

# Полимерные вещества для покрытия таблеток оболочками



Существенно улучшить свойства обычных таблеток и пилюль удалось с использованием в их производстве ряда синтетических полимеров, которые в настоящее время входят практически во все виды таблетированных форм в качестве связующих, пластификаторов, защитных оболочек, пролонгаторов и регуляторов скорости высвобождения препарата.

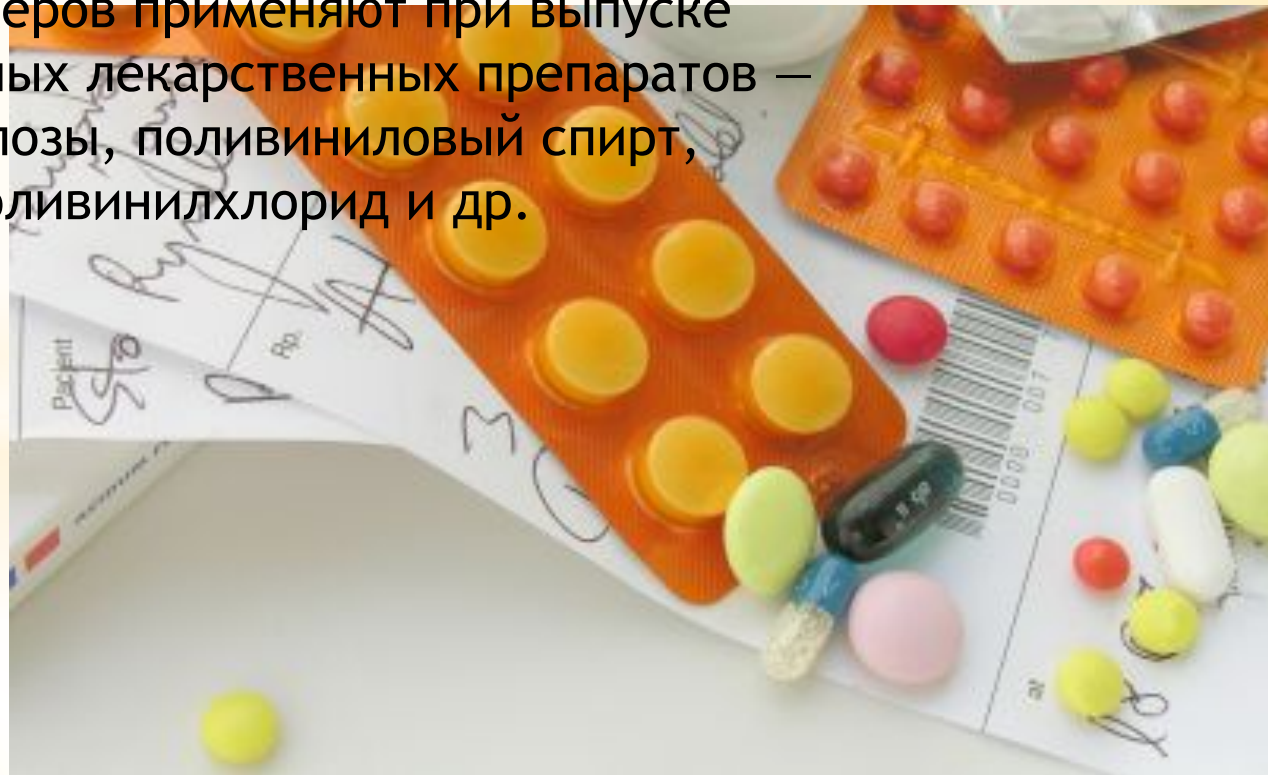


Роль синтетических полимеров в фармации в последние годы быстро возрастает. Если 20–30 лет назад в производстве лекарственных средств находили применение преимущественно природные и реже искусственные полимеры – желатин, крахмал, дестран, производные целлюлозы, то в настоящее время более широко внедряются синтетические высокомолекулярные соединения, применяемые в качестве компонентов лекарственных средств – основ защитных и лечебных мазей, лекарственных пленок, наполнителей и связующих для таблеток, оболочек для микрокапсулированных препаратов, стабилизаторов и эмульгаторов



