МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
Кафедра хімії природних сполук і нутриціології

«Сучасний стан наукових знань спеціальності «Фармація»

Лекція 3

СУЧАСНІ ПІДХОДИ ДО СТВОРЕННЯ ФІТОПРЕПАРАТІВ, ЩО ВИЯВЛЯЮТЬ Р-ВІТАМІННУ АКТИВНІСТЬ

План лекції

1. Визначення витаміну Р. Характеристика та фармакологічна дія
2. Характеристика кверцетину та його похідних
3. Кверцетинвімсні препарати
4. Дигідрокверцитинвмісні препарати
5. Рутинвмісні препарати
6. Флавонвмісні препарати
7. Препарати на основі фенольних сполук винограду
8. Рекомендована література

ФУНКЦІЯ ФЛАВОНОЇДІВ - відновлення захисних властивостей клітин, що ушкоджені різними зовнішніми факторами - ультрафіолетом, грибами, вірусами, комахами, вільними радикалами.

- Серцево-судинні захворювання
- Судинні ураження головного мозку
- Процес атеросклерозу
- Артеріальна гіпертензія
- Порушення функції печінки
- Цукровий діабет 2 типу
- Запальні процеси бронхо-легенової системи
- Запальні процеси нирок
- Катаракта
- Ураження шлунково-кишкового тракту

Продукти багаті на вітамін Р

Лимон
(белая часть кожуры и цедра)

Апельсин
(белая часть кожуры и цедра)

Грейпфрут
(белая часть кожуры и цедра)

