

**Лекарственная форма.
Вспомогательные
вещества используемые
в изготовлении ЛФ.
Название
лекарственных средств.**

Выполнила: Димова Валерия 306 гр.

- **Лекарственная форма** — это придаваемое лекарственному средству удобное для применения состояние (порошок, раствор, мазь, таблетки и т.д.), при котором достигается необходимый лечебный эффект. Изготовление лекарственных форм из лекарственных средств обычно сопровождается приданием им определенных геометрических форм, которые подбираются таким образом, чтобы обеспечить максимальное терапевтическое действие средства и удобство применения. Для изготовления лекарственных форм необходимы, помимо лекарственного средства, еще дополнительные компоненты — **вспомогательные вещества**.
- **Вспомогательное вещество** — это дополнительное вещество, используемое для изготовления лекарственной формы, разрешенное для медицинского применения с целью получения лекарственной формы, придания или сохранения определенных свойств лекарственного препарата.
- Вид лекарственной формы определяется в соответствии с назначением, путями введения в организм, дозами и учетом физико-химических и фармакологических свойств лекарственных средств.

Можно выделить следующие группы классификации лекарственных форм:

- Классификация лекарственных форм по агрегатному состоянию.
- Классификация лекарственных форм в зависимости от способа применения или метода дозирования.
- Классификация лекарственных форм в зависимости от способа введения в организм.

Классификация лекарственных форм по агрегатному состоянию

- **Твердые.**
- **Мягкие.**
- **Жидкие.**
- **Газообразные.**

Твердые лекарственные формы

- **Таблетки** – дозированная лекарственная форма, получаемая путем прессования или формирования лекарственного средства, лекарственных смесей и вспомогательных веществ;
- **драже** – дозированная лекарственная форма округлой формы, получаемая путем многократного наслаивания лекарственных средств и вспомогательных веществ в гранулы;
- **Гранулы** – однородные частицы (крупинки, зернышки) лекарственных средств округлой, цилиндрической или неправильной формы размером 0,2 – 0,3 мм.;
- **Порошки** – лекарственные формы, обладающие сыпучестью; различают порошки простые (однокомпонентные) и сложные (из двух и более компонентов), разделенные на отдельные дозы и неразделенные;
- **Сборы** – смесь нескольких видов изрезанного, истолченного в крупный порошок или цельного лекарственного сырья растений – иногда с добавлением других лекарственных средств;
- **Капсулы** – дозированные порошкообразные, гранулированные, иногда жидкие лекарственные средства, заключенные в оболочку из желатина, крахмала, иного биополимера;
- **Спансулы – капсулы**, в которых содержимым является определенное количество гранул или микрокапсул;
- **Карандаши лекарственные (медицинские)** – цилиндрические палочки толщиной 4-8 мм и длиной до 10 см с заостренным или закругленным концом;
- **Пленки лекарственные** – лекарственная форма в виде полимерной пленки.

Мягкие лекарственные формы.

- **Мази** – лекарственные формы мягкой консистенции для наружного применения; при содержании в мази порошкообразного вещества свыше 25% мази называют пастами;
- **Пластыри** – лекарственная форма для наружного применения в виде пластичной массы, обладающей способностью после размягчения при температуре тела прилипать к коже; пластыри наносятся на плоскую поверхность тела;
- **Суппозитории (свечи)** – твердые при комнатной температуре и расплавляющиеся при температуре тела дозированные лекарственные формы, предназначенные для введения в полости тела (ректальные, вагинальные свечи); суппозитории могут иметь форму шарика, конуса, цилиндра, сигары и т.д.
- **Пилюли** – дозированная лекарственная форма в виде шарика весом от 0,1 до 0,5 г, приготовленная из однородной пластической массы, содержащей лекарственные средства и вспомогательные вещества; пилюля весом более 0,5 г называется болюсом.

Жидкие лекарственные формы.

