

***Таблетки как лекарственная форма.
Физико-химические и фармако-
технологические свойства порошков.
Вспомогательные вещества в
производстве таблеток.***

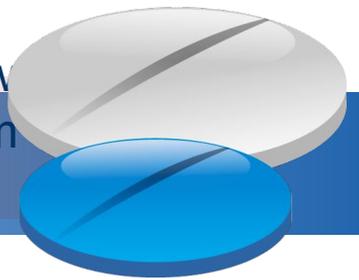


ПЛАН ЛЕКЦИИ

- ◆ **1. Таблетки как лекарственная форма. Их классификация.**
- ◆ **2. Положительные и отрицательные качества таблеток.**
- ◆ **3. Физико-химические характеристики частиц лекарственных порошкообразных веществ**
 - 3.1. Форма и размеры частиц
 - 3.2. Удельная поверхность
 - 3.3. Истинная плотность
 - 3.4. Гидрофильность
 - 3.5. Гигроскопичность
- ◆ **4. Фармако-технологические свойства лекарственных порошков**
 - 4.1. Фракционный (гранулометрический) состав
 - 4.2. Насыпной объем и насыпная плотность
 - 4.3. Коэффициент уплотнения (сжатия)
 - 4.4. Текучесть (сыпучесть)
 - 4.5. Прессуемость
 - 4.6. Сила выталкивания
- ◆ **5. Вспомогательные вещества и требования к ним**
 - 5.1. Связующие вещества
 - 5.2. Разрыхляющие вещества
 - 5.3. Антифрикционные вещества
 - 5.4. Вспомогательные вещества на основе лактозы

Таблетки

www
com



- ◆ **твердая лекарственная форма, которая содержит одну дозу или больше действующих веществ и получена обычно прессованием определенного объема частиц**
 - ***Содержание таблеток*** – это совокупность элементов и процессов, необходимых для ее формирования, образования таблетки. Форма таблетки – это структура, т. е. определенный порядок расположения структурных элементов, входящих в состав таблетки.

КЛАССИФИКАЦИЯ ТАБЛЕТОК



КЛАССИФИКАЦИЯ ТАБЛЕТОК СОГЛАСНО ГФУ



КАЧЕСТВА ТАБЛЕТОК

www.chempharm.ru
com



1. Должный уровень механизации стадий и операций производств
2. Точность дозирования ЛВ
3. Портативность таблеток
4. Сохранность ЛВ в спрессованном состоянии
5. Защитные оболочки для неустойчивых веществ
6. Маскировка неприятных органолептических свойств
7. Сочетание несовместимых ЛВ
8. Локализация действия ЛВ в определенном отделе ЖКТ
9. Пролонгирование действия ЛВ
10. Регулирование последовательного всасывания ЛВ в определенные промежутки времени
11. Предупреждение ошибок при отпуске и приеме лекарств (нанесение надписей)



1. Действие ЛВ в таблетках развивается относительно медленно
2. Таблетки невозможно ввести в организм при рвоте и обморочном состоянии
3. При хранении таблетки могут цементироваться, при этом увеличивается время распадаемости
4. В состав таблеток могут входить вспомогательные вещества, не имеющие терапевтической ценности, а иногда вызывающие побочные явления
5. Отдельные лекарственные препараты образуют в зоне растворения высококонцентрированные растворы, которые могут вызвать раздражение слизистых оболочек
6. Не все больные, особенно дети, могут свободно проглатывать таблетки

ФИЗИКО-ХИМИЧЕСКИЕ



ФАРМАКО-ТЕХНОЛОГИЧЕСКИЕ

- форма, размер, частиц
- контактная поверхность частиц
- удельная поверхность частиц
- истинная плотность
- гидрофильность
- гигроскопичность
- растворимость
- реакционная способность



- фракционный состав
- насыпной объем (плотность)
- текучесть (сыпучесть)
- прессуемость
- коэффициент уплотнения
- влажность
- дисперсность
- пористость



и др.