Абрикос

Гречка

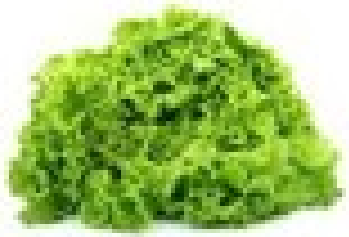
Черешня

Шиповник

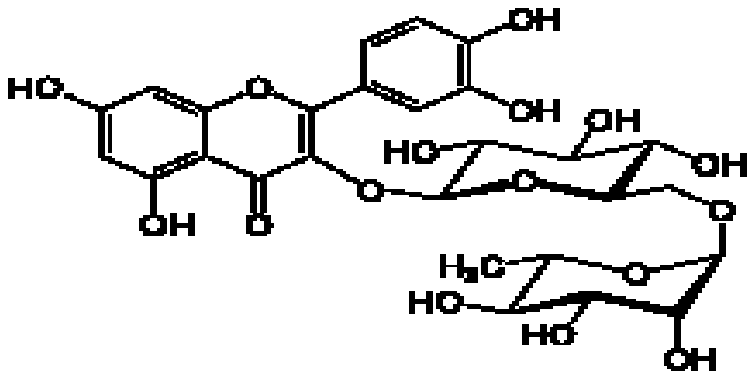
Черная смородина

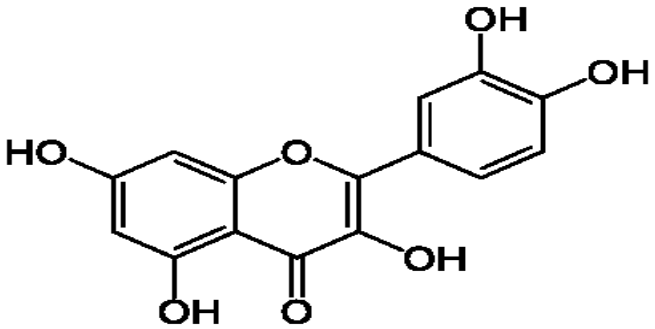
Черноплодная рябина

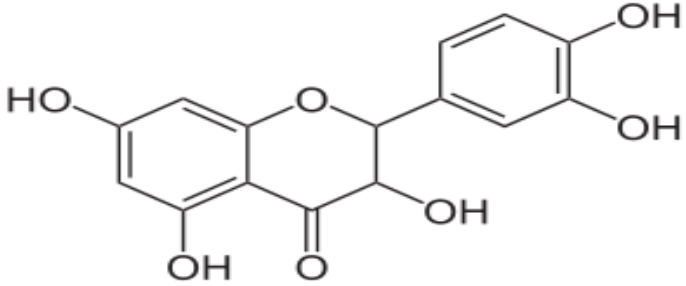
Салат

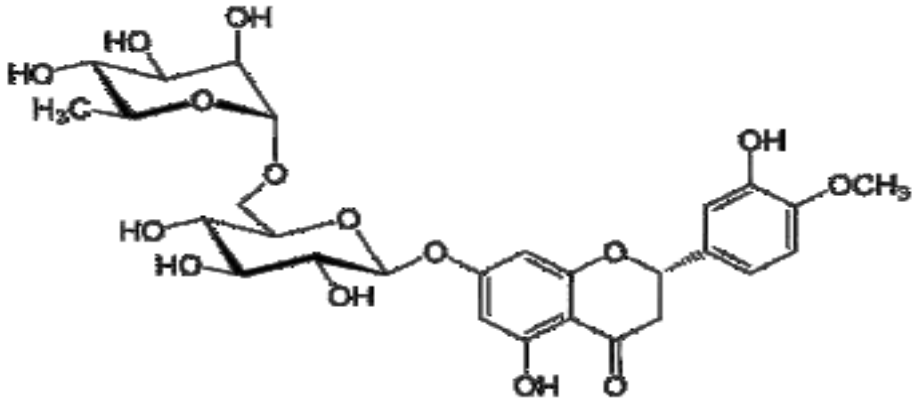


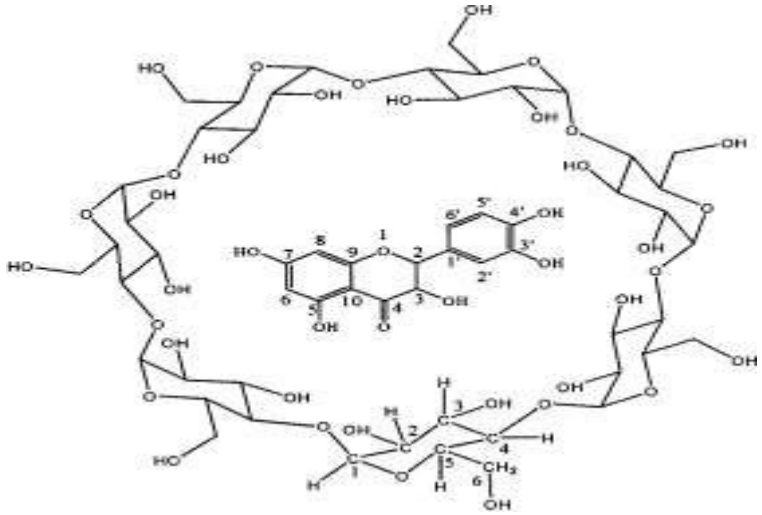
Флавоноїди, що проявляють Р-вітамінну дію











