

Мурад Аль-Товайти, Е.А. Рубан, С.А. Малиновская

ВЫБОР ВСПОМОГАТЕЛЬНЫХ ВЕЩЕСТВ ПРИ РАЗРАБОТКЕ КАПСУЛ С СУХИМ ЭКСТРАКТОМ ШИШЕК ХМЕЛЯ

Национальный фармацевтический университет, г. Харьков

Введение. В настоящее время капсулированные лекарственные формы приобретают широкое распространение, что связано с наличием большого количества преимуществ.

Цель. Разработка состава твердых желатиновых капсул с сухим экстрактом шишек хмеля обыкновенного для использования в гастроэнтерологии.

Материалы и методы. Для изучения влияния вспомогательных веществ на свойства субстанции были использованы методы определения насыпной плотности, сыпучести, прессуемости, влагопоглощения, отвечающие требованиям ГФУ.

Результаты и выводы. Была обоснована важность правильного выбора лекарственной формы и оптимальных вспомогательных веществ при разработке фармацевтического препарата на растительной основе. Проведенными исследованиями определено влияние наполнителей – лактозы моногидрата, лактозы безводной и микрокристаллической целлюлозы на фармакотехнологические показатели массы для инкапсулирования. Установлено, что использование лактозы моногидрата позволяет получить массу с наилучшей сыпучестью. Изучение влияния влагорегулирующих веществ на кинетику влагопоглощения позволило обосновать введение в состав массы для инкапсулирования аэросила, который препятствует поглощению влаги в количестве более 4%.

Ключевые слова: сухой экстракт, фармакотехнологические свойства, твердые желатиновые капсулы.

Введение. В настоящее время капсулированные лекарственные формы приобретают широкое распространение, что можно связать с наличием большого количества достоинств, чем недостатков. А именно, – относительная простота технологии производства и хорошие потребительские характеристики капсул делают их более привлекательными по сравнению с другими твердыми дозированными лекарственными средствами, как для производителей, так и для потребителей [1]. Что касается субстанций растительного происхождения, которые из-за своих технологических характеристик усложняют производственный процесс, то оболочки твердых желатиновых капсул являются практически идеальными для получения качественной и стабильной лекарственной формы [2]. Кроме того, выбор лекарственной формы имеет огромное значение в реализации процессов всасывания действующих веществ, которые определяются химическими, физико-химическими, фармакотехнологическими свойствами, а также терапевтической дозой лекарственного вещества [1].

Цель. Разработка состава твердых желатиновых капсул с сухим экстрактом шишек хмеля обыкновенного в составе для использования в гастроэнтерологии.

Материалы и методы. Сухой экстракт шишек хмеля – это аморфный,

гигроскопичний порошок желто-коричневого цвета, со специфическим ароматным хмелевым запахом и горьковатым вкусом. Легко растворим в воде, частично – в 50% и 70% этаноле, не растворим в 96% этаноле и органических растворителях [3]. Для изучения влияния вспомогательных веществ на свойства субстанции нами использовались различные методы исследования: влагопоглощающую способность определяли по динамике изменения массы навески при выдерживании субстанции в условиях различной влажности воздуха; влагосодержание – определяли на приборе МА 150 фирмы «Sartorius»; плотность до и после усадки, сыпучесть, прессуемость – согласно методикам ГФУ [4].

Результаты и их обсуждение. Как известно, ни один фармацевтический фактор не оказывает столь значительного и сложного влияния на действие препарата, как вспомогательные вещества. Поэтому, выбору вида и обоснованию оптимального количества вспомогательных веществ было уделено особое внимание. С целью разработки твердой лекарственной формы нами был проведен широкий спектр исследований субстанции сухого экстракта. Первым этапом наших исследований стал выбор наполнителя. Для этого нами были подобраны несколько вспомогательных веществ этой группы, которые входят в число наиболее изученных и употребляемых в фармацевтической технологии и проведены исследования сыпучести, способности к компактному формованию под давлением, насыпной плотности смесей действующего вещества с выбранными наполнителями. Данные представлены в табл..

Таблица

Результаты изучения технологических характеристик смесей для инкапсулирования

| Смесь Показатель | Сухой экстракт+ лактоза моногидрат | Сухой экстракт+ лактоза безводная | Сухой экстракт+ МКЦ |
|--|--|--------------------------------------|------------------------|
| Плотность до усадки, (m/V ₀), г/мл | 0,55±0,03 | 0,41±0,05 | 0,49±0,03 |
| Плотность после усадки, (m/V ₁₂₅₀), г/мл | 0,73±0,06 | 0,67±0,03 | 0,69±0,05 |
| Способность к компактному формованию под давлением, Н | 65±1,0 | 58±1,3 | 72±1,2 |
| Сыпучесть, с/100 | 46±0,03 | 70±0,05 | 85,0±0,04 |

Примечание: n=5.

