

Белорусская медицинская академия последипломного
образования

**НОВЫЕ ВОЗМОЖНОСТИ ИСПОЛЬЗОВАНИЯ
РАСТВОРА КИСЛОТЫ АЦЕТИЛСАЛИЦИЛОВОЙ
ДЛЯ ИНЪЕКЦИЙ В ПРОФИЛАКТИКЕ И
ЛЕЧЕНИИ ВОСПАЛИТЕЛЬНЫХ И
ТРОМБОЭМБОЛИЧЕСКИХ СОСТОЯНИЙ В
ОФТАЛЬМОЛОГИЧЕСКОЙ ПРАКТИКЕ.**

Гюрджян Т.А., Бондаренко А.И., Дудич О.Н

Минск 2005

Цель исследования

Разработать солюбилизованную, пролонгированную лекарственную форму кислоты ацетилсалициловой для инъекций (КАСи), как средство патогенетически направленного лечения и профилактики воспалительных заболеваний и тромбозно-эмболических состояний.

Задачи

- Увеличить растворимость и пролонгированность действие КАС с помощью соответствующего солюбилизатора и добиться уменьшения побочных эффектов препарата.
- Разработать технологический регламент сублимационной сушки экстенпорального приготовления раствора КАС.

Задачи

- **Разработать методику патогенетически направленной профилактики и лечения воспалительных и тромбозэмболических процессов в глазу с использованием новой лекарственной формы КАС.**
- **Провести сравнительное изучение эффективности противовоспалительного, антипростагландинового, антиагрегантного действия новой лекарственной формы КАС.**

Схема технологического процесса

I стадия.

Приготовление 1% раствора КАС в гемодезе.

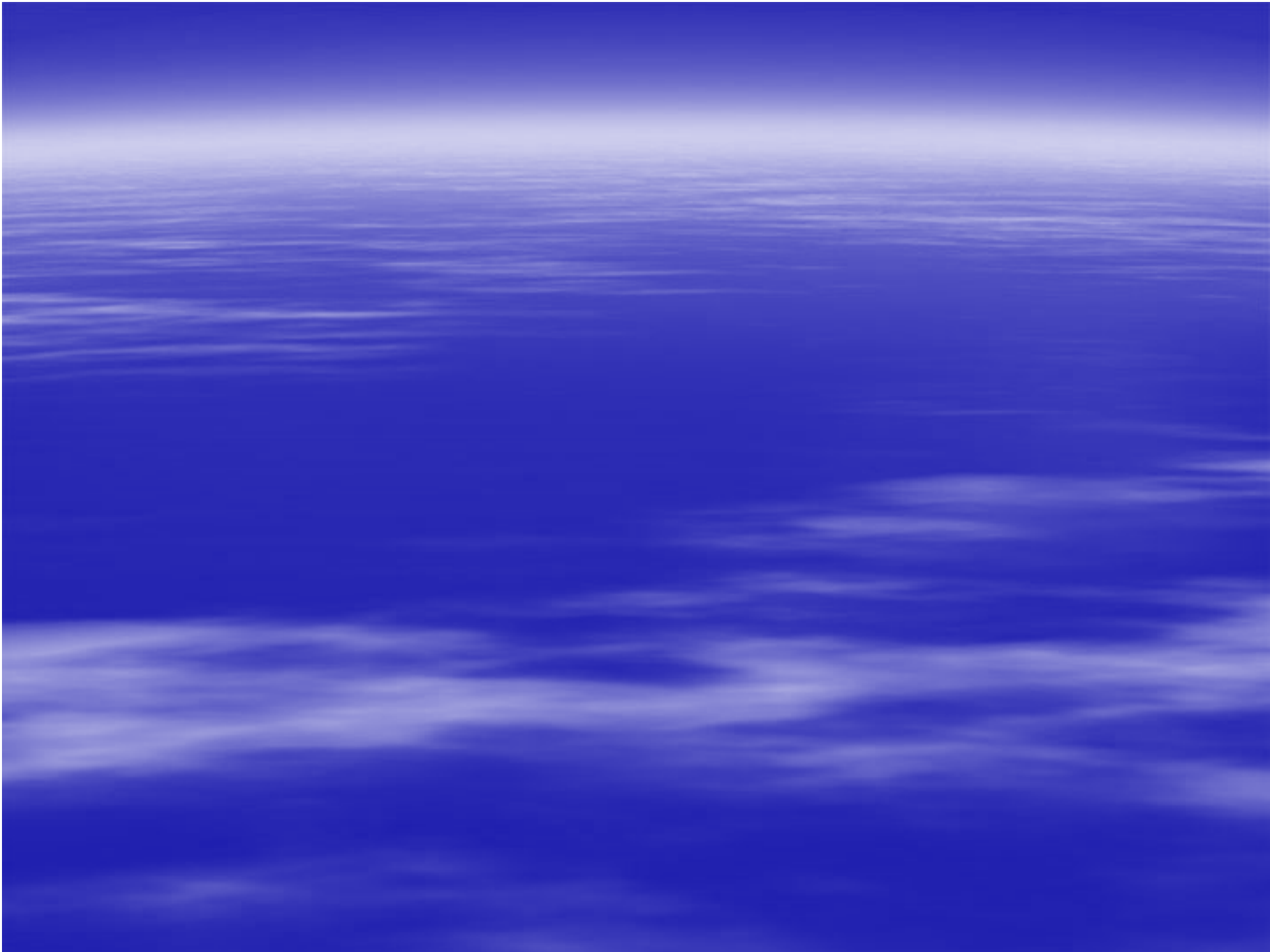
Операция 1. Приготовление раствора гемодеза .

