

ДОСЛІДЖЕННЯ ГІДРОФІЛЬНИХ ОСНОВ ДЛЯ РОЗРОБКИ ГЕЛЮ ІБУПРОФЕНУ

Національний фармацевтичний університет, м. Харків

Вступ. Розробка та створення нових комбінованих лікарських засобів для місцевого застосування у профілактиці та лікуванні проявів остеоартрозу є актуальною проблемою.

Мета. Вивчення технологічних параметрів гелевих композицій на основі метилцелюлози та карбомеру марки Ultrez-10 NF для створення гелю з ібупрофеном.

Матеріали та методи. Об'єктами дослідження стали зразки гелів на основі гідрофільних полімерів метилцелюлози (МЦ) (2 %, 3 %, 3,5 %) та карбомеру марки Ultrez-10 (0,5 %; 0,8 %; 1,0 %; 1,5 %). Досліджували фізико-хімічні показники зразків гідрофільних основ за методиками ДФ України.

Результати. В результаті проведення фізико-хімічних та органолептичних досліджень 7 зразків гелевих основ на першому етапі із дослідження як незадовільні були виключені гелі на основі метилцелюлози. Наступні дослідження, що проводилися з гелями на основі карбополу Ultrez-10 NF дозволили дійти висновку, що з технологічної точки зору найбільш оптимальною є концентрація 1 %.

Висновки. На підставі проведених досліджень для створення м'якої лікарської форми з ібупрофеном в якості гелеутворювача обрано карбомер марки Ultrez-10 NF.

Ключові слова: остеоартроз, гель, ібупрофен, гідрофільні основи.

Вступ. Проблема лікування остеоартрозу (ОА), що є одним з найпоширеніших захворювань опорно-рухового апарату у осіб похилого віку, вимагає розширення номенклатури лікарських засобів [1]. Тому, незважаючи на значну кількість лікарських засобів, що застосовуються для лікування ОА, створення і впровадження нових ефективних препаратів, які надають комплексний вплив на патологічний процес, є актуальним.

Мета. Дослідження гелевих композицій на основі метилцелюлози та карбомеру марки Ultrez-10 NF для створення гелю з ібупрофеном.

Матеріали та методи. Об'єктами дослідження стали зразки гелів на основі гідрофільних полімерів метилцелюлози (2 %, 3 %, 3,5 %) та карбомеру марки Ultrez-10 (0,5 %; 0,8 %; 1,0 %; 1,5 %). Фізико-хімічні показники зразків гідрофільних основ досліджували за методиками ДФ України [2].

Результати та їх обговорення. М'які лікарські форми є дисперсними системами, що складаються з діючих речовин, рівномірно розподілених в дисперсному середовищі. Гелі представляють собою структуровані системи, здатні зберігати форму, що володіють пружністю і еластичністю. У порівнянні з іншими м'якими лікарськими формами гелі мають ряд переваг: легко наносяться на поверхню шкіри, добре утримуються на ній і забезпечують тривалий контакт з обробленою поверхнею. З літературних джерел відомо, що при нашкірному нанесенні біодоступність лікарських речовин вище, якщо використовують гідрофільні основи [3-6]. Нами були вивчені зразки модельних основ для створення м'якої лікарської форми, що наведені в табл. 1.

Модельні складові основ для гелю ібупрофену

Склад основи, г	№ складу						
	1	2	3	4	5	6	7
Карбопол Ultrez 10				0,5	0,8	1,0	1,5
Трометамол				0,3	0,6	1,0	1,5
Метилцелюлоза	2,0	3,0	3,5				
Пропіленгліколь				7,5	7,5	7,5	7,5
Гліцерин	10	10	10	7,0	7,0	7,0	7,0
Вода очищена	до 100,0						

