АНГИПУР – НОВОЕ АНТИАГРЕГАНТНОЕ СРЕДСТВО

**А.А. Спасов¹, Ф.А. Халиуллин², А.Ф. Кучерявенко¹, В.С. Сиротенко¹,
К.А. Гайдукова¹, А.В. Самородов², Ю.В. Шабалина²**

¹Волгоградский Государственный Медицинский Университет Минздрава РФ,
400131, Россия, г. Волгоград, пл. Павших Борцов, 1.

²Башкирский Государственный Медицинский Университет Минздрава РФ,
Россия, г. Уфа, ул. Ленина 3.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-93

E-mail: sirotenko.viktor@yandex.ru

Ингибирование агрегации тромбоцитов является главной стратегией для предотвращения тромботических состояний. Поэтому, использование современных антитромбоцитарных препаратов, существенно снижает риск развития тромботических осложнений. На сегодняшний день, самыми мощными антиагрегантными средствами являются препараты, блокирующие конечное звено агрегации тромбоцитов, являющееся общим для всех путей их активации, а именно рецепторы гликопротеина IIb/IIIa.

В результате мишень-ориентированного поиска ингибиторов гликопротеиновых IIb/IIIa рецепторов тромбоцитов методом проточной цитометрии найдено высокоактивное соединение Ангипур – (3-метил-8-(пиперазин-1-ил)-7-(тиетан-3-ил)-1-этил-1H-пурин-2,6(3H,7H)-диона гидрохлорид), синтезированный в БГМУМЗ РФ (г. Уфа, Россия).

Данное соединение синтезировано из 8-бром-3-метилксантина в четыре стадии. Реакцией исходного ксантина 2-хлорметилтираном получали продукт тиран-тиетановой перегруппировки 8-бром-3-метил-7-(тиетан-3-ил)ксантин, который этилировали в 8-бром-3-метил-7-(тиетан-3-ил)-1-этилксантин. Далее реакцией нуклеофильного замещения с пиперазином синтезировали 3-метил-8-(пиперазин-1-ил)-7-(тиетан-3-ил)-1-этил-1H-пурин-2,6(3H,7H)-дион, и переводили в гидрохлорид. Разработаны регламенты получения субстанции и лекарственной формы соединения Ангипур, проведена их стандартизация.

Ангипур по антитромботической активности на моделях артериальных тромбозов, индуцированных хлоридом железа, электрическим током, смесью адреналина с коллагеном, а также модели венозного тромбоза превосходит ингибиторы IIb/IIIa гликопротеиновых рецепторов эптифибатид и тирофибан. В настоящее время завершен полный цикл доклинических исследований его лекарственной формы для инфузий «Ангипур», предназначенной для лечения острого коронарного синдрома, проведена I фаза клинических испытаний и разработанный препарат проходит II фазу клинических испытаний.