водорозчинний комплекс
дигідрокверцетино-β-циклодекстрин

КВЕРЦЕТИН

3,5,7,3',4' - пентагідроксифлавон

капілярозміцнююча

протизапальна

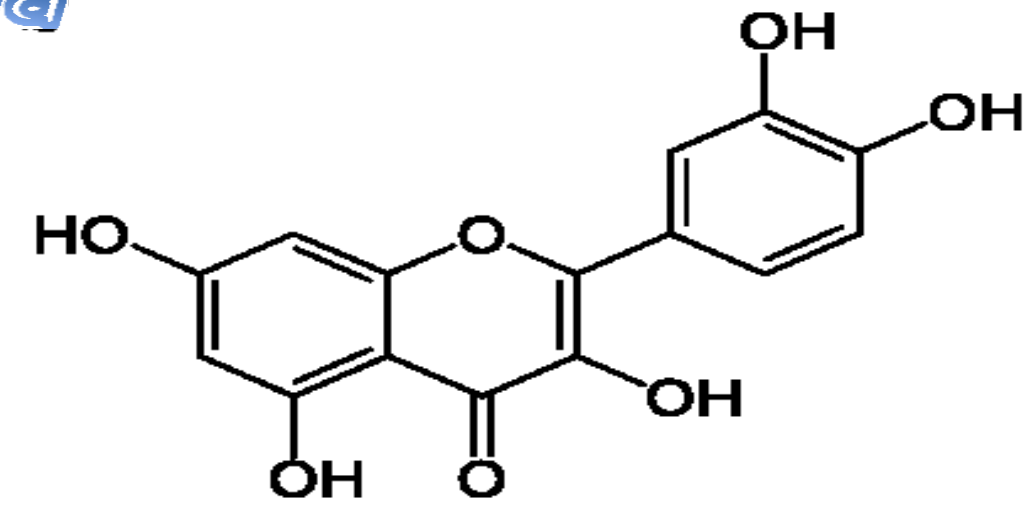
спазмо

ична

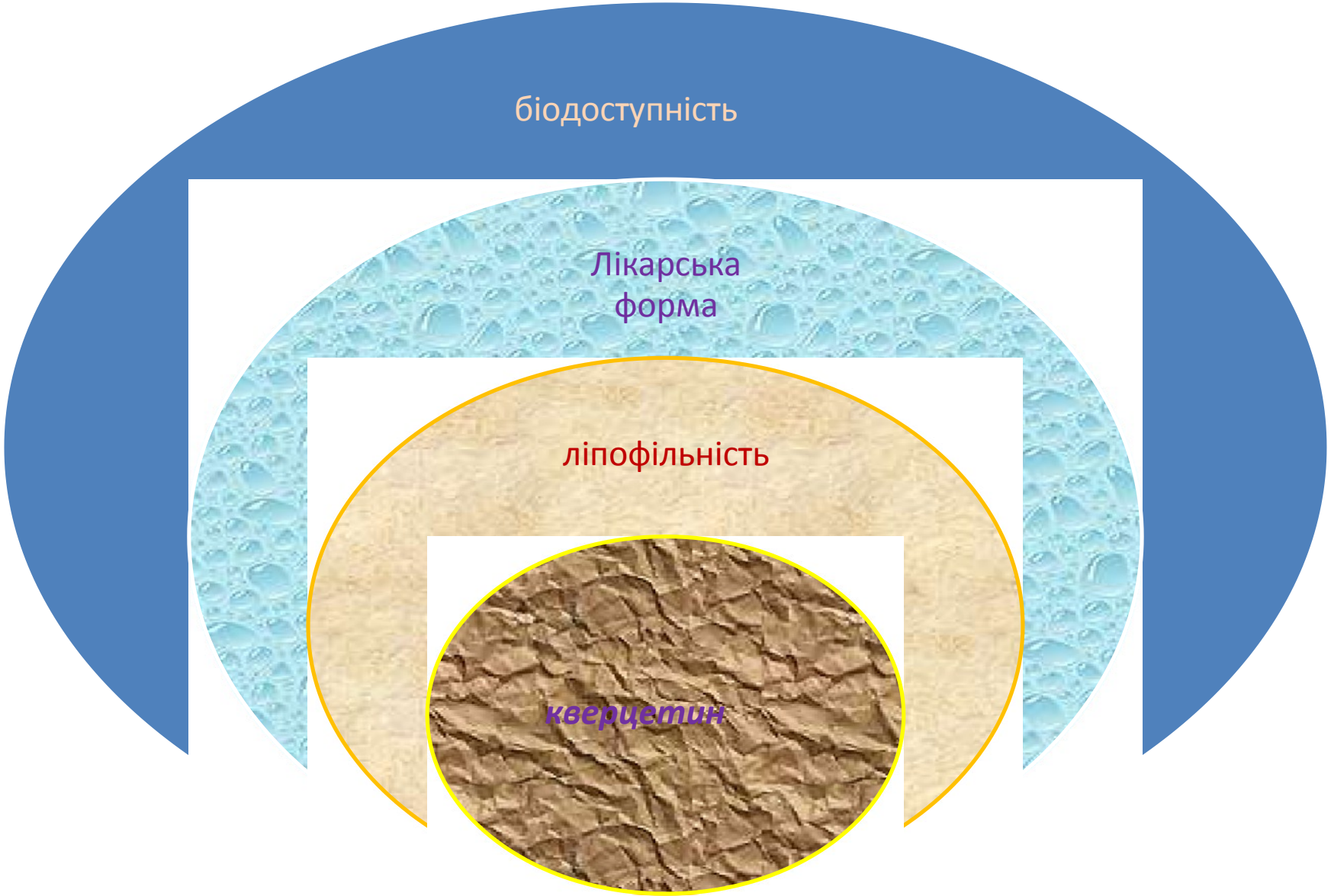
антиоксидантна

радіо отекторна

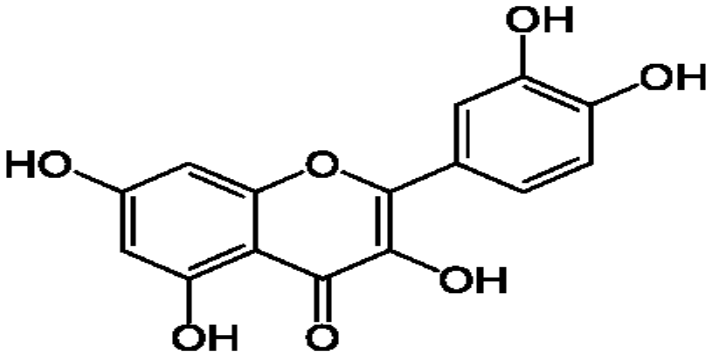
антигістамінна



Основні кверцетинвмісні продукти


біодоступність
Лікарська форма
ліпофільність
кверцетин

Кверцетинвмісні препарати



Кверцетин

Діюча речовина: 1 г препарату містить кверцетину (у перерахуванні на 100 % суху речовину) – 0,04 г;

Показання для застосування.

У комплексному лікуванні:

- для запобігання ерозивно-виразковим ураженням верхніх відділів травного тракту, спричинених прийомом нестероїдних протизапальних засобів;
- місцевих променевих уражень після рентген- та гамма-променевої терапії та їх профілактики;
- пародонтозу, ерозивно-виразкових захворювань слизової оболонки ротової порожнини;
- гнійно-запальних захворювань м’яких тканин;
- клімактеричного, вертебрально-больового синдрому, нейрорефлекторних проявів остеохондрозу хребта;
- хронічного гломерулонефриту;
- нейроциркуляторної дистонії, ішемічної хвороби серця, стенокардії напруження II-III функціонального класу.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до кверцетину та до інших компонентів препарату, а також до препаратів з Р- вітамінною активністю.