Полимеры этой группы придают лекарственным средствам ряд важных функциональных качеств: регулируют устойчивость к средам организма, скорость растворения в них, повышают стабильность при хранении и др. В производстве таблеток широкое применение находят производные целлюлозы, поливиниловый спирт, поливинилпирролидон, полиэтиленоксид.

Широкий круг полимеров применяют при выпуске микрокапсулированных лекарственных препаратов — производные целлюлозы, поливиниловый спирт, поливинилацетат, поливинилхлорид и др.

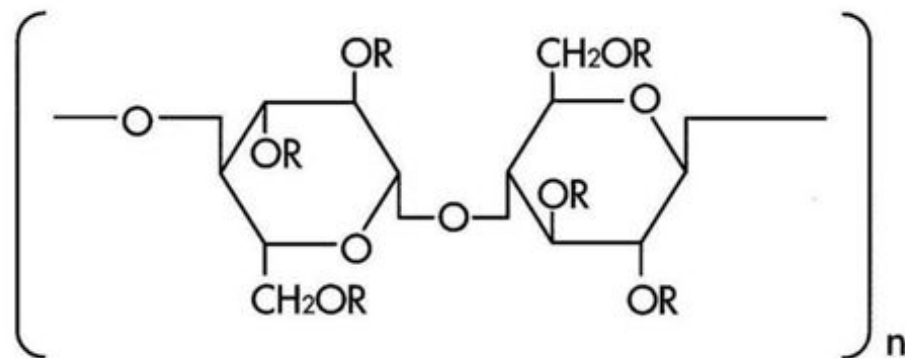


# ГПМЦ-фталат (НРМС-Р, Hypromellose-phthalat) Гидроксипропилметил целлюлоза

ГПМЦ-фталат, является частично этерифицированной гидроксипропилметил целлюлозой, в которой гидроксигруппы замещены на группы фталата. Таким образом, его растворимость зависит от pH растворителя. ГПМЦ-фталаты растворимы в органических растворителях (этанол / ацетон). Фталаты являются функциональными, желудочно-резистентными полимерными покрытиями.

## Применение

ГПМЦ-фталат (ГПМЦ-Р) используется для нанесения кишечнорастворимых покрытий на капсулы, таблетки и гранулы. Высвобождение может варьироваться от требуемого pH, от 5,5 до 5,0. ГПМЦ-фталат растворим во многих органических растворителях.



R = -H

-CH<sub>3</sub>

-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)OH

-COC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>COOH

# ГПМЦ-сукцинат / AQOAT

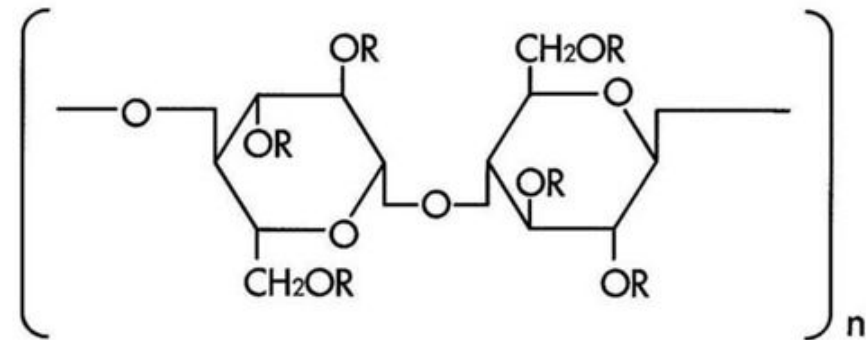
## Гидроксипропилметил целлюлоза-сукцинат

ГПМЦ-сукцинат это частично этерифицированные производные гипромеллозы, в которой остатки янтарной и уксусной кислоты присоединены к главной цепи полимера. Материал может быть использован для кишечнорастворимых пленочных покрытий, или для улучшения растворимости плохорастворимых действующих веществ.