Операция 2. Растворение порошка КАС в гемодезе.

Операция 3. Контроль pH, количественного содержания КАС.

II стадия.

Стерилизующая фильтрация и розлив препарата.



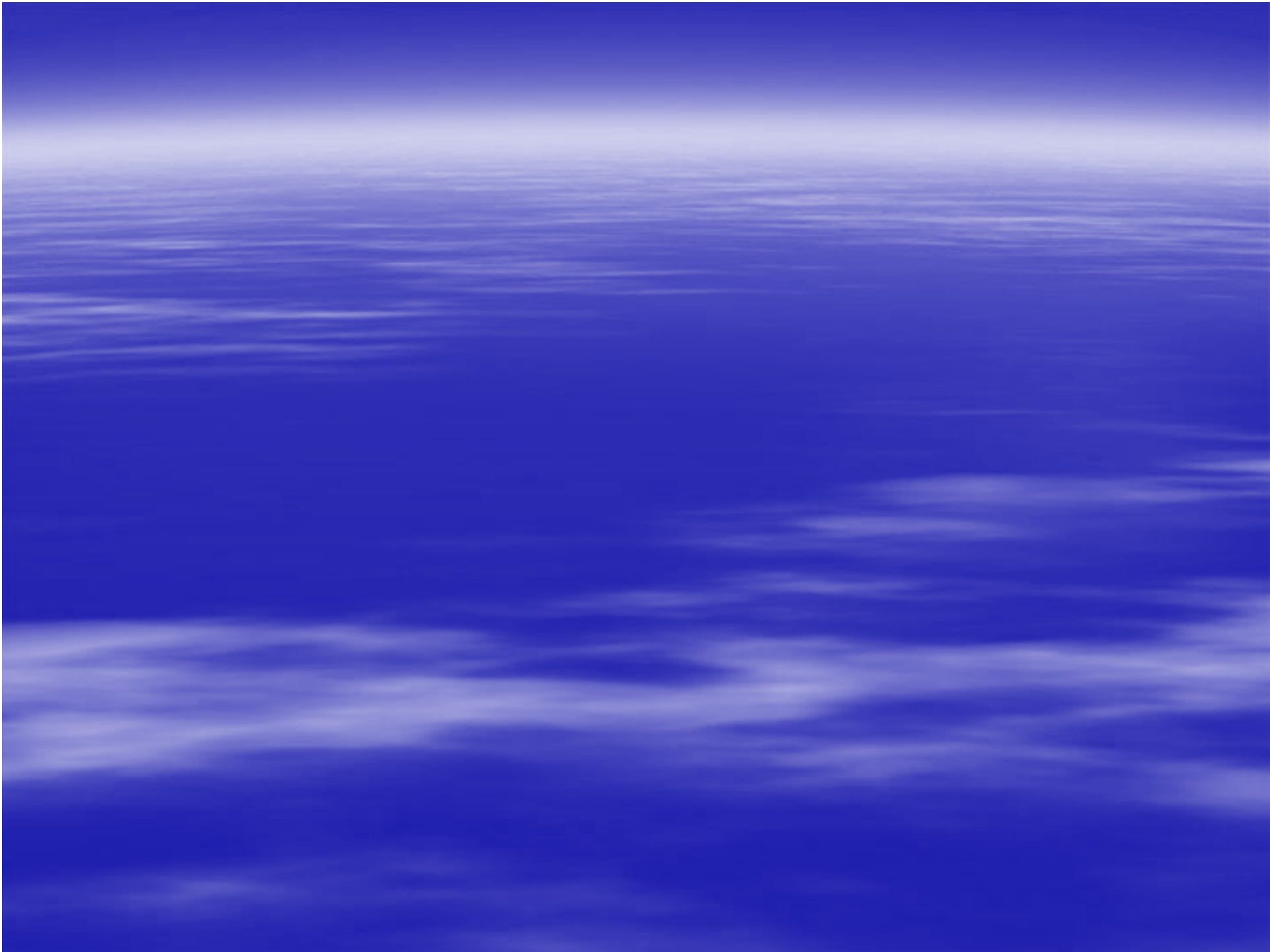


Схема технологического процесса

III стадия.

Получение лиофилизированного препарата

Операция 1. **Замораживание, «закалка».**

Операция 2. **Лиофильная сушка**

IV стадия.

Контроль готового препарата.

V стадия.

