



(19) RU (11) 2 129 430 (13) C1
(51) МПК⁶ A 61 K 35/70

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 98103980/13, 17.03.1998

(46) Дата публикации: 27.04.1999

(56) Ссылки: Волков Ф.А., Апалькин В.А.
Ивермектин в ветеринарии. - Новосибирск:
МСДАГВЕТ, 1995, 33 с.

(98) Адрес для переписки:
117218, Москва, Б.Черемушкинская, 28, ООО
"ВИК - здоровье животных"

(71) Заявитель:

Общество с ограниченной ответственностью
"ВИК - здоровье животных"

(73) Патентообладатель:

Общество с ограниченной ответственностью
"ВИК - здоровье животных"

(54) ПРЕПАРАТ ДЛЯ БОРЬБЫ С ЭКТО- И ЭНДОПАРАЗИТАМИ ЖИВОТНЫХ "САНТОМЕКТИН"

(57) Реферат:

Изобретение относится к области ветеринарии. Предложенный препарат Сантомектин рекомендуется для профилактики и лечения болезней, вызываемых эндо- и эктопаразитами.

Препарат содержит в качестве активных компонентов авермектиновый комплекс и клозантел. Сочетание компонентов в определенном соотношении обеспечивает высокий терапевтический эффект при уменьшенном содержании авермектина.

R U
2 1 2 9 4 3 0
C 1

RU
2 1 2 9 4 3 0
C 1



(19) RU (11) 2 129 430 (13) C1
(51) Int. Cl. 6 A 61 K 35/70

RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: 98103980/13, 17.03.1998

(46) Date of publication: 27.04.1999

(98) Mail address:
117218, Moskva, B.Cheremushkinskaja, 28, OOO
"VIK - zdrorov'e zhivotnykh"

(71) Applicant:
Obshchestvo s ogranicennoj
otvetstvennost'ju "VIK - zdrorov'e zhivotnykh"

(73) Proprietor:
Obshchestvo s ogranicennoj
otvetstvennost'ju "VIK - zdrorov'e zhivotnykh"

(54) PREPARATION "SANTOMECTIN" FOR ECTO- AND ENDOPARASITES CONTROL IN ANIMALS

(57) Abstract:

FIELD: veterinary science. SUBSTANCE:
invention proposes the preparation
"Sandomectin" that can be recommended for
prophylaxis and treatment of animals with
sicknesses caused by endo- and

ectoparasites. Preparation has an avermectin
complex and clozantel as active components.
Combination of components taken at the
definite ratio provides high therapeutic
effect at decreased dose of avermectin.
EFFECT: enhanced effectiveness. 10 ex

R U
2 1 2 9 4 3 0
C 1

RU
2 1 2 9 4 3 0
C 1

RU ? 1 2 9 4 3 0 C1

R
U
2
1
2
9
4
3
0
C
1

Изобретение относится к области ветеринарии и может быть использовано для профилактики и лечения болезней, вызываемых эндо- и эктопаразитами животных.

Известен антипаразитарный препарат ЦИДЕКТИН, выпускаемый фирмой "Цианамид" (США), который содержит в качестве активного вещества моксидектин.

Препарат широко используется для борьбы с кишечными клещами, вшами, чесоточными клещами, вшами и другими паразитами животных (Чирх Г., Ветеринарные препараты фирмы "Цианамид", Ветинформ, N 1, 1992, с. 13-14).

Недостатком препарата является высокое содержание активного вещества в лечебной дозе (20 мг/100 кг массы животного).

Известно семейство соединений - АВЕРМЕКТИНЫ -, представляющих собой комплекс из восьми близких в химическом отношении веществ, которые, в свою очередь, представляют собой 16-членный макролидный лактон, соединенный с двумя остатками сахара омандрозы.

Авермектиновые компоненты имеют обозначение: A_{1a}, A_{1b}, A_{2a}, A_{2b}, B_{1a}, B_{1b}, B_{2a}, B_{2b}.

Авермектины являются продуктом жизнедеятельности культуры *Srf. avermitilis*.

Авермектины представлены тремя препаратами:

Абамектин - авермектиновый комплекс, содержащий не менее 80% авермектина B_{1a} и не более 20% авермектина B_{1b}.

Ивермектин - полусинтетическое дигидрированное производное авермектина, содержащий не менее 80% дигидроавермектина B_{1a} и не более 20% дигидроавермектина B_{1b} (Campbell W.C., Ivermectyn and Abamectyn. - Springer-Verlag. - New York-Berlin-London-Paris-Tokyo. - 1989, - 363 р.).

Дорамектин - аверметкин B₁, содержащий в положении C₂₅-циклогексил (Архипов И.А. и др.-ж. Ветеринария, 1997. - N 2. стр. 34-38).

Данные препараты являются противопаразитарными средствами широкого спектра действия, применяются раздельно, в основном парентерально, реже - перорально.

Однако авермектины не эффективны против цestодозов и trematodозов животных.

