Изучение седативной активности препарата Лексон

Комиссаренко А.Н., Кошевой О.Н., Ковалева А.М., Комиссаренко Н.А

Кафедра фармакогнозии, кафедра химии природных соединений, Национальный фармацевтический университет, г. Харьков, Украина

xxx25spiderxxx@yandex.ru

Фармакотерапия расстройств сна является актуальной проблемой в связи с их широкой распространенностью – 95% населения в течение жизни имели проблемы со сном, 36% - жалуются на бессонницу, в Украине около 26% пациентов, обратившихся за медицинской помощью, страдают бессонницей [1,3].

Направление исследований фармакологических свойств раствора для перорального применения Лексон определено, исходя из показаний к его медицинскому применению в качестве снотворного средства.

При этом учитывали, что исследование психофармакологических средств в значительной степени затруднено невозможностью адекватного моделирования психопатологических нарушений у животных, вследствие чего изучение их свойств обычно проводят путем выявления тех видов активности, которые присущи известным и клинически исследованным аналогам.

В соответствии с этим и основываясь на данных литературы о фармакологическом профиле снотворных препаратов, прежде всего зопиклона, настоящие исследования были направлены на выявление у разработанного препарата седативной активности.

Фармакологические эффекты препарата Лексон оценивали в общепринятых в психофармакологии тестах, в том числе с учетом методических рекомендаций ГФЦ МЗ Украины «Экспериментальное (доклиническое) изучение фармакологических веществ, предлагаемых в качестве транквилизаторов и нейролептиков». Изучали влияние препарата на спонтанно-двигательную активность крыс в тесте “открытое поле” [2].

Исследования проводили только при внутрижелудочном введении препарата в дозах от 0,5 до 30 мг/кг (по зопиклону), которые соответствуют диапазону фармакологически активных доз зопиклона в различных видов экспериментов. При этом в зависимости от вида экспериментальных исследований осуществляли предварительный подбор эффективных доз. Из раствора Лексон удаляли этиловый спирт выпариванием.

В качестве препаратов сравнения использовали таблетки Имован, содержащие 7,5 мг зопиклона («Рон-Пуленк Рорер», Франция), и смесь фитокомпонентов в концентрациях, аналогичным их содержанию в препарате Лексон.

Статистическую обработку результатов проводили с использованием пакета статистического анализа электронных таблиц Excel. Рассчитывали средние значения показателей (x) и стандартную ошибку (S_x). Достоверность

различий между средними определяли по критерию Стъюдента. Вероятность полученных результатов оценивали на уровне значимости не менее 95% ($P \leq 0.05$).

При оценке поведенческих реакций крыс в тесте "открытое поле" установлено, что однократное внутрижелудочное введение изучаемых препаратов вызывает дозозависимое снижение числа стоек (исследовательская активность) и пересеченных квадратов (спонтанная двигательная активность), которое в большей из изученных доз достигает достоверных различий сравнительно с нелеченным контролем. Сравниваемые препараты не вызывают достоверных изменений показателей эмоциональной активности крыс.

$ЭД_{50}$ седативного эффекта, рассчитанные по показателям исследовательской активности, составляют для раствора Лексон – 3,2 мг/кг, для таблеток Имован – 7,6 мг/кг; $ЭД_{50}$, рассчитанные по показателям спонтанной двигательной активности, для раствора Лексон – 3,3 мг/кг, для Имована – 6,5 мг/кг.

Полученные результаты свидетельствуют, что в тесте «открытое поле» Лексон оказывает характерные для снотворных препаратов депримирующие эффекты на поведенческие реакции крыс количественно эквивалентные эффектам препарата сравнения, но дозы которого были в 2-2,4 раза выше. По-видимому, включение в состав разработанного препарата фитокомпонентов седативного действия существенно потенцирует эффект зопиклона.

Литература

1. Аведисова А.С., Краснов В.Н., Милопольская И.М. и др. Современный гипнотик пиклодорм (зопиклон): результаты многоцентрового изучения // Психиатр. психофармакотер. – 2003. – Т. 5, N 1. – С. 20-22.
2. Комиссаров И.В., Тихонов В.Н. Экспериментальное (доклиническое) изучение фармакологических веществ, предлагаемых в качестве транквилизаторов и нейролептиков // Доклинические исследования лекарственных средств. Методические рекомендации. – Киев. : «Авиценна». – 2002. – С. 374-383.
3. Сыропятов О.Г., Дзеружинская Н.А. Лечение расстройств сна у пациентов инволюционного возраста. // Здоров’я України. – 2002. – С. 24-25.