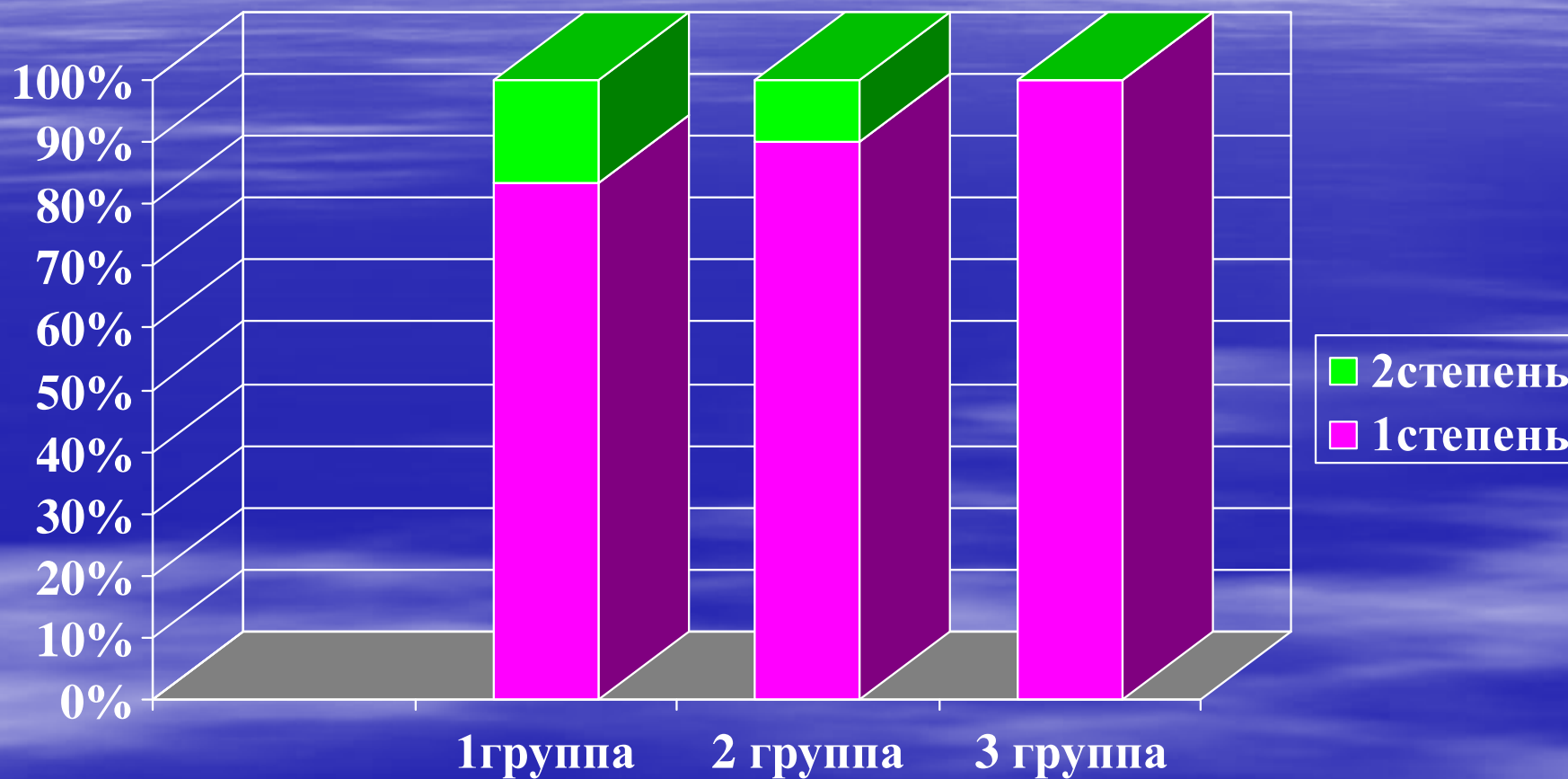
Бракераж, маркировка, упаковка.

РЕЗУЛЬТАТЫ

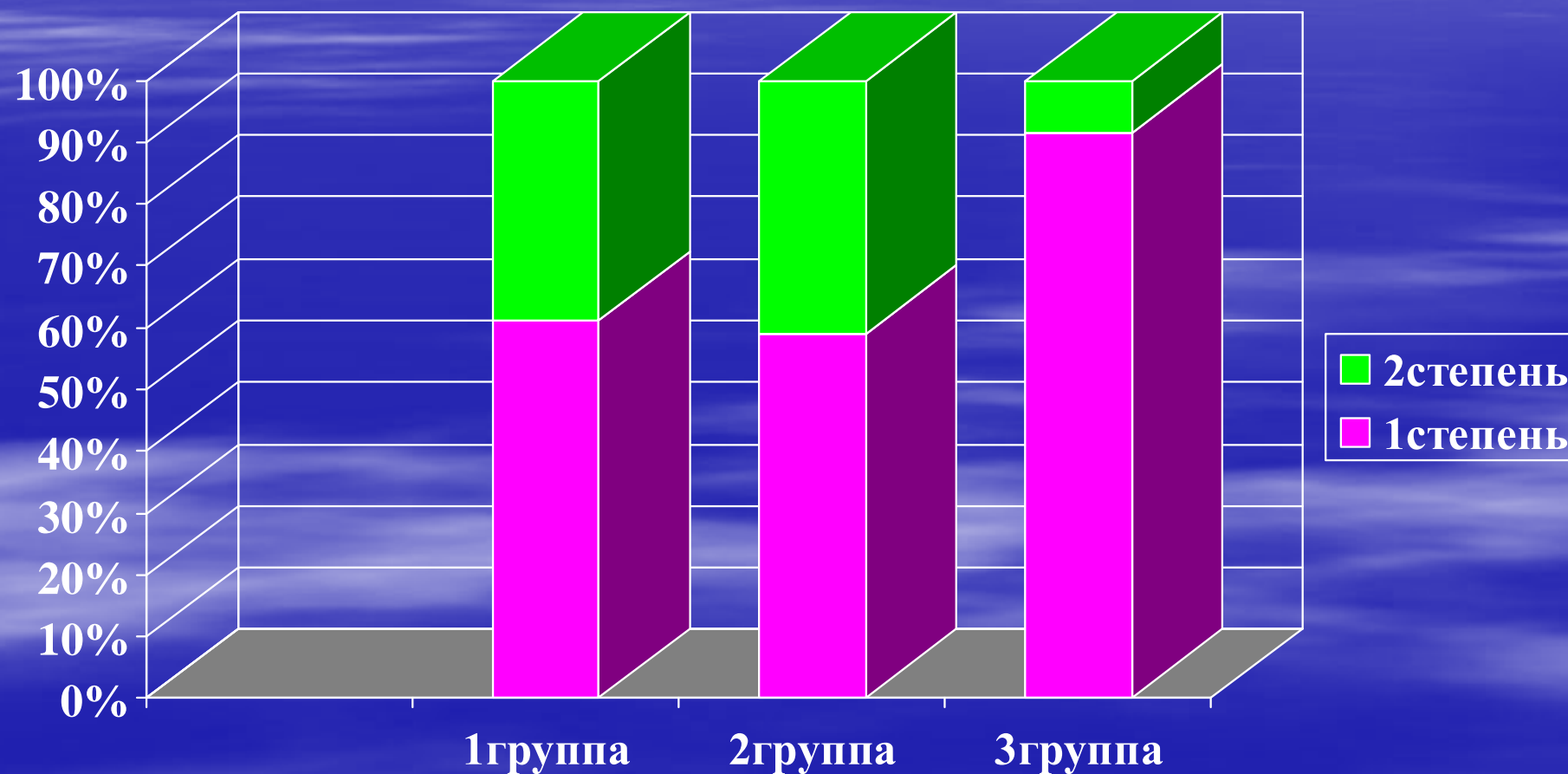
Состав раствора:

Кислоты ацетилсалициловой	10.0
Поливинилпирролидона низко- молекулярного медицинского	60.0
Натрия хлорида	5.5
Калия хлорида	0.42
Кальция хлорида	0.5
Магния хлорида	0.005
Натрия гидрокарбоната	0.23
Воды для инъекций	до 1 л.

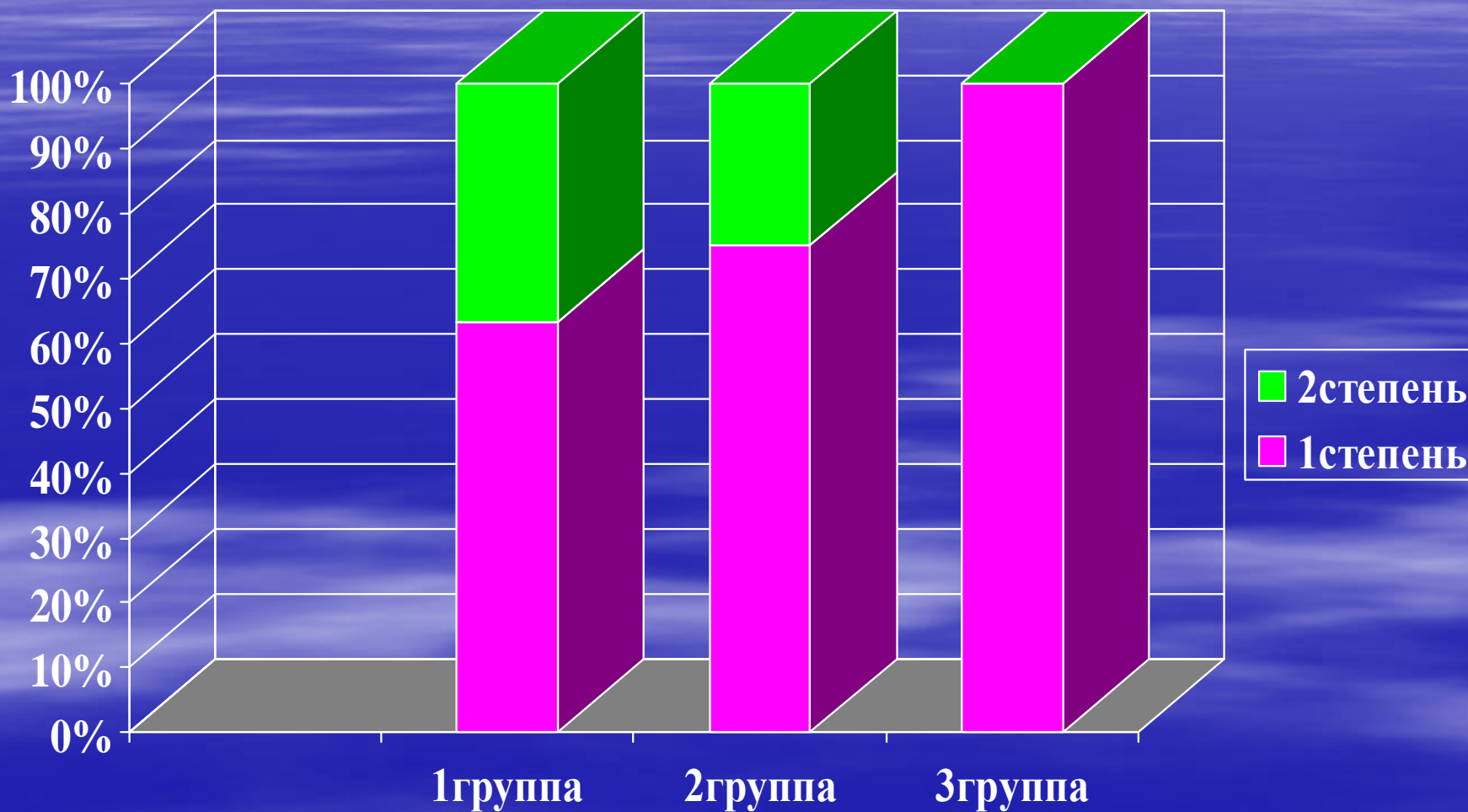
Выраженность экссудативной реакции в первые сутки после операции