Наиболее глубоко и всесторонне изучен ИВЕРМЕКТИН в различных лекарственных формах (Волков Ф.А., Апалькин В.А., Ивермектин в ветеринарии, Новосибирск, МСДАГВЕТ, - 33 с.)

Ивермектин вызывает гибель нематод членистоногих. Механизм действия этого вещества на различных паразитов неодинаков, но общим является влияние его на передачу нервных импульсов между нервыми клетками или от нервной клетки к клетке мышечной ткани посредством нейромедиатора-гамма-аминомасляной кислоты.

Данный препарат принят за прототип.

Целью изобретения является снижение содержания антипаразитарного вещества в лечебной дозе препарата и расширение спектра его действия.

Поставленная цель достигается тем, что в состав препарата дополнительно введен клозантел.

Клозантел является действующим веществом таких противопаразитарных препаратов, как фасковерм, ронелон и сантел.

Клозантел - C₂₂H₁₄Cl₂I₂N₂O₂ -

N-[5-chloro-4-[4-chloro-phenyl)cyanomethyl]2-methylphehy]-2-hydroxy-3.5 diiodobenzamide - обладает широким спектром действия, активен в отношении экто- и эндопаразитов, в том числе *Fasciola hepatica*, *Fasciola gigantica*, *Bunostomum sp.*, *Haemonchus contortus*, *Haemonchus placei*, *Oesophagostomum radiatum* и др.

Механизм действия препарата заключается в изменении процессов фосфорилирования и переноса электронов в организме паразита, что приводит к нарушению энергетического обмена и гибели паразита (Closantel, a new antiparasitic hydrogen ionophore. Van den Bossche, H.; Verhoeven, H.; Vanparus, O. et all; Archives International's de Physiologie et de Biochemie, 1979 Vol. 87 (4) 851-3).

Предложенный нами препарат содержит, мас.%:

Авермектиновый комплекс (абамектин или ивермектин или дорамектин) - 0,025 - 20,0

Клозантел - 0,5 - 25,0

Растворители или наполнители, стабилизаторы, консерванты - До 100

Препаратуре присвоено название "Сантомектин".

Анализ известного уровня техники показал отсутствие какой-либо информации о технических решениях, полностью совпадающих по совокупности существенных признаков с заявленным средством, что позволяет сделать вывод о соответствии предложенного технического решения условию патентоспособности "новизна".

Только сочетание заявленных компонентов в заявлении соотношении позволяет достичь эффект, указанный в цели изобретения, что позволяет сделать вывод о соответствии заявленного препарата условию патентоспособности "изобретательский уровень".

Препарат соответствуют также условию патентоспособности "промышленная применимость", т.к. может широко использоваться в ветеринарной практике.

Получают препарат путем смешивания и растворения компонентов, а затем при необходимости его фильтруют, стерилизуют, расфасовывают во флаконы или ампулы.

В качестве растворителей используют диметилацетамид, диметилсульфоксид, диметилформамид, N-метилпирролидон, спирты, полиэтиленгликоли, пропиленгликоли, триглицериды, бензиловый эфир бензойной кислоты, глицерол формаль, масла (кунжутное, оливковое, персиковое, абрикосовое, миндальное) и другие. В качестве стабилизаторов - лимонную кислоту, аскорбиновую кислоту, ЭДТУ, гидроокись натрия или калия, а в качестве консервантов - бензиловый спирт, метилпарабен, пропилпарабен и другие.

Препарат может быть использован в форме растворов: инъекционных, оральных, накожных (в виде rug on и spot on), супензий, а также в форме порошков, болюсов, таблеток и паст.

Наполнителями для порошков могут быть

R U ? 1 2 9 4 3 0 C 1

сахара (лактоза, глюкоза, фруктоза), цеолиты, мел, мука, аэросил и другое.

Примеры, приведенные ниже, характеризуют биологическую активность предложенного препарата.

Пример 1

На 38 головах бычков в возрасте 2 - 2,5 года спонтанно инвазированных желудочно-кишечными нематодами и фасциолами испытали лекарственную форму ивермектина с клозантелом в дозах соответственно по 0,1 и 2,5 мл ДВ/кг в форме инъекционного раствора, подкожно. Перед лечением копроовоскопическими исследованиями установлено, что бычки интенсивно инвазированы желудочно-кишечными стронгилятами и фасциолами. На 32 день после лечения послеубойное вскрытие показало, что против фасциол Экстенс эффективность (ЭЭ) составила 91,5%, а интенс эффективность (ИЭ) - 99,4%, против нематод соответственно 90,8 и 99,6%.

Пример 2

На 215 головах овец в возрасте 2 года, пораженных псороптозом и саркоптозом, а также желудочно-кишечными стронгилятами испытали аналогичный инъекционный раствор клозантела и дорамектина в дозах по ДВ соответственно 2 и 0,15 мл/кг массы тела, внутримышечно. На 15 день после лечения живых клещей на теле животных обнаружено не было. Эффективность против гельминтов (ЭЭ) составила 100%.

