

*Материалы конференции
«Интеграция науки и образования»,
Мальдивские острова, 14-21 февраля 2014 г.*

Фармацевтические науки

**ФАРМАКОЛОГИЯ ПРОИЗВОДНОГО
1-[(3,4-ДИМЕТОКСИФЕНИЛ) МЕТИЛ]
-6,7-ДИМЕТОКСИЗОХИНОЛИНА**

Сохова М.Р.

*МБУЗ «Центральная городская больница г.
Пятигорска», Россия, e-mail: clinfarmacologia@bk.ru*

Изохинолин представляет собой платформу для синтеза биологически активных веществ (в частности так был выделен препарат папаверина гидрохлорид), применяемых в медицинской практике, как и другие лекарственные средства природного и синтетического происхождения [1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35]. В последнее время накопились факты применения папаверина гидрохлорида по показаниям, которые не указаны в официальной инструкции на препарат.

Цель исследования. Определить возможные дополнительные показания к применению папаверина гидрохлорида.

Материал и методы исследования. Данные анализа научных клинических и экспериментальных публикаций.

Результаты исследования и их обсуждение. В инструкции на препарат приводятся сведения по основным параметрам фармакодинамики и фармакокинетики лекарственного средства. Основной механизм действия связан с тем, что препарат ингибирует фермент фосфодиэстеразу, вызывает накопление в клетке циклического аденозинмонофосфата и уменьшает содержание внутриклеточного кальция. Снижает тонус гладких мышц (в первую очередь) внутренних органов (желудочно-кишечного тракта, дыхательной, мочевыделительной, половой системы) и сосудов. Вызывает расширение артерий, способствует увеличению кровотока, в том числе церебрального. Оказывает гипотензивное действие. В высоких дозах снижает возбудимость сердечной мышцы и замедляет внутрисердечную проводимость. При применении в средних терапевтических дозах действие на центральную нервную систему выражено слабо (в отдельных случаях возникает повышенная потребность во сне). Фармакокинетические параметры - биодоступность составляет 54%; связывание с белками плазмы - 90%. Папаверина гидрохлорид хорошо распределяется в организме, проникает через гистогематические барьеры. Метаболизируется в печени. Период полувыведения - 0.5-2 часа. Возможно увеличение до 24 часов. Выводится почками в виде метаболитов. Препарат выпускается в виде таблеток, све-

чей и стерильного раствора в ампулах для инъекций. В официальной инструкции на препарат указаны следующие показания к применению: спазмы гладких мышц органов брюшной полости, бронхов, периферических сосудов, сосудов головного мозга, почек; стенокардия (в составе комбинированной терапии). Как вспомогательное средство для премедикации. В результате применения в клинической практике выявлены следующие дополнительные показания: 1. Применение при гипертонусе матки. Папаверин при беременности применяют при гипертонусе матки (повышенный тонус миометрия – мышц матки, по закону Старлинга). Эта патологическая реакция может привести к угрозе прерывания беременности и встречается довольно часто в современных условиях. Папаверин в виде свечей предназначен для введения в прямую кишку и дневная доза может составлять две - три свечи в сутки. Папаверин в виде инъекций назначается в количестве двадцати миллиграммов препарата, разведенных в физрастворе – для внутривенного использования (использование внутривенного введения должно осуществляться под контролем врача). Папаверин в инъекциях могут назначить и подкожно или внутримышечно. Тогда дозировка составляет от одного до двух миллилитров двухпроцентного раствора, от двух до четырех раз в день. Папаверина гидрохлорид улучшает кровоснабжение мускулатуры матки, что весьма положительно влияет на состояние плода. Этот препарат проверен педиатрами, которые на протяжении десятилетий применяли при патологии беременности. Причем довольно часто папаверин при беременности принимают длительными курсами, но это никак не отражается на здоровье малыша. 2. В конце восьмидесятих годов двадцатого века было обнаружено, что папаверина гидрохлорид можно использовать для восстановления эрекции полового члена. Для этого нужно сделать инъекцию папаверина гидрохлорида в пещеристое тело полового члена. От сорока до семидесяти процентов случаев нарушений эрекции корректируются с его помощью. В настоящее время рекомендуют применение папаверина в виде свечей, в результате есть эффект, но нет болезненных ощущений в месте инъекции. В виде свечей, для лечения эректильной импотенции, следует применять за 10-20 минут до полового акта. 3. Использование папаверина гидрохлорида при воспалении слюнных желез. Рекомендуется применение в виде раствора (стерильного или растворив ½ таблетки в 2-5 мл воды) в ротовую полость и держать до 10 минут. Положительный эффект

