



УКРАЇНА

(19) UA (11) 6794 (13) C1

(51) A 61 D 7/00; A 61 K 9/50

ДЕРЖАВНЕ
ПАТЕНТНЕ
ВІДОМСТВООПИС ДО ПАТЕНТУ
НА ВІНАХІД(54) ЛІКАРСЬКА ФОРМА ПРОЛОНГОВАНОЇ ДІЇ ДЛЯ ВВЕДЕННЯ В ПЕРЕДШЛУНКИ ЖУЙНИХ
ТВАРИН

1

(21) 93121840

(22) 09.03.93

(46) 29.12.94. Бюл. № 8-І

(56) Патент США № 4326522, А 61 К 9/50, 1982.

(71) Харківський зооветеринарний інститут
(72) Кузьмін Анатолій Альбертович, Малінін Олег Олексійович, Шеховцов Віталій Степанович

(73) Харківський зооветеринарний інститут (UA)

(57) Лекарственная форма пролонгированного действия для введения в преджелудки

2

жвачных животных, включающая имеющий отверстия контейнер из нерастворимого материала, заполненный твердой дисперсной системой, состоящей из дисперсионной среды и дисперсной фазы в виде порошкообразных лекарственных веществ или кормовых добавок, отличающаяся тем, что в качестве дисперсионной среды использована сера при следующем соотношении компонентов, мас. %:

дисперсионная среда	65-99
дисперсная фаза	1-35

Изобретение относится к ветеринарии и кормлению сельскохозяйственных животных и может быть использовано для лечения и профилактики заболеваний жвачных животных, а также для повышения их продуктивности.

Широко известно использование преджелудков жвачных животных, в связи с их анатомо-физиологическими особенностями, в качестве места нахождения лекарственных форм для длительного выделения лекарственных веществ и кормовых добавок. Постоянное выделение в преджелудках жвачных животных небольших количеств лекарственных веществ и кормовых добавок позволяет снизить курсовую дозу, повысить переносимость животными биологически активных веществ, уменьшить риск проявления их отрицательного действия и трудозатраты на ветеринарные обработки.

* Наиболее близкой по технической сущности к изобретению является лекарственная форма в виде капсулы цилиндрической

формы, содержащей лекарственную композицию из лекарственного вещества (левамизола или мебендазола) и биодеструктируемой основы (матрицы). Основу составляют сополимеры лактида и глюкозида (1).

Недостатком лекарственной формы является то, что биодеструкция полимерной основы протекает в течение 2 недель. Это ограничивает срок ее действия. Кроме того, полимерная матрица физиологически инертна и не оказывает лечебного, профилактического или стимулирующего действия на организм животных.

В основу изобретения поставлена задача создания лекарственной формы пролонгированного действия для введения в преджелудки жвачных животных, в которой за счет усовершенствования дисперсной системы, обеспечивается возможность дозирования как гидрофильных, так и гидрофобных веществ, за счет чего расширяется спектр вводимых веществ, а также ока-

(19) UA (11) 6794 (13) C1

зывается стимулирующее действие на организм жвачных животных.

Поставленная задача решается тем, что в лекарственной форме пролонгированного действия для введения в преджелудки жвачных животных, включающей имеющий отверстие контейнер из нерастворимого материала, заполненный твердой дисперсной системой, состоящей из дисперсионной среды и дисперсной фазы в виде порошкообразных лекарственных веществ или кормовых добавок, согласно изобретению в качестве дисперсионной среды использована сера при следующем соотношении компонентов, мас. %:

дисперсионная среда	65-99
дисперсная фаза	1-35

Вследствие медленного растворения и биодеструкции дисперсионной среды в преджелудках жвачных животных, освобождается дисперсная фаза - лекарственные вещества или кормовые добавки. Характер дисперсной фазы (в т.ч. растворимость в воде) не оказывает существенного влияния на скорость растворения и биодеструкцию серы, которая зависит от свойств рубцовой жидкости и площади смачиваемой поверхности. Высвобождаемые лекарственные вещества и/или кормовые добавки покидают контейнер и переходят через отверстия в нем в полость преджелудков путем конвекции. Скорость биодеструкции сплава серы с вводимыми в организм жвачных животных веществами и, следовательно, продолжительность действия лекарственной формы, можно регулировать размерами помещаемых в контейнер частей дисперсной системы.