Состав

Фракционный (гранулометрический) состав

**оказывает влияние
на сыпучесть
порошка**

**стабильность
массы
таблеток**

**ритмичная
работа
таблеточных
машин**

**точность
дозировки
лекарственно
го вещества**

**качественные
характеристики
таблеток**

Насыпной объем (плотность)

**МАССА ЕДИНИЦЫ ОБЪЕМА
СВОБОДНО НАСЫПАННОГО ПОРОШКООБРАЗНОГО МАТЕРИАЛА.**

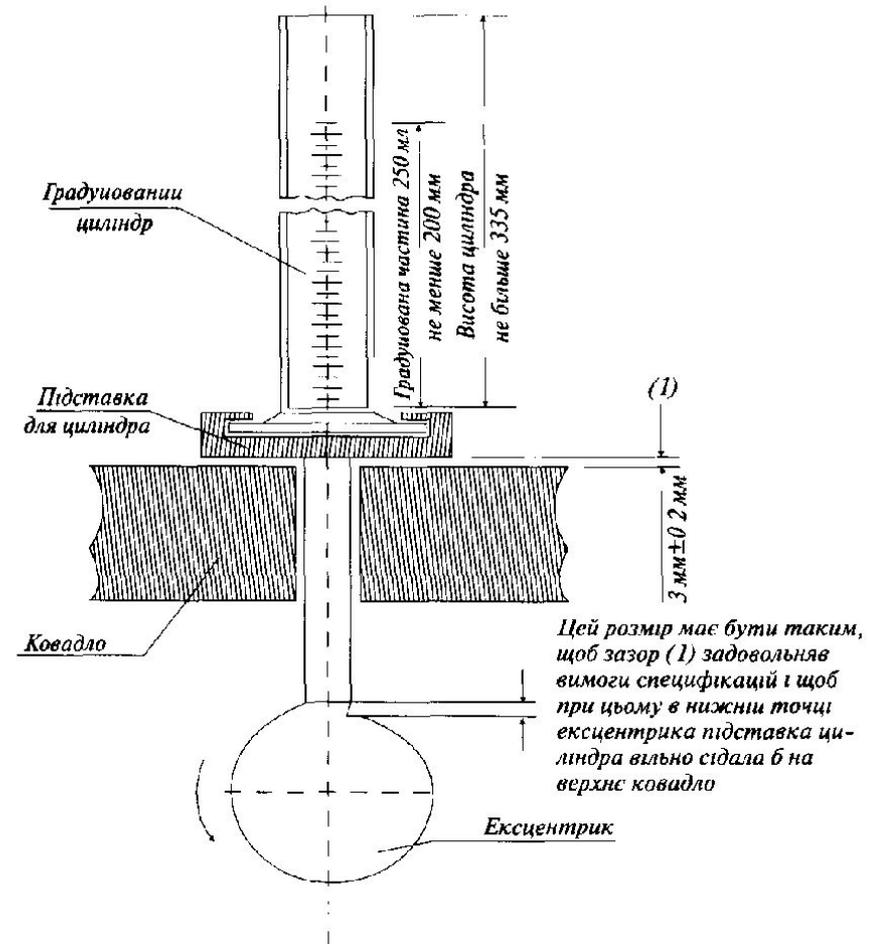
ЗАВИСИТ ОТ:

1 **формы** частиц порошка

2 **размера** частиц порошка

3 **плотности** частиц порошка

4 **влажности** частиц порошка



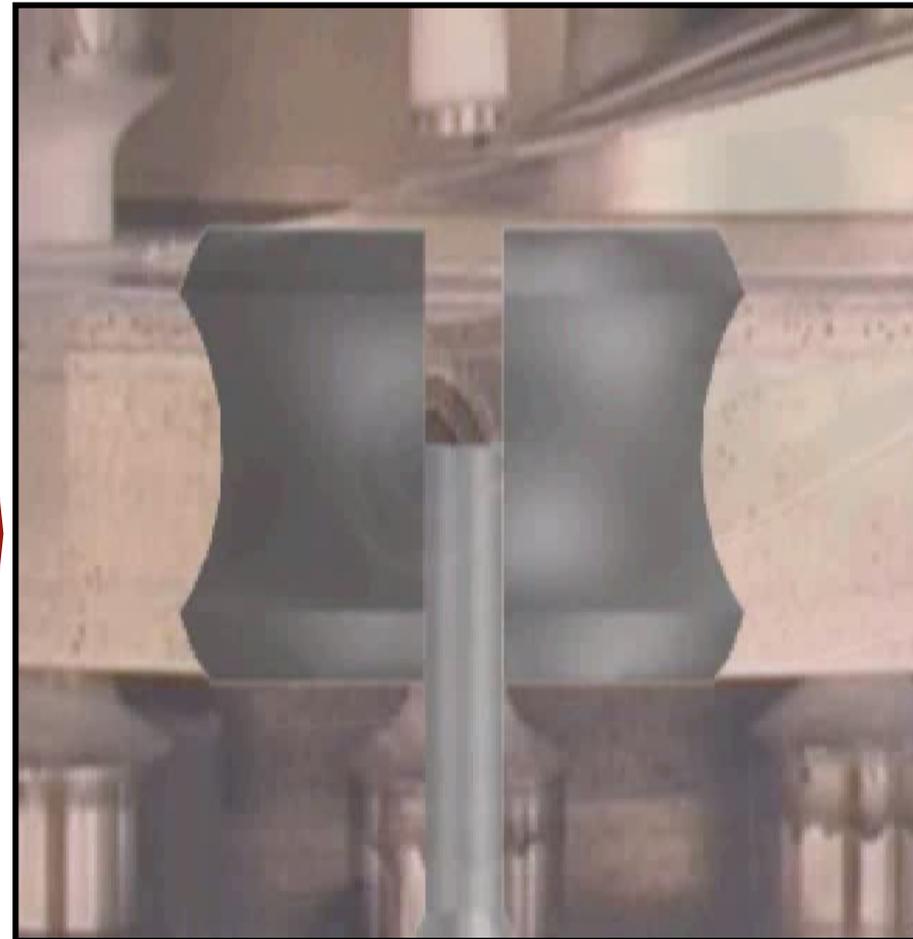
Коэффициент уплотнения (сжатия)

