

Д. Л. Сало, В. И. Чуешов, И. Г. Швагер, А. М. Савкин

ИЗУЧЕНИЕ КАПИЛЛЯРНОЙ ВЛАГОЕМКОСТИ МОДИФИЦИРОВАННЫХ АЭРОСИЛОВ

Харьковский фармацевтический институт

В последние годы наблюдается тенденция к увеличению ассортимента вспомогательных веществ, значение которых не только в том, что они влияют на физико-химические свойства лекарств, но и в том, что они значительно воздействуют на фармакотералевтическую активность действующих ингредиентов [1].

К числу наиболее распространенных вспомогательных веществ, применяемых при изготовлении таблеток, драже, порошков и других форм, относится высокодисперсная двуокись кремния — аэросил. Он улучшает технологические свойства материалов, увеличивает насыпной вес, повышает сыпучесть, облегчает гранулирование лекарственных веществ [2].

На поверхности высокодисперсной двуокиси кремния каждый второй атом кремний несет гидроксильную группу, которая способна к химическому взаимодействию с различными органическими радикалами. Степень замещения — ОН-групп на поверхности аэросила радикалами может колебаться от 1—2 до 100%.

В зависимости от природы радикала и степени модифицирования получают продукты с различными физико-химическими свойствами [2—4]. Это позволяет использовать модифицированные аэросилы для получения эффективных лекарств с заданными свойствами, например устойчивых к воздействию влаги, способных к длительному хранению и др.

Целью настоящего исследования явилось изучение устойчивости как самого аэросила, так и его модифицированных образцов к воздействию влаги. При этом качественное взаимодействие указанных препаратов с водой характеризовали способностью их смачиваться, а количественное — капиллярной влагоемкостью.

Под капиллярной влагоемкостью понимается количество влаги, поглощаемое единицей материала в воздушно-сухом состоянии. Эта величина является показателем степени комкуемости материала, она очень чувствительна к изменению гранулометрического состава. Капиллярная влагоемкость позволяет количественно установить гидрофильность модифицированных аэросилов и может оказаться очень ценной их физико-химической характеристикой при совершенствовании известных и создании новых, с заранее заданными свойствами материалов, в том числе и лекарственных форм.

Экспериментальная часть

Определение капиллярной влагоемкости аэросила и его модифицированных образцов проводили по методу, в основу которого положен принцип капиллярного насыщения колонок [4].

В стеклянную колонку со съёмным пористым дном помещали исследуемое вещество 0,2 г и уплотняли на вибраторе с частотой 6000 колебаний в 1 мин. В качестве съёмного дна использовали двойной слой марли и одинарный слой фильтровальной бумаги, который фиксировали резиновой обхваткой. Загруженную колонку ставили на дно кюветы на предметное стекло с двойным слоем фильтровальной бумаги. В кювету перед погружением колонки заливали воду в таком объеме, чтобы ее уровень был выше слоя вещества на 2—3 мм. Момент погружения колонки фиксировали по секундомеру и регистрировали увеличение веса через определенные интервалы времени. Контроль заканчивали при достижении постоянного веса колонки.

Капиллярную влагоемкость рассчитывали по формуле, приведенной ранее [4]:

$$W_{ке} = \frac{P_3 - P_2 - P_0}{P_2 - P_1} \cdot 100\%$$

P_1 —масса стеклянной колонки; P_2 — масса стеклянной колонки с навеской аэросила; P_3 — масса стеклянной колонки с насыщенной навеской аэросила; P_0 — поправка на съёмное дно (0,3124), которая устанавливается экспериментально.

Быстроту водопоглощения аэросила характеризовали скоростью насыщения, вычисленной по формуле:

$$S_n = \frac{P}{t} \text{ г/мин (см. рис.),}$$

P — привес влаги;
 t —время полного насыщения навески образца.

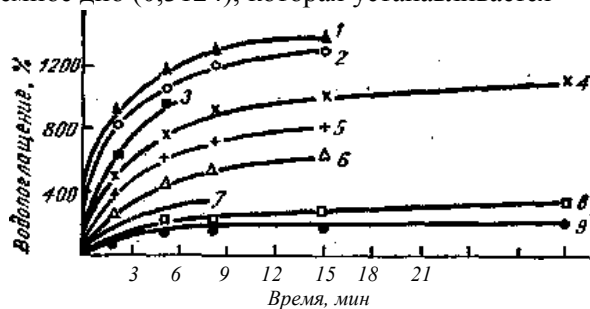
Из рисунка видно, что изменение удельной поверхности аэросила от 175 до 300 м²/г существенного влияния на скорость водопоглощения не оказывает.

Модифицирование же поверхности значительно влияет как на длительность насыщения, так и на скорость водопоглощения. Наибольшее время насыщения имеют аминокэросил, метилаэросил (степень модифицирования 100%), а также бутасил (82%). Наибольшую капиллярную влагоемкость проявляют аминокэросил и аэросилы с удельной поверхностью ($S_{уд}$), равной 175 и 300 м²/г. Наряду с определением капиллярной влагоемкости скорости водопоглощения находили насыпной вес и коэффициент сыпучести. Средние величины из 5 определений представлены в таблице.

