

## ერექციული დისფუნქციის სამკურნალო კომპოზიცია

სასარგებლო მოდელი განეკუთვნება ფარმაცევტულ მრეწველობას და ეხება ერექციული დისფუნქციის სამკურნალო საშუალებებს.

ერექციული დისფუნქცია არის მდგომარეობა, რომლის დროსაც აღინიშნება ერექციის გამოწვევის და/ან შენარჩუნების გაძნელება, ნაადრევი ეაკულაცია. ამ დროს არ ხდება ასოს მღვიმოვან სხეულებში სისხლის ნორმალური მოდინება ან არ ხდება მოდინებული სისხლის მღვიმოვან სხეულებში ბლოკირება. აღნიშნული მოვლენები განაპირობებს მამაკაცების და მათი სექსუალური პარტნიორების სექსუალური ცხოვრებით დაუკმაყოფილებლობას. მსოფლიოში ერექციული დისფუნქცია აღინიშნება 40 წელზე უფროსი მამაკაცების 35-50%-ს.

ნორმალური ერექციის დროს მღვიმოვან ქსოვილებში სისხლის მოდინებას ტრამბეკულური ქსოვილი კუმშვავს მღვიმოვან ვენებს, რაც უზრუნველყოფს ერექციის შენარჩუნებას. მღვიმოვან სხეულებში სისხლის მოდინებასა და ზემოაღნიშნულ მოვლენებს უზრუნველყოფს აზოტის ოქსიდი, რომელიც თავისუფლდება უპირატესად პოსტინაფსური პარასიმპათიკური ნეირონებიდან. აზოტის ოქსიდი ასტიმულირებს მღვიმოვან სხეულებში ციკლური გუანოზინმონოფოსფატის (GMP) წარმოქმნას, რაც თავის მხრივ განაპირობებს გლუვკუნთოვანი უჯრედების მოდუნებას.

ამჟამად ერექციული დისფუნქციის სამკურნალოდ ფართოდ გამოიყენება PDE5-ის ინჰიბიტორები, როგორებიცაა სილდენაფილი, ტადალაფილი, ვარდენაფილი და ა.შ. PDE5-ის ინჰიბიტორები აძლიერებენ აზოტის ოქსიდის ზემოქმედებას მღვიმოვან სხეულებში, რაც უზრუნველყოფს მღვიმოვან ქსოვილებში სისხლის მოდინების გაზრდას, განსაკუთრებით სქესობრივი სტიმულაციის დროს.

ერექციული დისფუნქციის მკურნალობაში PDE5-ის ინჰიბიტორების წარმატებული გამოყენების მიუხედავად, არსებობს მთელი რიგი პრობლემები. უპირველეს ყოვლისა მათ ახასიათებთ დოზადადამოკიდებული ხშირი გვერდითი ეფექტები, როგორიცაა მხედველობის პრობლემები (ფერების ანორმალური აღქმა) თავის ტკივილი, სახის გაწითლება, ცხვირის გაჭედვა, თავბრუსხვევა, დისპეპსია, დიარეა,

გამონაყარი კანზე. ასევე აღსანიშნავია, რომ მათი ხანგრძლივად გამოყენებისას საჭირო ხდება დოზის თანდათანობითი ზრდა, რაც თავის მხრივ ზრდის გვერდითი მოვლენების სიხშირეს. გარდა ამისა, ზოგიერთი PDE5 ინჰიბიტორი, უპირველეს ყოვლისა სილდენაფილი, ხასიათდება ხანმოკლე ეფექტით, რის გამოც საჭირო ხდება მისი დღეში რამდენჯერმე მიღება, რაც არაა სასურველი. აღნიშნულის საპირისპიროდ, ზოგიერთი PDE5 ინჰიბიტორი, უპირველეს ყოვლისა ტადალაფილი, ხასიათდება მოქმედების ხანგრძლივი პერიოდით, თუმცა სამაგიეროდ მისი მოქმედება მიღებიდან საკმაოდ გვიან იწყება, რაც თავისთავად საკმაო პრობლემებს უქმნის მომხმარებლებს, განსაკუთრებით სპონტანური, წინასწარ დაუგეგმავი სქესობრივი აქტის დროს.

ზემოაღნიშნული ასპექტებიდან გამომდინარე კვლავ აქტუალურია ერექციული დისფუნქციის სამკურნალო ისეთი პრეპარატის შემუშავება, რომელიც იმოქმედებს სწრაფად, ექნება ხანგრძლივი ეფექტი და ამავე დროს ნაკლები სიხშირით აღენიშნება გვერდითი ეფექტები.

