

ОБҐРУНТУВАННЯ СКЛАДУ АНТИАДГЕЗІЙНИХ КОМПОНЕНТІВ У ТАБЛЕТКАХ З ГУСТИМ ЕКСТРАКТОМ ЛИСТЯ БЕРЕЗИ БОРОДАВЧАСТОЇ

Чумак О.О., Безрукавий Є.А.

Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

Вступ. Рослини завжди служили в якості джерела нових фармацевтичних продуктів і недорогих вихідних матеріалів для синтезу деяких відомих лікарських засобів. Природні продукти та їх похідні є основою більше 50% препаратів в клінічній практиці в світі. При використанні препаратів рослинного походження є можливість тривалого їх використання оскільки вони рідше викликають ускладнення, особливо алергічні реакції, на відміну від синтетичних препаратів, тому їх можна призначати для тривалого застосування з завданням мінімального негативного впливу на організм хворого завдяки м'якій терапевтичній дії, невеликій кількості протипоказань поряд з високою ефективністю, що виправдовує їх широке використання при лікуванні різних захворювань. Компоненти з рослинної сировини за хімічною структурою подібні або навіть ідентичні фізіологічно активним речовинам організму людини. Тому препарати рослинного походження більш фізіологічно включаються в біохімічні процеси людського організму, ніж хімічні, чужі для організму, синтетичні ліки. Однак, не дивлячись на незаперечні переваги, попит на вітчизняні фітопрепарати перевищує їх наявність, що пояснює актуальність розробки нових препаратів на основі лікарської рослинної сировини, в тому числі для застосування в урології.

Сечокам'яна хвороба та запальні захворювання сечовидільної системи останнім часом набувають великого значення оскільки погане екологічне становище та вживання в їжу неякісних продуктів харчування і води призводить до збільшення хворих на пієлонефрит, цистит, уретрит та сечокам'яну хворобу. Тільки сечокам'яною хворобою страждає близько 15% населення. Тому розробка нових вітчизняних лікарських засобів для лікування порушень сечовидільної системи є актуальним завданням.

Особливу увагу серед рослин, які містять у своєму складі поліфеноли, слід приділити березі бородавчастій (*Betula verrucosa*), листя цієї рослини містить значну кількість флавоноїдів. Густий екстракт з листя берези виявляє протизапальні властивості, виражену гіпоазотемічну дію, зменшує набряк нирок при гострій нирковій недостатності та сприяє виведенню сечових конкрементів.

При розробці технології виробництва таблетованих лікарських засобів постає питання використання антиадгезійних компонентів, які відіграють важливу роль у виробництві твердих лікарських форм. При роботі сучасних високопродуктивних таблеткових пресів виникає тертя між боковою поверхнею таблетки і матрицею, що призводить до розігріву останньої. В наслідок цього погіршуються технологічні характеристики таблетмаси і підвищується реакційна здатність її компонентів. Тому в даних випадках слід використовувати антиадгезійні добавки, які знижують тертя до припустимого рівня.

Для отримання швидкорозчинних (шипучих) таблеток слід обирати

антиадгезійні добавки, які разом з хімічною індиферентністю володітимуть добрими змащувальними, ковзними властивостями і при цьому добре розчинятимуться у воді.

Мета дослідження. Залежно від концентрації антиадгезійних компонентів у масі для таблетування, оцінити здатність знижувати тертя між таблеткою та матрицею шляхом вимірювання тиску виштовхування таблеток з матриці, визначити вплив антиадгезійних компонентів на стійкість таблеток до роздавлювання, текучість гранулятів та розпадання.

Матеріали та методи. У даній роботі було досліджено антиадгезійні добавки, які найбільш часто використовуються у технології швидкорозчинних (шипучих) таблеток: макрогол 6000, макрогол 4000, гліцин, кислота фумарова. Ці речовини добре розчиняються у воді, фармакологічно індиферентні та мають добрі змащувальні і ковзні властивості.

Визначення сили пресування та тиску виштовхування таблеток з матриці проводили на лабораторному гідравлічному пресі за зусиллями на поверхні пуансонів. Вимірювання текучості проводили за методом лійки з вібропристроєм на приладі Pharma Test, діаметр отвору лійки якого складає 12 мм.

Основні результати. Першим етапом дослідження стало визначення текучості гранулятів у залежності від концентрації антиадгезійних компонентів. Наступним етап – вимірювання тиску виштовхування таблеток з матриці в залежності від концентрації антиадгезійних речовин в масі для таблетування.

Аналіз даних показує, що кислота фумарова і гліцин, з одного боку, надають гранулятам найкращі показники текучості, але разом з тим, мають найнижчі показники міцності і за зовнішнім виглядом не відповідали вимогам – сколи та тріщини на поверхні таблеток та фасках. Гліцин виявив найгірші змащувальні властивості на відміну від кислоти фумарової, яка показала найкраще зниження тиску виштовхування таблеток з матриці. Випробування таблеток на розпадання витримали всі зразки таблеток – час розпадання усіх зразків знаходився у межах 3 хвилин. Найбільш оптимальні показники за всіма дослідженнями показали макроголи 4000 та 6000. При задовільних показниках текучості вони показали високу антиадгезію здатність. Найбільш оптимальними антиадгезійними властивостями володіє макрогол 4000, при цьому найінтенсивніше зниження тиску виштовхування таблеток з матриці проходило до 4% його вмісту. Задовільними змащувальними властивостями володіє макрогол 6000, але при концентрації 6%.

Висновки. Для визначення оптимального складу антиадгезійних добавок для отримання шипучих таблеток з густим екстрактом листя берези бородавчастої було використано гідрофільні змащувальні речовини (макроголи 4000 та 6000, гліцин, кислота фумарова), серед яких оптимальні показники за всіма дослідженнями показали макроголи 4000 та 6000. За результатами досліджень у якості антиадгезійного компонента для отримання таблеток з густим екстрактом листя берези бородавчастої було обрано макрогол 4000, який виявив високу антиадгезію здатність, при цьому, найінтенсивніше зниження тиску виштовхування таблеток з матриці проходило при концентрації макроголу 4000 до 4% у таблетковій масі.