- **Растворы** – лекарственные формы, полученные путем растворения одного или нескольких лекарственных средств;
- **Суспензии (взвеси)** — системы, в которых твердое вещество взвешено в жидком и размер частиц колеблется от 0,1 до 10 мкм;
- **Эмульсии** – лекарственные формы, образованные нерастворимыми друг в друге жидкостями;
- **Настои и отвары** – водяные вытяжки из лекарственного растительного сырья или водные растворы экстрактов;
- **Слизи** – лекарственные формы высокой вязкости, а также приготовленные с применением крахмала из водной вытяжки растительного сырья;
- **Линименты** – густые жидкости или студнеобразные массы;
- **Пластыри жидкие** – при нанесении на кожу оставляют эластичную пленку;
- **Сиропы лекарственные** – раствор лекарственного вещества в густом растворе сахара;
- **Настойки** – спиртовые, водно-спиртовые или спирто-эфирные прозрачные извлечения из лекарственного растительного сырья, полученные без нагревания и удаления экстрактов;
- **Экстракты** – концентрированные извлечения из лекарственного растительного сырья; различают жидкие, густые, сухие и другие виды экстрактов.

Газообразные лекарственные формы.

- **Аэрозоль** – лекарственная форма в специальной упаковке, в которой твердые или жидкие лекарственные средства находятся в газе или газообразном веществе;

Классификация лекарственных форм в зависимости от способа применения или метода дозирования.

- Капли.
- Микстуры.
- Таблетки.
- Примочки.
- Припарки.
- Промывания.
- Пудры.
- Присыпки.
- Полоскания.
- Капли — жидкие лекарственные формы, предназначенные для приема в виде капель в полость рта, в глаза, уши и т.д.
- Микстуры — жидкие лекарственные формы для внутреннего применения, дозируемые столовой, десертной или чайной ложками.
- Некоторые лекарственные формы называют полосканиями, примочками, припарками, промываниями, пудрами, присыпками.

Классификация лекарственных форм в зависимости от способа введения в организм.

- **Энтеральные.**
- **Парентеральные.**
- **Энтеральные — формы, вводимые в организм через желудочно-кишечный тракт (через рот, прямую кишку).**
- **Парентеральные — формы, вводимые, минуя желудочно-кишечный тракт, путем нанесения на кожу и слизистые оболочки организма; путем инъекций в сосудистое русло (артерию, вену), под кожу или мышцу; путем вдыхания, ингаляций.**

Вспомогательные вещества

- - это дополнительные вещества, необходимые для приготовления лекарственного препарата. Создание эффективных лекарственных препаратов требует применения большого числа вспомогательных веществ. До недавнего времени ко вспомогательным веществам предъявляли требования фармакологической и химической индифферентности. Однако выяснилось, что эти вещества могут в значительной степени влиять на фармакологическую активность лекарственных веществ: усиливать действие лекарственных веществ или снижать их активность, изменять характер действия под влиянием разных причин, а именно комплексообразования, молекулярных реакций, интерференции и др.

- 
- **В основе классификации вспомогательных веществ лежит ряд признаков:**
 - **1) природа (в том числе химическая структура);**
 - **2) влияние на технологические характеристики и фармакокинетику ЛФ.**

Классификация вспомогательных веществ по природе и химической структуре.

- По своей природе вспомогательного вещества можно разделить на:
- а) природные;
- б) синтетические и полусинтетические вещества.

природные вспомогательные вещества:

- + Вспомогательные вещества природного происхождения получают путем переработки сырья, сырья микробного происхождения и минералов. (+) природных вспомогательных веществ: в их высокой биологической безвредности. Сегодня 1/3 вспомогательных веществ приходится на природные. Растительные биополимеры используют в качестве эмульгаторов, стабилизаторов, пролонгаторов и для др. целей при производстве ЛФ.

- - они подвержены высокой микробной контаминации, в связи с чем растворы быстро портятся. Использование стерилизации и добавление консервантов может снизить до предельно допустимых норм микробную контаминацию природных вспомогательных веществ.

Природные вспомогательные вещества.

