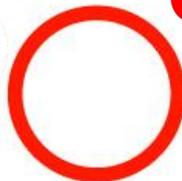


# Твердые лекарственные формы



# Характеристики основных видов твердых лекарственных форм

В настоящее время твердые лекарственные формы являются наиболее популярными и востребованными, имеющими широкий спектр возможностей и преимуществ перед другими лекарственными формами. Большое число фармацевтических компаний в России и за рубежом заняты производством твердых лекарственных форм, рыночная доля которых составляет около 80 % от общего объема производства всех лекарственных форм.

Основными видами твердых лекарственных форм являются порошки, пелле-ты (микросферы), таблетки и капсулы

# Общие сведения о порошках

- **Порошок** — твердая лекарственная форма для внутреннего и наружного применения, состоящая из одного или нескольких измельченных веществ, обладающая свойством сыпучести

# Общие сведения о порошках

В зависимости от состава порошки делят на *простые*, которые состоят из одного ингредиента, и *сложные*, состоящие из двух и более ингредиентов. В зависимости от характера дозирования порошки подразделяют на *дозированные* и *не-дозированные*. В зависимости от способа применения порошки бывают *для внутреннего и наружного применения*. Порошки для внутреннего применения прописываются в дозированном виде, для наружного применения — в недозированном виде. Кроме того, порошки классифицируют по степени измельченности на *крупные, средnekрупные, среднемелкие, мелкие, мельчайшие, наимельчайшие*.

# Общие сведения о порошках

- В Государственной фармакопее содержатся требования, предъявляемые к порошкам, а именно: сыпучесть, однородность, допустимые нормы отклонения в массе отдельных доз, цвет, вкус, запах, упаковка и оформление, соответствующие входящим в состав ингредиентам. Порошки должны быть однородными при рассмотрении невооруженным глазом, иметь размер частиц не более 0,16 мм (при отсутствии других указаний в частных статьях). Порошки, применяемые для лечения ран, поврежденной кожи и слизистых оболочек, а также для новорожденных и детей до 1 года, должны быть стерильными и готовиться в асептических условиях

# Общие сведения о порошках

- Порошки являются исходным продуктом для изготовления гранул, пеллет, таблеток, драже, приготовления растворов и суспензий и т.д
- Преимущества порошков состоят в следующих факторах: простая и быстрая технология изготовления,
- возможность регулирования степени дисперсности,
- в некоторых случаях положительное влияние кристаллической структуры веществ на биодоступность,
- отсутствие наполнителей,
- точность дозирования,
- удобство применения,
- универсальность состава,
- удобство хранения и транспортирования —

# Общие сведения о порошках

При объективной оценке порошков как лекарственной формы необходимо учитывать некоторые свойственные им недостатки: более медленное терапевтическое воздействие по сравнению с жидкими лекарственными формами, а также раздражающее действие на слизистую оболочку ЖКТ (например, калия и натрия бромиды), которое исключается при их применении в виде растворов. Кроме того, в результате увеличения удельной поверхности лекарственного вещества за счет измельчения порошки легко теряют кристаллизационную воду, если есть склонность к выветриванию, или быстро отсыревают, если являются гигроскопичными. Порошки могут поглощать диоксид углерода из воздуха и изменять свои свойства под действием кислорода воздуха. Порошки могут приобретать посторонний запах, адсорбируя пары летучих веществ или терять запах вследствие улетучивания пахучих компонентов. Многие из перечисленных недостатков можно избежать за счет выбора соответствующей упаковки и при правильном хранении как исходных ингредиентов, так и самих порошков.

# Общие сведения о порошках

- В последнее время в фармацевтической промышленности производители лекарственных препаратов занимаются получением *микросфер, или пеллет* (от англ. *pellet* — шарик, гранула, окатыш), как конечным или промежуточным видом лекарственной формы для производства готовых лекарственных форм. Микросферы находят все более частое применение в производстве готовых лекарственных препаратов, так как обладают рядом значимых и неоспоримых преимуществ. Пеллеты можно таблетировать с добавлением подходящих вспомогательных веществ, они могут являться содержимым капсул, а также входить в состав суспензий.