Данные, представленные в табл. 1, позволяют сделать вывод о том, что оптимальным по технологическим параметрам наполнителем является лактозы моногидрат.

Известен тот факт, что одним из показателей, оказывающих влияние на подбор вспомогательных веществ, особенности технологического процесса и условия хранения, как самой субстанции, так и лекарственных форм на ее основе, является влагосорбция. Как было выяснено нами в предыдущих исследованиях, сухой экстракт шишек хмеля обыкновенного обладает высокой степенью гигроскопичности, что может негативно повлиять на стабильность препарата в процессе хранения. Поэтому, дальнейшие наши исследования были посвящены выбору влагорегулятора в составе массы для инкапсулирования. Согласно данным литературы [1, 5], в качестве влагорегулирующих веществ нами были выбраны магния оксид, магния карбонат и аэросил. Исследование проводили при таких условиях: температура окружающей среды – 18-20°C, влажность воздуха – 75%. Исследование проводили до установления равновесного влагосодержания. Результаты проведенных исследований представлены на рисунке.

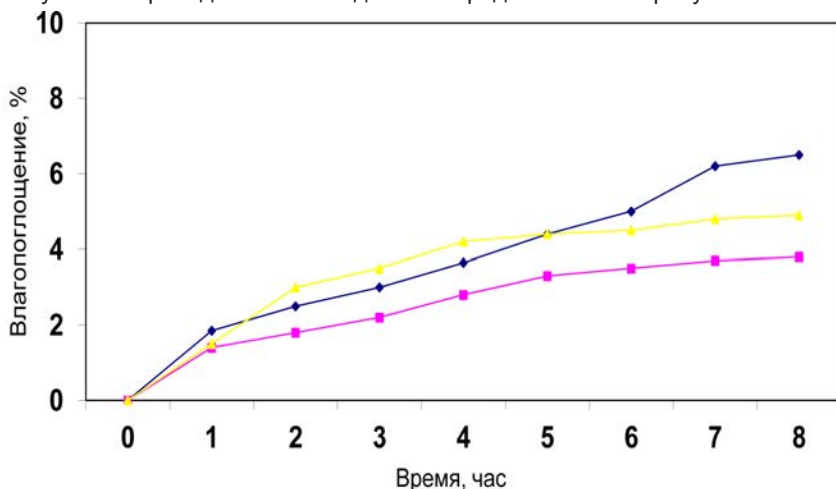


Рисунок. Зависимость влагопоглощения массы для инкапсулирования от содержания различных влагорегуляторов: 1-экстракт+аэросил; 2-экстракт+магния оксид; 3-экстракт+магния карбонат.

Как видно из данных на рисунке, оптимальным влагорегулятором для экстракта шишек хмеля является аэросил, так как в данной смеси при повышенной влажности воздуха содержание влаги в течение исследования не превышает 4%. Это, вероятно, связано с тем, что аэросил имеет отличные сорбционные свойства, поглощает от 15 до 60 % различных жидкостей в зависимости от их природы, не изменяя при этом внешний вид и сыпучесть порошка [6].

Выводы. Обоснована важность правильного выбора лекарственной формы и оптимальных вспомогательных веществ при разработке лекарственного средства на растительной основе. На основании проведенных

исследований выбраны наполнитель и влагорегулятор для включения в состав массы для инкапсулирования с сухим экстрактом шишек хмеля.

Литература

1. Допоміжні речовини в технології ліків: вплив на технологічні, споживчі, економічні характеристики і терапевтичну ефективність: навч. посіб. для студ. вищ. фармацев. навч. закл. / І.М. Перцев, Д.І. Дмитрієвський, В.Д. Рибачук [та ін.]; за ред. І.М. Перцева. – Х.: Золоті сторінки, 2010. – 600 с.
2. Encyclopedia of Pharmaceutical Technology: 3-d Ed. / Ed. by James Swarbrick. – New York / London: Informa Healthcare, 2007. – 4128 p.
3. Мазурець С.І. Фармакогностичне дослідження хмелю звичайного (*Humulus lupulus* L.): дис. на здобуття наук. ступ. канд. фармацев. наук: 15.00.02 / Мазурець Світлана Ігорівна. – Х., 2011. – 206 с.
4. Державна фармакопея України / Держ. п-во «Науково-експертний фармакопейний центр». – 1-е вид. – Х.: РІРЕГ, 2001. – 556 с.
5. Быков В.А. Исследование влагообмена стеариновой кислоты, кальция стеарата и магния стеарата / В.А. Быков, В.А. Дубинская // Химико-фармацевтический журнал. – 2010. – №2. – С. 41–45.
6. Майзельс А. Использование коллоидного диоксида кремния Aerosil® в фармацевтической промышленности / А. Майзельс // Фармацевтические технологии и упаковка. – 2008. – №5. – С. 20–22.