წარმოდგენილი სასარგებლო მოდელით შემოთავაზებულია ერექციული დისფუნქციის სამკურნალო კომპოზიცია, რომელიც პასუხობს ზემოაღნიშნულ მოთხოვნებს.

სასარგებლო მოდელის არსია ის, რომ ერექციული დისფუნქციის სამკურნალო კომპოზიცია შეიცავს აქტიური ინგრედიენტის სახით სიდენაფილის ციტრატსა და ტადალაფილს, ხოლო ფარმაცევტულად მისაღები დანამატების სახით - დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატს, მიკროკრისტალურ ცელულოზას, სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატს, კოლოიდურ სილიციუმის დიოქსიდსა და მაგნიუმის სტეარატს, კომპონენტებს შემდეგი თანაფარდობით მას.%-ში:

სიდენაფილის ციტრატი	20-25
ტადალაფილი	3-5
დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატის	50-60
მიკროკრისტალური ცელულოზა	15-20

სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატი	3-5
კოლოიდური სილიციუმის დიოქსიდი	1-1,5
მაგნიუმის სტეარატი	1-1,5

სასარგებლო მოდელის განხორციელების უპირატეს ვარიანტში კომპოზიციას აქვს ტაბლეტის ფორმა.

სასარგებლო მოდელის განხორციელების უპირატეს ვარიანტში ტაბლეტი შეიცავს კომპონენტებს შემდეგი თანაფარდობით მგ-ში:

სიდენაფილის ციტრატი	130
ტადალაფილი	20
დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატი	314
მიკროკრისტალური ცელულოზა	100
სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატი	24
კოლოიდური სილიციუმის დიოქსიდი	6
მაგნიუმის სტეარატი	6

სიდენაფილის ციტრატის სისხლის პლაზმაში მაქსიმალური კონცენტრაციის მიღწევის დრო ( $T_{max}$ ) არის 1 საათი, ხოლო ნახევარგამოყოფის პერიოდი ( $T_{1/2}$ ) შეადგენს 4 საათს. ტადალაფილის  $T_{max}$  არის 2,5 საათი, ხოლო  $T_{1/2}$  შეადგენს 17 საათს. სასარგებლო მოდელით შემოთავაზებულ კომპოზიციაში ზემოაღნიშნული ორი აქტიური ინგრედიენტის კომბინირება უზრუნველყოფს ეფექტის სწრაფ დადგომას (დაახლოებით 15-20 წუთი) და მის ხანგრძლივ შენარჩუნებას დაახლოებით (დაახლოებით 24 საათი). გარდა ამისა, ორი აქტიური ინგრედიენტის კომბინირება ამცირებს გვერდითი ეფექტების სიხშირეს.

ერთ კომპოზიციაში ორი აქტიური ინგრედიენტის კომბინირებამ შესაძლოა გამოიწვიოს მათი ურთიერთქმედება და ასევე მათი გამოყოფის შეფერხება. სასარგებლო

მოდელით შემოთავაზებულ კომპოზიციაში არსებული არააქტიური ინგრედიენტების სახეობრივი და რაოდენობრივი მაჩვენებლები უზრუნველყოფს სიდენაფილის ციტრატისა და ტადალაფილის ურთიერთქმედების თავიდან აცილებას და ასევე მათ შეუფერხებელ გამოთავისუფლებას.

სასარგებლო მოდელის მიხედვით კომპოზიცია შეიცავს აქტიური ინგრედიენტის სახით სიდენაფილის ციტრატსა და ტადალაფილს, ხოლო ფარმაცევტულად მისაღები დანამატების სახით - დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატს, მიკროკრისტალურ ცელულოზას, სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატს, კოლოიდურ სილიციუმის დიოქსიდსა და მაგნიუმის სტეარატს, კომპონენტებს შემდეგი თანაფარდობით მას.%-ში:

სიდენაფილის ციტრატი	20-25
ტადალაფილი	3-5
დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატი	50-60
მიკროკრისტალური ცელულოზა	15-20
სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატი	3-5
კოლოიდური სილიციუმის დიოქსიდი	1-1,5
მაგნიუმის სტეარატი	1-1,5

სასარგებლო მოდელის განხორციელების უპირატეს ვარიანტში კომპოზიციას აქვს ტაბლეტის ფორმა.

სასარგებლო მოდელის განხორციელების უპირატეს ვარიანტში ტაბლეტი შეიცავს კომპონენტებს შემდეგი თანაფარდობით მგ-ში:

სიდენაფილის ციტრატი	130
ტადალაფილი	20
დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატი	314

მიკროკრისტალური ცელულოზა	100
სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატი	24
კოლოიდური სილიციუმის დიოქსიდი	6
მაგნიუმის სტეარატი	6

ტაბლეტი შეიძლება დამზადდეს ფარმაცევტულ მრეწველობაში საყოველთაოდ მიღებული მეთოდებით, უპირატესად, სველი გრანულაციით.

