

АНТИАГРЕГАЦИОННАЯ АКТИВНОСТЬ ТКАНЕВЫХ ПРЕПАРАТОВ ФИБСА И ЭКСТРАКТА ДОННИКА В ОПЫТАХ IN VITRO

Т.Л. Карасёва, Т.А. Кабанова, Г.С. Фесюнова

Одесса, Украина

Одним из основных патогенетических механизмов патологии системы кровообращения является нарушение реологических свойств крови. Необходимость использования лекарственных препаратов, влияющих на гемореологические параметры, определяет медицинское и социально-экономическое значение данной проблемы для Украины. К средствам, уменьшающим свёртываемость крови, относятся антикоагулянты прямого и непрямого действия, тромболитические и фибринолитические препараты, антиагреганты, ангиопротекторы и др.

Препарат ФиБС содержит отгон лиманной грязи (пелоидодистиллат), кумарин и коричную кислоту, - последние два компонента оказывают гипокоагулянтное действие.

Экстракт Донника, полученный по специальной технологии из травы донника лекарственного, содержит кумариноподобные вещества.

Целью настоящего исследования явилось изучение антиагрегационной активности тканевых препаратов ФиБСа и экстракта Донника (3серии). Проверка осуществлялась в опытах in vitro по методу Борна на богатой тромбоцитами плазме крови человека на агрегометре THROMLITE – 1006 А ("Биохиммак", Россия). Суть метода заключается в оценке способности исследуемых объектов ингибировать АДФ – вызванную агрегацию (слипание) тромбоцитов пос-

ле их предварительной инкубации с плазмой крови человека.

Антиагрегационную активность исследуемых нами тканевых препаратов выражали в % подавления агрегации тромбоцитов по сравнению с контролем (с учётом 7-кратного разведения в кювете агрегометра).

Установлено, что антиагрегационная активность ФиБСа составляет 27,5%, а экстракта донника от 74,2% (серия 2) до 83,3% (серия 1 и 3).

Результаты проверки свидетельствуют о высокой антиагрегационной активности экстракта Донника (всех серий), практически втрое превышающей активность препарата ФиБСа.

В качестве сравнения можно привести препарат аспирин, широко используемый в клинической медицине в качестве антитромботического средства в концентрации соединения ($IC_{50} - 22 \times 10^{-4}$ м). Аспирин проявляет активность, при которой степень агрегации тромбоцитов составляет 50% от исходного значения.

Полученные результаты подтверждают целесообразность дальнейшего изучения антикоагулянтных свойств ФиБСа и экстракта Донника в опытах in vivo, что имеет важное практическое значение для профилактики и лечения тромбозов.

ANTIAGGREGATIVE ACTIVITY OF TISSUE PREPARATIONS FIBS AND DONNIK EXTRACT ON EXPERIMENT IN VITRO

T. L. Karasyova, T. A. Kabanova, G. S. Fesyunova

Odessa, Ukraine

It is established that the antiaggregative action of the preparation FiBS is 27.5% and Donnik extract (3 series) is from 74.2% to 83.3% in experiment in vitro (by Born method).

УДК 619:579.842.11

ИССЛЕДОВАНИЕ ПОСТУПЛЕНИЯ ГУМИНОВЫХ КИСЛОТ УГЛЯ В КЛЕТКИ ESCHERICHIA COLI С ИСПОЛЬЗОВАНИЕМ МЕЧЕННОГО ТРИТИЕМ ПРЕПАРАТА

Н. А. Куликова, И. В. Перминова, Г. А. Бадун

Москва, Россия

Обширное распространение и большие запасы каустобиолитов, а также относительно простые способы получения на их основе гуминовых кислот (ГК), обусловили большой интерес к проблеме исследования физиологической активности ГК. Несмотря на разнообразие данных, свидетельствующих о физио-

логической активности и адаптогенных свойствах ГК, механизм их действия на биологические объекты до сих пор неясен. В частности, нерешенным остается вопрос о проникновении ГК через биологические мембраны и поступлении в клетки живых организмов. Решение этой проблемы требует применения меченых

препаратов ГК. Использование меченных по углероду ГК, получившее наибольшее распространение, имеет ряд недостатков. В частности, ГК обычно получают с помощью синтеза из мономеров, считающихся предшественниками ГК, или путем компостирования выращенных на меченом субстрате растений.