Минимальная и максимальная концентрация дисперсной фазы в дисперсной системе зависит от механических свойств получаемой дисперсной системы. При концентрации дисперсной фазы более 35 мас. % вязкость расплава не позволяет формировать изделия определенной формы. При концентрации дисперсной фазы менее 1 мас. %, вследствие возникновения напряжений из-за малой теплопроводности чистой серы, резко снижается механическая прочность получаемых лекарственных форм.

Для экспериментальной проверки были подготовлены пять смесей ингредиентов. Для этого серу осажденную (Государственная фармакопея X, с. 644) тщательно смешивали с измельченным в мельчайший порошок антигельминтиком фенбендазолом, затем помещали в фарфоровую чашку и нагревали до температуры от 119°C (температура плавления серы) до 233°C (температура разложения фенбендазола) и

перемешивали для получения смеси однородного состава. В полученном расплаве сера находится в жидком состоянии, а фенбендазол - в твердом. Расплав выливали в форму и охлаждали на воздухе до затвердевания.

Данные экспериментальной проверки представлены в таблице.

Была изготовлена лекарственная форма пролонгированного действия для введения в преджелудки жвачных животных в виде контейнера с отверстиями, внутри которого была размещена дисперсная система в виде цилиндрического слитка высотой 80 мм и диаметром 20 мм. В качестве дисперсионной среды применили серу, 65 мас. %, а в качестве дисперсной фазы - фенбендазол, 35 мас. % лекарственную форму поместили в колбу, заполненную буферным раствором (температура 38°C, pH 6,5). Установили, что биодеструкция дисперсной системы произошла за срок более 3,5 месяцев.

В отличие от лекарственных форм матричного типа, где лекарственные вещества и/или кормовые добавки вводятся в полимерную матрицу, в лекарственной форме пролонгированного действия для введения в преджелудки жвачных животных по изобретению дисперсная среда, а именно сера, не является чужеродным для организма жвачных животных веществом. Широко известно, что благодаря микрофлоре, содержащейся в преджелудках, а также в кишечнике жвачных животных, сера принимает участие в синтезе серосодержащих аминокислот, а также способствует усилению витаминобразовательной функции, что благотворно влияет на рост и развитие жвачных животных.

На фиг.1 заявленная лекарственная форма изображена в вертикальном разрезе.

Фиг.2 - то же, поперечный разрез.

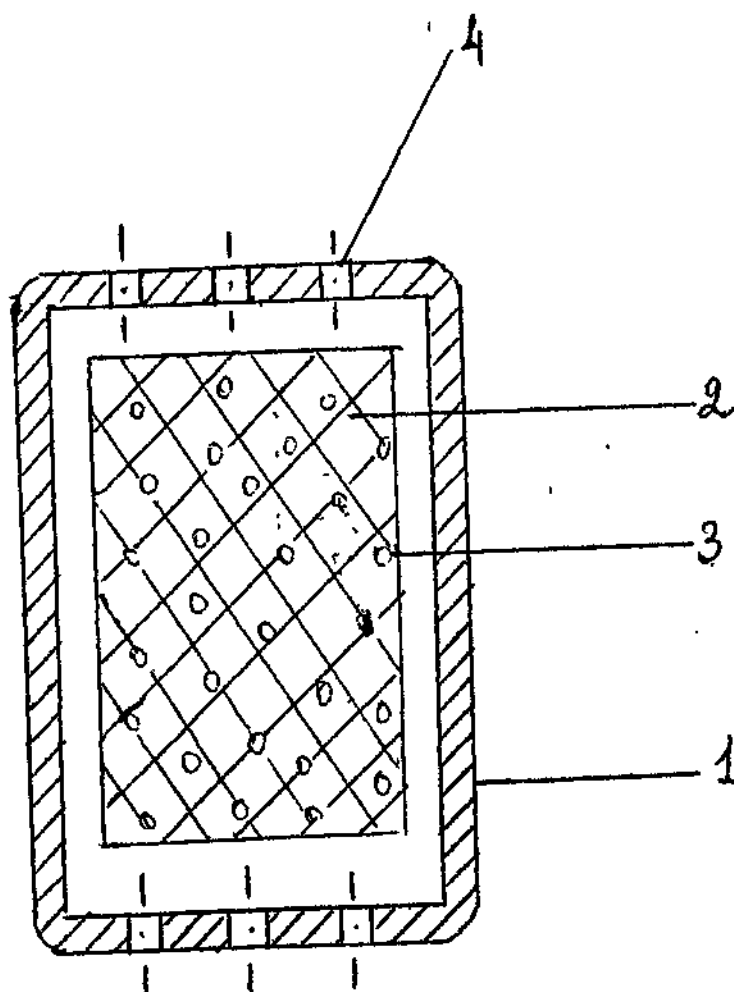
Лекарственная форма пролонгированного действия для введения в преджелудки жвачных животных (фиг.1, фиг.2) представляет собой цилиндрический наполненный контейнер, состоящий из корпуса 1, дисперсионной среды 2, дисперсной фазы 3 и отверстий в корпусе 4.

