

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
КАФЕДРА ПРОМИСЛОВОЇ ФАРМАЦІЇ



МАТЕРІАЛИ

III НАУКОВО-ПРАКТИЧНОЇ КОНФЕРЕНЦІЇ
З МІЖНАРОДНОЮ УЧАСТЮ

СУЧАСНІ ДОСЯГНЕННЯ ФАРМАЦЕВТИЧНОЇ ТЕХНОЛОГІЇ

СОВРЕМЕННЫЕ ДОСТИЖЕНИЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЙ ТЕХНОЛОГИИ

THE UP-TO-DATE ACHIEVEMENTS OF PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY

21-23 листопада 2012 р.
м. Харків, Україна



Харків 2012

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

СУЧАСНІ ДОСЯГНЕННЯ ФАРМАЦЕВТИЧНОЇ ТЕХНОЛОГІЇ

МАТЕРІАЛИ

III науково-практичної конференції з міжнародною участю

21-23 листопада 2012 року
м. Харків

Видавництво НФаУ
2012

Полученные хинонмоноимины (**5a–в**) представляют собой кристаллы ярко-красного цвета, их строение доказано данными элементного анализа, спектров ЯМР ^1H и ^{13}C .

Реакция N-арил(алкил, трифторметил)сульфонил-1,4-хинониминов (**1–3**) с 4-аминоантипином (**4**) протекает по схеме 1,2-присоединения–элиминирования с образованием N-антипирил-1,4-бензохинонмоноиминов (**5**) через переходное состояние **A**.

С помощью программы PASS выполнен анализ возможной биологической активности синтезированных соединений.

Вероятные биологические эффекты 1,4-бензохинонмоноиминов (5a–в)

№ п/п	Активность	Величина P_a		
		5a	5б	5в
1	Analgesic, non-opioid	0,975	0,966	0,968
2	Corticotropin releasing factor antagonist	0,915	0,920	0,899
3	Analgesic	0,912	0,890	0,896
4	Antiinflammatory	0,891	0,882	0,908
5	Convulsant	0,842	0,920	0,840
6	Autoimmune disorders treatment	0,884	0,863	0,881
7	CYP2A8 substrate	0,876	0,801	0,823
8	CYP2B substrate	0,831	0,892	0,632
9	CYP2 substrate	0,824	0,785	0,588
1	CYP2A2 substrate	0,808	0,778	0,804

Анализ представленных данных показывает, что полученные N-антипирил-1,4-бензохинонмоноимины могут быть использованы в качестве анальгетических средств (вероятность проявления активности до 0,98), противовоспалительных препаратов (до 0,91) и антагонистов рилизинг-фактора адренокортикотропного гормона (до 0,92).

БИОФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ ИССЛЕДОВАНИЯ РЕКТАЛЬНОЙ МЯГКОЙ ЛЕКАРСТВЕННОЙ ФОРМЫ КАПТОПРИЛА

АЛМОХАМАД ЖУМАА АБДУЛЛАХ, ГЛАДЫШЕВА С.А., ГОЛОВКИН В.В.

Запорожский государственный медицинский университет,

г. Запорожье, Украина

gladishevvv@gmail.com

Наряду с созданием оригинальных фармакотерапевтических антигипертензивных средств для отечественной медицинской практики перспективным является также направление исследований в области повышения эффективности известных биологически активных веществ путем разработки новых лекарственных форм. Одним из таких путей является использованием трансмукозных путей введения антигипертензивных лекарственных веществ, в частности, ректального с использованием соответствующих аппликационных лекарственных форм.

В результате предварительных исследований нами научно обоснован состав и технология изготовления ректальных суппозиторий, содержащих антигипертензивное средство из группы ингибиторов ангиотензин-превращающего фермента (АПФ) – каптоприл в количестве 0,05 г на основе масла какао с добавлением 2 % моноглицеридов дистиллированных. Целью настоящих исследований является изучение динамики высвобождения каптоприла из ректальных суппозиторий, проведенных через естественную биомембрану – свежееотпрепарированную прямую кишку крысы в воду очищенную при температуре 37 °C. Концентрацию каптоприла устанавливали спектрофотометрически через 5, 15, 30, 45 и 60 минут от начала диализа. В результате исследований установлена динамика высвобождения каптоприла из ректальной лекарственной формы на липофильном носителе и на основании полученных данных рассчитаны его константа скорости высвобождения ($0,047 \text{ мин.}^{-1}$) и период полувывсвобождения (14,75 мин.), как первый этап определения фармацевтической доступности.