

Скованные одной цепью

Фармакология пептидных препаратов, благодаря достижениям в структурной биологии и аналитических технологиях, в начале XXI века получила мощный толчок в развитии. И сегодня мы можем наблюдать появление новых средств этой группы в наших аптеках.

АМИНОКИСЛОТЫ В РЯД

Терапевтические пептиды – уникальный класс препаратов, состоящих из упорядоченных аминокислотных цепочек, обычно с молекулярной массой от 500 до 5000 Да. Если первые его представители (*инсулин, окситоцин*) были аналогами гормонов или простыми последовательностями аминокислот, то современные формулы имеют сложную структуру, например¹:

- * противовирусный препарат *энфувиртид*, предназначенный для лечения ВИЧ-инфекции, представляет собой цепочку 36 аминокислот, имитирующих белки вируса иммунодефицита
- * сахароснижающее ЛС *лираглутид* (ТН Виктоза®, Саксенда®) – синтезированный аналог человеческого глюкагоноподобного пептида-1 (ГПП-1), полученный путем присоединения производного пальмитиновой кислоты к остатку лизина и действующий как агонист ГПП-1
- * метаболит *тедуглутид* (ТН Гэттивест®) – аналог ГПП-2, который получают с использованием штамма *Escherichia coli*, модифицированного с помощью технологии рекомбинантной ДНК. Препарат применяют для лечения синдрома короткой кишки.

Благодаря современным технологиям пептидные препараты, даже самые сложные, могут быть быстро синтезированы и легко модифицированы. И это – далеко не единственное их преимущество по сравнению с белками или антителами.

СИЛЬНОЕ ЗВЕНО

Среди плюсов терапевтических пептидов – их небольшой размер и высокая способность проникать через клеточные мембраны. Они также обладают высокой аффинностью и специфичностью, что обеспечивает оптимальный лечебный эффект и низкую способность вступать в лекарственные взаимодействия. Дополнительным преимуществом использования пептидов в клинической практике считается их свойство не накапливаться в определенных органах, например в почках или печени, что позволяет минимизировать побочные эффекты². При этом препараты этой группы

- способны достигать самых разных мишеней: они используются в широком диапазоне терапевтических областей, в том числе в кардиологии, урологии, лечении боли, инфекционных, онкологических заболеваний, сахарного диабета. В клинической практике применяется более 80 пептидных препаратов, 33 из них синтезированы уже в XXI веке¹. Новые формулы разрабатывают как западные, так и отечественные ученые.

Совсем недавно на фармацевтический рынок вышел российский пептидный препарат *Дизайрикс*, который стал единственным официально зарегистрированным в РФ* средством для лечения сниженного сексуального влечения у женщин.

ПЕПТИДЫ, В БОЙ!

Сексуальная дисфункция у представительниц слабого пола – довольно распространенная проблема, о которой, увы, не принято говорить вслух. В то же время она может иметь серьезные последствия. Так, снижение либидо может негативно отражаться и на здоровье, и на качестве жизни обоих партнеров, общее самочувствие которых, по данным исследования, связано с частотой сексуальных отношений³. Решить проблему помогает *Дизайрикс*, предназначенный для нормализации либидо у женщины⁴. Он выпускается в форме назального спрея, которая является оптимальной для доставки пептидов: при распылении вся доза попадает в верхнюю носовую раковину, где расположен обонятельный эпителий и дендриты обонятельных нервов, по которым препарат проникает в головной мозг и обеспечивает эффект за счет нескольких механизмов⁴:

- * воздействие на сигнальные пути, ответственные за регуляцию сексуального и репродуктивного поведения
- * модуляция активности нейронов гипоталамуса, влияние на рецепторы, ответственные за быструю ингибирующую трансмиссию в мозге
- * регуляция нейромедиаторной системы головного мозга, восстановление баланса между торможением и возбуждением.

Активность препарата *Дизайрикс* продемонстрирована в клинических исследованиях, показавших, что он превосходит по эффективности плацебо у женщин со снижением либидо⁴. Это единственный* лекарственный препарат для лечения сниженного сексуального влечения у женщин⁴ с доказанной эффективностью в увеличении числа удовлетворительных половых актов и испытываемых оргазмов⁵, а также в уменьшении стресса и беспокойства, связанного с сексом⁵.

Препарат имеет благоприятный профиль безопасности, а нежелательные реакции при его применении кратковременны⁴, что связано в том числе с отсутствием системного эффекта. *Дизайрикс* выпускают во флаконе из стекла, являющегося инертным материалом и сохраняющим свойства пептидов, со специальной дозирующей насадкой, при нажатии на которую ЛС попадает на эпителий верхней носовой раковины сфокусированным пятном, что обеспечивает точность дозирования. Температурный режим хранения препарата – 2–8 °С.

- * Популярность и востребованность пептидных ЛС постоянно растет: если в 2013 году их продажи составили около 35 млрд долларов, то в 2019 году – более чем в два раза больше¹

*По данным ГРЛС на 15.09.2022.

1. Wang L. et al. Therapeutic peptides: current applications and future directions // Signal Transduction and Targeted Therapy, 2022. Т. 7. № 1. С. 1–27. 2. Marquis S., Pirogova E., Piva T.J. Evaluation of the use of therapeutic peptides for cancer treatment // Journal of biomedical science. 2017;24(1):1–15. 3. Muise A., Schimmac U., Impett E. Sexual frequency predicts greater well-being, but more is not always better // Soc Psychol Pers Sci. 2015;7(4):255–302. 4. Инструкция по медицинскому применению лекарственного препарата *Дизайрикс*. Рег. уд. №: ЛП–007842 от 01.02.2022. 5. По данным многоцентровых рандомизированных плацебо-контролируемых клинических исследований 1–3-й фазы.