Виробник: ПАТ «Науково-виробничий центр «Борщагівський хіміко-фармацевтичний завод» (Київ, Україна)

Корвітин

Діючі речовини: 1 флакон містить корвітину (комплекс кверцетину з ПВП) - 0.5 г
Фармакотерапевтична група. Капіляростабілізуючі засоби. Біофлавоноїди.

Показання для застосування.

- у комплексній терапії при гострому порушенні коронарного кровообігу та інфаркті міокард;,
- для лікування і профілактики реперфузійного синдрому при хірургічному лікуванні хворих на облітеруючий атеросклероз черевної аорти і периферичних артерій.

Побічна дія.

Препарат добре переноситься хворими. При швидкомувнутрішньо венному введенні та в комбінації з органічними нітратами можлива невелика гіпотензія. Можлива індивідуальна чутливість до препарату.

Протипоказання.

Індивідуальна чутливість до кверцетину.

Ліпофлавон

Діючі речовини: 1 флакон (пляшка) містить лецитин-стандарту у перерахуванні на лецитин 550 мг, кверцетину у перерахуванні на суху речовину 15 мг

Показання.

Ліпофлавон призначають у комплексному лікуванні гострого інфаркту міокарда без зубця Q, нестабільної і стабільної стенокардії (ІХС), міокардитів, для запобігання токсичних уражень міокарда при проведенні циклів полі хіміотерапії раку молочної залози.

Побічні реакції.

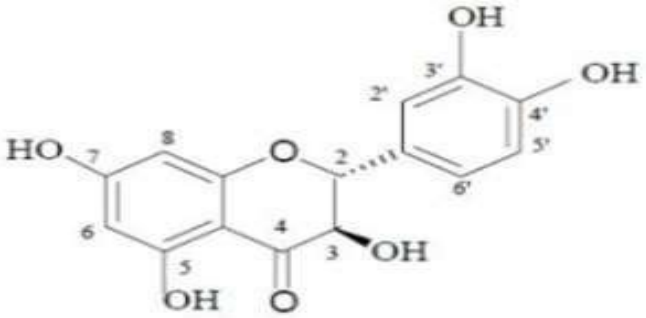
Можливе зниження артеріального тиску. У разі підвищеної індивідуальної чутливості до препарату можливі прояви кропив'янки, гіпертермії, місцевої гіперемії, алергічні прояви. В поодиноких випадках може виникнути діарея.

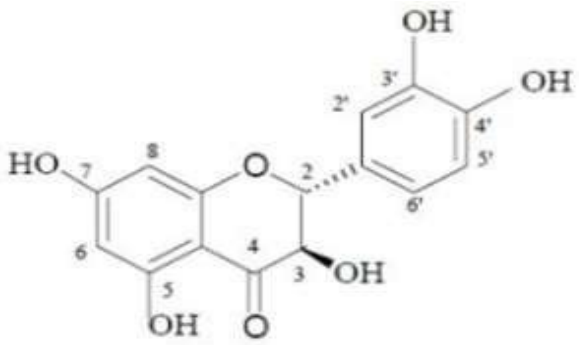
Протипоказання.

Індивідуальна підвищена чутливість до компонентів препарату. Алергічні реакції на вакцини або білок в анамнезі. У зв'язку з обмеженою на сьогоднішній день інформацією. Ліпофлавон не рекомендується призначати у період вагітності або годування груддю, а також дітям віком до 18 років.

Виробник: ПАТ «Науково-виробничий центр «Борщагівський хіміко-фармацевтичний завод» (Київ, Україна)

Препарати дигідрокверцетину





Дигідрокверцетин

- ***Діюча речовина:*** таблетки по 250 мг або капсули по 200 мг. До складу 1 таблетки (1 капсули) входить дигідрокверцетин (природний біофлавоноїд, виділений з кори ялиці сибірської) – 25 мг.

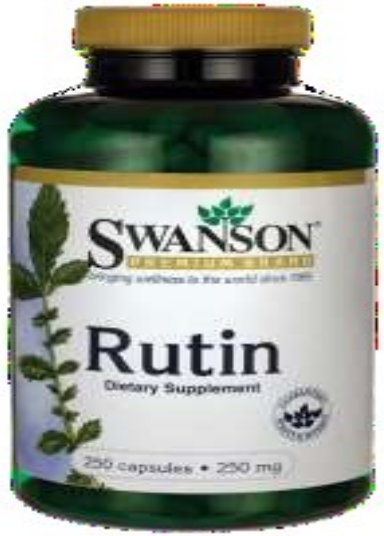
Показання до застосування:

- Для покращення функціонального стану серцево-судинної системи та підтримки капилярної микроциркуляції.