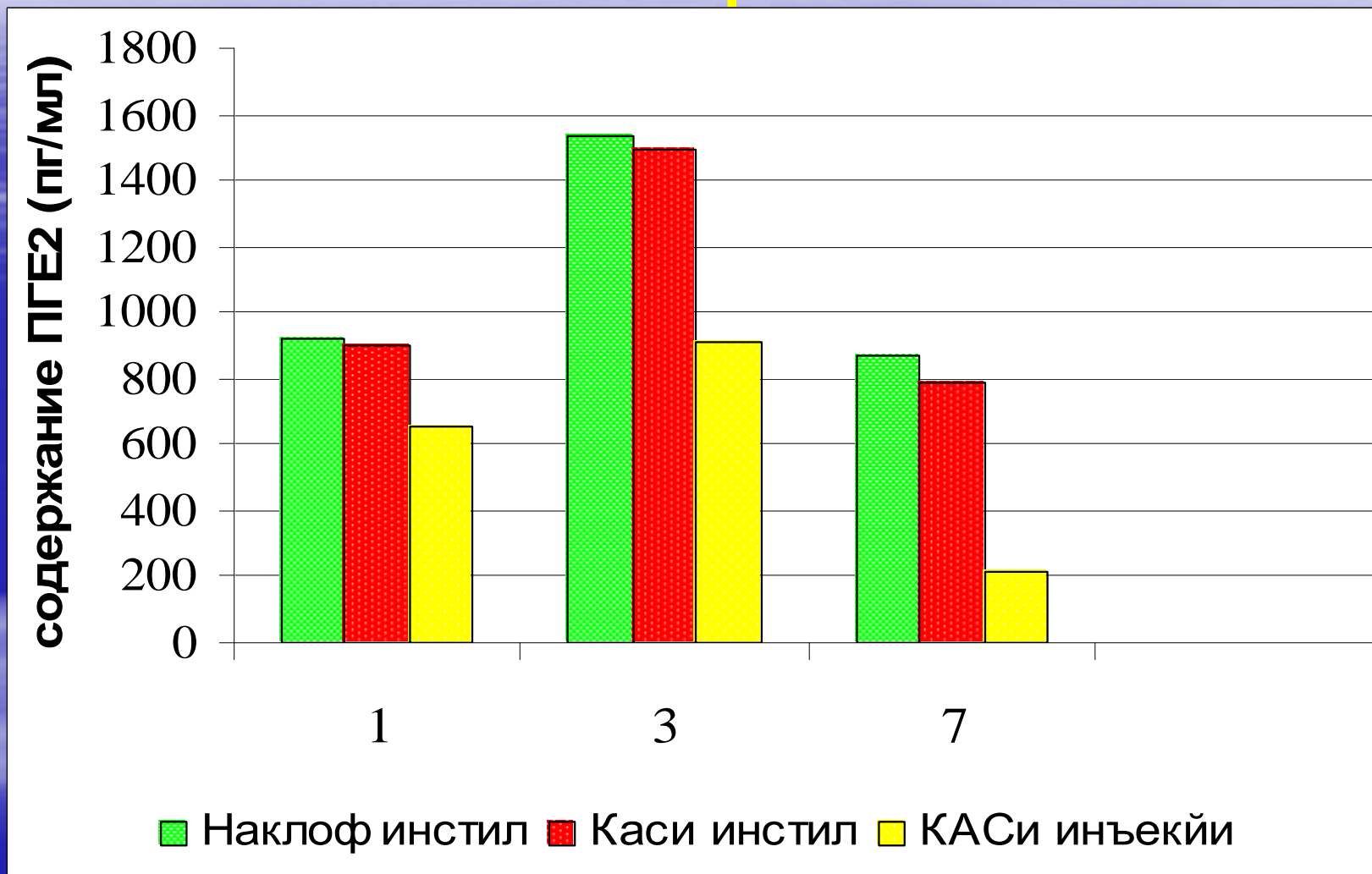
Выраженность эксудативной реакции на третьи сутки после операции



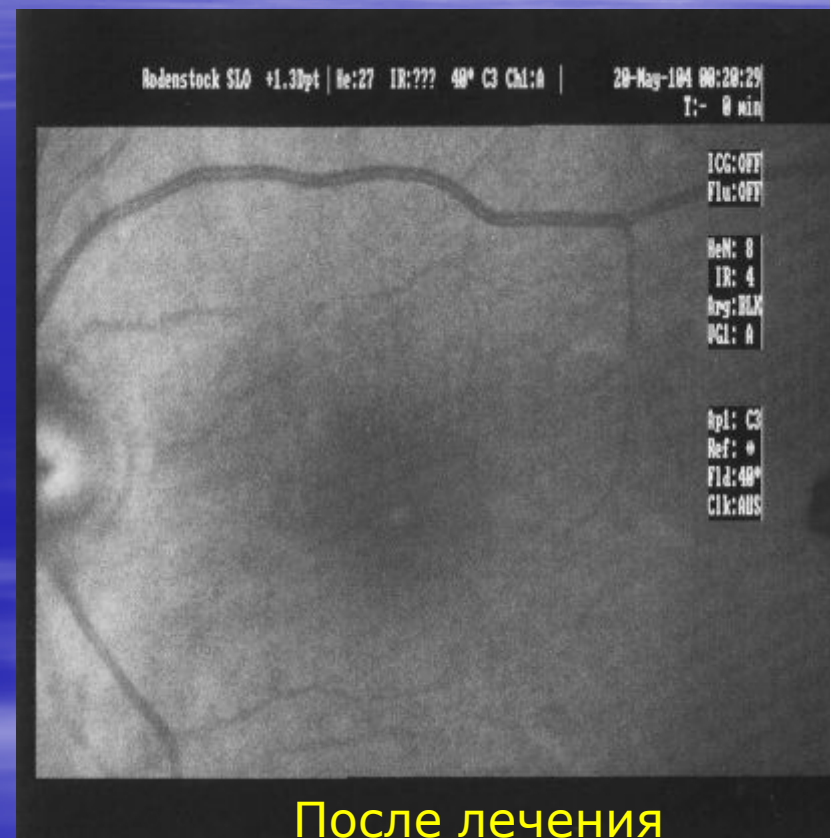
Выраженность экссудативной реакции на седьмые сутки после операции



