

РАЗРАБОТКА СОСТАВА И ТЕХНОЛОГИИ АНТИКАТАРАКТАЛЬНЫХ ГЛАЗНЫХ КАПЕЛЬ С АМИНОКИСЛОТАМИ

Халикова М.А. - аспирант, Фадеева Д.А. – аспирант
Жилякова Е.Т. – к.фарм.н., доцент, Новиков О.О. – д.фарм.н., профессор
Белгородский государственный университет (г. Белгород)
ООО "Асклепий"

Согласно самым последним оценкам ВОЗ, около 314 миллионов человек во всем мире имеют нарушения зрения, вызванные глазными болезнями или нескорректированными рефрактивными погрешностями. Из этого числа 45 миллионов человек являются слепыми, 90% из которых проживают в странах с низкими доходами. Основной причиной слепоты, несмотря на улучшение результатов хирургической помощи, является катаракта (39%).

Анализ глобальных эпидемиологических данных о структуре слепоты показывает, что 80% ее случаев можно предотвратить, а приоритетным направлением по ее предупреждению является профилактика и медикаментозное лечение.

Катаракта это заболевание глаза, основным признаком которого является помутнение основного вещества или капсулы хрусталика, сопровождающееся понижением остроты зрения.

Препятствует развитию помутнения в хрусталике высокий уровень эндогенных веществ, важнейшими из которых принято считать пептиды, аминокислоты и зависимые от них ферменты.

В состоянии катарактогенеза количества указанных веществ в хрусталике стремительно уменьшаются, исходя из чего очевидна научная перспектива разработки поликомпонентных глазных капель, способных восполнять уровни пептидов и аминокислот.

Таким образом, *целью работы* является создание новой комбинированной, конкурентоспособной лекарственной формы в виде глазных капель для профилактики и лечения катаракты. разработка состава, технологии и изучение антикатарактальных глазных капель с аминокислотами.

На пути достижения поставленной цели, нами определены *следующие задачи*:

- Провести маркетинговые исследования российского рынка антикатарактальных препаратов;

- Разработать составы и показатели качества антикатарактальных глазных капель с аминокислотами;

- Обеспечить защиту интеллектуальной собственности путем подачи заявки на изобретение;

- Разработать технологию производства с учетом международных стандартов качества GMP и НД (технологические регламенты на производство глазных капель);

- Осуществить лабораторную наработку серий глазных капель и определить соответствие заявленным показателям качества;

- Реализовать аналитическое обеспечение глазных капель, разработать проекты Фармакопейных статей предприятия (ФСП) на глазные капли;

- Провести доклинические испытания для подтверждения антикатарактального действия;

- Организовать производство глазных капель и осуществить внедрение на российский фармацевтический рынок.

На российском фармацевтическом рынке существующие *аналоги* представлены препаратами «Тауфон», «Карнозин» и «Витайодурол трифосфаденин», «Вицеин».

- «Тауфон» (Россия, ЗАО фармацевтическая фирма Лекко) – монокомпонентные глазные капли 4% таурина. Применяют при дистрофических поражениях сетчатой оболочки глаза, наследственной тапеторетинальной дегенерации глаза, дистрофиях и травмах роговицы, катарактах различного происхождения, глаукоме для снижения внутриглазного давления. Так как препарат не пролонгированный, инстиллировать рекомендуется до 6 раз в день.

- «Карнозин» (Россия, ООО Самсон-Мед) – 5% глазные капли карнозина, применяющиеся при различных офтальмологических заболеваниях. Препарат зарегистрирован впервые в 1996 году, однако в настоящее время не выпускается.

- «Витайодурол трифосфаденин» (Франция, LABORATOIRE H.FAURE) – поликомпонентные глазные капли, в составе со-

держат калия йодид, хлориды магния и кальция, трифосфаденин, никотиновую кислоту, тиамин, цистеин и глутатион. Показаниями являются старческие, миопические, лучевые и контузионные катаракты в начальной стадии, умеренное понижение остроты зрения. Как и другие капли не являются пролонгированными и требуют инстилляций до 7 раз в день.

- «Вицеин» (Россия) - комбинированный препарат, содержащий цистеин, кислоту глутаминовую, гликокол, натриевую соль аденозинтрифосфорной кислоты, тиамина бромид, кислоту никотиновую, калия йодид, кальция хлорид и магния хлорид. Применяется при болезнях хрусталика (H25-H28). Не является пролонгированным.

Разработанные нами глазные капли являются поликомпонентными, включают комплекс важнейших пептидов и аминокислот, обладающих доказанным антикатарактальным действием. Кроме того, являются пролонгированными и не требуют частых инстилляций, что уменьшает их расход и обеспечивает удобство в применении.