### Применение

Гипромеллоза ацетата сукцинат AQOAT была разработана для водных кишечно-растворимых покрытий. Альтернативный способ напудривания, без использования растворителей, так же возможен при использовании AQOAT.

AQOAT находит все чаще и чаще свое применение в сочетании с липофильными препаратами. Здесь активный ингредиент растворяется вместе с AQOAT, что значительно улучшает его растворимость и тем самым биодоступность.



R = -H

-CH<sub>3</sub>

-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)OH

-COCH<sub>3</sub>

-COCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH

-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)OCOCH<sub>3</sub>

-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)OCOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH

# Этилцеллюлоза (ЭЦ/ЕС)

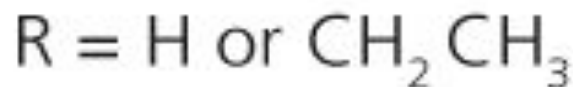
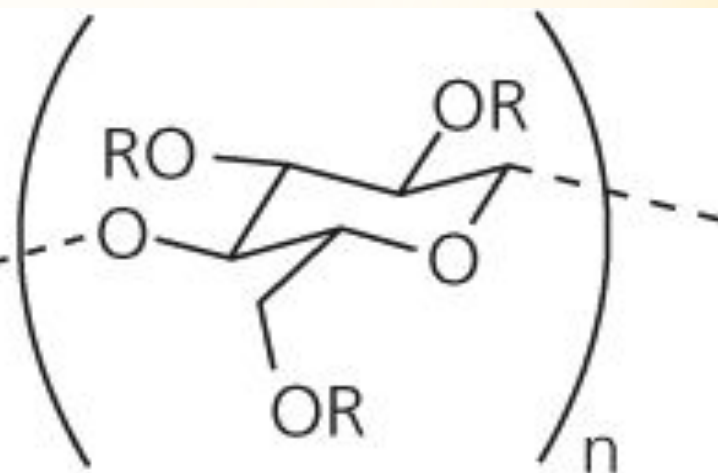
## Многофункциональный наполнитель

Этилцеллюлоза является производным целлюлозы, в которой гидроксильные группы замещаются этиленовыми группами.

Этилцеллюлоза очень инертный<sup>1</sup>, гидрофобный<sup>2</sup>, низкокалорийный полимер, без вкуса и без запаха.

Физиологически инертен. На протяжении многих десятилетий этилцеллюлозу используют в качестве связующего вещества или в качестве защитного, многофункционального покрытия. Этилцеллюлоза растворима только в органических растворителях.

Покрытия из ЭЦ очень плотны и следовательно представляют собой хороший барьер для защиты от влаги и окисления. Такого рода покрытия обеспечивают значительно замедленное высвобождение действующего вещества. Широкое распространение получила Этилцеллюлоза в качестве пленочного агента, с хорошими адгезионными качествами. может быть использована для маскировки запаха и вкуса



В настоящее время в качестве пленкообразующих веществ используются полимеры природного происхождения, полученные в основном биохимическим методом.

- Так, фирма «FMC» (Швейцария) выпускает пленкообразующую композицию на основе каррагинина и микрокристаллической целлюлозы под торговым названием **Lustre Clear**. Каррагинин представляет собой полисахарид, полученный методом щелочной экстракции из красной водоросли (**Rhodophyceae**)

Эта композиция позволяет вести процесс при низких температурах, таким образом, подходит для покрытия таблеток с термолабильными веществами





# Акриловые полимеры для многофункционального покрытия твердых лекарственных форм

многие активные вещества, составляющие основу твёрдых лекарственных форм, остро нуждаются в защитных покрытиях. В особенности это актуально для гигроскопичных (хорошо впитывающих влагу), нестабильных и агрессивных активных веществ.



