

см⁻¹, которые можно отнести к валентным колебаниям возмущенной водородной связью концевым ОН-группам ПМК. Полосы с максимумом 3300 см⁻¹ характеризуют валентные колебания ОН-групп бетулина, возмущенных образованием водородных связей.

Список литературы

1. M. Komorowska-Durka et al., *A concise review on microwave-assisted polycondensation reactions and curing of polycondensation polymers with focus on the effect of process conditions Chemical Engineering Journal* 264(2015).– 633–644.
2. Bakibaev A.A., Guba G.Ya. and at. *Polymerization of Lactic Acid Using Microwave and Conventional Heating. Procedia Chemistry*, 2015.– Vol.15.– P.97–102.

ВЛИЯНИЕ ПАВ НА СТАБИЛЬНОСТЬ ВОДНОЙ СУСПЕНЗИИ ГРАМИЦИДИНА S

А.А. Дранников^{1,2}

Научный руководитель – д.х.н. М.Е. Трусова¹

¹Национальный исследовательский Томский политехнический университет
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30

²АО «ПФК Обновление»
630071, Россия, г. Новосибирск, ул. Станционная 80, a.drannikov@pfk-obnovlenie.ru

Среди антибиотиков, применяемых для лечения заболеваний полости рта, особое место занимает грамицидин S, открытый в 1942 г. [1]. Данный полипептид обладает ярко выраженными бактерицидными свойствами в отношении грамм-положительных бактерий, в меньшей степени проявляет антимикробную активность в отношении грамм-отрицательных микроорганизмов и грибов [2, 3]. Антибиотик уникален также тем, что микроорганизмы не вырабатывают к нему устойчивость, что обусловлено его циклической структурой [3].

Однако, на фармацевтическом рынке практически отсутствуют препараты в жидкой лекарственной форме для местного применения на основе грамицидина S [4]. Возможной причиной данного явления служит низкая растворимость грамицидина S в воде, которая составляет 0,12 мг/л [5].

Целью работы была разработка состава для создания жидкой лекарственной формы гра-

мицидина S для местного применения в виде водной суспензии.

Таким образом, введение бетулина в реакционное пространство при полимеризации ОМК увеличивает выход полимера ПМК с 78% до 95–99% и препятствует образованию побочного продукта реакции – лактида.

Разработка жидкой лекарственной формы поможет увеличить биодоступность лекарственного средства, а также снизить раздражающие свойства лекарственного препарата [6].

В процессе разработки состава был получен ряд суспензий грамицидина S в воде с добавлением различных ПАВ (табл. 1). Методом оптической микроскопии было установлено распределение частиц по размеру. Стабильность полученных суспензий была определена визуально по наличию осадка. Концентрация грамицидина S в каждой суспензии составляла 10 мг/мл.

Таким образом, установлено, что наилучшими стабилизаторами водной суспензии грамицидина S в воде являются Na-карбоксиметилцеллюлоза и β-циклодекстрин, которые обеспечивают наибольшую дисперсность частиц полипептида.

Таким образом, введение бетулина в реакционное пространство при полимеризации ОМК увеличивает выход полимера ПМК с 78% до 95–99% и препятствует образованию побочного продукта реакции – лактида.