Протипоказання

- Індивідуальна підвищена чутливість до компонентів препарату

Рутинвмісні препарати



Аскорутин

Діючі речовини: 1 таблетка містить кислоти аскорбінової 0,05 г, рутину 0,05 г;

Фармакотерапевтична група. Вітаміни.

Фармакологічні властивості.Рутин, особливо в сполученні з кислотою аскорбіновою, знижує проникність і ламкість капілярів, утому числі за рахунок пригнічення активності гіалуронідази, має антиоксидантні властивості, бере участь в окислювально-відновних процесах.

Фармакокінетика. Аскорбінова кислота всмоктується в дванадцятипалій кишці. Максимальна концентрація в плазмі крові досягається через 4 години. Легко проникає в лейкоцити, тромбоцити, а потім – в усі тканини.

Максимальна концентрація рутину в плазмі крові реєструється через 1-6 годин. Період напіввиведення становить 10-25 годин. Виводиться у виді метаболітів, головним чином з жовчю, меншо мірою – із сечею.

Показання для застосування.

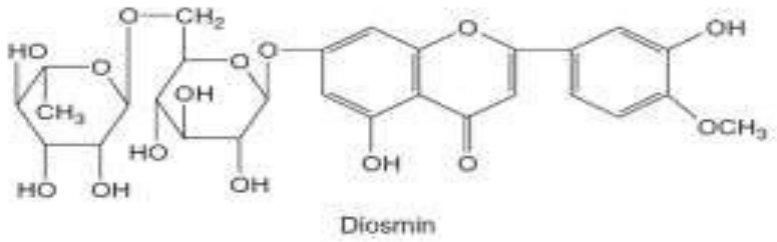
Гіпо- і авітаміноз Р (профілактика і лікування); захворювання, що супроводжуються підвищенням проникності судин (у тому числі в складі комплексної терапії): геморагічні діатези, капіляротоксикози, променева хвороба, алергічні захворювання, тромбоцит опенічна пурпура, гломерулонефрит, крововилив у сітківку ока, септичний ендокардит, артеріальна гіпертензія, ревматизм, арахноїдит, інфекційні хвороби (висипний тиф, кір, скарлатина); ураження капілярів, обумовлені застосуванням антикоагулянтів і саліцилатів (профілактика і лікування).

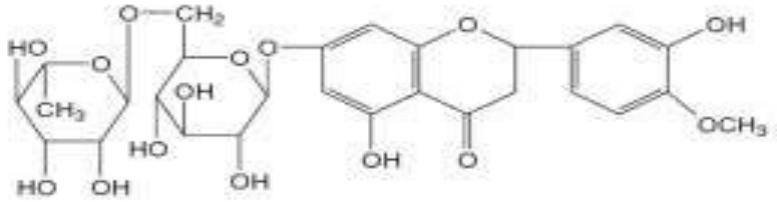
Побічна дія. Алергічні реакції, гіпервітаміноз.

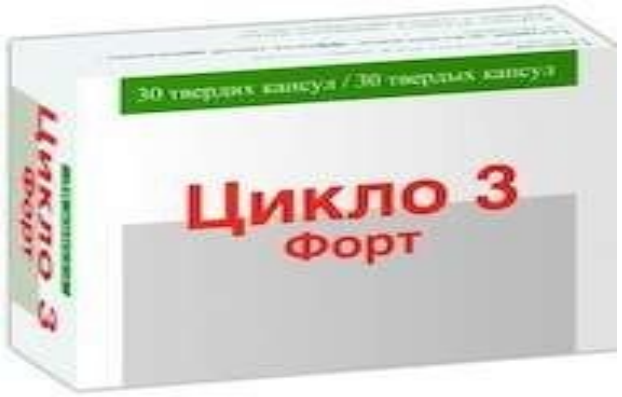
Протипоказання. Підвищена чутливість до компонентів

Виробник: ВАТ "Монфарм", м. Монастирище, Черкаська обл., Україна, «Лекхім»

