

Облікова картка ДіР



I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0224U033461

Державний реєстраційний номер: 0123U100824

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 27-12-2024

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 2

Назва етапу: 2. Визначення хімічних та фізико-хімічних властивостей субстанції пропоксазепаму, необхідних для інтерпретації фармацевтичної взаємодії.

Початок етапу: 01.2024

Закінчення етапу: 12.2024

Вид звітнього документа: Остаточний звіт

III. Відомості про виконавця ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Фізико-хімічний інститут ім. О. В. Богатського Національної академії наук України

Код за ЄДРПОУ: 03534535

Місцезнаходження: Люстдорфська дорога, буд. 86, м. Одеса, Одеська обл., 65080, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Національна академія наук України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380487662044

IV. Відомості про співвиконавців ДіР

V. Відомості про замовника ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Національна академія наук України

Код за ЄДРПОУ: 00019270

Місцезнаходження: вул. Володимирська, буд. 54, м. Київ, 01601, Україна

Форма власності:

Сфера управління:

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380442343243

VI. Джерела, напрями та обсяги фінансування ДіР

Підстава для проведення ДіР: 34 - договір (замовлення) з центральним органом виконавчої влади, академією наук (головними розпорядниками бюджетних коштів на проведення НДДКР)

Напрямок фінансування: 2.2 - прикладні дослідження і розробки

Джерела фінансування

7713 - кошти держбюджету

Код програмної класифікації видатків і кредитування (КПКВК): 6541230

Фактичний обсяг фінансування (тис. грн.): 5231.000

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Визначення безпечності новаторського анальгетичного засобу пропоксазепаму при його хімічній та біологічній взаємодії з іншими препаратами в умовах політерапії

Назва роботи англійською:

Determining the safety of the innovative analgesic propoxazepam in its chemical and biological interactions with other drugs in polytherapy

Реферат українською:

У проведених дослідженнях вивчено взаємодію пропоксазепаму на фармацевтичному, фармакокінетичному та фармакологічному рівнях. Встановлено відсутність значних фармацевтичних взаємодій на етапі всмоктування. Пропоксазепам добре переноситься при одноразовому прийомі (5 мг), має швидку абсорбцію та повільне виведення. Окислені метаболіти та їх глюкуроніди виводяться із сечею в загальній кількості до 10,5% введеної дози, що вказує на високий рівень метаболізму. За результатами досліджень інгібування різних ізоформ цитохрому СYP 450 пропоксазепам може спричинити клінічно значущу взаємодію з субстратами CYP1A2, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19 та CYP2D6, проте після одноразового прийому препарату концентрації, що можуть викликати гальмування активності досліджуваних ензимів, не досягаються. Показана можливість корегування фармакологічних ефектів пропоксазепаму флумазенілом. Загалом, пропоксазепам не викликає значних фармакокінетичних та фармацевтичних взаємодій при одноразовому прийомі, хоча для оцінки потенціалу інгібування ферментів CYP та впливу на фармакологічні ефекти при курсовому застосуванні потрібні подальші дослідження.

Реферат англійською:

The conducted studies studied the interaction of propoxazepam at the pharmaceutical, pharmacokinetic and pharmacological levels. The absence of significant pharmaceutical interactions at the absorption stage was established. Propoxazepam is well tolerated after a single dose (5 mg), has rapid absorption and slow excretion. Oxidized metabolites and their glucuronides are excreted in the urine in a total amount of up to 10.5% of the administered dose, which indicates a high level of metabolism. According to the results of studies of inhibition of various isoforms of cytochrome CYP 450, propoxazepam can cause clinically significant interaction with substrates of CYP1A2, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19 and CYP2D6, however, after a single dose of the drug, concentrations that can cause inhibition of the activity of the studied enzymes are not reached. The possibility of adjusting the pharmacological effects of propoxazepam with flumazenil has been shown. In general, propoxazepam does not cause significant pharmacokinetic and pharmaceutical interactions with a single dose, although further studies are needed to assess the potential for inhibition of CYP enzymes and the impact on pharmacological effects with chronic use.

Індекс УДК: 615.03; 615.1/.3, УДК 615.(014+015).26

Коди тематичних рубрик: 76.31

Керівники роботи

Власне Прізвище Ім'я По-батькові: Головенко Микола Якович

Науковий ступінь: д. б. н.

Вчене звання: професор, академік

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

VIII. Наукова (науково-технічна) продукція (НТП)

Назва НТП українською: Науковий звіт; публікація результатів роботи, як розділів у двох колективних монографіях.

Назва НТП англійською: Scientific report; publication of the results of the work as chapters in two collective monographs.

