

- 1 препарат у формі спрею для парентерального введення на основі ібупрофену – Ноофен Белупо (заявник - Хорватія);

- 2 препарата у формі спрею для парентерального введення на основі диклофенаку натрію – Аргетт спрей (заявник - Швейцарія) та Диклофенак-Здоров'я Ультра (заявник - Україна). [1]

Із зареєстрованих лікарських препаратів Аспрікс використовується назально. Ця лікарська форма не може бути використана для шкірного нанесення. [2]

Лікарський засіб Ноофен Белупо – відсутній у вільному продажу по всій території України. Використовується для шкірного нанесення. [3]

Лікарські засоби Аргетт спрей та Диклофенак-Здоров'я Ультра містять у своєму складі диклофенак натрію у однаковій концентрації – 4%. Використовується для шкірного нанесення.[2]

Висновки. Проаналізувавши український фармацевтичний ринок, дійшли висновків, що відсутній великий перелік лікарських засобів із НПЗЗ, які призначені для зовнішнього застосування із безконтактним нанесенням. Тому, цю нішу можна вважати перспективною.

Список літератури

1. <http://www.drlz.com.ua/> - Державний реєстр лікарських засобів України
2. <https://compendium.com.ua/> - Компендіум
3. <https://tabletki.ua/> - Tabletki.ua

Сучасні аспекти інтраназального введення лікарських речовин у вигляді спреїв

Хохлов М.Б., Рубан О.А.

Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

kolya.hohlov.2012@gmail.com

Вступ. В останні роки все частіше слизову оболонку порожнини носа використовують як не інвазивний шлях для введення лікарських засобів. У визначенні ДФУ першого видання назальні спреї являють собою розчини, емульсії та суспензії, призначені для упорскування в носову порожнину з метою одержання певного фармакологічного ефекту. Тобто, це аерозолі без пропелентів, вивільнення вмісту яких відбувається за рахунок тиску, що створюється за допомогою механічного розпилювача насосного типу або при стисканні полімерного пакування. Крім того, вони портативні, зручні в застосуванні та мають певні переваги серед крапель і м'яких лікарських форм (мазі, гелі, бальзами для інгаляцій), а саме: естетичність, гігієнічність, висока ефективність дії при порівняно малих витратах лікарських речовин; при використанні клапано-дозувальних систем забезпечується висока точність дозування АФІ;

невеликий розмір часток зумовлює їх швидке проникнення в слизові оболонки та, при необхідності, в верхні дихальні шляхи; контейнери, що застосовуються для пакування назального спрею, герметично закриті та виключають забруднення лікарського препарату ззовні, і захищають його від висихання, дії світла і вологи. Інтраназальне введення препаратів легко виконується самими пацієнтами або особами, що здійснюють за ними догляд. Це важливо, коли необхідно швидко купірувати важкі симптоми, а пацієнт не здатний зробити ін'єкцію самостійно. Інтраназальне введення лікарських речовин, як правило, дозволяє підвищити їх біодоступність, виключити вплив шлункового соку, травних і печінкових ферментів.

На фармацевтичному ринку вже багато років присутні інтраназальні форми ліків у вигляді спреїв місцевої дії: деконгестанти, анестетики, антисептичні та антимікробні засоби, кортикостероїди. Але вже сьогодні є чимало назальних спреїв, призначених для системної доставки лікарських засобів: суматриптан та золмітриптан для лікування нападів мігрені, гормон десмопресин як антидіуретичний засіб, гормон кальцитонін для лікування остеопорозу та інших захворювань кісток, діазепам для купірування нападів кластерних та гострих повторюваних судом тощо.

Мета дослідження. Проведення досліджень з розробки складу назального спрею для застосування в анестезіології.

Методи та об'єкти дослідження. Методологічну основу досліджень складають наукові публікації вчених в галузі аеродисперсних лікарських форм. Під час виконання експериментальних робіт були використані сучасні фізико-хімічні методи ДФУ.

Основні результати. При розробці лікарської форми для інтраназального введення є обмеження, пов'язані з фізіологічними особливостями будови верхніх дихальних шляхів, які необхідно враховувати. При використанні назальних спреїв велика більшість введеної дози осідає в передній частині носової порожнини. Завдяки поверхневому натягу між краплями і слизовою оболонкою, спрей швидко розподіляється по останній. В подальшому мукоциліарний кліренс забезпечує поширення шару рідини по носовій порожнині. Оскільки слизова носа постійно оновлюється з видаленням відмерлих клітин в напрямку глотки, час знаходження лікарського препарату в носовій порожнині залежить від того, наскільки швидко він розчиняється в слизу і проникає в слизову оболонку.

Найбільш зручними для інтраназального застосування вважаються рідкі лікарські форми. Для подолання ферментативного бар'єру слизової оболонки носа, фізичного бар'єру носового епітелію, мукоциліарного кліренсу і шару слизу до складу спреїв назальних поряд з активними сполуками входять різні допоміжні речовини, які за призначенням класифікують на регулятори в'язкості, регулятори рН і консерванти.

Використання як регуляторів в'язкості мукоадгезивних полімерів, таких, як поліакрилова кислота, карбомер, хітозан, альгінат натрію, гідроксипропілметилцелюлоза, карбоксиметилцелюлоза, підвищує комфортність застосування спреїв, дозволяє збільшити час контакту лікарського препарату зі слизовою оболонкою порожнини носа і призводить до покращення абсорбції лікарської речовини. Деякі з цих регуляторів в'язкості відносяться до, так званих, розумних («smart») полімерів. Їх розчини здатні загущувати або формувати гелі при попаданні в носову порожнину («*in situ*») в результаті підвищення температури, зміни рН або при взаємодії з певними катіонами металів.

Склади на основі термочутливих полімерів мають досить невелику в'язкість при нормальних умовах, що дозволяє ефективно їх дозувати за допомогою насадок-розпилювачів, і здатні до збільшення в'язкості при температурі, що відповідає назальній порожнини. Наприклад, це стосується застосування 10-20% водних розчинів полоксамера. Крім чистих розчинів полімерів, також використовують комбінації полімерів, наприклад, полоксамер і карбопол, полоксамер і поліакрилова кислота, полоксамер і похідні целюлози, що дозволяє змінити час і температуру гелеутворення.

В кислому середовищі ці речовини знаходяться в стані розчину і мають низьку в'язкість. При збільшенні значення їх рН до 5,0-7,0 спостерігається золь-гель-перехід. Тобто при розробці складу назального спрею необхідно проводити дослідження динамічної в'язкості препарату при різних швидкостях зсуву і температурах, що дозволить визначити оптимальний вміст регуляторів в'язкості для забезпечення можливості розпилення препарату і його гелеутворення при температурах, близьких до температури носової порожнини.

При розробці назальних форм слід враховувати, що рН слизової оболонки носа становить близько 7,4, а рН назального секрету 5,6. Таким чином, для попередження подразнення слизової оболонки носа спреї назальний повинен мати значення рН 4,5-6,5.

В назальних спреях флакони містять ручні помпи, які дозволяють створювати із рідини або емульсії аерозолі, розмір крапель яких визначає, наскільки глибоко в носову порожнину потрапить засіб.

Висновки. Зараз на фармацевтичному ринку України найбільший асортимент лікарських засобів у вигляді спреїв налічують препарати для місцевого лікування порожнини носа, захворюваннях горла та адренергічні препарати для інгаляційного використання.