## полиметилметакрилаты (ПММА)

Под влиянием описанных факторов на свет появился новый тип покрытий, основу которых составили полиметилметакрилаты (ПММА) - производные акриловой кислоты полимеры, получившие торговое название **Эудрагит (EUDRAGIT®)**.

The advertisement features the Evonik logo at the top right. The main title is "EUDRAGIT® Acrylic Polymers for Solid Oral Dosage Forms". Below this, there are two rows of pill images. The first row shows two white pills labeled "MON" and "TUE". The second row shows five pills labeled "MON", "TUE", "WED", "THU", and "FRI", each with a different color combination (blue, pink, purple, white). At the bottom, there is a process flow diagram with six steps: 1. EUDRAGIT® Products, 2. Technical Support, 3. Formulation Development, 4. Proof of Concept, 5. GMP Services, and 6. Drug Delivery & Licensing. The Evonik slogan "Evonik. Power to create." is at the bottom right.

Родоначальником данного вида полимеров стало **предприятие Рём (Rohm)**, основанное *немецким инженером* **Отто Рёмом** в тридцатых годах прошлого века. Ныне Рём входит в состав немецкого химического концерна Дегусса (Degussa). Последний является признанным мировым лидером в производстве специальных химикатов для самых разных отраслей промышленности и науки, начиная от крупнотоннажной химии и заканчивая нанотехнологиями.



Даже очень тонкие плёночные оболочки из полимера EUDRAGIT®, толщина которых составляет всего одну сотую долю миллиметра, позволяют избежать истирания таблеток и образования пыли, неизбежно возникающих при производстве таблеток и их последующей обработке. Так, обработка таблеток материалом EUDRAGIT® сразу после их прессования устраняет образование вредной для людей пыли гормональных препаратов и антибиотиков. При этом обеспечивается непрерывная работа чувствительных к пыли фасовочных машин.

Влаго-, термо- и светозащитные свойства EUDRAGIT® намного превосходят соответствующие свойства целлюлозы, тем самым существенно увеличивая срок годности лекарственных препаратов.

Другим важным свойством защитных плёнок EUDRAGIT® является их способность к полной нейтрализации неприятного вкуса и запаха, которыми зачастую обладают действующие в лекарстве вещества.

Комбинация EUDRAGIT® с пигментами позволяет получить равномерно окрашенные таблетки любых оттенков.

Скользкие свойства плёнок EUDRAGIT® обеспечивают лёгкость при проглатывании таблеток большого размера.



## Больше, чем просто оболочки

Помимо чисто защитных функций, благодаря своим уникальным свойствам плёнки EUDRAGIT® обладают рядом других специфических функций. Во-первых, EUDRAGIT® позволяет обеспечить доставку активного вещества в любой отдел желудочно-кишечного тракта (ЖКТ)

## Полимеры EUDRAGIT® для продления действия лекарства

Помимо использования в виде оболочек, EUDRAGIT® может применяться и в качестве матрицы для создания так называемых ретардных лекарственных форм. Подобные формы обеспечивают замедленное высвобождение действующего вещества в организме человека, тем самым продлевая его терапевтический эффект.