# Общие сведения о порошках

- Микросферы (пеллеты) являются агломератами мелкодисперсных порошков или гранул, которые, в свою очередь, могут состоять из лекарственных и вспомогательных веществ. Микросферы — это мелкие, сферической или полусферической формы твердые частицы диаметром от 0,5 до 1,5 мм, имеющие хорошую сыпучесть, предназначенные для орального приема. Микросферы могут быть изготовлены различными методами, но наиболее широко используются методы компактирования и нанесения лекарственного вещества на инертные микросферы.

# Общие сведения о порошках

- Независимо от способа производства, микросферы должны удовлетворять следующим требованиям:
  - \* иметь близкую к сферической форму и гладкую поверхность. Эти условия являются необходимыми для дальнейшего нанесения покрытия оптимальным образом;
  - \* размеры частиц не должны сильно варьироваться. Оптимальный размер частиц микросферы для использования в фармацевтических нуждах составляет от 600 до 1000 мкм;
  - \* микросферы должны содержать максимально возможное количество активного вещества.



# *Таблетки – это...*

**Таблетки** - дозированная лекарственная форма, получаемая прессованием лекарственных или смеси лекарственных и вспомогательных веществ, предназначенная для внутреннего, наружного, сублингвального, имплантационного или парентерального применения.

# Преимущества таблеток:

- точность дозирования вводимых в таблетки лекарственных веществ;
- портативность таблеток, обеспечивающая удобство отпуска, хранения и транспортировки лекарственной формы;
- сохранность лекарственных веществ в спрессованном состоянии. Для недостаточно устойчивых веществ возможно нанесение защитных оболочек;
- маскировка неприятных органолептических свойств лекарственных веществ (вкус, запах, красящая способность), которая достигается наложением оболочек из сахара, какао, шоколада и др.;
- локализация действия лекарственного вещества в определенном месте ЖКТ путем нанесения оболочек, растворимых в кислой или щелочной среде;
- \* пролонгирование действия лекарственных веществ (путем нанесения покрытий);
- \* регулирование последовательного всасывания отдельных лекарственных веществ из таблетки сложного состава в определенные промежутки времени (многослойные таблетки);
- сочетание лекарственных веществ, несовместимых по физико-химическим свойствам

# *Недостатки таблеток:*

- при хранении таблетки могут терять свою распадаемость и цементироватьсь или, наоборот, разрушаться;
- с таблетками в организм вводятся вспомогательные вещества, вызывающие иногда побочные явления (например, тальк раздражает слизистые оболочки);
- отдельные лекарственные препараты образуют в зоне растворения высококонцентрированные растворы, которые могут вызывать сильное раздражение слизистых оболочек. Этот недостаток легко устраним, если такие таблетки перед приемом размельчить и растворить в определенном количестве воды;
- таблетки невозможно ввести в организм при рвоте или обморочном состоянии;  
не все больные, особенно дети, могут свободно проглатывать таблетки.

# Таблетки как лекарственная форма

Различают следующие классы таблеток:

- **Прессованные таблетки**, получаемые путем прессования лекарственных порошков на таблеточных машинах. Этот способ является основным при производстве таблеток.
- **Тритурационные таблетки** (формованные, микротаблетки), получаемые формованием таблетлируемой массы.
- Этот класс таблеток изготавливают в случаях, если использование давления по каким-либо причинам нежелательно (например, таблетки нитроглицерина, когда при использовании давления может произойти взрыв), либо дозировка лекарственных веществ мала, а добавление большого количества вспомогательных веществ нецелесообразно. Масса таких таблеток может составлять до 0,05 г.

# Таблетки как лекарственная форма

- **Непокрытые, покрытые** — таблетки без оболочки или покрытые оболочкой из одного или нескольких слоев вспомогательных веществ.
- **Шипучие** — таблетки, принимаемые после растворения.
- **Кишечнорастворимые таблетки (желудочно-резистентные)** — таблетки, сохраняющие лекарственное вещество в желудочном соке и высвобождающие его в кишечном соке.
- **С модифицированным высвобождением** — покрытые или непокрытые таблетки, содержащие специальные вспомогательные вещества или полученные по особой технологии, что позволяет программировать скорость или место высвобождения лекарственных веществ.
- **Таблетки-ретард** — таблетки с пролонгированным (периодическим) высвобождением лекарственного вещества из запаса. Обычно представляют собой микрогранулы с лекарственным веществом, окруженные биополимерной матрицей (основой), у которых послойно растворяются основа или микрогранулы, высвобождая очередную порцию лекарственного вещества.
- **Таблетки для приготовления раствора, суспензии и др.**