Динамика содержания простагландина E₂ в слезе пациентов после экстракции катаракты



Результаты



- Пациентка 2 группы С. – в схему лечения был включен КАСи.

Преимущества новой лекарственной формы КАС перед Наклофом.

- Концентрация КАС в 10 раз выше;
- Возможность инъекционного способа введения;
- Более высокий антипростагландиновый, противовоспалительный эффект при посттравматическом воспалительном процессе;
- Более эффективное средство профилактики воспалительных осложнений в плановой хирургии;
- Имеет выраженное антиагрегантное действие , что расширяет показания к применению препарата;
- Значительно дешевле (более, чем в 10 раз)

Выводы

- Применение физиологически сбалансированного солевого раствора и поливинилпирролидона в качестве растворителя позволило увеличить растворимость препарата, потенцировать и пролонгировать его действие, а также исключить побочные эффекты КАС.
- Разработанный технологический режим сублимационной сушки раствора КАС позволил добиться стабильности препарата, значительно улучшить его растворимость в воде без изменения специфической активности препарата.

Выводы

- В офтальмологической практике 1% р-р КАС используется в виде инъекций и инстилляций согласно разработанным способам профилактики и лечения воспалительных процессов и вазок-клюдсионных заболеваний сетчатки и зрительного нерва.
- Локальное применение КАС повышает эффективность комплексной терапии вазок-клюдсионных заболеваний сетчатки и зрительного нерва и позволяет исключить необходимость перорального приема препарата.

Выводы

- Сравнительное изучение действия разработанной формы КАСи показало его явное преимущество перед Наклофамом и Дексаметазоном по профилактическому и лечебному противовоспалительному и антипростагландиновому действию.

**Белорусская медицинская академия
последипломного образования**

**ОПЫТ ПРИМЕНЕНИЯ ИНЪЕКЦИОННОЙ
ЛЕКАРСТВЕННОЙ ФОРМЫ КИСЛОТЫ
АЦЕТИЛСАЛИЦИЛОВОЙ КИСЛОТЫ В
ЛЕЧЕНИИ ВОСПАЛИТЕЛЬНЫХ
ЗАБОЛЕВАНИЙ ОРГАНА ЗРЕНИЯ**

Минск 2005

Цель исследования

Оценить терапевтическую эффективность инъекционной формы кислоты ацетилсалициловой (КАСи) в лечении воспалительных заболеваний органа зрения

Задачи

1. Разработать патогенетически ориентированный способ лечения травматического увеита с использованием инъекционной формы нестероидного противовоспалительного препарата – кислоты ацетилсалициловой для инъекций
2. Провести сравнительную оценку противовоспалительной эффективности разработанного способа лечения травматического увеита в сравнении с традиционными способами, включающими применение кортикостероидов.

Задачи

3. Разработать дифференцированные подходы в лечении воспалительных заболеваний органа зрения с использованием новой лекарственной формы КАС.

Материалы и методы

- Доклинические исследования проведены на 60 кроликах (на база ЦНИЛ Бел МАПО)
- Методы исследования:
 - Офтальмологический
 - Радиоиммунологический
 - Биохимический
 - Гистологический
 - Бактериологический
 - Спектрофотометрический
 - Фармацевтический
- Клинические исследования проведены на 4-х клинических базах (г.Минск, Гомель, Витебск) – на 243 больных в возрасте от 5 до 80 лет.

Состав раствора:

Кислоты ацетилсалициловой	10.0
Поливинилпирролидона низко- молекулярного медицинского	60.0
NaCl	5.5
KCl	0.42
CaCl	0.5
MgCl	0.005
NaHCO ₃	0.23
Воды для инъекций	до 1 л.



ОАО "БЕЛМЕДПРЕПАРАТЫ"

