

ФАРМАКОКЕНЕТИКА

Компания «СТЕКО ЛТД» на базе исследований ученых разработала комплексный препарат «Йодомидол», имеющий уникальную формулу, основой которой является: органический йод, водорастворимые высокомолекулярные соединения, не имеющие аналогов в мире, природные моно= олиго=полисахариды и микроэлементы железо, медь, марганец, цинк, кобальт.

Формула препарата «Йодомидол» построена на основе уникального вещества - жидкого кристалла.

Жидкие кристаллы сочетают в себе противоположные свойства, характерные для живой материи во всех её проявлениях:

- обладают кристаллической решеткой, характерной для твердого тела и текучестью, являющейся свойством жидкости;
- молекулы жидких кристаллов способны к самоорганизации и образованию упорядоченных структур;
- они весьма чувствительны к внешним воздействиям и легко образуют системы типа «хозяева и гости».

«Йодомидол» комплексный препарат йода и лития на матрице α -декстрина создан с целью сочетания неспецифического антимикробного и противовирусного действия молекулярного и ионизированного йода с системным иммуномодулирующим свойством отрицательно заряженных полисахаридов.

В основе физико-химической модели препарата, лежат такие свойства жидких кристаллов, которые характерны для комплексов включения α -декстрина с молекулами и ионами йода и лития (системы типа «хозяева и гости»). Комплекс представляет собой упорядоченное целостное и равновесное состояние входящих в его состав биологически активных компонентов, обладает свойствами самоорганизации, пролонгированного отщепления молекул йода и лития из комплексного полимера, а также текучестью коллоидных систем. В комплексе включения с молекулами и ионами йода и лития цепи α -декстрина образуют двойную антипараллельную v -спираль с типом укладки подобно цифре 8. Внутри полости размером $\sim 5 \text{ \AA}$ укладывается полийодная цепочка с дискретной последовательностью $(I_2I_3)_n$ (n -число повторов), среднее расстояние между которыми составляет $\sim 2,9 \text{ \AA}$ и стабилизируется Li^+ .

Жидкокристаллическая природа комплекса обеспечивает сочетание в одном препарате противовирусного и антибактериального (молекулы и ионы йода), иммуномодулирующего и противовоспалительного (отрицательно заряженный полисахарид - декстрин) и нейропротекторного (катионы лития) действия.

Однако, низкая токсичность, высокая переносимость, биодоступность и совместимость с организмом не могут быть обеспечены только жидкокристаллической природой комплекса, важное значение при этом отводится коллоидному составу комплекса. «Йодомидол» представляет собой коллоидный раствор полимеров, где вода является растворителем, а полисахариды, синтетические поливинил-полимеры и их

комплексы являются коллоидными компонентами, а йод и литий являются растворимыми веществами.

Для исключения возможности развития феномена резистентности микроорганизмов и толерантности макроорганизма к препарату «Йодомидол» был выбран йод - вещество, которое испокон веков известно как мощный антимикробный агент, обладающий широким спектром бактерицидного, вирулицидного, фунгицидного и цистицидного действия.

Современная биохимия доказала, что йод способен взаимодействовать со всеми классами биологических макромолекул, включая белки, липиды, полисахариды и нуклеиновые кислоты с образованием йодопроизводных биомолекул, свойства которых варьируются в широких пределах. Высокая скорость кинетической реакции йодирования приводит к расщеплению белков и нуклеиновых кислот, разобщению мембранных липидов, нарушению нативной структуры ферментов, структурных белков вирусного капсида и полисахаридов стенок бактерий и грибов. Следовательно, вероятность возникновения и фиксации в популяции микробов таких мутаций, которые бы способствовали развитию устойчивого фенотипа всех классов биомолекул одновременно, ничтожно, а практически невозможно.

Учитывая токсичность йода (летальная концентрация составляет 1-1,5 г) и его высокую реактогенность с клетками и белками организма, была принята идея о том, что в конечном препарате следует увеличить не концентрацию суммарного йода, а создать условия для полной реализации основных свойств оптимальных, нетоксичных его концентраций. Единственный верный путь-это увеличение множественности форм молекул и ионов йода при низкой избыточности его концентрации путем конструирования комплексов типа «хозяева и гости», где в качестве «гостей» может быть все известное разнообразие молекул, катионов и анионов йода в уравновешенном, динамическом равновесии. Действительно йод в препарате существует в состоянии динамического равновесия между различными формами анионов и катионов: йод(I₂), гипойодовая кислота(HIO), катион йода([H₂OI]⁺), трийодид анион(I₃⁻), йодид анион (I⁻), гипойодат анион(IO⁻), йодат анион (IO₃⁻).

Это, в конечном итоге, и способствует пролонгированному отщеплению молекул и ионов йода из комплексного полимера, способствуя реализации антибактериальной, антивирусной активности, исключающей возникновения резистентных форм возбудителей и низкой токсичности препарата.

Исследования показали, что универсальная неспецифическая антимикробная активность препарата «Йодомидол» проявляется на ДНК и РНК-содержащих вирусах человека и животных, антибиотикоустойчивых и антибиотикочувствительных патогенных бактериях, грибах, простейших и их цистах как при пероральном, так и при внутри - мышечном и внутривенном введении препарата.

«Йодомидол» обладает явно выраженным селективным антибактериальным действием против патогенных или условно-патогенных бактерий и грибов, в то время как непатогенные бактерии нормальной микрофлоры оказались устойчивыми к нему. Изучение механизмов антимикробного действия препарата «Йодомидол» показало, что препарат в организме усиливает внутриклеточную гибель бактерий путем стимуляции высвобождения целого ряда эндогенных антимикробных субстанций,

включая интермедиаты активной формы кислорода, оксида азота и так называемых галидов.

Механизм такого действия заключается в том, что йод в составе препарата «Йодомидол» способствует замещению физиологического галогена – хлорид - аниона на более активный йодид-анион, который вступает в реакцию с перекисью водорода и специальными ферментами с образованием обладающей высокой биологической активностью гипойодовой кислоты в клетках естественной иммунной системы. Одновременно достигается «гашение» короткоживущих свободных радикалов в местах с пониженным рН(очаги воспаления) путем образования вторичных, долгоживущих йодированных продуктов аминокислот, например, йодтаурина, обладающего мощным антимикробным и противовоспалительным свойством.

Таким образом, препарат «Йодомидол» действует как антиоксидант в очаге инфекции и воспаления, обладает выраженной способностью стимулировать индукцию гуморального иммунного ответа лимфоцитов человека к антигенам патогенных бактерий.

Важным этапом процесса совершенствования препарата стала разработка технологии присоединения к комплексу (йод-литий— α -декстрин) анионов и катионов металлов, за счет изменения изоэлектрической точки белковых соединений, что позволило расширить множественность его терапевтического действия.

«Йодомидол» обладает ярко выраженным иммуномодулирующим, иммунокорректирующим, антимикробным и антисептическим действием. При его потреблении внутрь количество защитных аутогенных клеток увеличивается в 20 раз! Даже при однократном употреблении этого препарата приобретается стойкий противовирусный («пассивный») иммунитет, который проявляется уже через несколько часов и длится 2-4 недели. Этого вполне достаточно, чтобы избежать многих инфекционных заболеваний в период эпидемий гриппа и других недугов.

Обладая абсорбирующим, детоксикационным, обволакивающим, связывающим, ранозаживляющим, противоаллергическим, фитозащитным и другими лечебно-профилактическими свойствами, препарат «Йодомидол» эффективен при внутреннем и наружном применении (в зависимости от решаемой проблемы).