

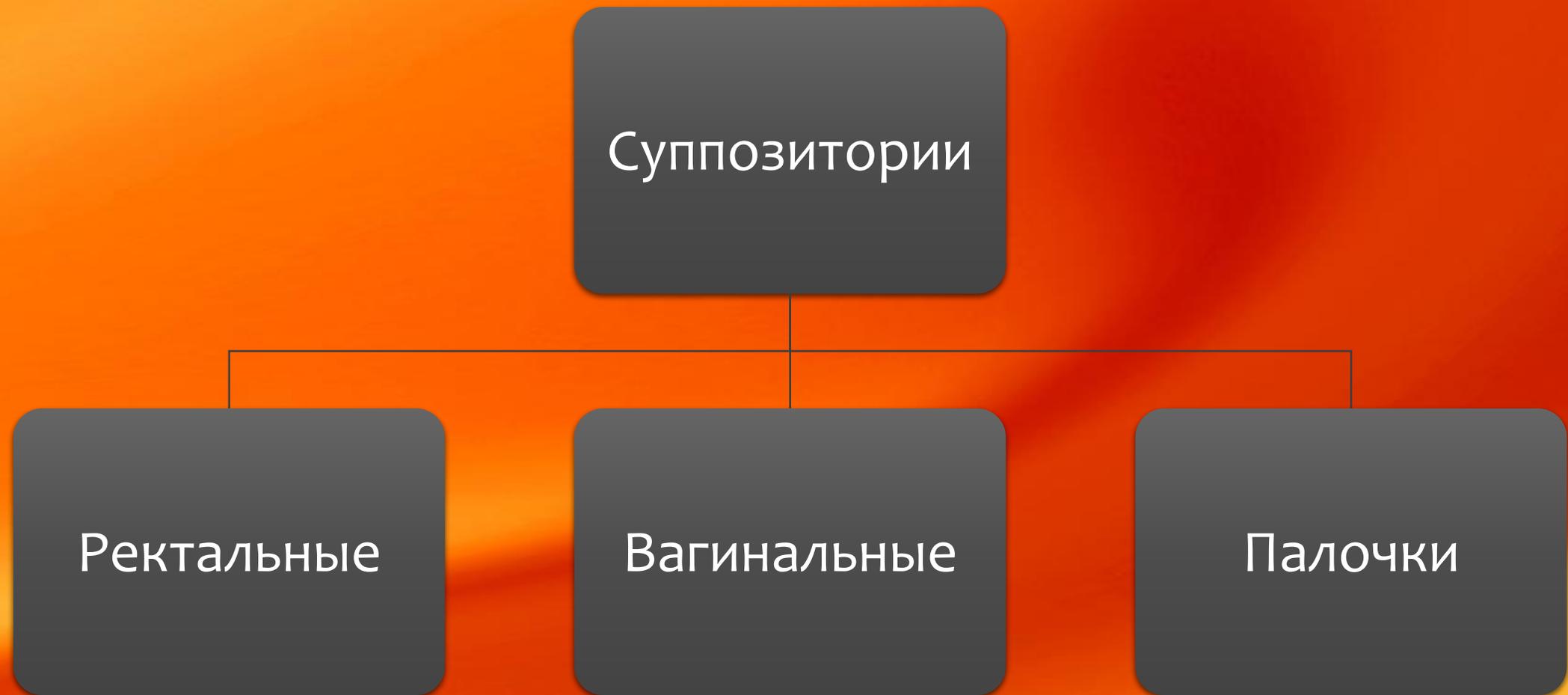
Гидрофильные основы суппозиториев

Определение ЛФ

Суппозитории – твердая при комнатной температуре дозированная лекарственная форма, содержащая одно или более действующих веществ, растворенных или диспергированных в подходящей основе, предназначенная для введения в полости тела и расплавляющаяся (растворяющаяся, распадающаяся) при температуре тела.



Классификация суппозиториев



Требования к суппозиторным основам

- основа должна быть твердой и пластичной при комнатной температуре;

- плавиться или растворяться при температуре тела;

- при необходимости способствовать резорбции лекарственных веществ слизистыми оболочками;

- смешиваться с возможно большим количеством лекарственных веществ;

- быть химически и фармакологически индифферентной;

- легко высвобождать лекарственные вещества;

- не обладать раздражающим действием, быть устойчивой по отношению к свету, влаге, кислороду воздуха, микроорганизмам.