Acidum acetylsalicylicum 0,025
pro injectionibus

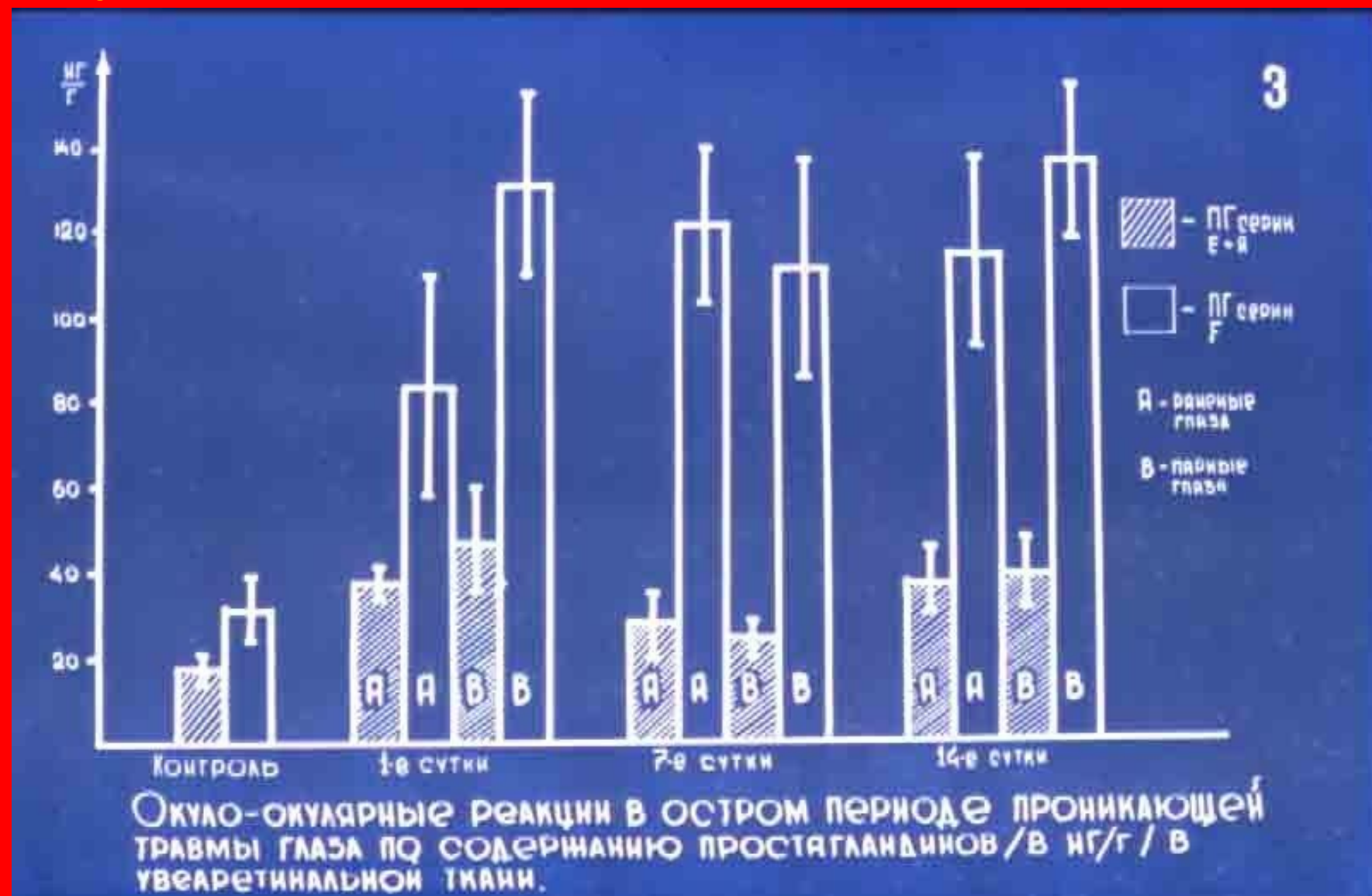
**КИСЛОТА
АЦЕТИЛСАЛИЦИЛОВАЯ**
для инъекций

