



ЯРМАРКА ПРОДУКТОВЫХ РАЗРАБОТОК В СФЕРЕ МЕДИЦИНЫ И ЗДРАВООХРАНЕНИЯ

ЯРМАРКА РАЗРАБОТОК
ЯР

Разработка лекарственного препарата на основе селективного ингибитора карбоангидразы II типа для лечения открытоугольной глаукомы

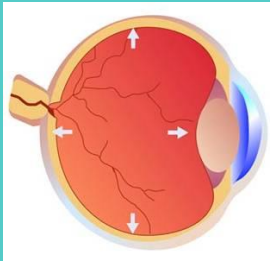
Руководитель проекта:
академик РАН, профессор
А.Л. Хохлов

Докладчик:
научный сотрудник института фармации ФГБОУ ВО
ЯГМУ Минздрава России
А.Н.Тюшина



АКТУАЛЬНОСТЬ

По данным ВОЗ глаукома является основным заболеванием, которое, при отсутствии своевременного лечения, необратимо вызывает слепоту



Возраст	Распространенность заболевания
новорожденные	1 на 10 000–20 000
40–45 лет	0,1 % населения
50–60 лет	1,5 % населения
75 лет и старше	более чем у 3 % населения

ЦЕЛЬ РАБОТЫ

создание офтальмогипотензивных средств, сопоставимых по эффективности системным блокаторам карбоангидразы (КА), а по безопасности – препаратам несистемного действия

СПОСОБ РЕШЕНИЯ ПРОБЛЕМЫ (1)

синтез и последующее изучение соединений с селективной активностью по отношению КА II

По химическому строению все вновь синтезированные соединения относились к классу производных сульфониламидов.

Для синтеза новых соединений использовались методики компьютерного моделирования.

Для отбора наиболее перспективных соединений применялись методики *in vitro*: измерение эстеразной каталитической активности модельного фермента (бычьей карбоангидразы изоформы II) в отсутствие и в присутствии ингибиторов; дифференциальная сканирующая флуориметрия методом теплового сдвига (thermal shift).

Было отобрано 25 соединений со следующими параметрами:

- % ингибирования КА II не менее 90%;
- константа ингибирования КА II (K_i , нмоль) не более 0,5 (у ацетазоламида – 12).

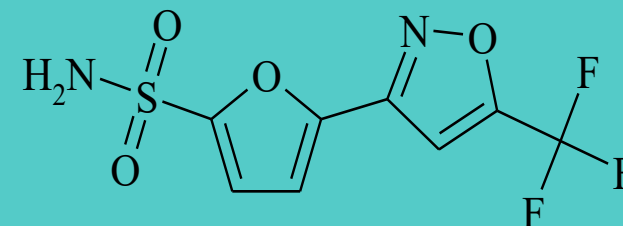
СПОСОБ РЕШЕНИЯ ПРОБЛЕМЫ (2)

Исходя из расчета следующих параметров:

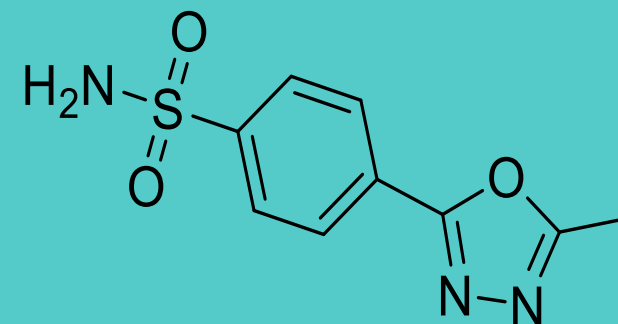
- сила офтальмогипотензивного эффекта;
- длительность эффекта;
- начало эффекта;
- временная характеристика максимума;
- вероятность нормотензии при адреналин-индуцированной глаукоме