ФЛАВОНВМІСНІ ПРЕПАРАТИ

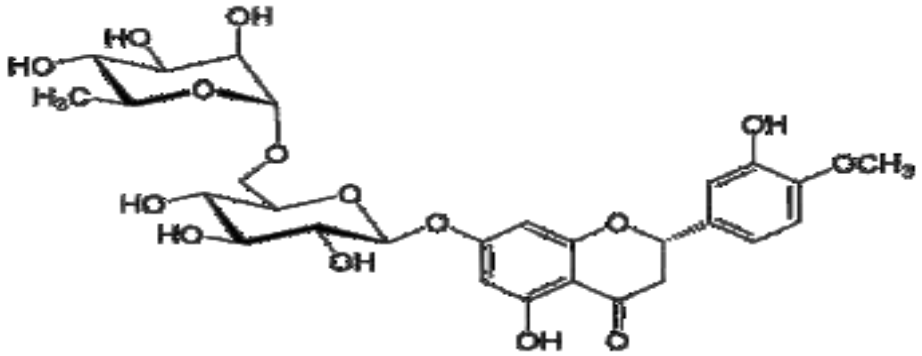


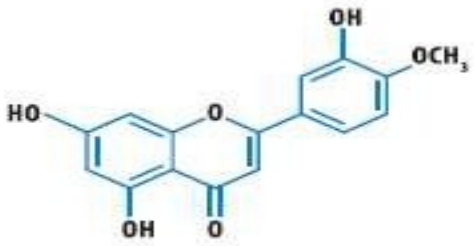




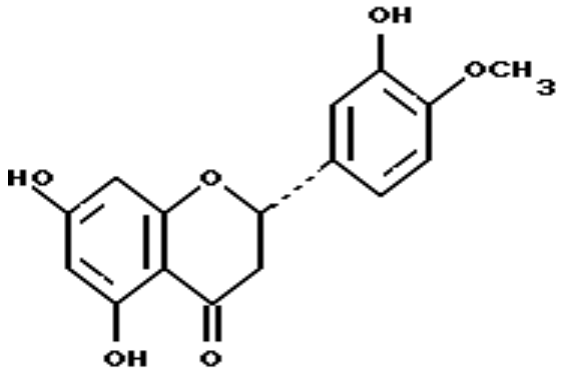
Якісний склад комплексу «Гесперидин»

ГЕСПЕРИДИН – комплекс флавонових глікозидів (гесперидину, лінарину, ізоройфолину) агліконів (гесперитину, діосметину)

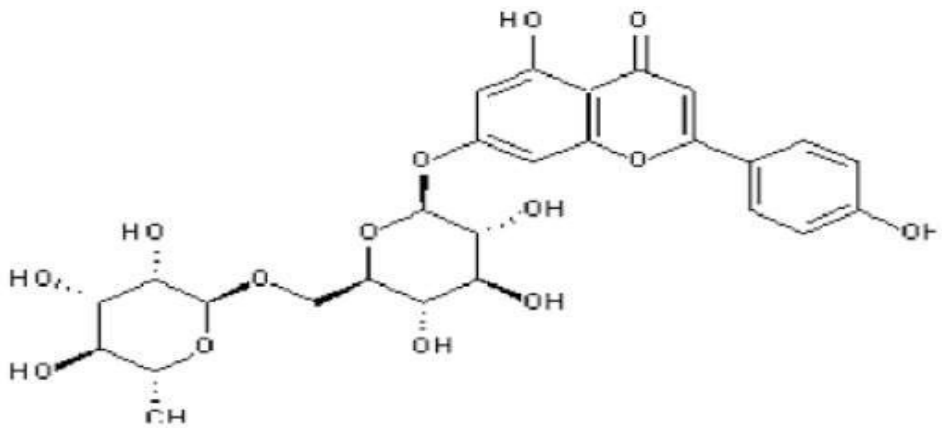




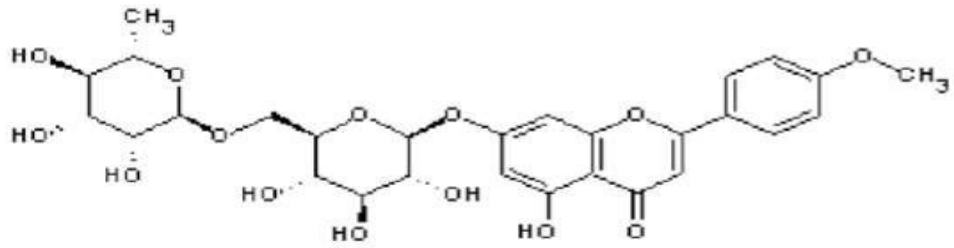
Диосметин



ГЕСПЕРЕТИН



Структурная формула линарина



Структурная формула изороифолина

ДЕТРАЛЕКС

Діючі речовини: діосмін, гесперидин;

•1 таблетка містить: 500 (1000) мг мікронізованої очищеної флавоноїдної фракції, яка містить 450 (900) мг діосміну (90 %) і 50 (100) мг флавоноїдів у вигляді гесперидину (10 %);

Фармакотерапевтична група: Капіляростабілізуючі засоби. Біофлавоноїди. Діосмін, комбінації

Фармакологія.

•Детралекс® чинить венотонічну та ангіопротекторну дію, зменшує розтяжність вен та веностаз, покращує мікроциркуляцію, знижує проникність капілярів та підвищує їх резистентність, а також поліпшує лімфатичний дренаж, збільшуючи лімфатичний відтік.

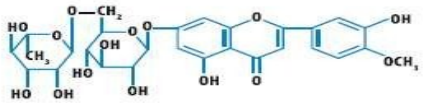
Показання до застосування

•Симптоматичне лікування венолімфатичної недостатності (важкість у ногах, біль, нічні судоми, набряки, трофічні порушення, включаючи варикозні виразки).