заклучается в том, что препарат всасываясь в ротовой полости способствует расширению воспаленных протоков слюнных желез и уменьшению болевой реакции при прохождении слюны (для усиления эффекта можно рекомендовать совместное применение с ацетилцистеином). В случае применения папаверина гидрохлорида по «требованию», то есть от случая к случаю, это средство, как правило, безопасно и даже рекомендовано применение у детей с 6 месяцев. При курсовом назначении следует помнить о спектре побочных отрицательных эффектов, которые могут развиваться у пациента. Это возможно: тошнота, запоры, сонливость, повышенная потливость, артериальная гипотензия, повышение активности печеночных трансаминаз. При быстром внутривенном введении, а также при применении в высоких дозах: развитие атрио-вентрикулярной блокады проводящей системы сердца, нарушений сердечного ритма

Выводы. На основании многолетнего использования препарата папаверина гидрохлорида специалистами выявлены дополнительные положительные влияния у пациентов с определенными состояниями и заболеваниями организма.

Список литературы

- Активность извлечений из травы черноголовки крупноцветковой при гипоксической гипоксии / А.А. Шамилов, А.В. Арлыт, М.Н. Ивашев // Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований.-2013.-№5.- С.132-133.
- Арлыт А.В. К вопросу эпидемиологии нарушений мозгового кровообращения / А.В. Арлыт, М.Н. Ивашев // Успехи современного естествознания. - 2013. - № 3. - С. 148.
- Биологическая активность соединений из растительных источников / М.Н. Ивашев [и др.] //Фундаментальные исследования.-2013.- № 10.- Ч.7.- С. 1482 – 1484.
- Влияние бутанольной фракции из листьев форзиции промежуточной на мозговое кровообращение/ А.В. Арлыт [и др.] // Кубанский научный медицинский вестник.-2011.-№5. - С. 10-12.
- Влияние дибикора и таурина на мозговой кровоток в постшемическом периоде / Абдулмуджид Али Кулейб [и др.] // Фармация. - 2009. - № 1. - С. 45-47.
- Влияние диована на динамику изменения объёмной скорости мозгового кровотока, системного артериального давления и сопротивления сосудов мозга в норме / А.В. Арлыт [и др.] // Международный журнал экспериментального образования. - 2013. - № 3. - С. 27.
- Влияние жирных растительных масел на динамику мозгового кровотока в эксперименте / А.В. Арлыт [и др.] // Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований. - 2012. -№11. - С. 45-46.
- Влияние катадолона на мозговой кровоток / Ю.С. Струговщик [и др.] // Успехи современного естествознания. - 2013. -№3. - С. 142.
- Влияние метронидазола и липида на экспериментальное воспаление / А.В. Сергиенко [и др.] // Кубанский научный медицинский вестник. - 2009. -№8. - С. 68-74.
- Влияние никотина на кровообращение мозга / А.В. Арлыт [и др.] // Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований.-2013.-№11-2.-С.90-91.
- Влияние препарата «профеталь» на мозговой кровоток А / А.В. Арлыт [и др.] // Биомедицина. - 2010. - Т. 1. -№5. - С. 66-68.
- Влияние субстанции дигидрокверцитина на динамику мозгового кровотока и артериального давления у крыс / А.В. Арлыт [и др.] // Современные проблемы науки и образования. - 2012. -№5. - С. 354.
- Влияние флупиртина малеата на мозговое кровообращение в эксперименте/А.В.Арлыт [и др.] //Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований.-2013.-№1.-С.134.
- Изучение биологической активности 20% раствора пиррацетама / С.А. Рожнова [и др.] // Депоированная рукопись № 1339-B2004 30.07.2004
- Изучение влияния эфирного масла и суммы лактонов полыни однолетней на мозговое кровообращение / Д.Д. Винников [и др.] // Вестник Воронежского государственного университета. Серия: Химия. Биология. Фармация. - 2006. -№2. - С. 219-221.
