микроэлементов и перемешивают. Осуществляют промежуточный контроль препарата, после чего проводят его асептическую фильтрацию.

Примеры. Для определения безвредности препарат вводят внутрь 6 кроликам из расчета 1 мл суспензии на 10 кг веса животного и 6 овцам из расчета 8 мл суспензии на 50 кг веса животного. В течение 10 суток наблюдения у всех животных должны отсутствовать отрицательные явления местного и общего характера.

Внутреннее введение испытуемого препарата кроликам в течение 14 дней в дозе 0,3мл/кг живой массы не вызывал каких либо отклонений от физиологической нормы. При патологоанатомическом вскрытии вынужденно убитых животных макроскопических изменений в паренхиматозных органах, мышцах и лимфатических узлах не зарегистрировано.

Результаты опытов показали, что разработанное соединение безвредно и является малотоксичным. При падеже хотя бы одного животного, наличии местной или общей отрицательной реакции проверку проводят на удвоенном количестве животных.

Определения активность проводили на больных гельминтозами (диктиокаулез, мониезиз) овцах. С этой целью 6 овцам, вводили препарат в дозе 8 мл суспензии на 50 кг массы тела. Животным контрольной группы препарат не вводили. Через 10 суток после введения препарата проводили капрологическое исследование на наличие яиц гельминтов. Партию препарата считают активной, если у животных опытных групп по сравнению, с контрольной группой спустя 10 дней не обнаруживают яйца гельминтов или отмечают гельминтоцидное действие препарата спустя 10 дней.

Терапевтический эффект испытуемого препарата изучали по сравнению с известными антигельминтиками альвет в форме 2,5% суспензии по 12мл/50кг живой массы и 18%-ый Альбен в форме таблеток 1 таб./50кг живой массы на 500 овцах больных диктиокаулезом и мониезизом. Альбендазол - ММ применяли в форме 22%-ных гранулы, которые вводили животным в дозе 2,0г/50кг живой массы, 19%-ный таблетки в дозе 1 таб./50 кг и в форме 5%-ный суспензии в дозе 8 мл/50 кг массы тела. Результаты опытов представлены в таблице.

Из данных таблиц видно, что наилучшей терапевтический эффект достигается при применении Альбендазол - ММ в форме 5%-ный суспензии в дозе 8 мл/50 кг массы тела. При этом лечебная эффективность достигается 97%, тогда как при применение альвета до 93% и при применение альбен таблетки достигала до 90%.

Таблица

Эффективность лечение гельминтозных заболеваний овец

Группы животных	Пробы	Кол-во ж-х, гол	Из них выздоровело	
			голов	%
Опытная	Альбендазол гранула	100	96	96,0
Опытная	Альбендазол таблетка	100	95	95,0
Опытная	Альбендазол суспензия	100	97	97,0
Контрольная	Альвет	100	93	93,0
Контрольная	Альбен таблетки	100	90	90,0

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Антигельминтный препарат, содержащий альбендазол и изготовленный в виде гранул, отличающийся тем, что дополнительно содержит крахмал, поливиниловый спирт, сахарозу и силикат алюминия с примесью магния, кальция при следующем соотношении компонентов, мас. %:

Альбендазол - 22

Крахмал - 20

Поливиниловый спирт - 2

Сахароза - 33

Силикат алюминия с
примесью магния, кальция – остальное

2. Антигельминтный препарат, содержащий альбендазол, отличающийся тем, что изготовлен в виде суспензии и дополнительно содержит поливиниловый спирт, полиэтиленгликоль, силикат алюминия с примесью магния, кальция и глицерина при следующем соотношении компонентов, мас. %:

Альбендазол - 5

Поливиниловый спирт - 2

Полиэтиленгликоль - 10

Силикат алюминия с
примесью магния, кальция - 5

Глицерин остальное

3. Антигельминтный препарат, содержащий альбендазол, отличающийся тем, что изготовлен в виде таблеток и дополнительно содержит крахмал, поливиниловый спирт, сахарозу, стеарат кальция и силикат алюминия с примесью магния, кальция при следующем соотношении компонентов, мас. %:

Альбендазол - 19

Крахмал - 20

Поливиниловый спирт - 2

Сахароза - 33

Стеарат кальция - 1

Силикат алюминия с
примесью магния, кальция – остальное

Компьютерный набор: Фатхуллоева М.С.

Заказ

Тираж

Подписное

Национальный патентно-информационный центр РТ
734042, г. Душанбе, ул. Айни, 14а.