•Симптоматичне лікування геморою.

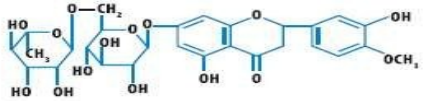
Протипоказання

•Підвищена чутливість до діючої або будь-якої допоміжної речовини.



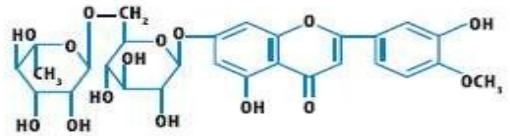
Диосмин

Виробник: Лабораторії Серв'є Індастрі/Les Laboratoires Servier Industrie (Франція)



Хесперидин

ФЛЕБОДИА



Диосмин

- ***Діюча речовина*:** 1 таблетка містить діосмін, що відповідає діосміна безводного чистого 600 мг;
- Фармакотерапевтична група

Ангіопротектори. Капіляростабілізуючі засоби. Біофлавоноїди.

Показання для застосування

- Для полегшення симптомів, обумовлених лімфовенозною недостатністю, таких як відчуття тяжкості у нижніх кінцівках, біль, трофічні розлади;
- у комплексному лікуванні загострення геморою;
- як додатковий метод лікування підвищеної ламкості капілярів, порушення мікроциркуляції.

Протипоказання

- Підвищена чутливість до компонентів препарату, особливо у пацієнтів, схильних до алергічних реакцій на кошеніль червону А (Е 124). Препарат звичайно не рекомендується застосовувати у період годування груддю.

Innothera Chouzy, France

Цикло 3 форт

Діючі речовини: 1 капсула містить сухий екстракт іглиці (*Ruscus aculeatus*) з титрованим вмістом стеролових гетерозидів (150 мг); гесперидину метилхалкон (150 мг), кислоту аскорбінову (100 мг);

Фармакотерапевтична група: Ангіопротектори. Капіляростабілізуючі засоби.

Показання до застосування

•Симптоматичне лікування венозно-лімфатичної недостатності (з такими проявами як тяжкість у ногах, біль, синдром стомлених ніг).

•Хронічна лімфатична недостатність, у тому числі після травм та оперативних втручань, стани після мастектомії.

•Ациклічні маткові кровотечі, спричинені застосуванням мікродозових прогестогенних контрацептивів або внутрішньоматкових засобів, після клінічного і параклінічного обстеження пацієнтів.

•Загострення геморою (лікування функціональних симптомів).

Протипоказання

•Підвищена чутливість до компонентів препарату, тяжкі захворювання нирок.

Виробник: Pierre Fabre Medicament Production (Франція).

Антистакс

Діючі речовини: 1 капсула містить екстракт червоного листя винограду 0,180 г.

Показання до застосування

-варикозне розширення вен з венозною недостатністю;
-хронічна венозна недостатність;
-відчуття втоми ніг;
-тяжкість у нижніх кінцівках;
-парестезії, болі після тривалого перебування у положенні стоячи.

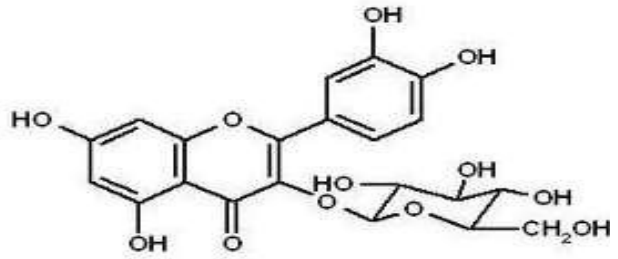
Побічна дія

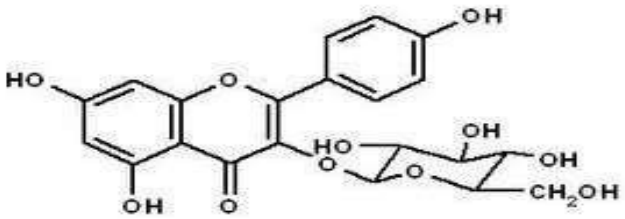
-генералізований висип із свербінням;
-кропив'янка;
-реакції гіперчутливості;
-нудота;
-епігастральний дискомфорт.