- Изучение острой токсичности извлечений из сырья черной головки крупноцветковой / А.А. Шамилов [и др.] // Успехи современного естествознания. - 2013. -№5. - С. 117-118.
- Изучение скорости мозгового кровотока при алкогольной интоксикации / А.А. Молчанов [и др.] // Фармация. - 2009. -№4. - С. 50-52.
- Использование гепаринов в хирургической практике / М.Н. Ивашев [и др.] // Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований.-2013.-№5.-С. 105.
- Клиническая фармакология антиаритмических лекарственных средств в обучении студентов / М.Н. Ивашев [и др.] // Международный журнал экспериментального образования. - 2013. - № 1. - С. 67-70.
- Клиническая фармакология биотрансформации лекарственных препаратов в образовательном процессе студентов / К.Х. Саркисян [и др.] // Международный журнал экспериментального образования. -2013. -№8. - С. 101-103.
- Клиническая фармакология глюкокортикоидов / А.В. Арлыт [и др.] // Современные наукоемкие технологии. - 2013. -№3. - С. 94-95.
- Клиническая фармакология карбапенемов / А.В. Сергиенко [и др.] //Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований.-2013.-№8-3.- С.138.
- Клиническая фармакология лекарственных средств, для терапии анемий в образовательном процессе / И.А. Савенко [и др.] // Международный журнал экспериментального образования. -2013. -№8. - С. 132-134.
- Клиническая фармакология лекарственных средств, применяемых в педиатрии в образовательном процессе студентов / А.М. Куянцева [и др.] // Международный журнал экспериментального образования. -2013. -№10-2. - С. 307-308.
- Клиническая фармакология препаратов, применяемых при грыже межпозвонковых дисков / А.В. Арлыт [и др.] // Современные наукоемкие технологии. - 2013. -№3. - С. 93-94.
- Клиническая фармакология препаратов, применяемых при неустановленном инсульте мозга / А.В. Арлыт [и др.] // Современные наукоемкие технологии. - 2013. -№3. - С. 101.
- Клиническая фармакология противосудорожных средств в образовательном процессе студентов / Т.А. Лысенко [и др.] // Международный журнал экспериментального образования. - 2012. - № 12-1. - С. 19-22.
- Моделирование патологических состояний кожи у крыс и мышей / Д.А. Бондаренко [и др.] // Цитокины и воспаление. -2010. - Т9. -№4. - С. 28 – 31.
- Результаты макроморфологического исследования состояния внутренних органов крыс при длительном применении масляного экстракта плодов пальмы сабаль / А.В. Савенко [и др.] // Международный журнал экспериментального образования. -2013. -№3. - С. 14.
- Совместное применение актовегина и кавинтона при инсульте / А.В. Арлыт [и др.] // Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований.-2013.-№7.-С.85-86.
- Сулейманов, С.Ш. Инструкции по применению лекарственных препаратов: закон новый, проблемы прежние / С.Ш. Сулейманов, Я.А. Шамина // Проблемы стандартизации в здравоохранении. - 2011. - №11-12. - С.13-16.
- Целенаправленный поиск и фармакологическая активность ГАМК- позитивных соединений / И.П. Кодоници, А.В. Арлыт, Э.Т. Отанесян, М.Н. Ивашев // Гос. образовательное учреждение высш. проф. образования «Пятигорская гос. фармацевтическая акад. Федерального агентства по здравоохранению и социальному развитию», Кафедры органической химии и фармакологии. Пятигорск, 2011.
- Экспериментальное исследование церебропротективной активности веществ синтетического и природного происхождения / А.В. Арлыт, М.Н. Ивашев, Г.В. Масликова // Научные ведомости Белгородского государственного университета. - 2012. - Т. 17. - № 4-1. С. 95-98.
- Экстракт жирного масла арахиса и его адаптивно-репаративная активность на модели ожога / Е.Е. Зацепина [и др.] // Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований. - 2012.-№12.- С. 99-100.
- Эффекты кавинтона на показатели церебральной гемодинамики / А.В. Арлыт [и др.] // Успехи современного естествознания. - 2013. -№3. - С. 121-122.