

**Дослідження з метою розробки таблеток на основі
екстракту листя аїру звичайного**

Андрюшаєв О. В., Рубан О. А., Маслій Ю. С.

Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

Linuks454@gmail.com

В останні роки науковці з усього світу велику увагу приділяють дослідженню терапевтичного потенціалу сировини Аїру звичайного (*Аcorus calamus*). Хоча історія використання цієї лікарської рослини (ЛР) бере свій початок ще з давніх часів, сучасні дослідження викривають нові можливості лікарської рослинної сировини (ЛРС) аїру з точки зору лікувальних властивостей.

На фармацевтичному ринку України зареєстровано 20 препаратів, до складу яких входить аїр звичайний. Ця сировина посилює ноотропну та адаптогенну дію лікарських засобів (ЛЗ), виявляє протизапальну та антибактеріальну активність. Особливе значення мають препарати “Вікаїр”, “Вікалін”, “Поліфітол”, “Гастрофіт” і “Детоксифіт”, які є ефективними засобами для профілактики та лікування патологій шлунково-кишкового тракту. Важливо зазначити, що у виробництві цих ЛЗ використовуються виключно підземні органи аїру звичайного, хоча ряд дослідників вказує на майже повну ідентичність якісного складу біологічно активних речовин (БАР) кореневищ та листя цієї ЛР. Нехтування надземними частинами рослини призводить до нераціонального використання її природного ресурсу та зменшення ареалу виду.

Зважаючи на потенціал листя аїру звичайного, а також на вищезазначені наукові проблеми, на базі кафедри ботаніки Національного фармацевтичного університету були проведені експериментальні дослідження з визначення раціонального способу вилучення БАР із ЛРС, вивчення фармакологічної активності одержаного витягу та розробка методик контролю його якості. Визначено оптимальний ступінь подрібнення листя (0,5-1 мм) та час екстракції (4 год). Розроблений спосіб екстракції заснований на методі дробної мацерації 70 % етанолом в якості екстрагенту із використанням ультразвуку, який забезпечував вихід майже 80% флавоноїдів із ЛРС.

За даними різних літературних джерел, у рідкому середовищі під дією ультразвуку виникає знакозмінний звуковий тиск, який зменшує динамічну в'язкість полярних рідин, а також призводить до розгалуження та збільшення за розміром і глибиною мікротріщин і пор, наявних у твердій фазі. Це, своєю чергою, сприяє кращому проникненню рідини у пори ЛРС та, відповідно, більш повній і швидкій екстракції з неї БАР.

Оскільки нами було обрано конкретний напрям роботи – розробка таблеток з

екстрактом листя айру звичайного, основним питанням у нашому дослідженні є визначення раціонального способу його введення у тверду лікарську форму (ТЛФ). Це, відповідно, вимагає використання різних допоміжних речовин та технологічних прийомів.

Однією з перепон на шляху розробки препарату у формі таблеток є властивість екстрактів адсорбувати вологу (гігроскопічність). Для вирішення цієї проблеми необхідно підібрати ефективний носій-вологорегулятор, який завдяки механізмам адсорбції БАР або надлишкової вологи забезпечує стабільність активних компонентів у препараті відносно вологи зовнішнього середовища. За даними наукової літератури з цією метою найбільш часто використовують мікрокристалічну целюлозу із низьким вмістом вологи (МКЦ-103, 200), магнію алюмометасилікат, двоосновний безводний фосфат кальцію, ізомальтит, циклодекстрин, аеросил та ін. Введення цих речовин можливе на різних етапах виробництва, але найбільш раціональним способом на сьогодні є їх додавання на етапах згущення та/або сушіння екстракту. Відомо, що підвищений вологовміст таблеткової маси може призвести до погіршення її текучості та можливого прилипання до прес-інструментів, тоді як занадто сухий матеріал може мати незадовільну здатність до пресування. У цьому випадку, за необхідності, проводять корекцію складу суміші для пресування із введенням інших допоміжних речовин.

З метою покращення зчеплення частинок порошку та одержання якісних таблеток необхідним є використання ексципієнтів з групи зв'язувальних речовин, до яких належать: похідні целюлози (карбоксиметилцелюлоза, оксиетилцелюлоза, оксипропілметилцелюлоза), полівінілпіролідон, крохмаль, альгірати та ін., які додають у таблеткову масу як у сухому вигляді, так і у вигляді розчинів.

Для забезпечення необхідного часу розпадання і режиму розчинення ТЛФ, та, відповідно, високої біодоступності препарату, до таблеткової маси додають розпушувачі. У сучасному виробництві цю роль грають такі речовини, як полівінілпіролідон різних марок, різні види крохмалів, натрію крохмальгліколят, ультраамілопектин, зшита форма натрію карбоксиметилцелюлози, кроскармелоза та ін.

Корекція показників текучості має особливе значення у рамках розробки ТЛФ на основі рослинних екстрактів. З цією метою використовують антифрикційні речовини, які зменшують тертя, яке розвивається в контактних зонах частинок із прес-інструментом таблеткової машини, та попереджають прилипання гранул або порошків до стінок матриці і пуансонів. До антифрикційних речовин належать похідні стеаринової кислоти (кальцію і магнію стеарат), крохмаль, тальк, аеросил та деякі високомолекулярні сполуки (полісорбат-80, поліетиленгліколі з високою молекулярною масою).

Отже, наведені матеріали будуть використані на наступних етапах фармацевтичної розробки таблеток на основі екстракту листя айру звичайного.