НТП, яку передбачалося створити:

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати: Методи, теорії

Галузь застосування: Фармацевтична галузь

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: Проведені дослідження можливості взаємодії пропоксазепаму на фармацевтичному, фармакокінетичному та фармакологічному рівнях. Спрогнозовано відсутність взаємодії на етапі всмоктування сполуки з шлунково-кишкового тракту, потенціал інгібування ізоформ CYP1A2, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19 та CYP2D6 при одночасному введенні з субстратами. Показана можливість корегування фармакологічних ефектів пропоксазепаму флумазенілом. На основі проведеного аналізу структури пропоксазепаму та його фізико-хімічних властивостей, зокрема ліпофільності, розчинності та констант іонізації, можна зробити висновок про відсутність фармацевтичних взаємодій, таких як утворення іонізованих сполук чи солеутворення. Крім того, враховуючи механізм всмоктування сполуки через пасивну дифузію, можна припустити, що ймовірність взаємодій на етапі всмоктування є мінімальною. За результатами досліджень інгібування різних ізоформ цитохрому CYP 450 пропоксазепам може спричинити клінічно значущу взаємодію з субстратами CYP1A2, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19 та CYP2D6, втім, після одноразового прийому препарату концентрації, що можуть викликати гальмування активності досліджуваних ензимів, не досягаються. Результати можуть бути використані при плануванні подальших клінічних досліджень пропоксазепаму та формуванні інструкції для пацієнта.

Соціально-економічна спрямованість НТП: Створення принципово нової продукції (матеріалів, технологій тощо) для забезпечення експортного потенціалу та заміщенню імпорту, Поліпшення якості життя та здоров'я населення, ефективності діагностики та лікування хворих

Вплив НТП на довкілля:

Впровадження НТП: Не впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: 01.2024

Закінчення етапу: 12.2024

Споживачі продукції: Фармацевтична галузь

Перспективні ринки: Фармацевтичний ринок України

Характер співробітництва з інвестором

Потрібний обсяг інвестицій, тис. грн.:

Права, що надаються інвестору після завершення роботи:

Наявність бізнес-плану:

Техніко-економічне обґрунтування:

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.:

Очікуваний термін окупності (років):

Додаткова інформація:

ІХ. Бібліографічний опис

Головенко М.Я., Ларіонов В.Б., Воліводзь І. П. Корекція флумазенілом фармакологічної дії похідних бензодіазепіну діазепаму та пропоксазепаму. *Medicine and psychology: modern problems, new technologies and ways of developing outdated theories: collective monograph* / Mezhiievska I., Maslovskiy V., Pavlov S. – etc. – International Science Group. – Boston : Primedia eLaunch, 2024. 386 p. Available at : DOI – 10.46299/ISG.2024.MONO.MED.1

Головенко М.Я., Ларіонов В.Б., Валіводзь І.П. Біофармацевтична класифікаційна система – наукова основа створення ефективних та безпечних лікарських засобів. *Sustainable healthcare development: national and global dimensions: scientific monograph* / edited by Valerii Zaporozhan and Valeriia Marichereda. Riga, Latvia :Baltija Publishing, 2024 p. 464 ISBN 978-9934-26-466-5 С.192-211.

Головенко М. Я., Кузьмін В. Є., Артеменко А. Г., Ларіонов В. Б., Огніченко Л. М., Кічова М. Є., Валіводзь І. П. Визначення фармакокінетичної лікарської взаємодії пропоксазепаму за допомогою моделі in silico. *Фармакологія та лікарська токсикологія*. – 2024. – 18(2). – С.107-114. <https://doi.org/10.33250/18.02.107>

Akischeva A. S., Larionov V. B., Golovenko M. Y., Makarenko O. A., Valivodz I. P., Borysiuk I. Y., Molodan Y. O. In silico exploration of antinociceptive activity of 1,4-benzodiazepines: Molecular docking on $\alpha 1$ A-adrenoceptor, and phosphodiesterase 4. *Regul. Mech. Biosyst.* 2024, 15(2), P.P.277-288. doi: 10.55262/fabadeczacilik.1230771.

V. B. Larionov, M. Ya. Golovenko, A. S. Akischeva, I. P. Valivodz, I. Yu. Borysiuk, Yu. O. Molodan, O. A. Makarenko. Molecular insights into propoxazepam interaction with trpv1 receptors: a docking analysis. *Вісн. Одеського нац.ун-ту. Серія Біологія*. – 2023. – Т. 28, вип. 2(53). – С. 99-112. [https://doi.org/10.18524/2077-1746.2023.2\(53\).293324](https://doi.org/10.18524/2077-1746.2023.2(53).293324).

Х. Заключні відомості

Керівник юридичної особи

Кузьмін Віктор Євгенович

Д. Х. Н.

Перелік осіб-виконавців

Артеменко Анатолій Григорович

(к. х. н., 02.00.03)

Буренкова Наталія Олександрівна

(молодший науковий співробітник)

Валіводзь Ірина Петрівна

(к. б. н., молодший науковий співробітник)

Головенко Микола Якович

(д. б. н.)

Кічова Марія Євгенівна

Ларіонов Віталій Борисович

(д. б. н., 14.03.05)

Огніченко Людмила Миколаївна

(к. х. н.)

Хромов Олександр Іванович

Цапенко Жанна Миколаївна

(к. б. н., молодший науковий співробітник)

Відповідальний за підготовку

Іллюшко Н. О.

облікових документів

Телефон

+38 (067) 724-39-55

Реєстратор

**Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є
відповідальним за реєстрацію наукової
діяльності**

