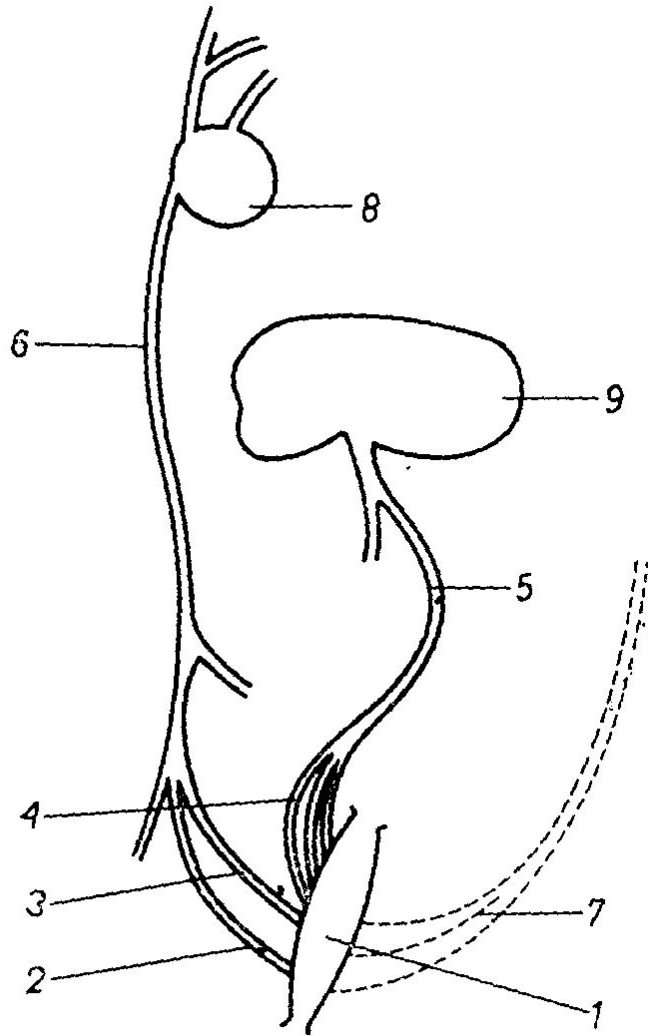


Ректальные лекарственные формы. Суппозитории как лекарственная форма. Суппозиторные основы.

к.ф.н. доц. Маринина Т.Ф.