В соответствии с поставленными задачами: проведен маркетинговый анализ российского фармацевтического рынка антикатарактальных препаратов; разработаны составы антикатарактальных глазных капель, показатели качества, такие как: подлинность, прозрачность, цветность, pH, осмолярность, механические включения, вязкость, номинальный объем, посторонние примеси, стерильность, количественное содержание; подана заявка на изобретение №2007148492 «Глазные капли»; разработаны технологические схемы производства и технологические регламенты с учетом международных стандартов качества GMP; осуществлена лабораторная наработка серий глазных капель и определено соответствие заявленным показателям качества; реализовано аналитическое обеспечение глазных капель, разработаны проекты Фармакопейных статей предприятия (ФСП) на глазные капли.

В настоящее время проводятся доклинические испытания, на примере «селениновой» катаракты. Разработанные глазные капли являются уникальными и могут являться конкурентоспособными, обладают рядом преимуществ по сравнению с аналогами. Являются пролонгированными, что уменьшает количество необходимых инстилляций, а значит, сокращает расход препарата, при этом обеспечивая необходимый терапевтический эффект. Оригинальный состав позволяет сни-

зить возможные побочные эффекты, характерные для лекарственных форм «глазные капли». Кроме того, некоторые этапы технологического процесса интенсифицированы с использованием механохимических процессов, что обеспечивает рентабельность производства и сокращает временные и экономические затраты.

Результаты проведенных НИР могут быть использованы для проведения опытно-конструкторских и опытно-технологических работ, направленных на создание производственных линий на фармацевтических предприятиях России.

Разрабатываемый состав офтальмологического лекарственного средства предназначен для обеспечения дополнительной возможности профилактики и лечения катаракты. Состав должен отличаться явными фармакотерапевтическими преимуществами, доказанными комплексом доклинических испытаний.

Разрабатываемая технология получения композиционных глазных капель направлена на обеспечение производства новых фармацевтических продуктов для профилактики и лечения офтальмологических заболеваний.

Полученные результаты и разработанные методы ориентированы на широкое применение в практике фирм-производителей наукоемкой фармацевтической продукции и должны быть конкурентоспособными на мировом рынке.

Продвижение препарата на рынок можно ассоциировать со стратегией диверсификации, хотя он таковым, по сути, не является. Как и при диверсификации предполагается заниженная цена вхождения на рынок в сочетании с активными элементами продвижения. Однако стратегия потенциального производителя не нуждается в искусственном занижении стоимости препарата, т.к. его прогнозируемая себестоимость и так достаточно низка. Следовательно, исключается финансовая перегрузка проекта с целью поддержания демпинговых цен разрабатываемого продукта по сравнению с товарами-субститутами.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Жиликова, Е.Т. Обоснование производства глазных капель с учетом требований GMP в аптеке [Текст] / Е.Т. Жиликова, М.Ю. Новикова, М.А. Халикова и др. // Научные ведомости БелГУ. - 2008. - №6(46). - С.126-130.
2. Жиликова, Е.Т. Методология обоснования выбора состава лекарственных форм с использованием инновационных технологий

РАЗРАБОТКА СОСТАВА И ТЕХНОЛОГИИ АНТИКАТАРАКТАЛЬНЫХ ГЛАЗНЫХ КАПЕЛЬ С АМИНОКИСЛОТАМИ

[Текст] / Е.Т. Жиликова, Э.Ф.Степанова, М.А. Халикова //Фармация из века в век: Часть II. Фармацевтические технологии: сб. науч. тр./ Санкт-Петерб. хим.-фарм. академия. – СПб, 2008. – С. 44-49.

3. Фадеева, Д.А. Целесообразность применения природных антиоксидантов для профилактики и лечения катаракты [Текст]/Д.А. Фадеева, М.А. Халикова, М.Ю. Новикова и др. //Материалы международной научно-практической конференции «Ботанические сады в 21 веке: сохранение биоразнообразия, стратегия развития и инновационные решения», Белгород. - 2009. - С. 472-473.

4. Фадеева, Д.А. Изучение физико-

химических свойств пролонгаторов для глазных лекарственных форм [Текст]/ Д.А. Фадеева, М.А. Халикова, М.Ю.Новикова и др.// Кубанский научный медицинский вестник. – 2009. - №3 (108). - С. 132-135.

5. Фадеева, Д.А. Перспективы использования карнозина в глазных лекарственных формах [Текст]/ Д.А.Фадеева, О.О.Новиков, Е.Т.Жиликова и др.//Материалы международной научно-практической конференции «Биологически активные соединения природного происхождения: фитотерапия, фармацевтический маркетинг, фармацевтическая технология, фармакология, ботаника», Белгород. - 2008. - С. 69-72.