З цією метою було виготовлено 7 композицій на основі гідрофільних полімерів МЦ і карбополу марки Ultrez-10 NF, що широко використовуються в технології гелів. Їх готували за загальноприйнятими методиками. Для дослідження фізико-хімічних і структурно-механічних властивостей були виготовлені основи з різною концентрацією гелеутворювачів, а саме: метилцелюлози (МЦ) (2 %, 3 %, 3,5 %) та карбомеру марки Ultrez-10 NF (0,5 %; 0,8 %; 1,0 %; 1,5 %). Спостережено, що консистенція полімеру 2 % МЦ представляється занадто рідкою та розшаровується відразу після приготування. Зразки гелю з МЦ (№ № 2, 3) через годину після приготування мали незадовільні споживчі харак-теристики (грудко подібна липка маса), в результаті зразки були виключені з подальших досліджень. При розробці сучасних препаратів місцевої дії широко використовують синтетичний загущувач-сополімер кислоти акрилової, отриманий полімеризацією в органічних розчинниках, марки Ultrez-10 NF. Полімер відповідає основним вимогам, що пред'являються до допоміжних речовин які дозволені для створення лікарських препаратів на шкірної дії. Обрана нами марка карбомеру Ultrez-10 NF (дозволена USP до застосування в фармацевції), має кращі технологічні і споживчі характеристики і є найменш токсичною серед карбомерів, що використовуються. Основи з карбополом Ultrez-10 NF відповідають вимогам, для препаратів, місцевої дії а саме: вони мають помірну осмотичну активність, хорошу адгезійну здатність та ін. Тому для подальшого експерименту нами був обраний карбомер марки Ultrez-10 NF. Отримані дані свідчать про те, що структурна в'язкість досліджуваних зразків істотно зростала зі збільшенням концентрації карбомеру (в інтервалі досліджуваних концентрацій), а саме: зразки з концентрацією 0,5 % мали в'язкість 4 500 мПа • с і були рідкими. Зразки з концентрацією 0,8 % мали в'язкість 7200 мПа • с, 1,0 % мали в'язкість 8800 мПа • с, і задовільні споживчі характеристики. Необхідно відзначити, що зразки з концентрацією карбомеру 1,5 %, в'язкість якого дорівнює 12500 мПа • с були надто щільними, з грудочками, що в подальшому створювало б труднощі при виготовленні препарату (додаванні

активних речовин, фасуванні) і його застосуванні (екструзії з туб, нанесенні на шкіру). Тому ці зразки були виключені з подальшого дослідження (табл. 2).

Таблиця 2

Органолептичне дослідження гелів карбомеру

№ зразку	Термін спостереження		
	Щойно виготовлені	через 3 міс.	через 6 міс.
1,4	Розрідження, розшарування	з випробувань виключено	
2, 3, 7	Надто щільні	з випробувань виключено	
5	Задовільні споживчі характеристики	стабільний	стабільний
6	Задовільні споживчі характеристики	стабільний	стабільний

За даними експерименту для подальших досліджень нами була обрана гідрофільна основа гелю з концентрацією карбомеру Ultres 10 NF, 1,0 %.

Розробка препарату триває. Проводяться дослідження з вивчення умов уведення ібупрофену в гелеву основу, вплив гідрофільних розчинників на ступінь вивільнення активної речовини та інші.

Висновки. На підставі проведених досліджень для створення м'якої лікарської форми з ібупрофеном як гелеутворювач обрано карбомер марки Ultrez-10 NF.