Пути абсорбции лекарственных средств из прямой кишки

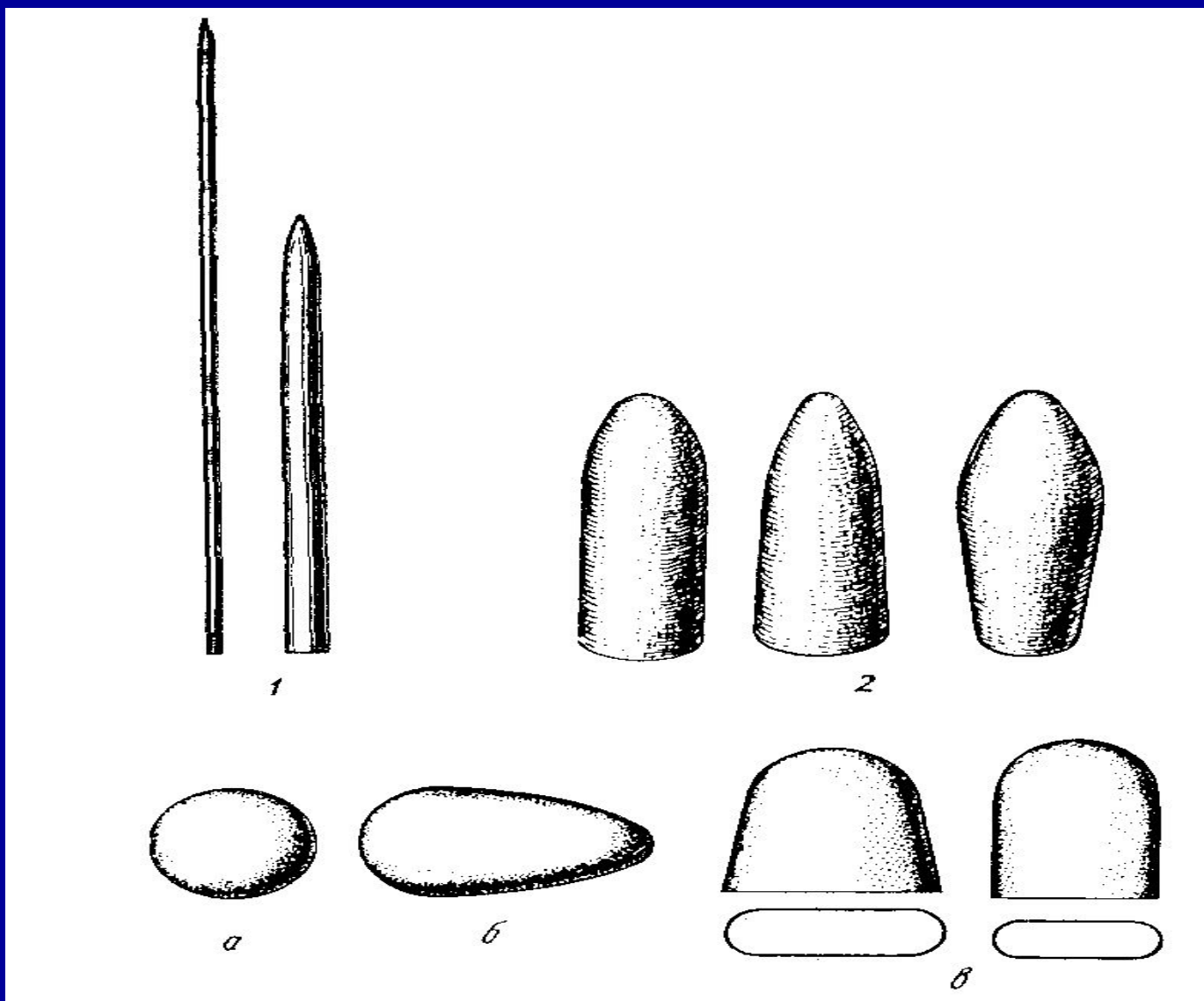


- 1- прямая кишки,
- 2 - нижние ректальные вены
- 3- средние ректальные вены
- 4 — верхняя ректальная вена
- 5 — вторичная вена,
- 6 — нижняя полая вена,
- 7 — лимфатический проток,
- 8 - сердце,
- 9 - печень

Суппозитории (Suppositoria)- твердые при комнатной температуре и расплавляющиеся или растворяющиеся при температуре тела дозированные лекарственные формы для введения в полости тела

Формы суппозиторий а, б, в- вагинальные суппозитории

1- палочки. 2- ректальные



Технологические требования к основам.

Основы должны:

- ❖ обеспечивать химическую и физическую стабильность в процессе изготовления и хранения суппозиториев;
- ❖ иметь способность легко формоваться и сохранять необходимую твердость при введении;
- ❖ обладать способностью эмульгировать необходимое количество водных растворов;
- ❖ иметь определенные структурно-механические критерии пластичности, вязкости, деформации и т. п.;
- ❖ иметь четкую температуру плавления в небольшом интервале температур без стадии размягчения;
- ❖ быстро затвердевать, быть технологичными, легко формоваться, выливаться, прессоваться.

Липофильные основы

Масло какао (Oleum Cacao seu Butyrum Cacao) получают из семян какао (Theobroma Cacao, Sterculiaceae). Представляет собой плотную однородную массу желтоватого цвета со слабым ароматным запахом и приятным вкусом. Оно относится к твердым растительным жирам и представляет собой триглицериды высших жирных кислот пальмитиновой, олеиновой, лауриловой, стеариновой, арахидоновой.

В качестве основ используют Massa Estarinum и Witepsol (фирма «Dynamit Nomel Chemical» Великобритания).

В химическом отношении основы **Эстаринум (Massa Estarinum)** иногда упоминается под названием Imhauzen- это смеси моно-, ди- и триглицеридов насыщенных жирных кислот (лауриновой, миристиновой, пальмитиновой, стеариновой). Кислоты получают путем омыления кокосового и пальмового масел.

Основы **Эстарам (Estaram)** и **Суповаис (Supoweiss)** представляют собой полусинтетические глицериды (твердые жиры), состоящие из смеси три-, ди- и моноглицеридов природных жирных кислот.

Основы **Новата (Novata)** РК (температура плавления 31, 0—35,5 °С), Новата РК5-37 (температура плавления 36,0-37,5 °С), Novata PKS (температура плавления 38,0-40,0 °С) выпускаются фирмой «Henkel», Германия. Представляют собой твердые моно-, ди- и триглицериды насыщенных жирных кислот C11- C17.

В Германии выпускаются также основы **Лазупол (Lasupolum)** С, Е, М, состоящие из фталатов цетилового и стеарилового спиртов C12- C20, (температура плавления 34—37 °С) и неионогенного эмульгатора из группы полиэтиленгликолей, образующего эмульсию типа вода/масло.

