

ВИВЧЕННЯ ВПЛИВУ ДОПОМІЖНИХ РЕЧОВИН НА ВЛАСТИВОСТІ ТАБЛЕТОК АТЕНОЛОЛУ

Ляпунова О.О., Суконкіна І.М.

*Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна
ksalex@i.ua*

Пероральний спосіб введення є одним із найбільш поширених у клінічній практиці, тому препарати пероральних лікарських форм із модифікованим вивільненням мають велике клінічне значення і характеризуються дуже великою різноманітністю.

Пероральні лікарські форми із модифікованим вивільненням об'єднують не тільки ті, що забезпечують сповільнене або пролонговане вивільнення активного фармацевтичного інгредієнта, а й більш складні за кінетикою вивільнення системи доставки. При створенні лікарської форми із модифікованим вивільненням враховують багато факторів лікарського препарату, а саме: умови всмоктування у шлунково-кишковому тракті; місце, швидкість і механізм всмоктування; розчинність у шлунково-кишковому середовищі; особливості фармакокінетики (наявність пресистемного метаболізму, взаємозв'язок швидкості всмоктування з концентрацією препарату в плазмі крові); особливості фармакодинаміки (зв'язок концентрація - ефект, імовірність розвитку толерантності при постійному надходженні його в організм). Шлунково-кишковий тракт представляє великий діапазон перешкод для лікарських засобів, що призначають внутрішньо: морфологічні бар'єри (шар слизу, мікроворсинки і тому подібне), фізіологічні бар'єри (рН, ферменти, специфічний транспорт, час транзиту), які обмежують всмоктування. Для всмоктування важко- або повільно розчинних лікарських засобів необхідний більш тривалий час для розчинення у шлунку, ніж тривалість фізіологічного транзиту через шлунок. Для всмоктування високоліпофільних лікарських засобів, важкорозчинних у водному середовищі шлунково-кишкового тракту, також необхідні спеціальні лікарські форми, що забезпечують їх дисперсію у водному середовищі. З метою підвищення всмоктування важкорозчинних лікарських засобів застосовують декілька технологій: солідні дисперсії активного фармацевтичного інгредієнта, мікрочастинки для збільшення площі поверхні, системи носіїв (полімерний міцелій, мікроемульсії та інше). Лікарські форми із модифікованим вивільненням дозволяють вирішувати всі основні задачі: змінювати швидкість і тривалість вивільнення активного фармацевтичного інгредієнта, місце вивільнення активного фармацевтичного інгредієнта, а також інтенсивність терапевтичного ефекту лікарського засобу. Крім того, пероральні системи доставки лікарського засобу мають додаткові властивості: захист лікарського засобу від деградації в шлунково-кишкового тракті під впливом соляної кислоти та травних ферментів, збільшення тривалості транзиту у верхніх відділах шлунково-кишкового тракту, покращення проникності через епітеліальні бар'єри.

Метою нашого дослідження було вивчення впливу допоміжних речовин на властивості таблеток атенололу, а також розробка складу та технології таблеток атенололу.

Ми планували провести експериментальне вивчення властивостей субстанції атенололу, вивчити форму і розмір часток, технологічні характеристики.

На підставі вивчених технологічних характеристик субстанції і теоретичних обґрунтувань встановити принципову можливість розробки оригінального складу таблетованих лікарських форм атенололу.

Вибрати метод отримання таблетованих лікарських форм з використанням вивченої субстанції.

Дослідити структурно-механічні характеристики розроблених твердих дозованих лікарських форм, вивчити вплив технологічних чинників на показники якості таблеток.

Експериментально обґрунтувати оптимальну промислову технологію виробництва препарату атенолол.

Вивчити якісні показники таблеток Атенлолу, отриманих за розробленою промисловою технологією і порівняти з препаратом, що випускається.

Було вивчено ряд допоміжних речовин і обрані найбільш оптимальні для створення якісного лікарського препарату. Також нами були розроблені склад і технологія таблеток атенололу і зроблений порівняльний аналіз розроблених таблеток з тими, що випускаються промисловістю.

У даний час у нас в країні та за кордоном розробляються і випускаються різні види твердих лікарських форм пролонгованої дії від більш простих таблеток, гранул, драже, спансул до більш складних таблеток що імплантуються, таблеток системи "Oros", терапевтичних систем з саморегуляцією. При цьому необхідно відзначити, що розвиток лікарських форм пролонгованої дії пов'язаний з широким використанням нових допоміжних речовин, у тому числі полімерних сполук.