отношение высоты порошка в матрице (H_1)
к высоте полученной таблетки (H_2):

$$K_{сж} = \frac{H_1}{H_2}$$

Определение проводят в матрице. Матричный канал заполняют порошком и прессуют под давлением 1200 кг/см²

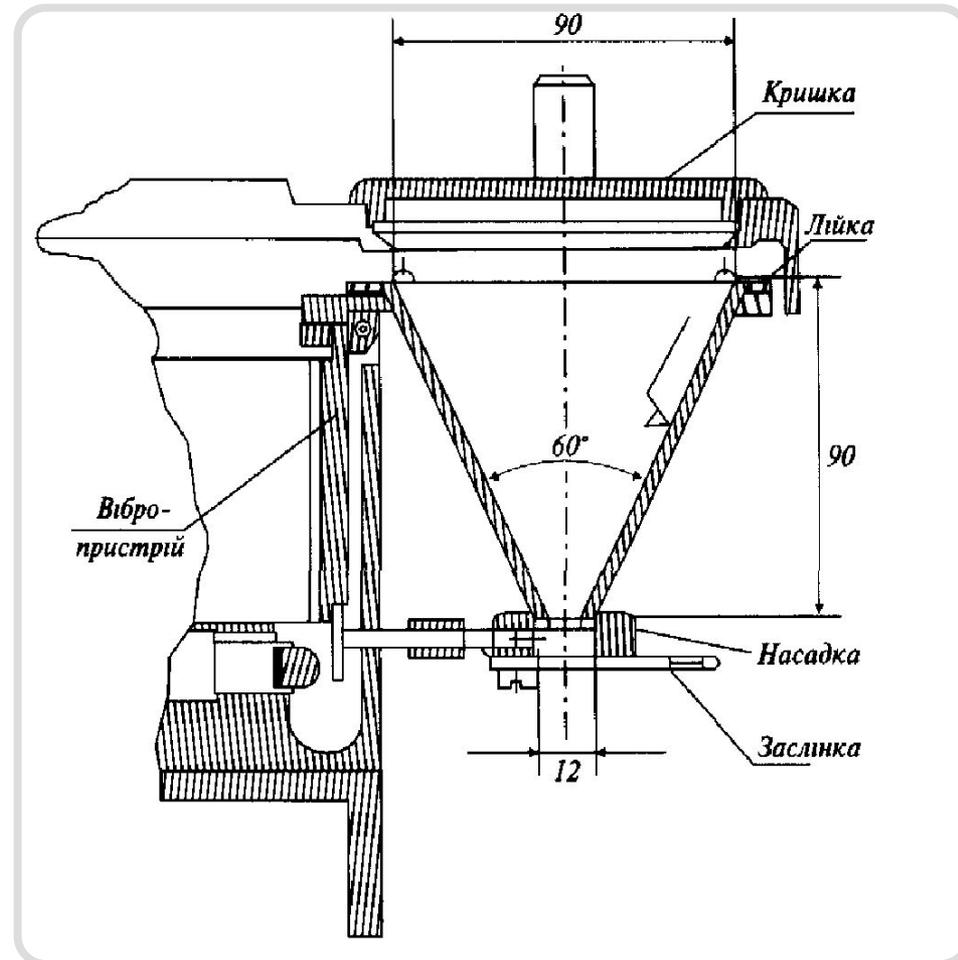
Полученную таблетку выталкивают пуансоном и измеряют высоту.