Гидрофильные основы



**Желатино-
глицериновая основа**



**Мыльно-
глицериновая основа**



**Полиэтиленоксидные
основы**



Желатино-глицериновая основа

- 1 часть желатина, 2 части воды, 5 частей глицерина
- Изготовление основы: желатино-глицериновую основу изготавливают согласно правилам изготовления геля высокомолекулярного ограниченно набухающего вещества. Измельченный желатин с водой и частью глицерина оставляют для набухания в предварительно взвешенной выпарительной чашке и последующего растворения на водяной бане в присутствии остального количества глицерина.
- Данную основу из-за малой механической прочности применяют главным образом для выливания вагинальных суппозиториях. Она совместима с алкалоидами, борной кислотой, солями цинка. Основа хорошо высвобождает ЛВ, однако подвергается микробной контаминации, не совместима с электролитами (наблюдается синерезис (расслоение); также возможна пептизация (разжижение геля)), дубильными веществами, кислотами, щелочами, солями тяжелых металлов (образует нерастворимые соединения), к тому же при хранении быстро высыхает и плесневеет.



Мыльно-глицериновая основа

- глицерина - 60,0 г; натрия карбоната - 2,6 г и кислоты стеариновой - 5,0 г.
- Желатино-глицериновые и мыльно-глицериновые основы изготавливают ex tempore по методикам ГФ. 2,6 г натрия карбоната кристаллического растворяют в 60,0 г глицерина при нагревании на водяной бане, затем понемногу добавляют кислоту стеариновую, перемешивают до полного удаления углерода диоксида, при этом выделяется углекислый газ, масса вспенивается. Образуется мыло:



После окончания химической реакции массу разливают в формы.

- Мыльно - глицериновая основа является одновременно лекарственным средством, как слабительное за счет образующегося мыла в результате реакции компонентов. Применяется для ректальных суппозиторий в педиатрической практике.



Полиэтиленоксидные основы

- Консистенция полиэтиленоксидов зависит от степени полимеризации. Сочетая между собой различные по консистенции полиэтиленоксиды, можно получить основы с нужными структурно - механическими свойствами.
- Как правило, данные основы представляют собой сплавы ПЭО с различной степенью полимеризации:
 - ✓ ПЭО-4000 (для изготовления суппозитория с ихтиолом) или его сплав с 10% ПЭО-400,
 - ✓ сплав ПЭО-6000 (60%) с ПЭО-4000 (20%) и ПЭО-1500 (20%),
 - ✓ сплав ПЭО-1200 и ПЭО-2000 1:1.

В США эти основы известны под названием Carbowax, во Франции -- Scurol, в Германии -- Postonal. Применяют и другие соотношения.

- Основы стабильны, хорошо высвобождают лекарственные вещества, устойчивы к изменению pH среды, перспективны для изготовления суппозитория в жарком климате, не образуют полиморфных модификаций, процесс изготовления легко автоматизируется.
- Недостатки: высокая гигроскопичность, малая вязкость (возможно вытекание из прямой кишки), обезвоживают слизистые, растворяются в секретах слизистой долго (около 40 минут) и неполно, вызывают антифизиологический экзоосмос, несовместимы с фенольными соединениями, йодидами, салицилатами, многими антибиотиками и сульфаниламидами, солями металлов.
- Используют сплавы жидких и твердых ПЭО (свечи с папаверином, анестезином). ПЭО актуальны при изготовлении суппозитория с водорастворимыми веществами.



Введение ЛВ гидрофильные основы

вещество
растворимо в воде
или глицерине

ЛВ растворяют в части
воды или глицерина,
предназначенных для
приготовления основы,
и добавляют к
расплавленной основе

Вещество не
растворимо ни в
воде, ни в глицерине

ЛВ растирают с частью
глицерина в тонкую
суспензию и перед
выливанием добавляют
к расплавленной основе.

ЛВ хорошо
растворимо в ПЭО-
основе,
коллагеновом геле

ЛВ вводят
непосредственно в
расплавленную часть
или всю основу(гель)

Некоторые особенности суппозиторий на гидрофильной основе:

- Желатино-глицериновые и мыльно-глицериновые основы изготавливают ex tempore по методикам ГФ.
- Суппозитории на ПЭО можно готовить как методом плавления, так и прессования.
- Формы перед розливом в них суппозиторной массы необходимо смазывать. Смазка должна быть гидрофобной (парафин жидкий).
- Полиэтиленоксид реагирует с пластмассами, поэтому готовые свечи хранят только в стеклянных или картонных контейнерах.
- Суппозитории на основе ПЭО должны иметь обязательно предупредительную надпись на упаковке «Смочить перед введением».

Спасибо за внимание!