- **Крахмал.** Состоит из 2-х фракций – амилазы и амилопектина. Амилоза растворяется в теплой воде, а амилопектин только набухает. Крахмал используется в твердых ЛФ. В качестве стабилизатора суспензий и эмульсий используется 10% раствор.
- **Альгинаты** – кислота альгиновая и ее соли. Кислота альгиновая – ВМС, получается из морских водорослей. Используется в качестве разрыхляющих, эмульгирующих, йрологирующих, пленкообразующих вспомогательных веществ, а также для приготовления мазей и паст.
- **Агароид.** В состав входят глюкоза и галактоза, а также минеральные элементы (Ca, Mg, S и др.). Получают из морских водорослей. В 0,1% концентрации обладает стабилизирующими, разрыхляющими и скользящими свойствами, в смеси с глицерином в 1,5% концентрации используется в качестве мазевой основы.
- **Пектин** – входит в состав клеточных стенок многих растений. Обладает желатинирующей способностью. Используется для создания детских лекарственных форм.

- **Микробные ПС** – наиболее распространен аубазидан – получаемой при м - б синтезе с помощью дрожжевого гриба *Аureobasidium pullulans*. Аубазидан (0,6%) образует гели, которые используются как основа для мазей, 1% - для пленок и губок. Конц. 0,1 - 0,3% - как пролонгатор глазных капель. При этом раствор устойчив при термической стерилизации до 120°C . Эффективный стабилизатор и эмульгатор.
- **Коллаген**. Источником является кожа крупного рогатого скота. Получают путем щелочно -солевой обработки. Коллаген применяется для покрытия ран в виде пленок с фурацилином, кислотой борной, маслом облепиховым, метилурацилом, а также в виде глазных пленок с а/б.
- **Желатин** – получают при выпаривании обрезков кожи, ВМС белковой природы, содержит гликокол, аланин, аргинин, лейцин, лизин, глютаминовая кислота. Благодаря высоким гелеобразующим свойствам используется для изготовления мазей, желатиновых капсул, суппозиториев.
- **Желатоza** – продукт неполного гидролиза желатина. Не обладает способностью желатинироваться, но имеет высокие эмульгирующие свойства.

- Из неорганических полимеров чаще используются бентонит, аэросил, тальк.
- **Бентонит** – в виде минералов кристаллической структуры размером частиц 0,01 мкм. Имеют сложный состав. Общая формула: $Al_2O_3 \cdot SiO_2 \cdot nH_2O$ (содержит 90% оксидов Al, Si, Mg, Fe, еще катионы K^+ , Na^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} - вступают в ионообменные реакции). Способность к набуханию и гелеобразованию позволяет использовать их в производстве мазей, таблеток, порошков, гранул. Бентониты обеспечивают лекарственным препаратам мягкость, дисперсность, высокие адсорбционные свойства, легкую отдачу лекарственных веществ.
- **Аэросил** – кремния диоксид SiO_2 , очень легкий микронизированный порошок с выраженными адсорбционными свойствами. Применяют для стабилизации суспензий. Загущенную способность аэросила используют при получении гелей для мазевых основ. Адсорбционные свойства используют с целью стабилизации сухих экстрактов (уменьшается их гигроскопичность). В порошках применяют при изготовлении гигроскопичных смесей и как диспергатор.

Синтетические и полусинтетические вспомогательные вещества.

- Особое место в этой группе занимают эфиры целлюлозы. Они представляют собой продукты замещения водородных атомов гидроксильных групп целлюлозы на спиртовые остатки – алкиды (при получении простых эфиров) или кислотные остатки – ацилы (при получении сложных эфиров).
- Метилцеллюлоза растворимая – простой эфир целлюлозы и метанола. Водные растворы МЦ обладают высокой сорбционной, эмульгирующей и смачивающей способностью. В технологии применяют 0,5 – 1% водные растворы в качестве загустителей и стабилизаторов, для гидрофилизации гидрофобных основ мазей и линиментов, в качестве эмульгатора и стабилизатора при изготовлении суспензий и эмульсий, а также как пролонгирующий компонент для глазных капель.
- Другие вещества этой группы: натрий – карбоксиметилцеллюлоза (Na – КМЦ), окипропилметилцеллюлоза и ацетилцеллюлоза.

