

**Министерство здравоохранения СССР**

**Главное аптечное управление**

**Научное общество фармацевтов**

**СОВРЕМЕННЫЕ ПРОБЛЕМЫ**

**ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЙ НАУКИ И ПРАКТИКИ**

**(тезисы докладов II съезда фармацевтов Украинской ССР)**

**Киев - 1972 г.**

Р А В Д Е Л Ш. МЯГКИЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ФОРМЫ  
И АЭРОЗОЛИ

БИ) ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ АСПЕКТЫ ЛЕКАРСТВЕННОЙ ФОРМЫ "МАЗИ"

И.М.Парцев, Г.С.Бешура, М.Т.Алюшин, Д.П.Сало, А.Ф.Пиминюв,  
А.Е.Добротворский

Харьковский научно-исследовательский химико-фармацевтический институт, Харьковский фармацевтический институт, Центральный аптечный научно-исследовательский институт

Многочисленными исследованиями последних лет установлено большое количество факторов, влияющих на фармакодинамическую активность лекарственных веществ в мазях. К числу этих факторов относятся свойства лекарственных веществ, основ, эмульгаторов и других добавок, их концентрация, характер взаимодействия вспомогательных веществ с лекарственными веществами, способ приготовления и применения мазей и т.д.

В настоящее время установлен примерно следующий ряд основ по их способности в порядке убывания отдавать (резорбировать) лекарственные вещества: водорастворимые (полиэтиленгликолевые, метилцеллюлозные гидрогели), водосмываемые (бентонитовые, эмульсионные типа м/в), эмульсионные типа в/м, абсорбционные, гидрофобные (растительные и животные жиры, силиконовые безводные, углеводородные). Выбор соответствующей основы зависит от свойств применяемых лекарственных веществ, от их растворимости, степени дисперсности и других факторов.

Установлено, что резорбция растворимых в основе препаратов происходит немного лучше, чем суспендированных. Так, если различная растворимость салициловой кислоты и натрия салицилата не оказывает влияния на диффузию из гидрофобных мазевых основ, то она существенно влияет на их диффузию из гидрофильных основ.

Многие исследователи предлагают избегать инкорпорирования водорастворимых лекарственных веществ в жировые, углеводородные и даже в эмульсионные типы в/м основы, требуя обязательного применения для них основ водорастворимых или эмульсионных типов м/в.

В гидрофобной основе водорастворимое лекарственное вещество образует суспензию и на скорость его выделения будет оказывать влияние способности вещества к гидратации потом. В эмульсионной основе типа в/м водорастворимое лекарственное вещество, находясь в водной фазе, оказывается как бы изолированным от кожи слоем липофильной среды. Выделение его будет зависеть от степени разрушения эмульсионной системы и способности ее к гидропроницаемости. Поэтому выделение лекарственного вещества из такой среды происходит в ограниченных размерах. Напротив, из эмульсионной основы типа м/в водорастворимые вещества выделяются хорошо, т.к. они находятся в водной дисперсионной среде, не имеющей фазовой границы с кожей. Вещества, адсорбирующиеся или вступающие в химическое взаимодействие со структурными единицами основы, выделяются более медленно. Не исключается влияние на процесс абсорбции кожей и таких факторов, как размеры молекул лекарственных веществ, вязкости, гидратации, температуры и времени контакта вещества кожей.

В отношении влияния воды основы на диффузию нерастворимых (суспендированных) в основе веществ в литературе имеются проти-

ворочивые сведения. Однако, бесспорно, установлен факт зависимости диффузии таких веществ от степени их дисперсности. С уменьшением размера частиц твердой фазы улучшаются условия для их растворения в секретах кожи или ран, что и создает условия для повышения резорбции. Настоятельной необходимостью с точки зрения биофармации является установление норм степени дисперсности суспензионных мазей.

При изготовлении суспензионных мазей на эмульсионных основах особое значение приобретает выбор технологического метода. Здесь возможны самые различные варианты: суспендирования твердой фазы с уже готовой эмульсионной основой или предварительное суспендирование ее с гидрофильной или липофильной фазой или средой. Частицы твердой фазы в этих случаях располагаются на поверхности раздела эмульгированной фазы или оказываются включенными внутрь фазы, что должно оказывать различный терапевтический эффект.

Включение твердого нерастворимого вещества в эмульгированную масляную фазу в случае эмульсионных основ типа м/в дает возможность замедлить и пролонгировать действие суспендированного вещества и уменьшить его раздражающее действие.

Биофармацевтические исследования последних лет со всей очевидностью подтверждают тот факт, что для каждого лекарственного вещества может быть установлен оптимум концентрации, за пределами которого повышение ее не будет приводить к заметному увеличению скорости диффузии, ниже которого диффузия будет резко уменьшаться. Это имеет большое практическое значение для выявления максимально эффективной концентрации лекарственных веществ.