



**Инна
БАРАНОВА,**
доктор
фармацевтических
наук, профессор,
зав. кафедрой
товароведения
Национального
фармацевтического
университета
(Украина)



**Светлана
КОВАЛЕНКО,**
доктор
фармацевтических
наук, профессор
Национального
фармацевтического
университета
(Украина)



**Анастасия
ГОНЧАРОВА,**
кандидат
фармацевтических
наук, Национальный
фармацевтический
университет
(Украина)

ДИАБЕТИЧЕСКАЯ СТОПА: ПРОФИЛАКТИКА И ЛЕЧЕНИЕ

Часть 2. Современные тенденции создания лекарственных и парафармацевтических средств местной терапии

Научные работы по разработке высокоэффективных средств местного действия проводятся с конца прошлого столетия. Доказано, что природа основы влияет на лекарственные активные субстанции, причем возможно как усиление, так и ослабление фармакологического действия. Сама основа мягкой лекарственной формы должна обеспечивать терапевтические свойства лекарственного средства, особенно в случае фармакотерапии диабетических язв

ПОИСК ОПТИМАЛЬНОЙ ОСНОВЫ ЛЕКАРСТВЕННОЙ ФОРМЫ

Как отмечалось в первой части данной статьи («Les Nouvelles Esthetiques Украина», № 6 (94) / 2015, стр. 64–68. – **Прим. ред.**), кожа больных сахарным диабетом характеризуется рядом особенностей: она чувствительная, сухая, тонкая и т. д.

С учетом особенностей такого состояния больных с диабетическими язвами оптимальная основа лекарственной формы местного действия должна отвечать определенным параметрам, а именно легко «отдавать» действующее вещество, быстро всасываться кожей (что позволяет использовать более низкую концентрацию активного компонента), увеличивать уровень эластичности и увлажненности кожи, содействовать газообмену кожи, а кроме того, проявлять удовлетворительные потребительские свойства, легко наноситься на обширные участки, быть рентабельной в производстве, по возможности легко смываться и не оставлять следов на коже и одежде.

Мази на гидрофобных основах будут способствовать восстановлению эластичности и смягчению при нанесении на кожу стоп с диабетическими язвами, но из-за значительных окклюзионных свойств будут нарушать газообмен кожи. Также возникнут определенные трудности с вводом гидрофильных действующих веществ в жировую основу, которая к тому же может оставлять следы на одежде, ухудшать ее потребительские характеристики.

Эмульсионные основы позволяют вводить в состав препарата как гидрофильные, так и липофильные активные вещества, однако необходимо осторожно выбирать элюенты и комплекс эмульгаторов, которые являются потенциальными аллергенами. Наружные лекарственные средства на эмульсионных основах менее выгодны экономически, менее рентабельны в производстве по сравнению с гелевыми.

На наш взгляд, кроме применения эмульсионных кремов, перспективной мягкой формой являются гели. Они также удовлетворяют требования, предъявляемые к наружному лекар-

ственному средству для лечения диабетических язв; хорошо поглощаются кожей, смягчают и увлажняют ее, а также оказывают легкое охлаждающее действие. В гель можно ввести гидрофильные лекарственные вещества, можно изготовить суспензионные гели (например, гель с серой), а также с помощью солюбилизатора можно вводить некоторые гидрофобные компоненты, например эфирное масло, ПЭГ-40 гидрогенизированное касторовое масло.

То есть среди преимуществ гелей можно выделить следующие: пролонгированное действие действующих веществ, простота технологии, удобство в применении. Кроме того, водные внутренние структуры геля позволяют вводить в его состав химически несовместимые вещества. Также они обладают способностью задерживаться (как твердое тело) на участках тела, требующих лечения, эффективны при аппликациях. Реологические исследования показали, что гидрогели сохраняют свою консистенцию при температуре кожи человека, обеспечивают пролонгированный эффект, более равномерно высвобождают активные вещества, имеют удовлетворительные потребительские свойства.

Отечественный рынок парафармацевтических средств зарубежного производства предлагает несколько гелей для профилактики и лечения синдрома диабетической стопы (СДС) и диабетических язв.

Разновидности гелей по уходу за диабетической стопой

Гель для стоп увлажняющий и отшелушивающий Virta (Российская Федерация) способствует размягчению рогового слоя эпидермиса и его эффективному удалению. Этот гель предназначен для ухода за сухой и растрескавшейся кожей стоп, особенно полезен больным с СДС. Активные компоненты геля: мочевины, D-пантенол, молочная кислота, камфора, витамин E, экстракты чабреца, ромашки и солодки.