для доклинических исследований были выбраны два препарата

B16



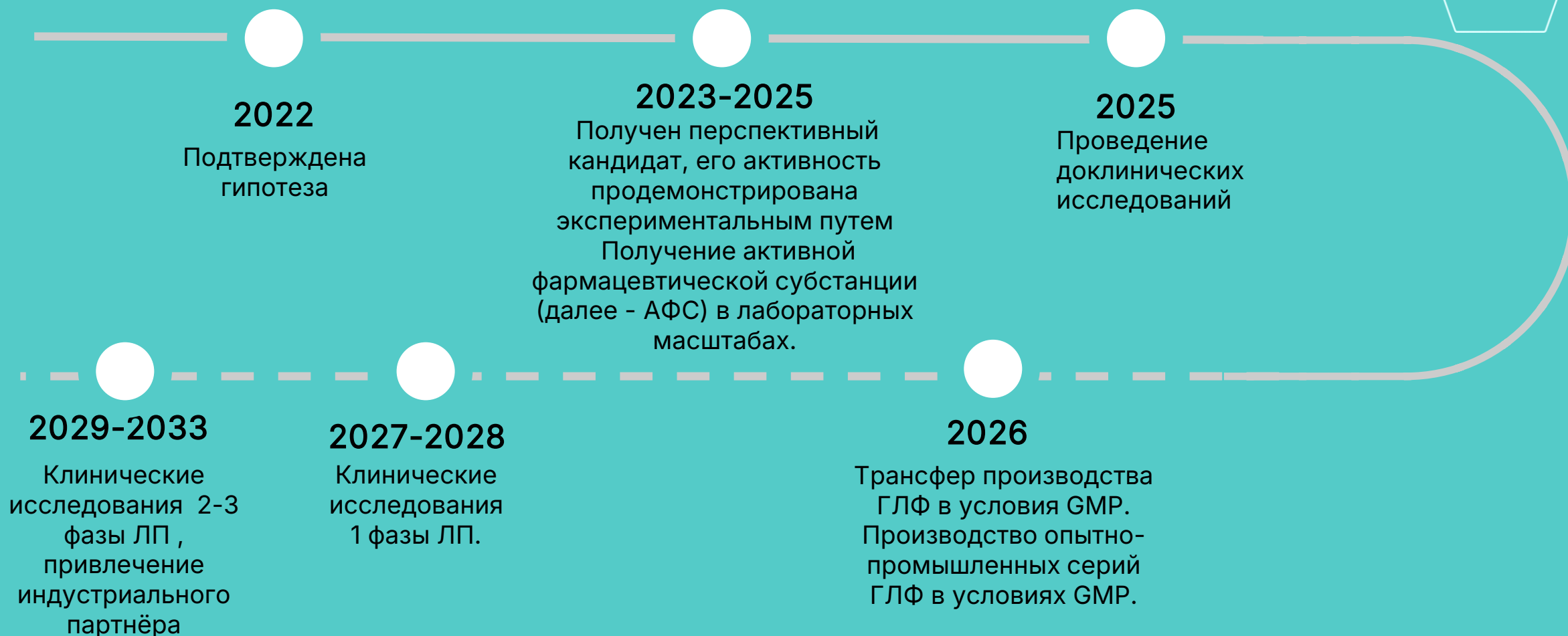
B25



В доклинических исследованиях по токсикологической и фармакологической безопасности (острое и повторное введение вещества, репродуктивная токсичность, гено- и канцеро безопасность и др.)

Наиболее безопасным препаратом оказалось соединение B25

Дорожная карта проекта





ЯРМАРКА ПРОДУКТОВЫХ РАЗРАБОТОК В СФЕРЕ МЕДИЦИНЫ И ЗДРАВООХРАНЕНИЯ

ЯРМАРКА РАЗРАБОТОК
ЯР

ФГБОУ ВО ЯГМУ Минздрава России

Проректор по научно-исследовательской работе,
профессор Староверов И.Н.
телефон: 8 (4852) 30 39 85
e-mail: aspirant.ygmy@yandex.ru



Спасибо за внимание!