Классификация вспомогательных веществ **(по влиянию на физико-химические характеристики и фармакокинетику ЛФ).**

- **В зависимости от влияния на физико-химические характеристики и фармакокинетику ЛФ вспомогательного вещества можно разделить на следующие группы: формообразующие, стабилизаторы, пролонгаторы, солюбилизаторы, корригенты.**

Формообразующие вещества.

- Эта группа вспомогательных веществ используется в качестве дисперсионных сред (вода или неводные среды) в технологии жидких ЛФ, наполнителей для твердых ЛФ (порошки, пилюли, таблетки и др.), основ для мазей, основ для суппозиториев. Формообразующие вещества дают возможность создавать необходимую массу или объем, придавать определенную геометрическую форму. Среди дисперсионных сред для приготовления жидких ЛФ наиболее часто используется вода (очищенная или для инъекций) в качестве неводных растворителей – этанол, глицерин, масла жирные, вазелиновое масло, полиэтиленоксид, пропиленгликоль, этилолеат, силиконовые жидкости (эсилоны), бензил – бензоат и др. Для изготовления твердых ЛФ в качестве вспомогательных веществ (нередко их называют наполнителями) используют сахар молочный или белый, крахмал, тальк, порошки лекарственных растений и их экстракты (сухие) и многие другие компоненты в зависимости от вида ЛФ. В технологии мазей в качестве основ наиболее часто применяют вязкопластичные вещества (вазелин, жиры, силиконовые основы и др.); гидрофильные (полиэтиленоксидные, крахмально-глицериновые, растворы МЦ и ее производных). Для изготовления суппозиториев используют вещества и их сочетания как нерастворимые в воде (масло какао, бутироя, масла гидрогенизированные), так и растворимые (желатин, полиэтиленоксиды и др.).

Стабилизаторы.

- **Классификация стабилизаторов:**
- - **физико-химических (дисперсных) систем:**
- **желатоза; производные МЦ; микробные ПС; ПВП; бентониты, твин – 80 и др.**
- - **химических веществ:**
- **вещества, тормозящие гидролитические процессы (кислоты, щелочи, буферные системы); вещества, тормозящие о – в процессы (натрия метабисульфит, тиомочевина, трилон Б и др.)**
- - **противомикробные стабилизаторы (консерванты):**
- **металлорганические соединения; органические соединения (спирты фенолы, кислоты, сложные эфиры, соли четвертичных аммониевых соединений, эфирные масла).**

Солюбилизаторы.

- С целью увеличения растворимости трудно растворимых или не растворимых лекарственных веществ применяются ПАВ, например, твин – 80, желчные кислоты. Эти вещества называются солюбилизаторами.
- **Солюбилизация** – процесс самопроизвольного перехода не растворимого в воде вещества в водный раствор ПАВ. Применение солюбилизаторов позволяет готовить ЛФ с нерастворимыми лекарственными веществами. Это группы а/б, цитостатиков, гормональных препаратов. При использовании твина – 80 получены инъекционные растворы гормонов (взамен таблеток), водные растворы камфары (взамен масляных) и т.д. При этом достигается быстрая и полная резорбция лекарственного вещества, что может привести к снижению дозировки лекарственного вещества. В случае с камфарой водные растворы, назначаемые больным при сердечно-сосудистых заболеваниях, плохо рассасываются и нередко образуют олеомы – опухоли, которых нет при введении водных растворов камфары.

Пролонгаторы.

- **Вспомогательные вещества, увеличивающие время нахождения лекарственных средств в организме, называются пролонгаторами. У лекарственных средств пролонгированного действия увеличена продолжительность действия.**
- **В качестве геля для пролонгированных ЛП чаще используют растворы ВМС различной концентрации, что позволяет регулировать время пролонгирования. К таким веществам относятся МЦ, КМЦ и натрий КМЦ (1%), ПВП, коллаген и др. ВМС. (пример – глазные капли в виде 10% раствора сульфацил – натрия, пролонгированные 1% МЦ).**

Корригенты.