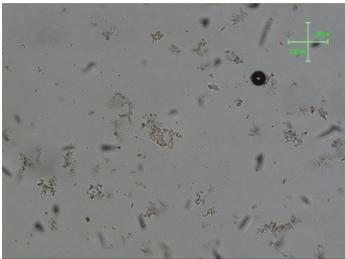
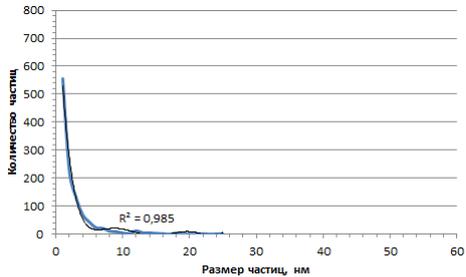
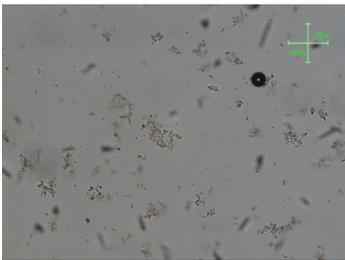
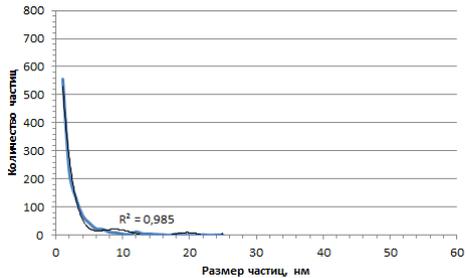
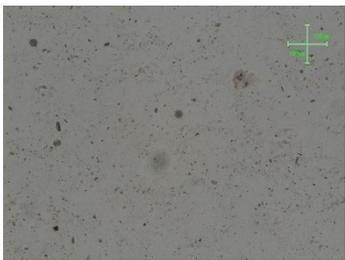
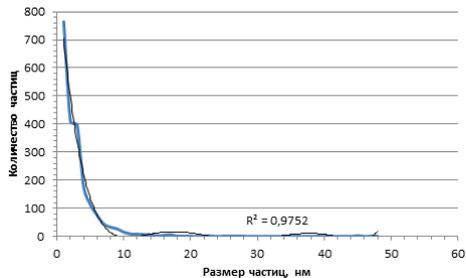
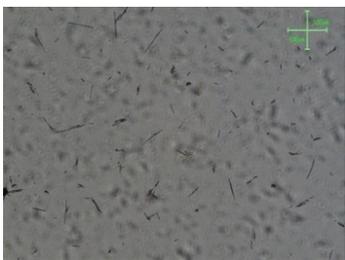
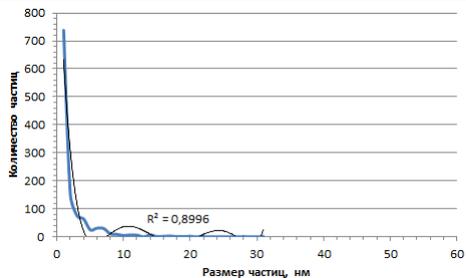
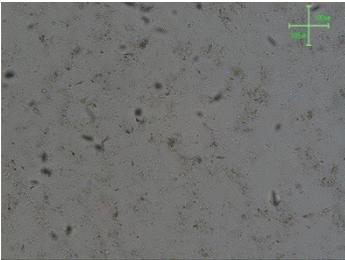
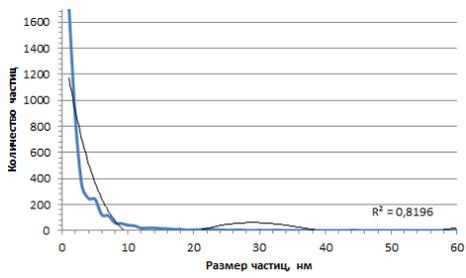
В процессе разработки состава был получен ряд суспензий грамицидина S в воде с добавлением различных ПАВ (табл. 1). Методом оптической микроскопии было установлено распределение частиц по размеру. Стабильность полученных суспензий была определена визуально по наличию осадка. Концентрация грамицидина S в каждой суспензии составляла 10 мг/мл.

Таким образом, установлено, что наилучшими стабилизаторами водной суспензии грамицидина S в воде являются Na-карбоксиметилцеллюлоза и β-циклодекстрин, которые обеспечивают наибольшую дисперсность частиц полипептида.

Таким образом, введение бетулина в реакционное пространство при полимеризации ОМК увеличивает выход полимера ПМК с 78% до 95–99% и препятствует образованию побочного продукта реакции – лактида.

Таким образом, введение бетулина в реакционное пространство при полимеризации ОМК увеличивает выход полимера ПМК с 78% до 95–99% и препятствует образованию побочного продукта реакции – лактида.

Таблица 1. Результат анализа полученных суспензий

ПАВ	Микрофотография суспензии (приближение 10×)	Распределение частиц по размеру (нм)	Стабильность, ч
–			24
Полиэтил-ленгликоль-400 (1%)			24
Поливинилпирролидон (1%)			72
На-карбок-си-метил-целлюлоза (1%)			144
β-цикло-декстрин (1%)			300

Список литературы

1. Гаузе Г.Ф., Бражникова М.Г. // Журн. микробиологии, эпидемиологии и иммунологии, 1943.– №4–5.– С.74–77.
2. T. Abraham, et al. // Biochim. Biophys. Acta., 2013.– Vol.1838.– №5.– P.1420–1429.
3. J. Swierstra et. al. // Eur. J. Clin. Microbiol. Infect. Dis., 2016.– Vol.35.– №5.– P.763–769.
4. Государственный реестр лекарственных средств
5. Юдина Т. П. Дисс. Физиолого-биохимические особенности продуцентов грамицидина *S Bacillus brevis subsp. G.-B.* и их вариантов.