Гель для ухода за стопами «Смут-гель» от компании Bliss Style (Индия) быстро и эффективно заживляет кожу, устраняет трещины на пятках, ухаживает за огрубевшей сухой кожей, обладает противогрибковым и антибактериальным действием. Средство избавляет от зуда и трещин, препятствует развитию грибковых заболеваний стоп и ногтей, смягчает, увлажняет и разглаживает уставшую кожу ног, снимает воспаление.

Гель «Диабета» (фирмы «АС-Ком», Россия) – ранозаживляющее средство, в состав которого входит гиалуроновая кислота и D-пантенол. Хорошо зарекомендовало себя при лечении трофических язв, которые долго не заживают у больных СД. Дает хороший обезболивающий эффект и уменьшает отечность тканей.

В состав ранозаживляющего геля «Апполо» (компания «Аполло ТД», Россия) входит мирамистин (антисептик) и анилокаин (анестетик). Гель предназначен для лечения ран различного происхождения, в том числе порезов, пролежней, язв, включая СДС.

ТЕРАПЕВТИЧЕСКИЙ УСПЕХ ПРЕПАРАТОВ ТИОКТОВОЙ (ЛИПОВОЙ) КИСЛОТЫ

Российскими учеными в 2006 году была изучена противовоспалительная активность липоевой (тиоктовой) кислоты и создана лекарственная форма в виде геля для лечения артритов и артрозов, который проявляет противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие.

С момента первого сообщения в 1955 году о терапевтическом применении тиоктовой кислоты (Токио) прошло более полувека. Мировой и отечественный опыт использования препаратов тиоктовой кислоты в ведущих клиниках позволил сделать вывод об их высокой эффективности при лечении ряда распространенных заболеваний в эндокринологии, урологии, токсикологии, сексопатологии, гастроэнтерологии, хирургии, гематологии и т. д. Многочисленные клинические исследования доказали их высокую эффек-

тивность при лечении диабетических поражений нервной системы: диабетической дистальной полинейропатии, энцефалопатии, СДС, диабетической автономной нейропатии сердца и желудочно-кишечного тракта, а также эректильной дисфункции.

Терапевтический успех препаратов тиоктовой кислоты при диабетических поражениях нервной системы обусловлен, прежде всего, патогенетической направленностью их действия и способностью активно накапливаться в периферической нервной ткани. Кроме метаболической нейропатии, выраженный эффект тиоктовой кислоты отмечен при различных токсических (алкогольной, экзогенной, эндогенной) и травматических полинейропатиях, а также при некоторых других заболеваниях.

В основе нейропротекторного действия лежит тот факт, что тиоктовая кислота способствует нормализации нарушенного обмена в нервных клетках и положительно влияет на аксональный транспорт.

В медицинской практике с лечебной целью используется ряд препаратов тиоктовой кислоты, которые представлены ее тремя основными солями: этилендиаминовой (препараты «Берлитион» («Берлин-Хеми», Германия) и «Эспа-липон» (Espharma, Германия), трометамоловой (препарат «Тиоктацид» («Виатрис ГмБХ», Германия) и мелгиуминовой (препараты «Диалипон» («Фармак», Украина) и «Тиогамма» (Werwag Pharma, Германия).

Препарат «Тиоктацид» является эндогенным антиоксидантом, который связывает свободные радикалы, выполняет роль коэнзима митохондриальных многоферментных комплексов. Способствует регулированию обмена веществ в организме, в частности углеводного и липидного. Оказывает гепатопротекторное действие, способствует утилизации глюкозы тканями, устраняя инсулинорезистентность.

Наиболее известные препараты тиоктовой кислоты: «Тиогамма», «Диа-

липон», «Берлитион», «Тиоктацид» – используют с профилактической и лечебной целью в комплексной терапии диабетических полинейропатий, заболеваний печени (гепатиты, цирроз), при хронических интоксикациях.

На основании вышесказанного можно сделать вывод о том, что существующие монопрепараты с тиоктовой кислотой в основном направлены на профилактику и лечение тяжелого диабетического поражения – диабетической полинейропатии.

Таким образом, особенности и фармакологические свойства тиоктовой кислоты вызывают повышенный интерес для дальнейшего изучения и создания на ее основе новых комбинированных препаратов для лечения диабетических осложнений.

