

ИЗУЧЕНИЕ АССОРТИМЕНТА ПРОТИВОВИРУСНЫХ ГЛАЗНЫХ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ФОРМ

Е.Т. ЖИЛЯКОВА
О.О. НОВИКОВ
М.Ю. НОВИКОВА
А.С. ТКАЧЕВА
Н.Н. ПОПОВ

*Белгородский
государственный
национальный
исследовательский
университет*

e-mail: ezhilyakova@bsu.edu.ru

Проведен анализ ассортимента лекарственных форм, применяемых для лечения вирусных конъюнктивитов. Дано описание наиболее часто встречающихся форм вирусных конъюнктивитов различной этиологии. Выявлены наиболее активные фармацевтические субстанции, используемые для лекарственных форм этой направленности действия. Дана сравнительная характеристика субстанциям и обзор их фармакологического действия на различные виды возбудителей вирусных конъюнктивитов. Дан обзор преимуществ ацикловира перед идоксуридином. Дан обзор проявления возможных побочных эффектов при применении данных препаратов. Приведены основные торговые наименования, под которыми выпускаются в настоящее время препараты на основе ацикловира и идоксуридина.

Ключевые слова: ацикловир, лекарственные формы.

Распространение офтальмологических патологий в настоящее время является одной из глобальных проблем современности в связи с особенным строением и функциями органа зрения, легкой ранимостью глаза. По данным ВОЗ, в мире насчитывается 42 миллиона слепых и слабовидящих. Причем ежегодно наблюдается увеличение этого показателя и прирост составляет 3-6% в год [1].

По материалам статистики Министерства здравоохранения и социального развития РФ, болезнями глаз и глазного аппарата страдают около 4,7 миллионов человек в России, из которых 1,2 миллиона человек составляют дети до 14 лет [2].

Болезни конъюнктивы составляют около трети всех глазных заболеваний. Из них ведущее место занимают воспалительные инфекционные конъюнктивиты, они составляют около 30% от всех глазных патологий. Вирусные конъюнктивиты, как правило, возникают в результате заболеваний верхних дыхательных путей, при заражении бытовым путем, как осложнения офтальмологических патологий.

В Белгородской области, по данным Роспотребнадзора за 2010 г., заболеваемость конъюнктивитами среди внутрибольничных инфекций в областном перинатальном центре составила 5, 7%, а среди внутриутробных болезней, по данным за 2009 г., около 13,3%. По данным за 2008 г., конъюнктивиты составляли 38,1% от всех внутрибольничных инфекций среди всех возрастов населения [3].

В связи с этим, целью работы является изучение ассортимента противовирусных глазных лекарственных форм, выявление наиболее используемых субстанций.

По-прежнему основной методикой лечения вирусных заболеваний глаз является применение глазных лекарственных форм, содержащих противовирусные активные субстанции. Нами был изучен ассортимент противовирусных лекарственных форм для лечения различных вирусных конъюнктивитов.

В табл. 1 представлены лекарственные формы, используемые для лечения вирусных конъюнктивитов.

Как видно из табл. 1, наибольшее распространение среди лекарственных форм для лечения вирусных конъюнктивитов занимают глазные капли, их число на рынке составляет около 43%. Вторую позицию удерживают глазные мази – 27%. Третье место приходится на долю лиофилизатов для интравитриального введения. Доля остальных лекарственных форм не превышает 5%.



Ассортимент лекарственных форм для лечения вирусных конъюнктивитов

№	Наименование лекарственной формы	Распространение лекарственной формы для лечения вирусных конъюнктивитов в %.
1	Глазные капли	43
2	Глазные мази	27
3	Лиофилизат для интравитриального введения	13
4	Глазные гели	5
5	Глазные кремы	3
6	Лиофилизат для капель	3
7	Порошок для инфузий	3
8	Раствор для интравитриального введения	3

При анализе составов лекарственных форм противовирусного действия выявлена 21 активная фармацевтическая субстанция, используемая для лечения этой патологии. Перечень субстанций представлен в табл. 2.