канд. хим. наук.– Москва: МГУ, 2002.– 172с.
 б. Гаврилов А.С. Фармацевтическая техноло-

гия. Изготовление лекарственных препара-
 тов.– М.: ГЭОТАР-Медиа, 2010.– 624с.

РАЗРАБОТКА И ИЗУЧЕНИЕ АМИДНЫХ ИЗОСТЕРОВ ГЛИЦЕРОЛИПИДНЫХ ПРОИЗВОДНЫХ НУКЛЕОЗИДНЫХ ИНГИБИТОРОВ ОБРАТНОЙ ТРАНСКРИПТАЗЫ ВИЧ

М.Н. Жданова, Н.С. Шастина

Научный руководитель – к.х.н., доцент Н.С. Шастина

Московский технологический университет

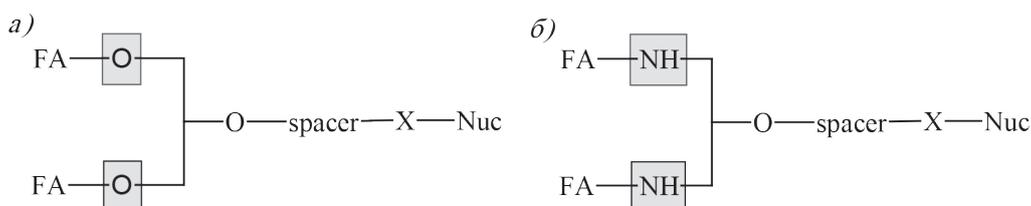
Институт тонких химических технологий имени М.В. Ломоносов
 119571, Россия, г. Москва, пр. Вернадского 86, zhdanova.m94@bk.ru

Биодоступность лекарственных средств к месту действия всегда являлась важной проблемой в области медицины, но в последние годы в связи с развитием такого вирусного заболевания как ВИЧ-инфекция, проблема стала еще более актуальной. Поэтому особое внимание уделяется разработке новых и модификации уже имеющихся анти-ВИЧ-препаратов, которые могут оказаться эффективнее своих предшественников [1].

Одним из путей решения задачи повышения биодоступности нуклеозидных ингибиторов обратной транскриптазы (НИОТ) ВИЧ является создание их пролекарственных соединений на основе веществ липидной природы: жирных кислот, диглицеридов, холестерина и фосфолипидов. Такие соединения сами по себе являются

фармакологически неактивными, в организме же они подвергаются ферментативному гидролизу, приводящему к высвобождению фармакологически активного соединения, противовирусного нуклеозида [2].

Ранее в нашей лаборатории был синтезирован ряд липофильных конъюгатов анти-ВИЧ-нуклеозидов (AZT и d4T), которые получали путем их конъюгирования с производными 1,3-диацилглицерина. Некоторые из них показали высокую противовирусную активность в условиях *in vitro*. Задачей представленной работы является синтез подобных пролекарственных соединений на основе изостерных амидных аналогов 1,3-диацилглицерина с целью повышения их химической и метаболической устойчивости, улучшения фармакологических свойств, так как



FA = остатки жирных кислот

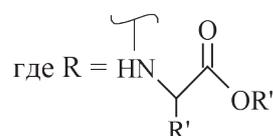
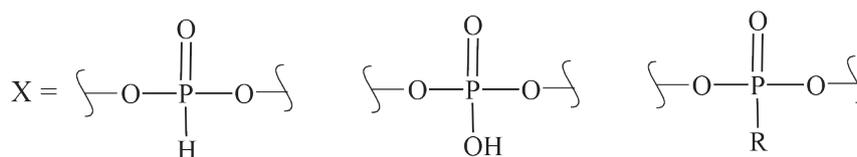


Рис. 1. Структуры пролекарственных соединений на основе 1,3-диацилдиглицерина (а) и 1,3-диаминопропан-2-ола (б)