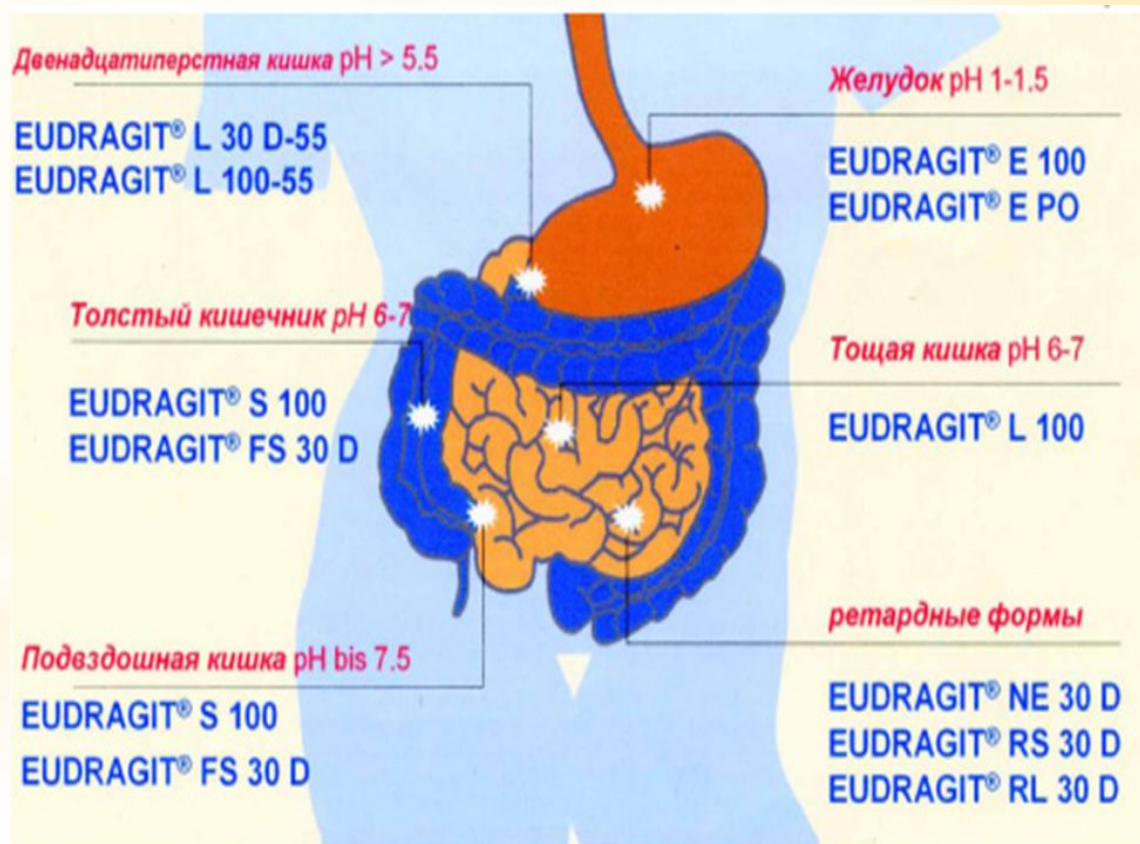
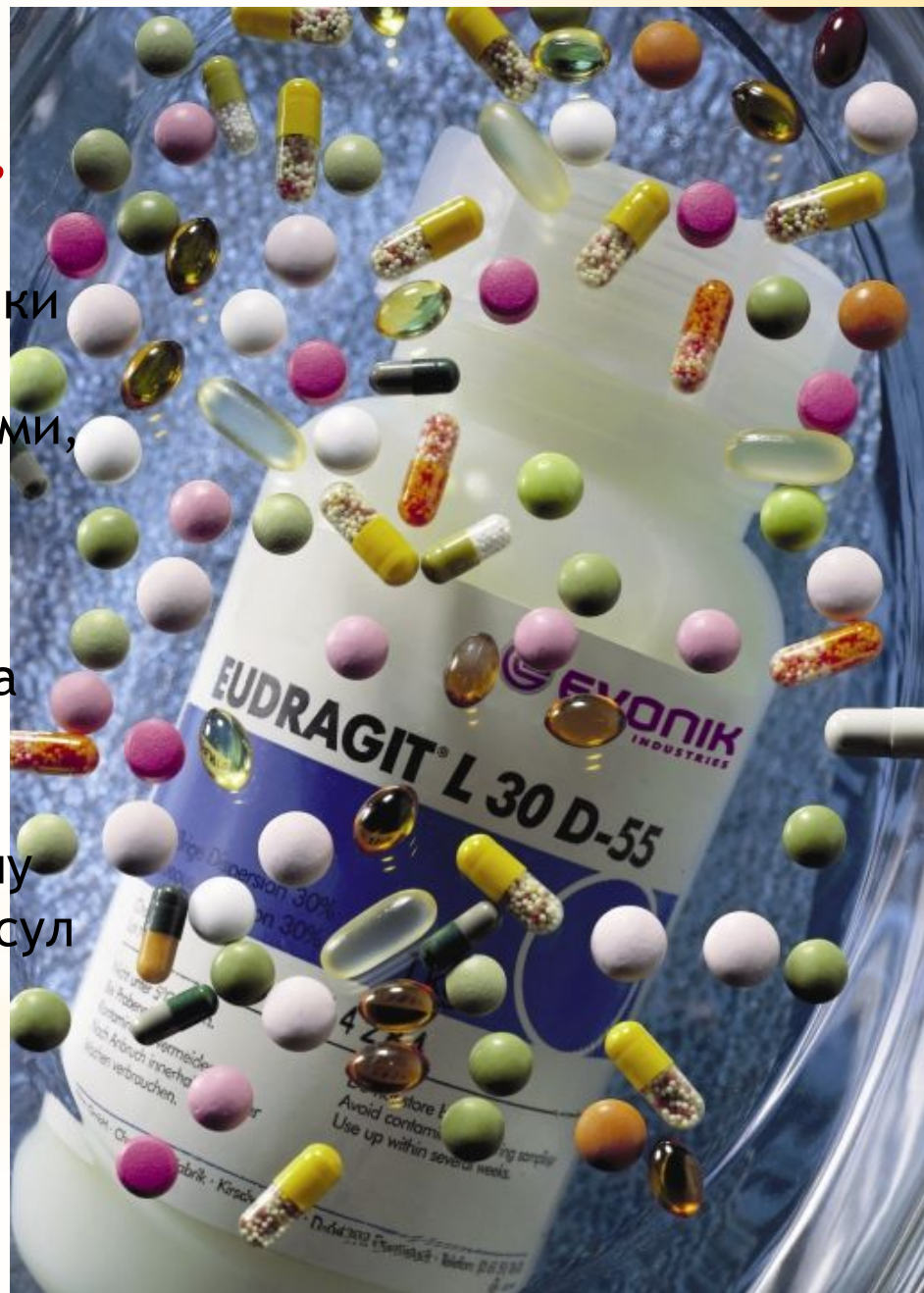


Рис. 1. Доставка активного вещества в заданный отдел ЖКТ посредством EUDRAGIT®

полимеры EUDRAGIT® можно применять и для нанесения оболочек *на капсулированные лекарственные формы.*

Наносимые на капсулы оболочки устраняют зазор между двумя составляющими капсулу частями, тем самым способствуя дополнительной защите действующего вещества от нежелательных воздействий, а также повышая его терапевтическую эффективность. Однако, в силу физических особенностей капсул (прежде всего по причине их мягкости) для их покрытия требуется специальное аппаратное обеспечение



# Список литературы

Алексеев К.В.

Дитковская А.Г.

Алексеева С.К.

Сизяков С.А.

Блынская Е.В. Издание: Фармация Год издания: 2009

Объем: 5с.Дополнительная информация: 2009.-N 8.-С.45-49. Библ. 18 назв.

Краснюк И.Н. Фармацевтическая технология: Технология лекарственных форм. М.: Издательский центр "Академия", 2004.

Милованова Л.Н. Технология изготовления лекарственных форм. Ростов на Дону: Медицина, 2002.



СПАСИБО ЗА  
ВНИМАНИЕ!