Как видно из табл. 2, ведущую роль играют препараты на основе ацикловира, их около 22%. Несколько меньшее распространение получили препараты на основе интерферона альфа 2b и идоксуридина, 19 и 8% соответственно, на остальные активные фармацевтические субстанции приходится менее 5%.

Таблица 2

Ассортимент активных фармацевтических субстанций для лечения вирусных конъюнктивитов

Наименование фармацевтической субстанции	Доля, приходящаяся на данную субстанцию, от общего числа субстанций
Ацикловир	22
Интерферон альфа-2b	19
Идоксуридин	8
Дексаметазон	5
Формидерина содиат	3
Аминобензойная кислота	3
Ганцикловир	3
Глюкоаминопропилакридон	3
Бромнафтохинон	3
Дезоксирибонуклеаза	3
Декаметоксин	3
Интерферон бета-1a	3
Трифлуридин	3
Бис(пиридин 6-2-дикарбоксилат) германия	3
Комплекс к-т (полиад+поли...)	3
Тетрабромтетрагидроксибензил	3
Флуоренонилглиоксаля бисульфит	3
Ципрофлоксацин	3
Гликозид Solanum tuberosum	3
Госпипол (хлопчатник)	3
Адгелон (гликопротеин из КРС)	3

В глазных мазях наиболее часто встречается ацикловир, около 60%, доли остальных действующих веществ примерно равны и составляют по 10%. К ним относят идоксуридин, бромнафтохинон, теброфен, флореналь.

В табл. 3 представлены активные фармацевтические субстанции, применяемые в составе глазных капель для лечения вирусных конъюнктивитов.

Как видно из табл. 3, в этой лекарственной форме доминирует интерферон альфа-2b –



27%. За ним следует идоксуридин – 13%. Доля всех остальных действующих веществ не превышает 7%.

Таблица 3

Ассортимент действующих веществ, используемых для лечения вирусных конъюнктивитов в глазных каплях

Наименование фармацевтической субстанции	Доля, приходящаяся на данную субстанцию, от общего числа субстанций
Интерферон альфа2b	27
Идоксуридин	13
Трифлуридин	7
Глюкоаминопропилакридон	7
ПАБК	7
Дексаметазон	7
Интерферон бета-1a	7
Бис пиридин 6,2дикарбоксилат германия	7
Комплекс полиадениловой и полиуридиновой кислот	6
Госсипол	6
Гликопротеин из сыворотки крови КРС	6

На рынке лекарственных форм для лечения вирусных конъюнктивитов лидируют три действующих вещества: ацикловир, интерферон и идоксуридин.

Свойства субстанций отличаются, так как они принадлежат к разным классам химических веществ, обладают различной растворимостью. Так, ацикловир и интерферон растворимы в воде при 37°C, идоксуридин растворяется при температуре выше 20°C [5].

Фармакологическое действие лекарственных субстанций варьируемо. Ацикловир является синтетическим аналогом пуриновых нуклеозидов, нарушает структуру вирусной ДНК без повреждения клеток хозяина путем взаимодействия с ДНК-полимеразой.

Идоксуридин блокирует изменение нормального синтеза ДНК и встраивание тимидина в вирусную ДНК, в результате чего ДНК вируса становится дефектной и не способной инфицировать и разрушать ткань. Интерферон действует на мембранные рецепторы и индуцирует синтез РНК, мешает репродукции и высвобождению вируса, активирует фагоцитоз.

В противовирусной терапии офтальмогерпеса на смену идоксуридину, обладающему выраженными раздражающими свойствами и слабой эффективностью при глубоких формах, прочно вошел в практику ацикловир. В отличие от других средств, ацикловир избирательно активируется ферментами, кодируемыми герпесвирусами, такими как тимидинкиназы вируса герпеса или продукт гена UL97 цитомегаловируса. Активность в отношении вируса простого герпеса (тип 1) выше в 10 раз, чем у идоксуридина. Таким образом, ацикловир имеет специфический механизм действия, предотвращающий размножение семейства герпесвирусов. Идоксуридин же не обладает действием на цитомегаловирус и умеренно активен на вирус Эпштейна-Барра [6].