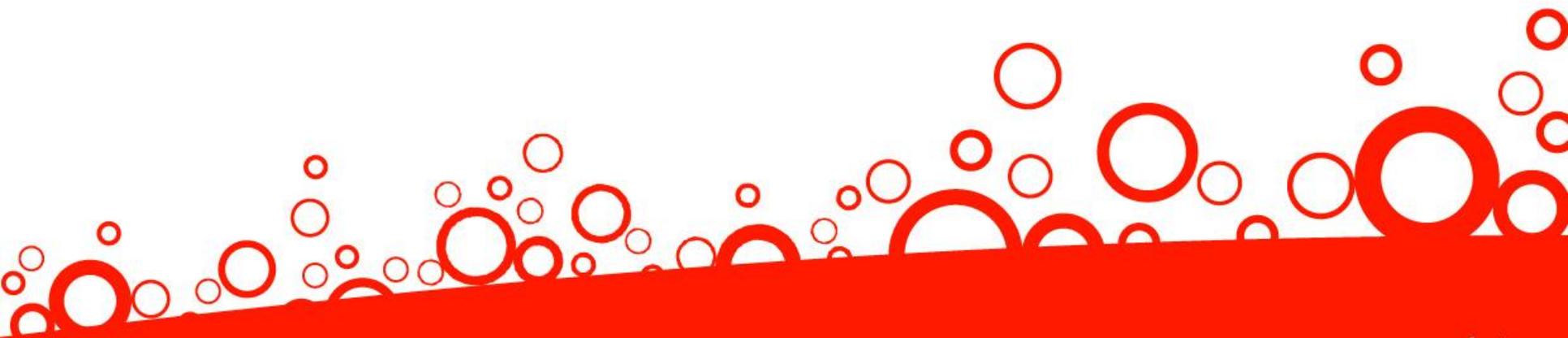
# *Основные требования, предъявляемые к таблеткам*

К таблеткам предъявляют следующие требования:

- \***точность дозирования** — однородность (равномерность) распределения действующего вещества в таблетке, правильность веса как самой таблетки, так и входящих в ее состав лекарственных веществ;
- \***механическая прочность** — твердость, ломкость, хрупкость — характеризуют качество таблеток; таблетки должны обладать достаточной прочностью, чтобы оставаться неповрежденными при механических воздействиях в процессе упаковки, транспортировки и хранения;
- \***распадаемость или растворимость** — способность распадаться или растворяться в сроки, установленные соответствующей научно-технической документацией (НТД) для определенных видов таблеток.