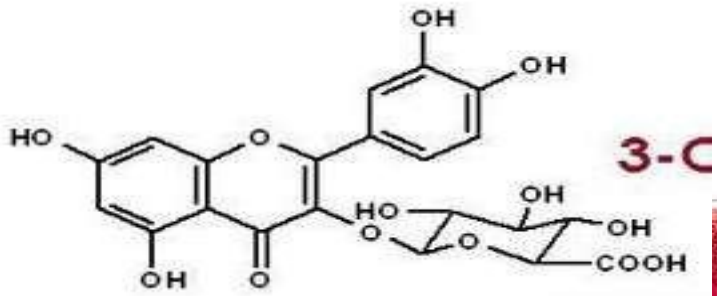
-**Протипоказання**

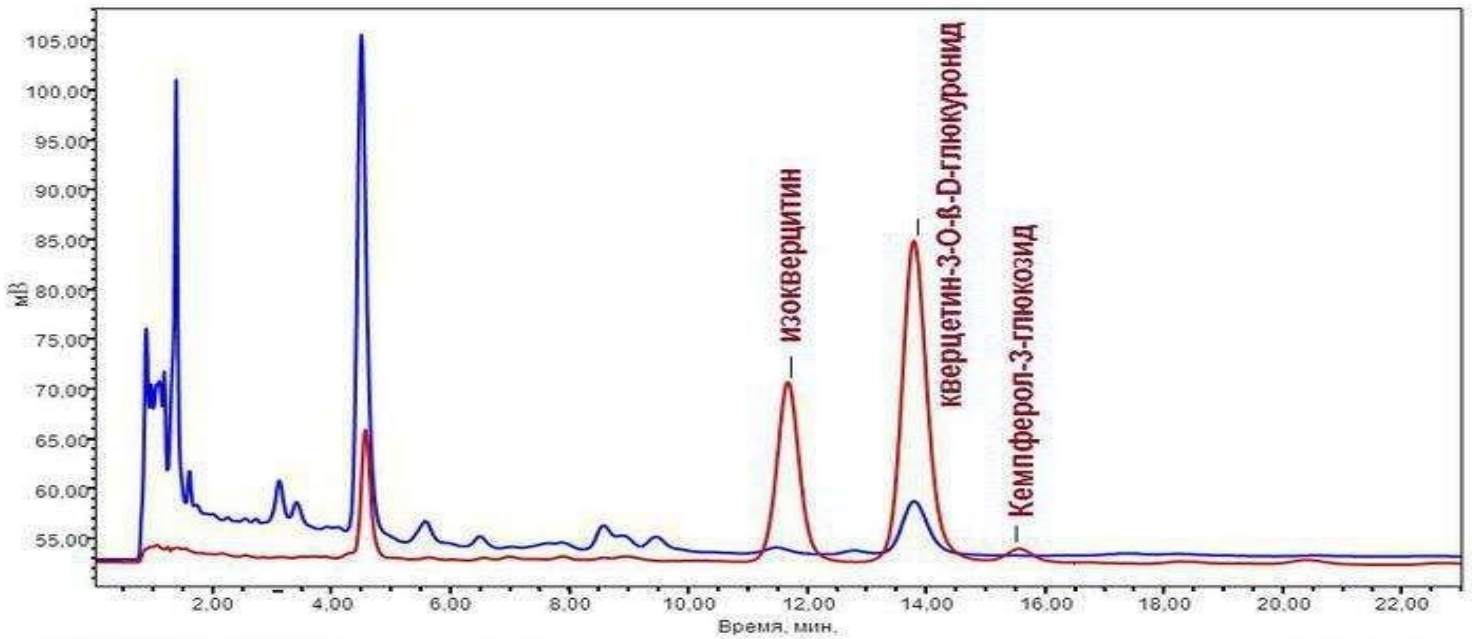
Не призначають Антистакс:
-у дитячому віці;
-при вагітності;
-при наявності гіперчутливості до витяжок із листя винограду, кверцетину, допоміжних компонентів;
-у період лактації.

Основні флавоноїди червоного листя винограду









Совмещенные хроматограммы ВЭЖХ:
___красный виноград сорта Dornfelder и
___ Капсула Антистакс® (2х180 мг)

MyShared

- **Перспективи використання фенольних сполук**

Список рекомендованої літератури

Базова

- Музафаров Е.Н., Абдрасилов Б.С., Алферов В.А. Очерки по истории биотехнологии: учеб. пособие. Тула: Изд-во ТулГУ. -2013. -359 с.
- Менщикова Е.Б., Ланкин В.З., Кандалинцева Н.В. Фенольные антиоксиданты в биологии и медицине. LAP LAMBERT Academic Publishing. 2012. – 488 с.
- Флавоноиды: биохимия, биофизика, медицина / Тараховский Ю. С., Ким Ю. А., Абдрасилов Б. С., Музафаров Е. Н.; [отв. ред. Е.И. Маевский] – Пущино: Synchrobook. - 2013. – 310 с.

Додаткова

- Патент України № 76393 «Спосіб отримання ліпосомального засобу, що містить кверцетин»(2006)
- Патент України № 23996 «Спосіб одержання корвітину» (2000)
- Патент US 7674488
- Патент US 7270838

ДЯКУЮ ЗА УВАГУ!

Наці h.edu.ua
вул. Пушкінська, 53, м. Харків, 61002
https://nuph.edu.ua