- **Относятся вспомогательные вещества, которые дают возможность исправлять вкус, цвет, запах различных лекарственных веществ. Чаще используют в детской практике. В качестве корригирующих веществ используют природные и синтетические вещества в виде растворов, сиропов, экстрактов, эссенций. Сиропы: сахарный, вишневый, малиновый, солодковый.**
- **Подслащивающие вещества – сахароза, лактоза, фруктоза, сорбит, сахарин. Наиболее перспективный – сорбит, который является еще и консервантом. К корригентам относятся различные ВМС, которые обволакивают лекарственные вещества и вкусовые рецепторы языка – агар, альгинаты, МЦ и пектины. Эфирные масла: мятное, анисовое, апельсиновое.**

НОМЕНКЛАТУРА ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ.

ТИПОВЫЕ ГРУППЫ НОМЕНКЛАТУРНЫХ НАИМЕНОВАНИЙ.

- **В номенклатуре лекарственных средств можно выделить несколько обширных типовых групп наименований, каждая из которых отличается некоторыми общими для входящих в нее наименований особенностями содержания и знаковой формой. Это следующие типовые группы:**

- Наименования лекарственного сырья:
части растений и продукты первичной переработки (камеди, смолы).
- 2. Наименования лекарственных препаратов, представляющих собой вытяжки из растительного сырья (настойки, настои, экстракты и т.д.)
- 3. Тривиальные наименования лекарственных веществ.
- 4. Международные непатентованные наименования (МНН) лекарственных веществ.
- 5. Торговые наименования лекарственных средств (препаратов).
- 6. Фармакопейная (полусистематическая) химическая номенклатура: наименования элементов, оксидов, кислот, солей.

ПЕРВАЯ ТИПОВАЯ ГРУППА: НАИМЕНОВАНИЯ ЛЕКАРСТВЕННОГО СЫРЬЯ И ПРОДУКТОВ ПЕРВИЧНОЙ ПЕРЕРАБОТКИ.

- Наименования фармакологических объектов обычно представляют собой словосочетания, состоящие из двух существительных: первое в именительном падеже единственного числа означает часть, орган или продукт первичной обработки (*herba, folium, oleum, gummi* и т.д.), второе - в родительном падеже единственного числа означает производящее растение. Например:
 - *Herba Passiflorae* - трава страстоцвета
 - *Folium Stramonii* - лист дурмана

- **Латинские и русские наименования органов растений сообщаются в заголовках фармакопеи и на этикетках препаратов единственном числе (за исключением flores -цветки). В некоторых наименованиях продуктов первичной обработки обозначается не растение как таковое, а его плоды (костянка) во множественном числе: oleum Amygdalarum - миндальное масло**

ВТОРАЯ ТИПОВАЯ ГРУППА: НАИМЕНОВАНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ПРЕПАРАТОВ В ВИДЕ ВОДНЫХ, СПИРТОВЫХ ВЫТЯЖЕК ИЗ РАСТИТЕЛЬНОГО СЫРЬЯ

- Эти наименования представляют собой словосочетания. Среди них различают:
- а) наименования лекарственных препаратов, производимых на заводах по стандартному предписанию. Это настойки и экстракты, а также получаемые из них путем смешивания с сахарным сиропом (*sirupus*). В этих названиях не указывается вид сырья, из которого произведено извлечение (*tinctura Convallariae, extractum Belladonnae, sirupus Althaeae*);
- б) наименования настоев и отваров, в которых обязательно указывается вид растительного сырья (*infusum herbae Millefolii, infusum foliorum Sennae, decoctum foliorum Uvaeursi*).