Пример 3

На 30 головах крупного рогатого скота спонтанно инвазированного желудочно-кишечными стронгилятами и фасциолами испытали порошкообразную форму смеси клозантела с ивермектином. Доза ДВ соответственно 10 и 0,1 мл/кг. ЭЭ против нематод составила 99,7% а против фасциол - 98,5%.

Пример 4

При гиподерматозе крупного рогатого скота ввели подкожно раствор клозантела с абамектином в дозах ДВ соответственно 1,5 и 0,1 мл/кг 65 коровам. Обработка проведена в октябре 1996 года, эффективность учитывали в апреле 1997 г. Исследования кожи коров в области спины, крупа, боков показали отсутствие желваков гиподермы.

Пример 5

На другой группе коров (20 голов) испытали пурон, содержащий в качестве ДВ клозантел и ивермектин. Пурон наносили на кожу спины из расчета по ДВ соответственно 5 и 0,15 мл/кг. В этом опыте и следующем животные были поражены диктиоулеозом. Копроовоскопическими исследованиями установлено, что ЭЭ составила 99,8%.

Пример 6

Аналогичной группе коров ввели орально раствор клозантела в сочетании с ивермектином из расчета по ДВ соответственно 7 и 0,1 мл/кг в форме орального раствора. Копроовоскопическое исследование, проведенное спустя 2 недели после лечения, показало ЭЭ, равную 98,4%.

Пример 7

Производственные испытания эффективности борьбы с фасциолами и желудочно-кишечными стронгилятами проведены на 70 коровах, которым ввели внутримышечно раствор клозантела в смеси с

абамектином в дозах по ДВ соответственно 2,5 и 0,1 мл/кг. Послеубойное вскрытие показало, что против незрелых фасциол ЭЭ = 98,6 и ИЭ = 91,2%, а против зрелых форм - ЭЭ = 98,8 и ИЭ = 99,7%.

Пример 8

В опыте на 45 коровах и нетелях отмечено прекращение отхождения личинок диктиоула и яиц фасциол с фекалиями через 3 недели после лечения. Перорально вводили болюсы с клозантелом и ивермектином в дозах ДВ соответственно 3 и 0,1 мл/кг.

Пример 9

На 3 головах лошадей с клинически выраженным признаками онхоцеркоза испытали лекарственную форму клозантела с ивермектином соответственно по 2,5 и 0,1 мл ДВ/кг в форме пасты перорально. После убоя животных в исследованных образцах связок живых онхоцерков обнаружено не было.

Пример 10

Производственные испытания эффективности борьбы с нематодами, а также с саркоптозом и сифункулятиозе свиней проведены на 47 подсвинках, которым ввели внутримышечно раствор клозантела в смеси с абамектином в дозах по ДВ соответственно 2,5 и 0,1 мл/кг. Послеубойное вскрытие показало, что против нематод ЭЭ = 93,1 и ИЭ = 97,4%. Эффективность против эктопаразитов составила 100%.

Таким образом, получен высокоэффективный препарат "Сантомектин", который может быть использованы при таких заболеваниях животных, как псороптоз, саркоптоз, сифункулятиоз и нематодозы, а также при фасциолезе, диктиоулеозе, гиподерматозе и телязиозе крупного рогатого скота; фасциолезе, диктиоулеозе и эстрозе мелкого рогатого скота.

Высокий терапевтический эффект предложенной лекарственной формы, в которой содержание авермектина вдвое занижено, обусловлен присутствием в препарате клозантела и его синергидным взаимодействием с авермектином.

Это отмечено в отношении желудочно-кишечных нематод, диктиоула, фасциол, гиподерм, чесоточных клещей и при эстрозе.

Лекарственная форма препарата в виде порошка с цеолитом или мелом хорошо поедается животными, обладает высоким терапевтическим эффектом и удобна в практическом применении.

Также удобна обработка животных сантомектином в форме rug op, т.к. такую обработку может проводить только один ветеринарный специалист и при этом не требуется дополнительная рабочая сила для фиксации животных.

Инъекционная форма сантомектина не обладает местно-раздражающим действием и не вызывает беспокойства животных.

Формула изобретения:

Препарат для борьбы с экто- и эндопаразитами животных на основе авермектинов, отличающийся тем, что дополнительно содержит клозантел, а также растворители или наполнители, стабилизаторы и консерванты, а в качестве авермектинов - авермектиновый комплекс: абамектин, или ивермектин, или дорамектин при следующем соотношении компонентов, мас.%:

Авермектиновый комплекс (абамектин, или
ивермектин, или дорамектин) - 0,025 - 20,0
Клозантел - 0,5 - 25,0

Растворители или наполнители,
стабилизаторы, консерванты - До 100

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

R U ? 1 2 9 4 3 0 C 1

R U 2 1 2 9 4 3 0 C 1