ტაბლეტის გამოყენების ჩვენებაა ნებისმიერი ეტიოლოგიის ერექციული დისფუნქცია.

ტაბლეტის დოზირებაა 1/2 ან ერთი ტაბლეტი დღეში ერთხელ. ტაბლეტი მიიღება სქესობრივ აქტამდე 15-20 წთ-ით ადრე.

### **მაგალითი**

ერთმანეთს შეურიეს 1,3 კგ სიდენაფილის ციტრატის, 200 მგ ტადალაფილის, 3,14 კგ დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატის, 1 კგ მიკროკრისტალური ცელულოზის და 240 მგ სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატის ფხვნილები. კარგად მორევის შემდეგ ნარევს დაასხეს 140 ლიტრი წყალი და კარგად მოურიეს. შედეგად მიღებულ ნარევს ჩაუტარდა სველი გრანულაცია და შემდეგ შრობა. შრობის შედეგად მიღებულ გრანულებს შეურიეს 60 მგ კოლოიდური სილიციუმის დიოქსიდის ფხვნილი და 60 მგ მაგნიუმის სტეარატის ფხვნილი. მიღებული ნარევი დააფასოეს 600-600 მგ შემცველობებად და დაატაბლეტეს პირდაპირი დაწნების გზით. შედეგად მიიღეს ათი 600 მგ-იანი ტაბლეტი.

### **ეფექტურობის შესწავლა**

სასარგებლო მოდელით შემოთავაზებული ტაბლეტის ეფექტურობა შეისწავლეს 15 ბოცვერზე, რომლებიც დაყვეს სამ თანაბარ ჯგუფად. პირველ ჯგუფს შეუყვანეს პერორალურად სასარგებლო მოდელით შემოთავაზებული ტაბლეტის 1/4. მეორე ჯგუფს შეუყვანეს პერორალურად ვიაგრის (სიდენაფილი) ტაბლეტი 25 მგ დოზით. მესამე ჯგუფს შეუყვანეს პერორალურად სიალისის (ტადალაფილი) ტაბლეტი 5 მგ დოზით.

პრეპარატების შეყვანის შემდეგ შეისწავლეს ერექციის დაწყების დრო, მაქსიმალური ერექციის მიღწევის დრო და ერექციის შენარჩუნების დრო.

ექსპერიმენტის მონაცემები ნაჩვენებია ცხრილში 1.

ცხრილი 1

ჯგუფის N	ერექციის დაწყების დრო (წთ)	მაქსიმალური ერექციის მიღწევის დრო (წთ)	ერექციის შენარჩუნების დრო (წთ)
1	3-5	10	360
2	4-6	15	120
3	20-30	40-60	360

როგორც ცხრილში 1 მოყვანილი მონაცემებიდან ჩანს, შემოთავაზებული პრეპარატი აშკარად უფრო ეფექტურია როგორც ერექციის დაწყების, ასევე მაქსიმალური ერექციის მიღწევისა და ერექციის შენარჩუნების დროის თვალსაზრისით.

ეფექტურობა ასევე შეისწავლეს 15 მოხალისე მამაკაცზე ასაკით 40-50 წელი, რომლებსაც აღენიშნებოდათ სხვადასხვა მიზეზით გამოწვეული ერექციული დისფუნქცია. მოხალისეები დაყვეს სამ თანაბარ ჯგუფად. დაყოფა მოხდა ისეთნაირად, რომ ყველა ჯგუფში ერთნაირი პარამეტრების მქონე პირები თანაბრად განაწილდა. ერთი ჯგუფი იღებდა სასარგებლო მოდელით შემოთავაზებულ 1/2 ტაბლეტს დღეში ერთხელ ორი კვირის განმავლობაში, მეორე ჯგუფი - ვიაგრის (სიდენაფილი) ტაბლეტს 100 მგ დოზით დღეში ერთხელ ორი კვირის განმავლობაში, მესამე ჯგუფი კი იღებდა სიალისის (ტადალაფილი) ტაბლეტს დოზით 20 მგ დღეში ერთხელ ორი კვირის განმავლობაში.

ორი კვირის შემდეგ მოხალისეებს ჩაუტარდათ გამოკითხვა და განისაზღვრა მათი ერექციული ფუნქციის საერთაშორისო ინდექსი (IIEF).

გამოკითხვის შედეგები მოცემულია ცხრილში 2.