Література

1. Бадюкин В. В. Основные симптомомодифицирующие препараты замедленного действия в терапии остеоартроза / В. В. Бадюкин // Consilium medicum. – 2010. – Т.12, № 9. – С. 10–14.
2. Державна Фармакопея України / ДП «Український науковий фармакопейний центр якості лікарських засобів» – 2-е вид. – X : Державне підприємство «Український науковий фармакопейний центр якості лікарських засобів», 2015. - Т. 1. – 1128 с.
3. Коваленко, С. Н. Експериментальне дослідження з вибору гелеутворювача при розробці засобу для лікування діабетичних виразок / С. Н. Коваленко, І. І. Баранова // Актуальні питання фармацевтичної і медичної науки та практики. – 2012. – № 3 (10). – С. 80–82.
4. Костина, А. А. Биофармацевтические исследования по выбору вспомогательных компонентов для геля с левзеи / А. А. Костина // Фармация и фармакология. – 2014. – № 3. – С. 3–5.
5. Лисянская, А. П. Биофармацевтические исследования интраназальной мягкой лекарственной формы с эналаприла малеатом / А. П. Лисянская, В. В. Гладышев, И. Л. Кечин // Актуальні питання фармацевтичної і медичної науки та практики. – 2010. – Вип. XXIII, № 4. – С. 42–45.
6. Шпичак, О. С. Теоретичне та експериментальне обґрунтування складу гелю протизапальної та місцевоанестезуючої дії для застосування в спортивній медицині / О. С.Шпичак, О. І. Тихонов // Фармац. журн. – 2014. – № 2. – С. 54–63.

Т.Н.Зубченко

Исследование гидрофильных основ для разработки геля ибупрофена

Национальный фармацевтический университет, г. Харьков

Введение. Разработка и создания новых комбинированных лекарственных средств для местного применения в профилактике и лечении проявлений остеоартроза является актуальной проблемой.

Цель. Изучение технологических параметров параметров гелевых композиций на основе метилцеллюлозы и карбомера марки Ultrez-10 NF для создания геля с ибупрофеном.

Материалы и методы. Объектами исследования стали образцы гелей на основе гидрофильных полимеров метилцеллюлозы (МЦ) (2 %, 3 %, 3,5 %) и карбомер марки Ultrez-10 (0,5 %; 0,8 %; 1,0 %; 1, 5 %). Исследовали физико-химические показатели образцов гидрофильных основ по методикам ГФ Украины.

Результаты. В результате проведения физико-химических и органолептических исследований 7 образцов гелевых основ на первом этапе по исследованию как неудовлетворительные были исключены гели на основе метилцеллюлозы. Последующие исследования, проводившиеся с гелями на основе карбо-пол Ultrez-10 NF позволили сделать вывод, что с технологической точки зрения наиболее оптимальной является концентрация 1%.

Выводы. На основании проведенных исследований для создания мягкой лекарственной формы с ибупрофеном в качестве гелеобразователя избран карбомер марки Ultrez-10 NF.

Ключевые слова: остеоартроз, гель, ибупрофен, гидрофильные основы.

T.N. Zubchenko

Study of hydrophilic bases for developing ibuprofen gel

National University of Pharmacy, Kharkiv

Introduction. Development and creation of new combined drugs for topical application in the prevention and treatment of osteoarthritis is a current issue.

The aim of research was to study the technological parameters of gel compositions based on methylcellulose and carbomer brand Ultrez-10 NF for creation ibuprofen gel.

Materials and methods. The objects of study were samples of gels based on hydrophilic polymers methylcellulose (MC) (2%, 3%, 3.5%) and carbomer brand Ultrez-10 (0.5%, 0.8%, 1.0%, 1 5%). Physical and chemical properties of hydrophilic bases samples were studied under methods of the State Pharmacopoeia of Ukraine.

Results. As a result of physical, chemical and organoleptic study 7 samples of gel bases samples containing methylcellulose were excluded in the first phase of the study. Subsequent studies on carbopol gels based on Ultrez-10 NF showed 1% concentration to be optimal from a technological point of view.

Conclusions. Based on the findings of the study aimed at creating a soft dosage form with ibuprofen as a helling agent, carbomer brand Ultrez-10 NF was chosen.

Key words: osteoarthritis, gel, ibuprofen, hydrophilic bases.

Відомості про автора:

Зубченко Тамара Миколаївна – к. фарм. н., доцент кафедри аптечної технології ліків НФаУ. Адреса: Харків, вул. Валентинівська, 4.