



ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ ТЕХНОЛОГИИ

УДК 615.12

РАЗРАБОТКА СОСТАВА, ТЕХНОЛОГИИ ОФТАЛЬМОЛОГИЧЕСКИХ СИСТЕМ ТРАНСПОРТА

Е.Т. ЖИЛЯКОВА
В.В. АКОПОВА
М.Ю. НОВИКОВА
Н.В. АВТИНА

*Белгородский государственный
национальный исследо-
вательский университет*

e-mail:ezhilyakova@bsu.edu.ru

В статье представлены результаты изучения состава полимеров контактных линз, а также данные, позволяющие сделать вывод о возможности насыщения контактных линз раствором лекарственного вещества. Разработка новых составов пролонгированных глазных капель для лечения инфекционных конъюнктивитов, как наиболее распространенных глазных заболеваний, а также методов их анализа является актуальной. На этапе теоретического обоснования выбора материала контактных линз под конкретные лекарственные вещества возможно использование метода молекулярного моделирования.

Ключевые слова: глазные капли, офтальмологические лекарственные формы, пролонгирование, антимикробный агент

В настоящее время инфекционные конъюнктивиты являются одной из серьезных проблем практической офтальмологии. Больные с этой патологией составляют до 50% пациентов, обращающихся за офтальмологической помощью.

Лечение глазных заболеваний инфекционной этиологии требует особо тщательного выбора не только лекарственного препарата, но и приемлемой лекарственной формы. Таковыми являются глазные капли – наиболее широко используемые в офтальмологической практике.

Наиболее эффективным в терапии глазных инфекций является выбор пролонгированных глазных капель, использование которых позволяет снизить количество инстилляций препарата при сохранении терапевтического эффекта, что обеспечивается путем введения в лекарственную форму вспомогательных веществ пролонгаторов. Повысить пролонгированный эффект можно за счет предварительной механохимической обработки полимеров, которая приводит к увеличению вязкости их водных растворов, что позволяет снизить концентрацию вспомогательных веществ в лекарственной форме.

Выбор антимикробного агента должен быть обусловлен широким спектром его антимикробного действия и возможностью возникновения резистентности микроорганизмов к нему. С этой точки зрения особого внимания заслуживает мирамистин, оказывающий широкое противовирусное и бактерицидное действие вследствие гидрофобного взаимодействия с мембранами микроорганизмов, приводящего к разрушению последних.

Основным недостатком глазных капель (ГК) является их низкая вязкость, из-за чего происходит вымывание препарата и как следствие снижение его биологической доступности. Поэтому разработка новых составов пролонгированных ГК для лечения инфекционных конъюнктивитов, как наиболее распространенных глазных заболеваний, а также методов их анализа является актуальной.

Исследования по обоснованию состава и разработке технологии проводились по определенной схеме, которая представлена на рисунке.

Схема исследований состоит из классических для фармацевтической технологии операций, а также операций с применением программного моделирования, что позволяет систематизировать данные и сузить объем проводимых исследований.