Основными обоснованиями для широкого использования тиоктовой кислоты являются:

- способность снижать перекисное окисление липидов (ПОЛ) (связывать свободные радикалы и свободное тканевое железо);
- участие в окислении жирных кислот и ацетата (предупреждает развитие жирового стеатоза печени);
- участие в декарбоксилировании α -кетокислот (энергообеспечение клетки и профилактика развития кетоацидоза);
- повышение трансмембранного транспорта глюкозы в клетку (накопление гликогена и увеличение энергетического баланса гепатоцитов);
- угнетение синтеза оксида азота гепатоцитами (профилактика и купирование расстройств реологических и сосудистых нарушений).

Анализ парафармацевтических средств местного действия на основе тиоктовой кислоты

Известно, что тиоктовая кислота – это мощный универсальный антиоксидант, который часто используется в косметологии. Как в водной, так и в липидной среде тиоктовая кислота активна в отношении широкого спектра свободных радикалов, которые повреждают

клетки кожи, приводят к появлению морщин и старению кожи, увеличивает эффективность косметических средств. Чаще всего в косметологии с тиоктовой кислотой сочетают омолаживающие кремы и сыворотки для лица и тела, маски и кремы для лечения проблемной кожи с расширенными порами и акне, ежедневные увлажняющие, антиоксидантные кремы для всех типов кожи, кремы для век, устраняющие круги, «синяки» и припухлости под глазами.

Компания Dermaxime (США) выпускает следующие препараты с тиоктовой кислотой в составе: омолаживающую сыворотку Rejuvenating Skin Serum (состав: тиоктовая кислота, гиалуроновая кислота, витамины А и Е, экстракты конского каштана, зеленого чая, центеллы, масла жожоба и клюквы) и омолаживающую маску Rejuvenating Face Mask (состав: каолин, экстракты центеллы, каштана конского и зеленого чая, гиалуроновая кислота, тиоктовая кислота, витамины А и Е, масла жожоба и клюквы, ксантан).

Компания Allura Esthetics (США) предлагает питательный крем с тиоктовой кислотой, витаминами Е и С, различными маслами растений (черники, клена, малины, клюквы) для ухода за кожей рук и ногтями, а также питательный антивозрастной крем с тиоктовой кислотой и коэнзимом, которые способствуют восстановлению и омоложению стареющей, атоничной кожи.

Компания Aubrey Organics (США) производит ночной крем Rosa Mosqueta и крем для век Lumessence Rejuvenating Eye Crème с тиоктовой кислотой. «Фаберлик» (Российская Федерация) выпускает серию кремов с тиоктовой кислотой Rala («Энергия молодости»): Rala Multactive – дневной и ночной кремы, крем для глаз и лица и т. д. Известная фирма Mary Kay (США) предлагает линию антивозрастных кремов для лица, век, шеи.

Компания Aubrey Organics (США) производит ночной крем «Чилийская роза» с тиоктовой кислотой для сухой и комбинированной кожи. Крем для лица с тиоктовой кислотой и витамином С,

способствующий омоложению и восстановлению стареющей кожи лица, выпускает фирма Derma E (США). Российская компания Firmimks производит антивозрастной дневной крем с экстрактом плаценты, тиоктовой кислотой и витаминами А и Е, который предотвращает процессы старения и способствует омоложению кожи лица и шеи.

Компания Skin Rebirth (Испания) производит Re-Nutriv ACE Lipoic Complex – интенсивный омолаживающий антиоксидантный ночной крем с тиоктовой кислотой и витаминами А, Е, С.

Итак, как видно из приведенных данных, антиоксидантные свойства тиоктовой кислоты широко используются в производстве косметических средств для ухода за лицом, веками, шеей, руками.

Установлено, что тиоктовая кислота, кроме антиоксидантных, проявляет также защитные и противовоспалительные свойства. При этом чувствительная кожа переносит тиоктовую кислоту намного лучше, чем витамины С и А и гликолевую кислоту, даже в высоких дозах. Это вещество способствует усилению метаболизма в клетках, защищает клеточную мембрану, помогает бороться с воспалениями кожи и сопутствующими им рубцами и шрамами. Именно эти свойства тиоктовой кислоты делают ее привлекательной для создания на ее основе парафармацевтических средств для ухода за чувствительной кожей больных с СДС (истончение, сухость, чувствительность кожи, трещины).

На кафедре товароведения Национального фармацевтического университета также ведутся научные исследования по разработке лекарственных и косметических средств на основе тиоктовой кислоты. На данный момент проведены доклинические исследования геля «Тиолан» и крема «Дермалипоин». Авторы данной статьи искренне надеются, что разработанные отечественные средства займут достойное место на полках аптек и специализированных магазинов и станут достойными конкурентами импортным аналогам. ■