# КЛАССИФИКАЦИЯ ТАБЛЕТОК

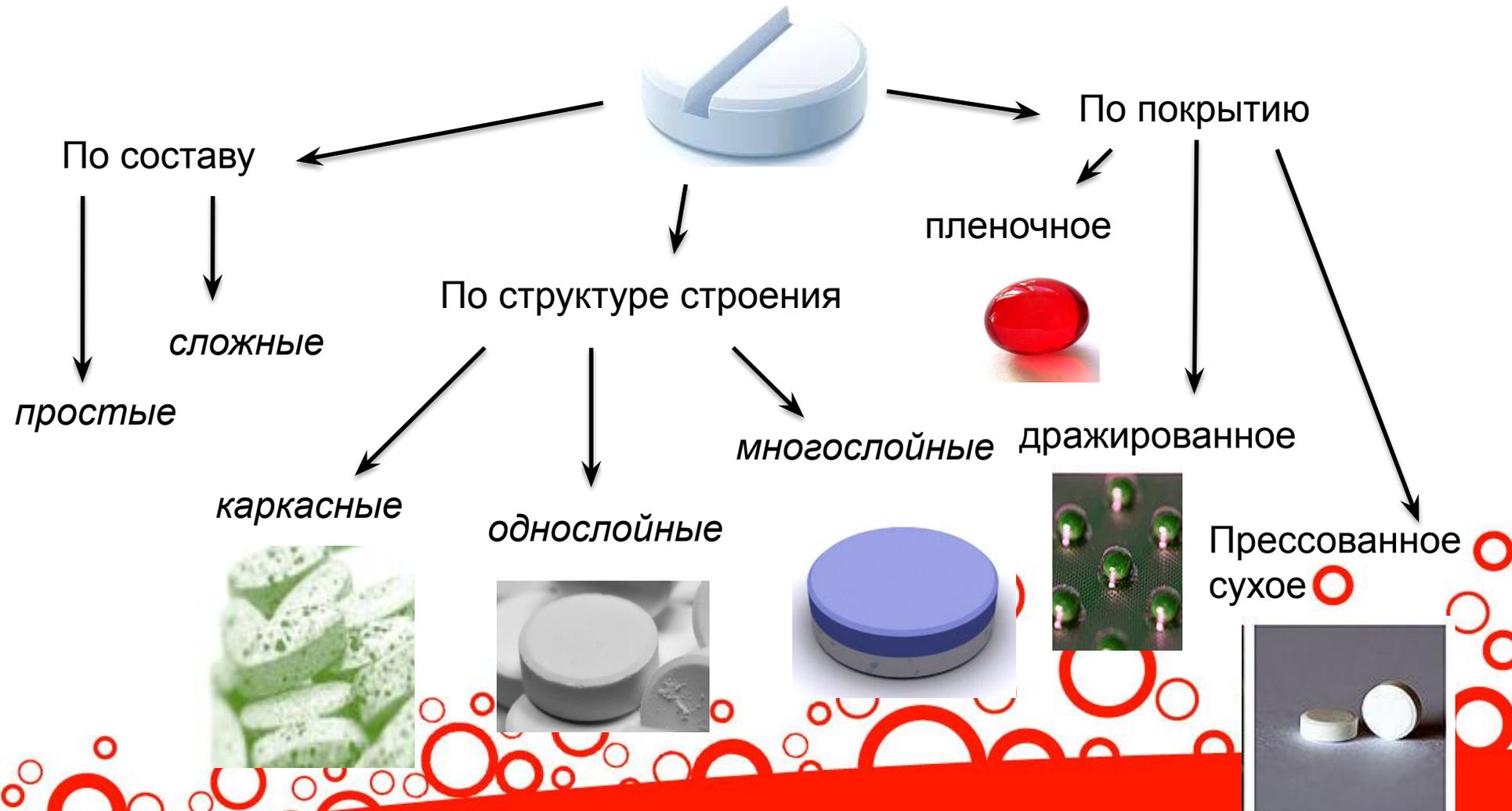


# *Классификация по способу получения*

- ❖ Прессованные. Получаются путем прессования лекарственных порошков на таблеточных машинах с различной производительностью.
- ❖ Формованные, или тритурационные таблетки, получаемые формованием таблетлируемой массы.



# Классификация таблеток по конструктивному признаку



# Классификация в зависимости от назначения и способа применения таблеток

- ❖ **Oriblettae** - таблетки, применяемые перорально. Эти таблетки принимают внутрь, запивая водой. Является основной.
- ❖ **Resoriblettae** - таблетки, применяемые сублингвально.
- ❖ **Implantabulettae** - таблетки, изготовленные асептически, применяются для имплантации.
- ❖ **Injectabulettae** - таблетки, изготавливаемые асептически, применяются для получения инъекционных растворов лекарственных веществ.
- ❖ **Solublettae** - таблетки, используемые для приготовления растворов различного фармацевтического назначения.
- ❖ **Dulciblettae bacilli, boli, uretratoria, vagitoria** - прессованные уретральные, вагинальные и ректальные лекарственные формы.

# Формы таблеток

- ❖ Формы таблеток бывают самые разнообразные. Самой распространенной является плоскоцилиндрическая форма с фаской и двояковыпуклая форма.
- ❖ Размер таблеток колеблется от 4 до 25 мм в диаметре. Таблетки диаметром свыше 25 мм называются брикетами.
- ❖ Масса таблеток в основном составляет 0,05-0,8 г.
- ❖ Таблетки должны иметь правильную форму, без выщербленных краев, гладкую и однородную поверхность, обладать достаточной прочностью и не крошиться.
- ❖ Высота плоскоцилиндрических таблеток должна быть в пределах 30-40% от диаметра.

# Свойства порошкообразных лекарственных субстанций

Свойства исходных лекарственных веществ зависят от способа таблетирования. В качестве исходных материалов применяют сыпучие вещества в виде порошкообразных или гранулированных форм, имеющих следующие свойства:

- ◆ физические;
- ◆ химические;
- ◆ Технологические;
- ◆ структурно-механические.