Мурад Аль-Товайті, О.А. Рубан, С.А. Малиновська

Вибір допоміжних речовин при розробці капсул з сухим екстрактом шишок хмелю

Національний фармацевтичний університет, м. Харків

Вступ. В даний час капсульовані лікарські форми набувають широкого поширення, що можна пов'язати з наявністю великої кількості позитивних якостей.

Мета. Розробка складу твердих желатинових капсул з сухим екстрактом шишок хмелю звичайного для використання в гастроентерології.

Матеріали та методи. Для вивчення впливу допоміжних речовин на властивості субстанції були використані методи визначення насипної густини, плинності, пресуємості, вологопоглинання, що відповідають вимогам ДФУ.

Результати та висновки. Була обґрунтована важливість правильного вибору лікарської форми та оптимальних допоміжних речовин при розробці фармацевтичного препарату на рослинній основі. Проведеними дослідженнями визначено вплив наповнювачів – лактози моногідрату, лактози безводної та мікрокристалічної целюлози на фармакотехнологічні показники маси для інкапсулювання. Встановлено, що використання лактози моногідрату дозволяє отримати масу з найкращою плинністю. Вивчення впливу вологорегулюючих речовин на кінетику вологопоглинання дозволило обґрунтувати введення до складу маси для інкапсулювання аеросилу, який перешкоджає поглинанню вологи в кількості більш ніж 4%.

Ключові слова: сухий екстракт, фармакотехнологічні властивості, тверді желатинові капсули.

Murad Al-Towayty, Ye.A. Ruban, S.A. Malynovskaya

Selection of excipients for developing hard gelatin capsules with dry hop cones extract

National University of Pharmacy, Kharkiv

Introduction. Nowadays encapsulated formulations become widespread, that can be explained by the large number of their positive qualities.

The **aim** of our work is to develop composition of hard gelatin capsules with hop cones dry extract for gastroenterology use.

Materials and methods. To study the effect of excipients on the substance properties methods of determining bulk density, flowability, compressibility and moisture absorption, which meet SPbU were used.

Results. The importance of proper selection of the optimal dosage form and excipients for the plant-based drug development was proved. The effect of fillers – lactose monohydrate, anhydrous lactose and microcrystalline cellulose – on technical indicators of mass for encapsulation was determined. It was found that the use of lactose monohydrate provides obtaining the mass with the best flowability. Studying the effect of moisture-regulating excipients on the kinetics of moisture absorption allowed substantiating addition of colloidal silica to the mass for encapsulation, which prevents the absorption of moisture in the amount of more than 4%.

Key words: dry extract, technological properties, hard gelatin capsules.

Сведения об авторах:

Аль-Товайти Мурад – аспирант кафедри заводської технології лікарств НФаУ. Адрес: Харків, ул. Блюхера, 4; тел. (0572) 67-88-52.

Рубан Елена Анатольевна – д. фарм. н., професор, зав. кафедри заводської технології лікарств НФаУ. Адрес: Харків, ул. Блюхера, 4; тел. (0572) 67-88-52.

Малиновская Светлана Анатольевна – к. фарм. н., доцент кафедри заводської технології лікарств НФаУ. Адрес: Харків, ул. Блюхера, 4; тел. (0572) 67-88-52.

УДК 615.32:582.998.16:615.015.36

© Т.В. ОПРОШАНСЬКА, 2015

Т.В. Опрошанська

ВСТАНОВЛЕННЯ МАКРО- ТА МІКРОСКОПІЧНИХ ОЗНАК ЛИСТЯ ТАТАРНИКА КОЛЮЧОГО

Національний фармацевтичний університет, м. Харків

Вступ. Татарник колючий – дворічна трав'яниста рослина родини айстрові, яка використовується в медицині як протизапальний, антимікробний, бактеріцидний, сечогінний та кардіотонічний засіб. Відомості про макроскопічні ознаки листя в різних джерелах різні та є дані про анатомічну будову листка на поперечному зрізі. Тому вивчення макро- та мікроскопічних ознак листя татарника колючого більш детально для ідентифікації лікарської рослинної сировини було актуально.

Мета. Встановлення макро- та мікроскопічних ознак листя татарника колючого.

Матеріали та методи. Листя татарника колючого заготовили у травні 2014 року у Вінницькій області. Анатомічну будову вивчали на препаратах з поверхні та поперечних зрізах, які робили за загальноприйнятими методиками.

Результати. Встановлено макроскопічні ознаки листя татарника колючого: форма листової пластини, виїмчасто-зубчастий край з міцними жовтими