Поскольку выделяемые препараты заведомо отличаются от природных ГК, это затрудняет интерпретацию получаемых данных.

Целью данной работы была оценка возможности поступления нативных ГК в клетки. Исследование проводили на ГК угля (леонардита), в которые вводили тритиевую метку (^3H) с использованием метода термической активации трития. Идентичность меченого и исходного препаратов подтверждали с помощью гель-хроматографического анализа. Концентрацию метки определяли методом жидкостного сцинтилляционного счета. В качестве тест-объекта использовали кишечную палочку *E. coli* XL1., наращивание которой проводили в среде М9 с добавлением меченных тритием ГК угля в концентрации 10-100 мг/л. После наращивания культуры (орбитальное встряхивание, аэробные условия, 10 час, 37°C) клетки отделяли центрифугированием (30 мин, 5000 об/мин) и в супернатанте определяли концентрацию несвязанных ГК. Осажденные клетки ресуспендировали, в суспензии определяли концентрацию поглощенных, т.е. адсорбированных на поверхности и про-

никнувших в клетку, ГК. После этого клетки *E. coli* лизировали с помощью хлороформа и дебрис осаждали центрифугированием (30 мин, 5000 об/мин). В супернатанте определяли концентрацию ГК, поступивших в клетки, а в дебрисе - количество ГК, адсорбированных на клеточных мембране и стенке.

Проведенные эксперименты показали, что в изученном диапазоне концентраций количество ГК, поглощенных клетками кишечной палочки, линейно зависело от равновесной концентрации несвязанных ГК ($R^2 = 0.99$).

В среднем (45 ± 8)% от внесенного количества ГК поглощалось клетками *E. coli*, что составило 1,1 г ГК/млн. клеток при максимальной исследованной концентрации 100 мг/л. При этом непосредственно в клетки поступало не более (4 ± 2)% ГК от внесенного количества, тогда как 96 % концентрировалось на мембране и стенке. Расчет баланса масс показал, что при измерении было обнаружено (88 ± 8)% от внесенного количества ГК, что подтверждает достоверность приведенных оценок. Полученные результаты свидетельствуют о том, что физиологическая активность ГК в значительной степени обусловлена их мембранотропными свойствами.

Работа выполнена при поддержке гранта Научно-Исследовательского Центра по охране окружающей среды и здоровья человека (GSF), Нойхерберг, Германия.

STUDIES ON PENETRATION OF COAL HUMIC ACIDS INTO THE CELLS OF ESCHERICHIA COLI USING THE TRITIUM LABELED PREPARATION

N. A. Kulikova, I. V. Perminova, G. A. Badun
Moscow, Russia

Despite the numerous findings on biological effects exerted by humic substances (HS) onto the living organisms, the mechanism of their biological activity remains unknown. One of the reasons is a lack of the radioactively labeled preparations identical in the tritium labeled HS structure to the natural HS. The goal of this work was to obtain and use for the biological studies. Coal humic acid from leonardite was used as a model HS, cells of bacteria *Escherichia coli* (strain *E. coli* XL1) - as a biological model, penetration of coal HA into the cells - as a biological effect to study. To introduce ^3H label into the coal HA, the method of thermal tritium activation was used. The cells of *E. coli* were cultivated for 10 hours on the nutritional medium containing 1-100 mg/L of ^3H -HA. The cell suspension was then centrifuged and radioactivity of the supernatant and cell pellet was measured. The amount of the sorbed HA onto the cell surface accounted for $45 \pm 8\%$ of the introduced HA, or 1.1 g HA per 10^6 cells at the HA concentration of 100 mg/L. The studies on the lysed cells have shown that only 4% of the label was determined in the cell interior, whereas 96% was concentrated in the cell debris. The obtained results allow to suggest that the biological activity is governed by the membranotropic properties of HS.

УДК 547.419.5:616-089-87;616-073.524

ФАРМАКОКИНЕТИКА ПРОИЗВОДНОГО ГЕРМАНИЯ С НИКОТИНОВОЙ КИСЛОТОЙ

В. И. Кресюн, А. Г. Видавская, Е. Ф. Шемонаева, Т. Н. Иванишина
Одесса, Украина

В настоящее время успешным является использование лекарственных веществ, синтезированных на основе естественных метаболитов (витаминов, мик-

ро- и макроэлементов). Исходя из этого, на кафедре химии и полимеров Одесского национального университета целенаправленно было синтезировано ком-