Особая роль в разработке составов и технологии глазных капель принадлежит физико-химическим свойствам активных фармацевтических субстанций.

Ацикловир имеет активное противовирусное действие, однако не растворяется в воде, что затрудняет его применение в составе глазных капель противовирусного действия. В современных литературных данных имеются сведения об улучшении растворимости ацикловира.

Так, в ходе проведения экспериментов различными группами ученых была улучшена растворимость ацикловира только в сочетании с различными вспомогательными веществами, а наилучшие результаты были получены в 2010 г. в Индии, в Канпуре, В. Томаром и др. путем образования комплексов ацикловира и таких веществ, как b-CD и HP b-CD, причем лучшая растворимость была именно у комплекса HP b-CD [7].

Следовательно, обоснованием данного исследования является повышение биологической производительности ацикловира за счет повышения его растворимости и скорости растворения по двум методам: получения твердых дисперсий с полиэтиленгликолем (PEG 6000), поливинилпирролидоном (PVP К 30) и образования комплексов с β-циклодекстрином и гидроксипропил β-циклодекстрином, что увеличит



биодоступность.

Литература

1. WHO Library Cataloguing-In-Publication Data, World health statistics 2011 – France.– электронный ресурс: www.who.int/whosis/whostat/EN_WHS2011_Full.pdf.
2. Какорина, Е. П. Заболеваемость в РФ в 2006-2007 гг. / Е.П. Какорина, Л.А. Михайлова, Е.В. Огрызко и др.// Электронный ресурс: www.fcgsen.ru/DOC/123/sborn.doc.
3. Доклад «О санитарно-эпидемиологической обстановке в Белгородской области в 2010 году» /под ред. д.м.н., профессора В.И. Евдокимова Белгород, 2010 г. – Электронный ресурс: www.31.rospotrebnadzor.ru/files/gsen_gov_report_2010.pdf.
4. Глазные болезни: учебник / под ред. В. Г. Копаевой. – М.: Медицина, 2002
5. Каспаров, А.А. Офтальмогерпес / А.А. Каспаров // М.: Медицина, 1994. – 224 с.
6. Регистр лекарственных средств России. Энциклопедия лекарств. – Электронный ресурс: http://www.rlsnet.ru/mnn_index_id_290.htm/.
7. Tomar, V. Enhancement of Solubility of Acyclovir by Solid Dispersion and Inclusion Complexation/ V. Tomar, N. Garud, P. Kannoija, A. Garud, N.K. Jain, N. Singh – Pranav Institute of Pharmaceutical science and research, Gwalior, M.P.,- India. – электронный ресурс: <http://scholarsresearchlibrary.com/DPL-vol2-iss5/DPL-2010-2-5-341-352.pdf>.

STUDY OF ASSORTMENT OF ANTIVIRAL EYE MEDICAL FORMS

E.T. ZHILYAKOVA
O.O. NOVIKOV
M.Y. NOVIKOVA
A.S. TKACHEVA
N.N. POPOV

Belgorod National Research University

e-mail: ezhilyakova@bsu.edu.ru

The analysis of the assortment of medicinal forms for treating viral conjunctivitis was done. The obtained statistics is presented. The most common forms of viral conjunctivitis of various etiologies were described. The most active pharmaceutical substances used for medicinal forms for the treating are detected. There is the characteristic of these substances and the review of their pharmacological action. The review of the benefits of acyclovir over the idoxuridine was compiled and possible side effects of these drugs were described. Major trade names of the currently available drugs based on acyclovir and idoxuridine were identified.

Key words: acyclovir, medicinal form.