Физико-химические свойства модифицированных аэросидов

Объект	Степень модифицирования %	R	Насыпной вес, г/л	Коэффициент сыпучести	Капиллярная влагоемкость	Скорость насыщения
Аэросил ($S_{уд}$ 175 м ² /г)	—	—	38,0	1,93	1346	0,48
Аэросил ($S_{уд}$ 300 м ² /г)	—	—	58,7	1,01	1130	0,42
Аминокэросил	100	—NH ₂	45,0	1,35	1119	0,07
Этасил	100	—C ₂ H ₅	149,0	0,21	631	1,44
Метилаэросил	40	= Si (CH ₃) ₂	45,0	0,83	925	0,13
»	80	= Si (CH ₃) ₂	52,7	1,50	250	0,06
»	100	= Si (CH ₃) ₂	120,0	2,10	190	0,03
Бутасил	58	— C ₄ H ₉	57,8	0,41	1080	0,43
»	82	— C ₄ H ₉	67,8	0,67	209	0,02

Из таблицы видно, что изменение удельной поверхности от 175 до 300 м²/г не оказывает значительного влияния на физико-химические показатели. С увеличением степени модифицирования коэффициент сыпучести и насыпной вес увеличиваются. Так, для метилаэросила со степенью модифицирования 40% коэффициент сыпучести составляет



Зависимость скорости водопоглощения от времени насыщения.

1 — аэросил ($S_{уд}$ 175 м²/г); 2 — аэросил ($S_{уд}$ 300 м²/г); 3 — бутасил 58%; 4 — аминокэросил; 5 — этасил; 6 — метилаэросил 40%; 7 — метилаэросил 80%; 8 — бутасил 82%; 9 — метилаэросил 100%.

0,80, а со степенью модифицирования 100%—2,1; насыпной вес возрастает с 52,7 до 120 г/л. Капиллярная влагоёмкость и скорость водопоглощения с увеличением степени модифицирования уменьшаются. Так, для бутасила со степенью модифицирования 58% капиллярная влагоёмкость составляет 182%, со степенью модифицирования 82%—209%, а скорость насыщения уменьшается с 0,43 до 0,02 г/мин.

Модифицирование аэросила органическими радикалами привело к увеличению насыпного веса, сыпучести, скорости водопоглощения и уменьшению капиллярной влагоёмкости по сравнению с исходным аэросилом.

Замена гидроксильных групп поверхности аэросила приводит к уменьшению средства поверхности к воде и позволяет применять модифицированные аэросилы для приготовления не отсыревающих, легко сыпучих порошков и сухих экстрактов.

В ы в о д ы

1. Изучено влияние природы радикала и степени модифицирования поверхности аэросила на насыпной вес, капиллярную влагоёмкость и скорость водопоглощения аэросилов.

2. Увеличение удельной поверхности аэросила не оказывает значительного влияния на физико-химические показатели. С увеличением степени модифицирования коэффициент сыпучести и насыпной вес повышаются, а капиллярная влагоёмкость и скорость насыщения уменьшаются.

3. Модифицирование поверхности аэросила диметилдихлорсиланом на 80 и 100%, а также бутанолом на 82% приводит к проявлению ярко выраженных гидрофобных свойств.

ЛИТЕРАТУРА. 1. Ч у е ш о в В. И. Физико-химические и биофармацевтические исследования модифицированных аэросилов с целью их использования для приготовления эмульсионных мазевых основ. Дис. канд. Харьков, 1974.—2. М а к а р о в А. С., К р у г л и ц к и й Н. Н., Ч у е ш о в В. И. и др. — «Коллоидн. ж.» 1975, № 5, с. 889—893. — 3. С о б о л е в В. А., Т е р т ы х В. А., Ч у й к о А. А. «Ж. прикладн. спектроскопии», 1970, т. 13, с. 646—650. — 4. С а в к и н А. М., Ш в а г е р И. Г. — В кн.: Материалы 3-го Всероссийского съезда фармацевтов (Тезисы докладов). Свердловск, 1975, с. 161—162

Поступила 15/XI 1976 г.

A STUDY OF THE CAPILLARY MOISTURE CAPACITY OF MODIFIED AEROSILS

D. P. Salo, V. I. Chueshov, I. G. Shvager, A. M. Savkin

A comparative study was made of the capillary moisture capacity of the modified organic radicals $-\text{NH}_2$, $-\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{C}_4\text{H}_9$, $=\text{Si}(\text{CH}_3)_2$ of aerosils produced in the USSR and that of the initial aerosil. It is shown that modification of the surface of the aerosil with dimethyl-dichlorosilane by 80 and 100% and with butanol by 82% leads to the appearance of pronounced hydrophobic properties.