В Бельгии выпускают жировую основу **Эртикоат (Erticoat)** Н-340 (получают путем фракционирования и гидрогенизирования пальмо-ядрового и соевого масел, температура плавления 35—37 °С).

Аналогом масла какао являются жиры марки Кува (Кува-900), производства голландской фирмы «Loders Crocilaan». Кува-300 представляет собой гидрогенизированный растительный жир на нелауриновой основе из растительных масел (пальмовое, соевое, хлопковое и масло земляного ореха), температура плавления 38 °С.

В промышленном производстве суппозиториев России используется **жировая основа** Горьковского ХФЗ (ФС 42-1622-81), в состав которой входит 30% масла какао, 49—60% гидрированного подсолнечного масла (жир кулинарный «фритюрный») и 10—21% парафина. Основа представляет собой твердую массу желтоватого цвета, жирную на ощупь, с запахом масла какао. Температура плавления $(38 \pm 2) ^\circ\text{C}$.

Ланолевая основа (Basic Lanolum) (ФС-42-1421-80), состоящая из 60—80% ланоля (ланоль представляет собой смесь сложных эфиров фталевой кислоты и высокомолекулярных спиртов, по свойствам близок маслу какао), 10-20% жира кулинарного «фритюрного» и 10—20% парафина. Основа представляет собой твердую однородную воскоподобную массу белого или с желтоватым оттенком цвета и своеобразным запахом. Температура плавления 35,5-37,5 °С.

На Украине производят **твердый кондитерский жир (Solides Adeps)** ФС 42-1117-86 на пальмоядровой основе и на основе пластифицированного саломаса — типов А, В, С, Е, отличающихся содержанием эмульгаторов (тип А — без эмульгатора, тип В содержит до 5% эмульгатора Т-1, тип С - до 5% эмульгатора Т-2, тип Е — до 5% спиртов шерстного воска). Solides Adeps представляет собой твердую основу от белого до светло-желтого с кремоватым оттенком цвета, со специфическим запахом. Температура плавления от 33 до 36 °С,

Твердый жир кондитерский тип А рекомендуется для изготовления суппозиторий, содержащих липофильные лекарственные вещества, а также суппозиторий для детей. Тип В рекомендуется для изготовления суппозиторий, содержащих водо- и жиронерастворимые порошкообразные лекарственные вещества и жидкие экстракты. Применяют также различные гидрогенизированные растительные масла в комбинации с эмульгаторами.

Основа ГХМ-5Т (сплав гидролизованного хлопкового масла с 5% эмульгатора Т-2). Температура плавления 36—37 °С.

Основа ГАМ-3Т является сплавом гидролизованного арахисового масла с 3% эмульгатора Т-2.

Суппорин-М (Supporinum-M) ВФС 42-173-98 представляет собой сплав 95%-го масла хлопкового гидрогенизированного (кондитерский жир по ГОСТ 28414-89) и 5%-го эмульгатора Т-2 (ФС 42-2689-96). Температура плавления 34—36 °С.

Гидрофильные (водорастворимые) основы

Желатино-глицериновая основа (*Massa gelatinosa*).

Основу готовят из желатина, глицерина и воды. Состав по ГФ Х: желатин — 1 ч., вода — 2 ч., глицерин — 5 ч.

Мыльно-глицериновая основа, свечи с глицерином (*Massa Sapo-glycerinata, Suppositoria cum glycerino*).

Полиэтиленоксиды (ПЭО) (Polyaetylenoxyda)- продукты полимеризации окиси этилена, общей формулы $\text{H}(\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2)_n\text{OH}$, где n от 3 до 325. В России выпускают ПЭО различной степени полимеризации с молекулярной массой (Мм) от 400 до 6000. За рубежом производят ПЭО с Мм от 200 до 6000, 20 000, 40 000 и более.

В США эти основы известны под названием Carbowax, во Франции - Scurol, в Германии – Postonal.

Дифильные основы

Дифильные основы представлены основами, содержащими гидрофильную и гидрофобную части. Получают основы из ПЭО-400, ПЭО-1500 и ГХМ-5Т. В качестве связующего компонента используют твин-80. Для получения агрегативно-устойчивых композиций применяют аэросил. По физико-химическим показателям основы соответствуют требованиям, предъявляемым к суппозиторным основам.

Витепсол (Witepsol) представляет собой смесь моно-, ди- и три-глицеридов растительных кислот C_{12} — C_{18} . Основная часть — триглицериды лауриновой кислоты. Выпускаются группы основ H, W, S, E отличающиеся физико-химическими свойствами.

Витепсол H-15, W-35 (ВТУ № 3-95) - белая твердая хрупкая легко плавящаяся масса без вкуса, без запаха, температура плавления 33,5- 35,5 °C.

**Благодарю за
внимание !**