

THE CZECHOSLOVAK MEDICAL SOCIETY J. E. PURKYŇE
THE CZECHOSLOVAK PHARMACEUTICAL SOCIETY
THE SLOVAK ACADEMY OF SCIENCES

2nd SYMPOSIUM

ON

BIOPHARMACEUTICS and PHARMACOKINETICS

WITH INTERNATIONAL PARTICIPATION

sponsored by International Pharmaceutical Federation

SMOLENICE, CZECHOSLOVAKIA

May 20—24, 1974

ABSTRACTS

OF PAPERS

Organized by

The Slovak Medical Society

The Slovak Pharmaceutical Society

The Institute of Experimental Pharmacology

О ВЗАИМОДЕЙСТВИИ ЛЕКАРСТВЕННЫХ И ВСПОМОГАТЕЛЬНЫХ ВЕЩЕСТВ

Г. В. Цагарейшвили, Г. С. Башура, И. М. Перцев

Институт фармакохимии АН Грузинской ССР, г.Тбилиси, СССР
и Научно-исследовательский химико-фармацевтический институт,
г. Харьков, СССР

Известно, что активность лекарственного вещества в носителе может быть повышена путем изменения технологии изготовления или путем ведения различных добавок-растворителей: причем, коэффициент активности лекарства при этом может значительно колебаться. Если растворенное вещество образует с растворителем комплексное соединение, которое прочно удерживается носителем, то лекарство обнаруживает низкий коэффициент активности, а скорость освобождения вещества из системы будет медленной. Если сродство носителя к лекарственному веществу или растворителю небольшое, то лекарство обнаруживает высокий коэффициент активности, а скорость освобождения вещества из таких комбинаций будет быстрой. Нами экспериментально показана возможность повышения антимикробного (бактериостатического) действия левомецитина, синтомицина, биомицина и стрептомицина при условии их растворения в полиэтиленгликоле-400 (ПЭГ-400). Калий бензилпенициллин не повышал активность по отношению ко всем изучаемым культурам микроорганизмов, а в ряде случаев его активность понижалась.

Это показывает, что полиэтиленгликоли и их производные, в ряде случаев не являются инертными веществами и могут взаимодействовать с целым рядом лекарственных веществ, повышая или уменьшая их активность в лекарственных формах. Предлагается, что ПЭГ и другие неионные поверх-

ностно-активные вещества образуют комплексы с веществами благодаря реакции между фенольным, гидроксильным или карбоксильным водородом и эфирным кислородом гликоля, в результате чего изменяется активность лекарственного вещества.

С целью выяснения причин, приводящих к усилению действия левомецитина и синтомицина после их растворения в ПЭГ, нами изучены ИК-спектры этих веществ и их растворов. Однако измененный в положении, характерных для валентных колебаний $= \text{OH}$, $= \text{NH}$, $\equiv \text{CH}$, $= \text{C} = \text{O}$ и др. групп и ароматического ядра нами не наблюдалось.

В связи с этим были изучены спектры дисперсий оптического вращения указанных веществ и их растворов в ПЭГ-400.

Исследования показали изменения вращения левомецитина в растворе ПЭГ, что может быть вызвано образованием водородных связей между гидроксильными группами левомецитина и атомами кислорода ПЭГ, т. е. наблюдается взаимодействие этих веществ, продукт которого легко освобождается из носителя.

Для растворов синтомицина в ПЭГ в спектрах не наблюдалось какое-либо вращение, т. е. ПЭГ способствует внутреннему вращению по всязи, соединяющей два ассиметрических атома углерода. Этим, очевидно и следует объяснить различную эффективность растворов левомецитина и синтомицина в ПЭГ-400 по отношению к изученным микроорганизмам. Повышение активности синтомицина можно объяснить его хорошей растворимостью в ПЭГ, с образованием истинного рацемата.

Таким образом, при применении вспомогательных материалов при изготовлении лекарств необходимо учитывать не только их влияние на технологические свойства лекарственной формы, но и возможные изменения ее терапевтического действия.

THE ABSORPTION OF SOME POORLY WATER SOLUBLE DRUGS FROM SUSPENSIONS AND TABLETS

G. KEDVESSY, I. A. HADI and J. MORVAY

*Medical University of Szeged, Department of Pharmaceutical Technology,
Department of Obstetrics and Gynecology, Szeged, Hungary*

The authors reported a biopharmaceutical review, concerning three model drugs: salicylic acid, acetylsalicylic acid and sulfadimidin. The liquid dispersion systems were evaluated against a variety of parameters including particle size, viscosity and surface tension. For the tablets the evaluation parameters were the disintegration rate and porosity.