

СЕКЦИЯ 1

Новейшие технологии поиска биологически активных соединений, создания эффективных, безопасных лекарственных препаратов.

Разработка современных организационных и информационных технологий обеспечения доступности лекарственных препаратов и фармацевтической помощи

Tsubanova N.A., Zhurenko D. S.

CARDIOPROTECTIVE EFFECT OF AN ORIGINAL SPIROCYCLIC OXINDOLE DERIVATIVE

National University of Pharmacy, Ministry Health of Care of Ukraine
Kharkiv, Ukraine

Blood supply disorders and myocardial hypoxia determine the pathogenesis of the ischemic heart disease. There are a lot of factors confirming heart dysfunction and cardiac hemodynamics disorders not only in case of hypoxia but also after restoration of myocardial perfusion and at its early stage. Therefore, searching for and developing new cardioprotective agents having an antihypoxic and metabolic effect is an urgent issue for present-day medicine and pharmaceuticals [1,3]. A new compound, original spirocyclic oxindole derivative (hereinafter referred to as compound 77), can be considered a promising agent to this end. It was synthesized the compound that became the leader out of other 28 original spirocyclic oxindole derivatives due to its high antihypoxic activity on the basis of standard tests.

Objective of the study: studying the cardioprotective effect of compound 77 on myocardial affection models characterized by early pathogenesis.

Materials and methods. The study was conducted on male outbred albino rats with the weight of 200-220 g. Compound 77 was administered in the effective dose of 5 mg/kg. The reference drug (Mexidol by Pharmasoft, Russia) was injected in the dose of 100 mg/kg. The animals were kept in a vivarium under standard conditions according to the principles of GLP. Provisions of the EU Council Directive regarding the protection of animals used for experimental and other scientific purposes were met. The cardioprotective activity was studied on the myocardial infarction (MI) model by means of diathermy coagulation of the coronary artery marginal branch and on the isoproterenol-induced myocarditis model [2].

Results and discussion. MI as a result of diathermy coagulation of the marginal branch of the left coronary artery is characterized by a high mortality. The mortality rate in the control group amounted to 70% in 12 hours and 96.7% in 72 hours. Compound R-77-371 and Mexidol reliably reduced the mortality rate in rats by 40%. Ischemic changes in the ECG with the atrioventricular node rhythm and bradycardia characteristic of MI were observed in the animals from the control group. The compound 77 and Mexidol therapy normalized the heart rate, restored the sinus rhythm and stabilized other ECG indices.

Based on the acute isoproterenol-induced myocarditis model, compound 77 substantially reduces the activity of cytolysis processes in myocardium, has a potent antioxidant effect (inhibits lipid peroxidation, which confirms the reduction in the contents of thiobarbituric acid and diene conjugates) and amplifies the antioxidant protection (catalase activity and contents of reduced glutathione).

Conclusions. According to preclinical results, compound 77 in the dose of 5 mg/kg has an evident cardioprotective activity. Based on the MI model, the efficacy of compound 77 is equal to that of Mexidol in the dose of 100 mg/kg. The cardioprotective activity of compound 77 confirmed

by the ECG indices is related to the potent antioxidant effect of the substance. In addition to cardioprotective effect, compound 77 has an antioxidant and membrane-protective effect based on the acute isoproterenol-induced model.

References

1. Асташкин Е. И. Коррекция энергетического обмена в миокарде – новое направление в лечении сердечно-сосудистых заболеваний / Е. И. Асташкин // Сердце и метаболизм. – 2008. – №21. – С. 1–3.
2. Доклінічні дослідження лікарських засобів: метод. рек. / за ред. О. В. Стефанова. – К. : Авіцена, 2001. – 528 с.
3. Stone P. H. Ischemia Dictates Outcome, Not Symptoms / P. H. Stone // J Am Coll Cardiol. – 2013. – Vol. 61 (7). – P. 712-713.

Абызова Е.О., Белоногова В.Д., Молохова Е.И., Калинина Д.Л.

ФАРМАКОТЕХНОЛОГИЧЕСКОЕ ИССЛЕДОВАНИЕ ЭКСТРАКТА ПОЛЫНИ ГОРЬКОЙ ТРАВЫ

ГБОУ ВПО ПГФА Минздрава России, г.Пермь

В последнее время в фармации и медицине все большую популярность приобретает лекарственные средства и сырье растительного и животного происхождения, содержащие в качестве ведущих групп биологически активные вещества (БАВ) флавоноиды, которые относятся по современной классификации к фенольным соединениям.

Богатым и перспективным источником флавоноидов является трава полыни горькой (*Artemisia absinthium* L.), семейства Астровых (*Asteraceae*). В связи с этим, весьма актуальным является комплексное фармакогностическое исследование сырьевых источников и физико-химическое исследование флавоноидов сырья полыни горькой, а также обоснование целесообразности разработки сухого экстракта и его фармакогностическое и технологическое исследование.

Целью настоящей работы являлось разработка технологии получения сухого экстракта и его комплексное фармакотехнологическое исследование.

Объектами исследования служили сухие экстракты водный и этилацетатный, полученные из травы полыни горькой.

Для решения поставленных задач нами был получен сухой экстракт из травы п. горькой, собранной в Добрянском районе Пермского края в окрестностях села Залесное. Сырье собрано 8 августа 2012г.

Исследуемые экстракты получены по методике: 500 г измельченного и просеянного сквозь сито 2 мм растительного материала (трава п. горькой) помещали в перколятор, заливали пятикратным объемом этанола 50% (1500мл) и настаивали в течение четырех часов (экстракцию проводили 2 раза). Извлечения процеживали и объединяли; упаривали на ротационном испарителе марки ИР-1 до 1/5 от предварительного объема (500мл). Теплый раствор отфильтровывали через фильтр. Далее проводили жидкость-жидкостную экстракцию смесью этилацетата и этанола 95% в соотношении 9:1 (500мл), экстракцию проводили трехкратно. Полученные водное и этилацетатное извлечения сгущали на ИР-1. Густые экстракты выдерживали в сушильном шкафу при температуре не более 60⁰С до полного удаления экстрагентат (Минина).

Полученные сухие водный и этилацетатный экстракты соответствуют следующему описанию:

- **водный экстракт** п. горькой сухой представляет собой аморфный порошок светло-коричневого цвета с бежевым оттенком сладковатого вкуса со специфическим запахом;