ПЕРСПЕКТИВИ СТВОРЕННЯ І ЗАСТОСУВАННЯ НОВОГО АНТИАНГІНАЛЬНОГО ПРЕПАРАТУ «ГІПЕРТРИЛ»

Н. В. Парнюк[1], Л. І. Кучеренко[1,2], І. Ф. Бєленічев[1,2]
[1]Запорізький державний медичний університет
[2]НВО «Фарматрон»
natalia.parniuk@gmail.com

Антиангінальними препаратами називають лікарські засоби, які знижують потребу міокарда в кисні, підвищують постачання киснем кардіоміоцитів і стійкість міокарда до гіпоксії, оптимізують енергетичний обмін і гемодинаміку. Тому, *метою нашої роботи* стало дослідження літературних джерел з питань перспективи створення та застосування нового оригінального антиангінального лікарського засобу Гіпертрил, який матиме мінімум побічних ефектів.

З 2010 року розробляються селективні і неселективні інгібітори ендотеліну-1 з метою створення ефективних антиангінальних препаратів. Селективний антагоніст рецепторів ендотеліну BQ-123 покращує виживаність щурів після відтворення експериментального інфаркту міокарда. В результаті багаторічних досліджень по створенню серцево-судинних препаратів, співробітниками НВО «Фарматрон» (Запоріжжя, Україна) під керівництвом професора Мазура І.А. на основі 4-аміно-1,2,4-триазолу розроблений новий оригінальний препарат Гіпертрил, що є кардіоселективним β-адреноблокатором з NO-міметичним ефектом, що виявляє антигіпертензивні, антиангінальні, протиішемічні, фібринолітичні та антиоксидантні властивості. Доклінічними дослідженнями показано, що введення Гіпертрилу паралельно формуванню гострого інфаркту міокарда призводило до 100 % зниження летальності та поліпшенню показників ЕКГ, характерних для кардіоселективних β-адреноблокаторів – зниження ЧСС, збільшення амплітуди зубця R на тлі зниження сумарного ступеня відхилення інтервалу ST (ΣΔST) від ізолінії в порівнянні з контрольною групою, що вказувало на збереження більш високої працездатності міокарда і прояв протиішемічної дії у досліджуваного препарату, а також до зменшення зони некрозу міокарда, зниження щільності апоптичних і деструктивно змінених кардіоміоцитів, підвищення щільності ядер кардіоцитів, підвищенню в них РНК у порівнянні з групою нелікованих тварин, що свідчило про наявність вираженої кардіопротективної дії у потенційного препарату.

Також було виявлено наявність у Гіпертрила властивостей NO-міметика – в серці тварин з інфарктом міокарда, які отримували Гіпертрил, було виявлено збільшення експресії ендотеліальної NO-синтази, підвищення її активності і збільшення продукції NO, що підвищувало адаптаційні можливості кардіоміоцитів до ішемії.

Гіпертрил покращує показники загальної і кардіогемодинаміки в умовах гострої ішемії міокарда – уповільнює серцевий ритм, знижує артеріальний тиск, зменшує загальний периферичний опір судин. Введення Гіпертрилу призводить до збільшення ударного об’єму, систолічного і серцевого індексів в умовах гострої ішемії міокарда. Отримані дані демонструють наявність у Гіпертрила

характеристик кардіоселективного β-адреноблокатора з властивостями периферичного вазодилататора.

Гіпертрил проявляє виражені антигіпертензивні властивості у щурів лінії SHR. Гіпертрил зменшує порушення в системі L-аргінін-NO-синтаза-NO міокарда при артеріальній гіпертензії. Гіпертрил проявляє NO-міметичні властивості, підвищуючи синтез NO за рахунок підвищення експресії ендотеліальної NOS в міокарді, крім того посилюючи захисні ефекти цього месенджера, що підвищують резистентність кардіоміоцита до несприятливих впливів за рахунок зменшення його перетворення в пероксинітрит (зниження нітротирозину) або інші деривати. Призначення Гіпертрилу при артеріальній гіпертензії зберігає гістоструктуру міокарда, зменшує гіпертрофію і гальмує апоптоз кардіоміоцитів.

Висновки: незважаючи на досягнуті успіхи в області лікування патології серцево-судинної системи проблема залишається актуальною, що вимагає розробки і створення нових ефективних антиангінальних засобів з новими механізмами дії. Перспективним напрямом вирішення цієї проблеми є створення оригінального препарату Гіпертрил з β1-адреноблокуючою активністю і NO-міметичним ефектом.

АКТУАЛЬНІСТЬ РОЗРОБКИ НАЗАЛЬНОГО ГЕЛЮ НА ОСНОВІ РОСЛИННИХ КОМПОНЕНТІВ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ГОСТРОГО РИНІТУ

К. В. Пащенко, Н. В. Хохленкова
Національний фармацевтичний університет
Broshka-95@rambler.ru

Гострий риніт – це запалення слизової оболонки носа інфекційного походження, який також виникає в результаті травматичних, токсичних і дратівливих чинників. Більш ніж 80 % людей страждає даною хворобою упродовж року, тому питання щодо зменшення симптомів і полегшення перебігу даного захворювання є актуальним.

Проведеними нами дослідженнями номенклатури назальних лікарських засобів встановлено, що значна більшість препаратів вітчизняного та імпортного виробництва належить до групи R01A A „Симпатоміметики, прості препарати” (36,2 %) та R01A B „Симпатоміметики в комбінації з іншими засобами” (13,3 %), тривале використання яких веде до атрофії слизової оболонки порожнини носа і при повторному використанні лікувальний ефект не досягається. Можна відмітити, що серед наявного асортименту препаратів рослинного походження для лікування гострого риніту є лише один засіб вітчизняного виробництва – краплі Піновіт (ТОВ «Фармак», м. Київ). Це свідчить про недостатній асортимент лікарських препаратів рослинного походження.

Також встановлено, що серед асортименту переважають лікарські засоби у формі крапель (до недоліків можна віднести неможливість точного дозування, короткочасність терапевтичної дії тощо) та спрею (недоліком цього виду лікарської форми є дороговизна упакування і небезпечність пропелентів). М`які лікарські засоби (у формі назальної мазі та гелю) займають лише 4 % ринку.