Предварительно изготовленный цилиндрический контейнер вводят через рот в преджелудок жвачного животного. Содержимое преджелудка проникает через отверстия 4 внутрь корпуса 1, где воздействует на дисперсионную среду 2, что приводит к постепенной деструкции этой среды, а именно серы. При этом освобождаются частички дисперсной фазы 3, которые поступают че-

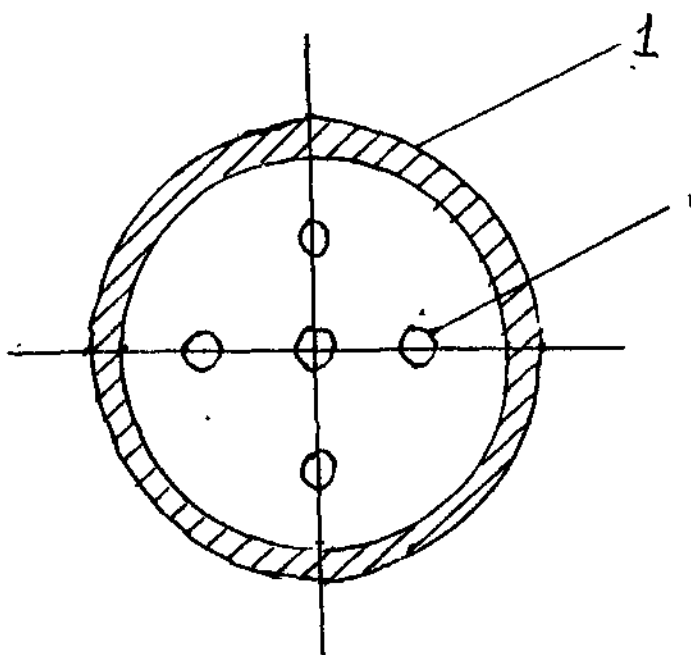
рез отверстия 4 корпуса 1 в содержимое преджелудка и оказывают соответствующее

воздействие, согласно функции веществ, применяемых в качестве дисперсной фазы.

№№	Соотношение между дисперсионной средой и дисперсной фазой, мас. %	Формируемость лекарственных форм путем литья	Растрескиваемость готовых лекарственных форм при поверхностном нагреве до 40°C
1	50-50	не формируются	не растрескиваются
2	65-35	формируются	не растрескиваются
3	80-20	формируются	не растрескиваются
4	99-1	формируются	не растрескиваются
5	99.5-0.5	формируются	растрескиваются



Фиг. I



Фиг. 2

Упорядник А.Кузьмін

Техред М.Моргентал

Коректор Л.Пилипенко

Замовлення 645

Тираж

Підписне

Державне патентне відомство України,
254655, ГСП, Київ-53, Львівська пл., 8

Виробничо-видавничий комбінат "Патент", м. Ужгород, вул.Гагаріна, 101