5 ампул по 0,025 г

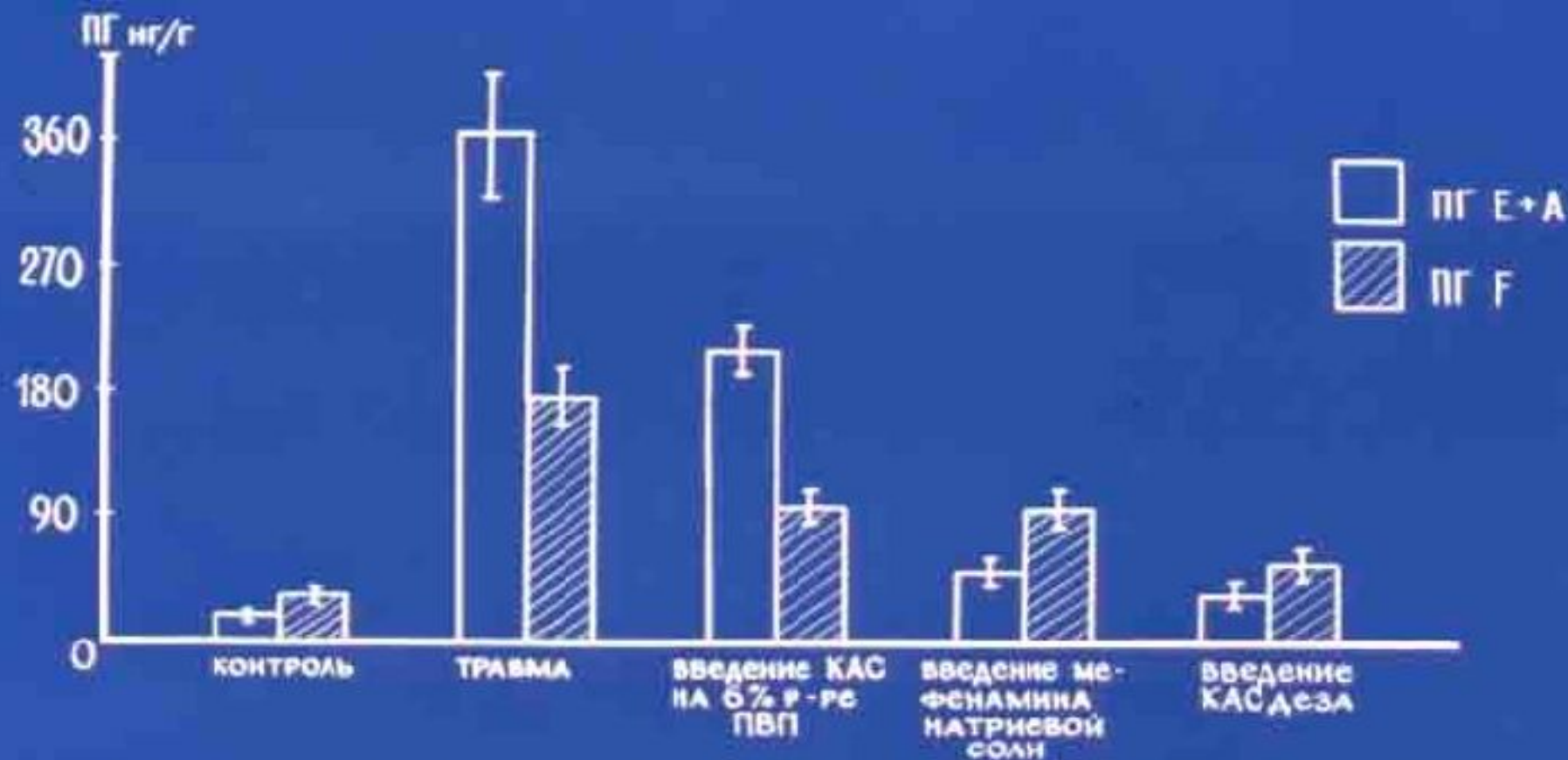
СТЕРИЛЬНО
СУБКОНЪЮНКТИВАЛЬНО
ПАРАБУЛЬБАРНО



Результаты



Результаты



Изменение уровня простагландинов в увеаретинальной ткани при травме глаз и под воздействием субконъюнктивального введения нестероидных противовоспалительных препаратов.

Результаты

№	Структура глазной патологии	Кол-во б-х
1	Травматические увеиты	169
2	Послеоперационные иридоциклиты и увеиты	28
3	Инфекционно-аллергические увеиты различной этиологии	17
4	Увеиты при ревматоидном артрите (б-нь Стилла) и др. заболеваниях	7
5	Склериты	8
6	Кератиты, кератоувеиты	14
Всего		243

Результаты

- Из 169 пациентов с травматическим увеитом была выделена основная группа (20 пациентов) с тяжелой открытой травмой глаза и выраженными экссудативно-воспалительными проявлениями и симпатическим раздражением парного глаза.

- В контрольной группе (20 больных) с аналогичной по тяжести открытой травмой глаза применялась общепринятая схема лечения с использованием кортикостероидов субконъюнктивально в сочетании с НПВП внутрь.
- В основной группе использовались кортикостероиды и КАСи субконъюнктивально.

Результаты

Сравнительная оценка результатов лечения в двух группах больных:

- **Улучшение зрительных функций в 45% случаев в контрольной и в 75 % в основной группе;**
- **Улучшение анатомических исходов травмы (уменьшение количества энуклеаций в 4 раза по сравнению с контролем)**
- **Сокращение сроков стационарного лечения на $13,1 \pm 1,1$ койко-дней (на 37%) $P < 0,01$**

Динамика зрительных функций при использовании КАСи

Нозологические формы	Повышение	Без изменений	Ухудшение
Травматический увеит различной степени тяжести	45%	49%	6%
Послеоперационный увеит	66,2%	33,8%	—
Увеиты другой этиологии	42%	50%	8%

Дифференциальный подход к применению 1%р-ра КАС на гемодезе

Нозологические формы	Способы введения и доза препарата
Блефариты, конъюнктивиты, склериты, эписклериты	Инстилляции 3-4 раза в день
Эндогенные и экзогенные увеиты любой этиологии, в том числе послеоперационные	Субконъюнктивально или парабульбарно по 0,5 мл ежедневно в сочетании с инстилляциями 4 раза в день, электрофорезом, фоно - и магнитофорезом
Реактивный синдром при лазерных и хирургических операциях	Инстилляции (при слабовыраженных воспалительных процессах)
Предупреждение синдрома отмены при кортикостероидной терапии	Субконъюнктивально или парабульбарно в сочетании с инстилляциями
Невриты, нейроретиниты и макулярный отек сетчатки	Ретробульбарно в сочетании с эндоназальным электрофорезом

Преимущества новой лекарственной формы КАСи перед Наклофом

- **Возможность инъекционного способа введения;**
- **Увеличение концентрации препарата (в 10 раз);**
- **Более высокий антипростагландиновый, противовоспалительный эффект;**

Преимущества новой лекарственной формы КАСи перед Наклофом

- **Более эффективное средство профилактики воспалительных осложнений в плановой хирургии;**
- **Имеет выраженное антиагрегантное действие , что расширяет показания к ее применению;**
- **Значительно дешевле (в 23 раза).**

Выводы

1. Применения гемодеза в качестве растворителя КАС позволило увеличить растворимость, потенцировать и пролонгировать анти-простаглиндиновое и противовоспалительное действие препарата, а также исключить побочные явления при его применении.
2. Сравнительное изучение разработанной формы КАС показало его явные преимущества перед Наклофом

Выводы

- 3. Противовоспалительная эффективность препарата наиболее выражена при острых и подострых иридоциклитах средней тяжести, где препарат можно назначаться как монотерапия.**
- 4. Тяжелые формы увеитов требуют назначения препарата в сочетании с рациональными схемами лечения кортикостероидами.**



Спасибо за
внимание !

Благодарю за внимание