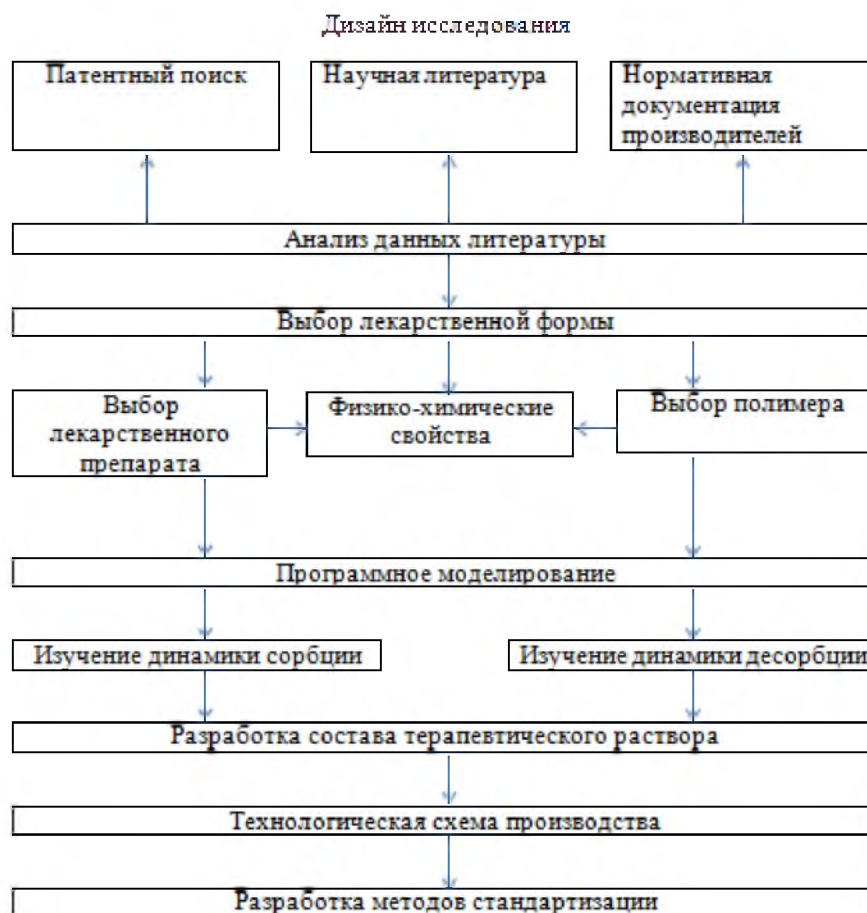


Рис. Дизайн исследований

Разработка систем транспорта с использованием компьютерного программирования

На этапе теоретического обоснования выбора материала контактных линз под конкретные лекарственные вещества нами были использованы методы молекулярного моделирования (метод молекулярной механики и метод молекулярных орбиталей) для получения (расчета) физико-химических дескрипторов. Для последующего сравнения вычисленных дескрипторов и, соответственно, определения материала линз, имеющего наибольшее сродство к данному биологически активному соединению, нами использовался кластерный анализ в приближении k-среднего.

В результате исследований были получены физико-химические дескрипторы молекулы мирамистина и мономеров контактных линз. Эти параметры были сгруппированы в кластеры (группы). Анализ результатов проведения кластерного анализа показывает, что в одинаковые группы (кластеры) веществ со сходными физико-химическими дескрипторами попадают лекарственные вещества и мономеры материалов контактных линз, что отражено в таблице.

Таблица

Сродство физико-химических дескрипторов лекарственных веществ и мономеров контактных линз

Лекарственное вещество	Мономер									
	NCVE	NVP	TPVC	N,N-Dim	TRIS	EDMA	HEMA	MAA	ALM	2E2H
1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11
Сульфацил-натрий	+	+		+		+	+	+	+	



Окончание табл.

1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11
Атропин										+
Левомецетин										+
Мирамистин			+		+					
Пилокарпин	+	+		+		+	+	+	+	
Таурин	+	+		+		+	+	+	+	
Тимолол										+
Эмоксилин	+	+		+		+	+	+	+	

Примечание:

NCVE – N-карбоксивиниловый эфир,
 NVP – N-винилпирролидон,
 TPVC – (триметилсилокси)селилпропилвинилкарбамат,
 PBVC – поли(диметилсилокси)ди(селилбутанол)бис-винилкарбамат,
 TRIS – метакрилоксипропилтрис(триметилсилоксисилан),
 N,N-Dim – N,N-диметилакриламид,
 HEMA – 2-гидроксиэтилметакрилат,
 EDMA – этилендиметакрилат,
 MAA – метакриловая кислота,
 ALM – аллилметакрилат,
 2E2H – 2-этил-2-гидроксиметил-1,3-пропандиолтриметакрилат.

Выводы.

Состав полимеров контактных линз, а также данные, приведенные в таблице, позволяют сделать вывод о том, что для насыщения контактных линз лекарственными препаратами: сульфацил-натрий, пилокарпин, таурин, эмоксилин – требуются следующие материалы полимеров: балафилкон А, лотрафилкон А, окуфилкон А, полимакон, хилафилкон А и этафилкон А. Однако существуют лекарственные вещества, сорбция которых требует применения строго определенного полимера. Сорбцию атропином, левомецетином и тимололом следует проводить на линзу из этафилкона А, а для мирамистина подходят такие полимеры, как балафилкон А и лотрафилкон А.

Литература

1. Акопова, В. В. Перспективы разработки пролонгированных глазных лекарственных форм с бензилдиметил [3-(миристоиламино) пропил] аммония хлорид моногидратом / В. В. Акопова // II Международная научно-практическая конференция «Молодые ученые в решении актуальных проблем науки»: сб. работ молодых ученых. – Владикавказ, 2011. – Ч. 1. – С. 161-163.
2. Акопова, В. В. Мягкие контактные линзы как возможное средство доставки лекарственных средств / В. В. Акопова // Современные наукоемкие лечебные и фармацевтические технологии для офтальмологии : для молодых ученых : сб. материалов Всерос. шк.- семинара, 28 сент. – 1 окт. 2009 г. / БелГУ ; под ред. Е.Т. Жиликова [и др.]. – Белгород, 2009. – С. 7-11.
3. Контактная линза как изделие медицинского назначения для введения глазных капель / В. В. Акопова [и др.] // Научные ведомости БелГУ. Сер. Медицина. Фармация. – 2012. – № 10 (129), вып. 18/3. – С. 148-150.

DEVELOPMENT OF COMPOSITION AND TECHNOLOGY OF OPHTHALMIC SYSTEMS OF TECHNOLOGY TRANSPORT

**E.T. ZHILYAKOVA
 V.V. AKOPOVA
 M.Yu. NOVIKOVA
 N.V. AVTINA**

*Belgorod National
 Research University*

e-mail: ezhilyakova@bsu.edu.ru

The article presents the results of a study of polymer contact lenses, as well as evidences for drawing a conclusion about the possibility of saturation of the contact lens solution of the drug substance. Development of new formulations of prolonged eye drops for the treatment of infectious conjunctivitis is the most common eye diseases as well as methods of their analysis is correct. At the stage of theoretical justification material selection of contact lenses for specific drugs can use the method of molecular modeling.

Key words: eye drops, ophthalmic dosage forms, prolongation, anti-microbial agent.