Текучность (сыпучесть)

способность порошкообразной системы высыпаться из емкости воронки или "течь" под силой собственной тяжести и обеспечивать равномерное заполнение матричного канала

Материал с плохой сыпучестью прилипает к стенкам воронки, что нарушает ритм его поступления в матрицу



Это приводит к тому, что заданная масса таблеток будет колебаться

Прессуемость

способность частиц порошка к когезии под давлением, т. е. способность под влиянием сил электромагнитной природы (молекулярных, адсорбционных, электрических) и механических зацеплений ко взаимному притяжению и сцеплению с образованием устойчивой прочной прессовки.

непосредственных методов определения прессуемости нет

$$K_{\text{пресс}} = \frac{m}{h}$$

косвенно оценивается по прочности таблетки на сжатие

определяет выбор связывающих веществ

результаты определения влияют на выбор технологии таблетирования

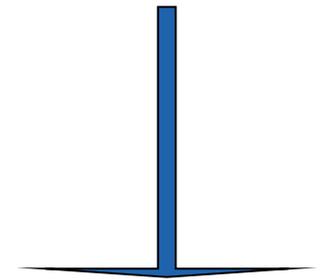
Сила выталкивания таблеток из матрицы

Для выталкивания таблетки из матрицы требуется затратить силу, чтобы преодолеть трение и сцепление между боковой поверхностью таблетки и стенкой матрицы



С учетом величины силы выталкивания прогнозируют добавки антифрикционных (скользящих или смазывающих) веществ

$$P_{\text{вытал}} = \frac{P_{\text{ман}} \cdot S_{\text{пл}}}{S_{\text{бок}}}$$



$$S_{\text{бок}} = 2 \times \pi \times r \times h$$

НОМЕНКЛАТУРА ВСПОМОГАТЕЛЬНЫХ ВЕЩЕСТВ

1. Наполнители (разбавители)

2. Связывающие

3. Разрыхляющие:

(набухающие)

-газообразующие

-улучшающие смачиваемость
и водопроницаемость

4. Антифрикционные:

- скользящие

- смазывающие

-противоприлипающие

5. Пленкообразователи

6. Корригенты:

-вкуса

-запаха

-цвета(красители,пигменты)

7. Пластификаторы

8. Пролонгаторы

9. Растворители

**1. Для получения
определённой массы
таблеток**

**2. Для достижения
необходимой силы сцепления
частиц**

**3. Для улучшения
распадаемости или
растворения**

**4. Для улучшения сыпучести
(текучести) таблеточной
массы**

5. При нанесении оболочек

**6. Для улучшения вкуса, цвета
и запаха таблеток**

**7. Для придания таблеточной
массе пластичности**

8. Для растворения веществ

должны проявлять фармакодинамическую индифферентность

не должны влиять и изменять биодоступность лекарственного средства

должны быть безопасными и совместимыми с тканями организма и не вызывать аллергии

**ТРЕБОВАНИЯ
К
ВСПОМОГАТЕЛЬНЫМ
ВЕЩЕСТВАМ**

не должны негативно влиять на органолептические свойства лекарственных препаратов

должны придавать лекарственной форме необходимые свойства т.о. влияя на биодоступность

Вспомогательные вещества на основе лактозы моногидрата

www.thomsonpharma.com

- α-моно крупнозернистый порошок (прималак 40, капсулак 60, сахелак 80, сферолак 100, ингалак);
- тонкоизмельченный порошок лактозы (гранулак 70, 140, 200, 230, сорболак 400);
- модифицированная лактоза (таблетоза 70, 80, 100 высокопрессуемый, фловлак 100);
- смеси лактозы с другими наполнителями: целлактоза 80 (содержит 25% целлюлозы и 75% лактозы моногидрата), микроцеллак 100 (содержит 25% микрокристаллической целлюлозы и 75% лактозы моногидрата), старлак (содержит 15% крахмала кукурузного и 85% лактозы моногидрата), нутрафлоу (содержит 50% аспартама и 50% лактозы), нутрафлок (4% аспартама и 96 % лактозы)



Спасибо за внимание!