ТРЕТЬЯ ТИПОВАЯ ГРУППА НОМЕНКЛАТУРНЫХ НАИМЕНОВАНИЙ: ТРИВИАЛЬНЫЕ НАИМЕНОВАНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ

- **Лекарственное вещество, или фармацевтическая субстанция – то химическое соединение, полученное методом синтеза, или биологически активное вещество, выделенное в индивидуальном виде (индивидуальное химическое соединение) путем специальной обработки из растительного, минерального, животного сырья, а также из продуктов жизнедеятельности бактерий и грибов.**
- **Наибольшее развитие в XX веке получило синтетическое создание лекарственных веществ. Как правило лекарственному веществу присваиваются два наименования: одно -научное химическое, или систематическое, другое -тривиальное (условное).**

ХИМИЧЕСКОЕ НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ВЕЩЕСТВА

- После установления состава и структуры молекулы органическое вещество описывается соответствующими химическими формулами -рациональной и/или структурной. На этом основании веществу присваивается научное химическое, или систематическое, наименование (лат. *nomenchemicum*, англ. *chemicalname*). Вещество должно иметь только одно научное наименование (название). Оно формулируется в соответствии с правилами Международной номенклатуры органической химии (ИЮПАК). Например: Фармакопейное лекарственное средство *Dimedrolum* - димедрол имеет химическое наименование и структурную формулу: β -
- диметиламиноэтилового эфира бензгидрола гидрохлорид

ТРИВИАЛЬНЫЕ НАИМЕНОВАНИЯ

- **Они по сути дела условные, произвольно сконструированные. За ними нет какой бы то ни было научной классификации, но они удобны для всех субъектов -участников сферы обращения лекарственных средств.**
- **В зависимости от своего правового (юридического) статуса тривиальные наименования активных субстанций могут быть двух видов: патентованное наименование (англ. proprietarname) и непатентованное наименование (англ. nonproprietarname). Патентованное наименование является товарной маркой (англ. trade-mark) и принадлежит на правах интеллектуальной собственности фирме - производителю соответствующей субстанции. Непатентованное тривиальное наименование может использоваться всеми производителями лекарственных средств как общее наименование без каких бы то ни было ограничений, кроме товарных марок. Такое общее наименование (англ. genericname) служит цели идентификации той или иной активной субстанции среди множества наименований других соединений.**

ЧЕТВЕРТАЯ ТИПОВАЯ ГРУППА НОМЕНКЛАТУРНЫХ НАИМЕНОВАНИЙ: МЕЖДУНАРОДНЫЕ НЕПАТЕНТОВАННЫЕ НАИМЕНОВАНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ

- **В условиях весьма запутанной номенклатурной реальности назрела осознанная необходимость обеспечить идентификацию (отождествление) каждого активного лекарственного вещества посредством единого и общепринятого в глобальном масштабе непатентованного наименования.**

ПЯТАЯ ТИПОВАЯ ГРУППА НОМЕНКЛАТУРНЫХ НАИМЕНОВАНИЙ: ТОРГОВЫЕ НАЗВАНИЯ ПРЕПАРАТОВ

- **Торговое (коммерческое) название -это название препарата (готового лекарственного средства), предназначенного для торговли.**
- **Предложенное производителем торговое название должно получить официальное разрешение на его использование. В РФ торговое название присваивается номенклатурной комиссией научного центра экспертизы и государственного контроля лекарственных средств Минздрава РФ. Лекарственное средство с установленным официальным торговым названием должно быть зарегистрировано в соответствии с законодательством. Далее лекарственное средство под присвоенным ему торговым названием заносится в Государственный реестр лекарственных средств**

ШЕСТАЯ ТИПОВАЯ ГРУППА НОМЕНКЛАТУРНЫХ НАИМЕНОВАНИЙ: ХИМИЧЕСКАЯ НОМЕНКЛАТУРА НА ЛАТИНСКОМ ЯЗЫКЕ

- **При прописывании в рецептах лекарственных средств, представляющих собой какие-либо химические соединения (оксиды, кислоты, соли, эфиры и т.д.) врач указывает не формулы и не систематические названия, построенные по международным правилам номенклатуры химических соединений, а полусистематические или тривиальные**
- **Систематические названия, как известно, состояются из слов, специально созданных или выбранных для описания структурных особенностей соединений.**
- **Полусистематические — это такие традиционные названия, в которых лишь некоторые части (слоги) применяются в систематическом смысле (лишь некоторые части названы по какой-либо системе номенклатуры). Например: фосфорная кислота, сульфат цинка и т.д**