## ცხრილი 2

ჯგუფის N	IIEF-ის საშუალო მაჩვენებელი
1	25.8
2	20.4
3	22

როგორც ცხრილში 2 მოყვანილი მონაცემებიდან ჩანს, შემოთავაზებული პრეპარატის შეფასების კრიტერიუმები მნიშვნელოვნად მაღალია ვიაგრასთან და სიალისთან შედარებით.

### გვერდითი ეფექტების შესწავლა

გვერდითი ეფექტები შეისწავლეს 30 მოხალისე მამაკაცზე ასაკით 30-40 წელი. მოხალისეები დაყვეს სამ თანაბარ ჯგუფად. დაყოფა მოხდა ისეთნაირად, რომ ყველა ჯგუფში ერთნაირი პარამეტრების მქონე პირები თანაბრად განაწილდა. ერთი ჯგუფი იღებდა სასარგებლო მოდელით შემოთავაზებულ 1/2 ტაბლეტს დღეში ერთხელ ორი კვირის განმავლობაში, მეორე ჯგუფი - ვიაგრის (სიდენაფილი) ტაბლეტს 100 მგ დოზით დღეში ერთხელ ორი კვირის განმავლობაში, მესამე ჯგუფი კი იღებდა სიალისის (ტადალაფილი) ტაბლეტს დოზით 20 მგ დღეში ერთხელ ორი კვირის განმავლობაში.

პრეპარატების შეყვანის შემდეგ შეისწავლეს გვერდითი მოვლენების პროცენტული მაჩვენებელი თითოეულ ჯგუფში.

მიღებული მონაცემები ნაჩვენებია ცხრილში 3.

## ცხრილი 3

გვერდითი ეფექტის სახე	გვერდითი ეფექტების %-ული მაჩვენებელი		
	ჯგუფი 1	ჯგუფი 2	ჯგუფი 3
სახის გაწითლება	10	50	40
თავის ტკივილი	0	30	20
დისპეპსია	0	20	20
დიარეა	0	10	20
მხედველობის პრობლემები	0	20	10

როგორც ცხრილში მოყვანილი მონაცემებიდან ჩანს, შემოთავაზებულ პრეპარატს ახასიათებს გვერდითი ეფექტების ბევრად ნაკლები სიხშირე, ვიდრე ვიაგრასა და სილისს.

ამრიგად, სასარგებლო მოდელით შემოთავაზებული კომპოზიცია წარმოადგენს ეფექტურ, უსაფრთხო საშუალებას ერექციული დისფუნქციის სამკურნალოდ.

### სასარგებლო მოდელის ფორმულა

1. ერექციული დისფუნქციის სამკურნალო კომპოზიცია, რომელიც შეიცავს აქტიური ინგრედიენტის სახით სიდენაფილის ციტრატსა და ფარმაცევტულად მისაღებ დანამატებს, განსხვავდება იმით, რომ აქტიური ინგრედიენტის სახით დამატებით შეიცავს ტადალაფილს, ხოლო ფარმაცევტულად მისაღები დანამატების სახით - დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატს, მიკროკრისტალურ ცელულოზას, სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატს, კოლოიდურ სილიციუმის დიოქსიდსა და მაგნიუმის სტეარატს, ამასთან, შეიცავს კომპონენტებს შემდეგი თანაფარდობით მას.%-ში:

სიდენაფილის ციტრატი	20-25
ტადალაფილი	3-5
დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატი	50-60
მიკროკრისტალური ცელულოზა	15-20
სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატი	3-5
კოლოიდური სილიციუმის დიოქსიდი	1-1,5
მაგნიუმის სტეარატი	1-1,5

2. კომპოზიცია, მ. 1 მიხედვით, განსხვავდება იმით, რომ აქვს ტაბლეტის ფორმა.

3. კომპოზიცია, მ. 2 მიხედვით, განსხვავდება იმით, რომ ტაბლეტი შეიცავს კომპონენტებს შემდეგი თანაფარდობით მგ-ში:

სიდენაფილის ციტრატი	130
ტადალაფილი	20
დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატი	314
მიკროკრისტალური ცელულოზა	100
სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატი	24

კოლოიდური სილიციუმის დიოქსიდი	6
მაგნიუმის სტეარატი	6

## რეფერატი

კომპოზიცია შეიცავს აქტიური ინგრედიენტის სახით სიდენაფილის ციტრატსა და ტადალაფილს, ხოლო ფარმაცევტულად მისაღები დანამატების სახით - დიკალციუმის ფოსფატის დიჰიდრატს, მიკროკრისტალურ ცელულოზას, სახამებლის ნატრიუმის გლიკოლატს, კოლოიდურ სილიციუმის დიოქსიდსა და მაგნიუმის სტეარატს.